

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6462706号  
(P6462706)

(45) 発行日 平成31年1月30日 (2019. 1. 30)

(24) 登録日 平成31年1月11日 (2019. 1. 11)

(51) Int. Cl.

F I

A O 1 N 25/02 (2006. 01)

A O 1 N 25/02

A O 1 N 25/00 (2006. 01)

A O 1 N 25/00 I O I

A O 1 N 43/653 (2006. 01)

A O 1 N 43/653 C

A O 1 N 47/24 (2006. 01)

A O 1 N 47/24 G

A O 1 N 43/56 (2006. 01)

A O 1 N 43/56 C

請求項の数 9 (全 25 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2016-551000 (P2016-551000)  
 (86) (22) 出願日 平成26年10月30日 (2014. 10. 30)  
 (65) 公表番号 特表2016-535092 (P2016-535092A)  
 (43) 公表日 平成28年11月10日 (2016. 11. 10)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2014/073368  
 (87) 国際公開番号 W02015/067524  
 (87) 国際公開日 平成27年5月14日 (2015. 5. 14)  
 審査請求日 平成29年10月27日 (2017. 10. 27)  
 (31) 優先権主張番号 13191608. 2  
 (32) 優先日 平成25年11月5日 (2013. 11. 5)  
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 510015257  
 ビーエイエスエフ・ソシエタス・エウロパ  
 エア  
 B A S F S E  
 ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒ  
 スハーフェン、カーラーボッシュシュト  
 ラーセ 3 8 番  
 (74) 代理人 110002572  
 特許業務法人平木国際特許事務所  
 (72) 発明者 クリスティン・ティーフェンゼー  
 ドイツ 6 7 0 9 8 パート・デュルクハイム  
 、ヘーエンヴェーク 8 番  
 (72) 発明者 インゴ・フロイテ-シュラハター  
 ドイツ 4 5 2 3 9 エッセン、ルートゲルス  
 シュトラ-セ 2 番

最終頁に続く

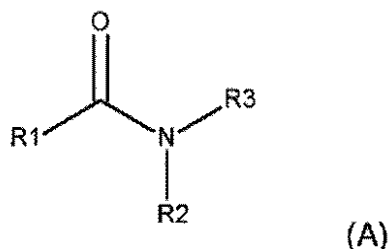
(54) 【発明の名称】 農薬およびアミドを含んでなる組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

農薬および式 (A) :

【化 1】



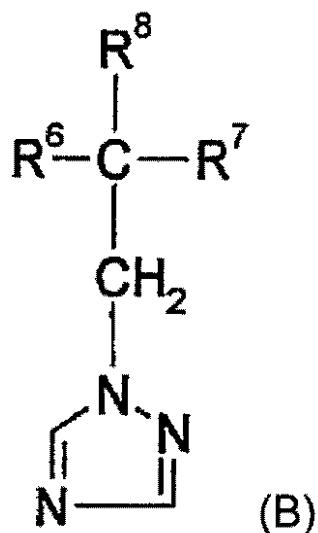
[ 式中、

R 1 は  $\text{C}_7$ -アルキルであり、R 2 および R 3 は、 $\text{C}_4$ -アルキルである。 ]

で示されるカルボン酸アミドを含む、水性組成物であって、

但し、該農薬は式 (B) :

【化 2】

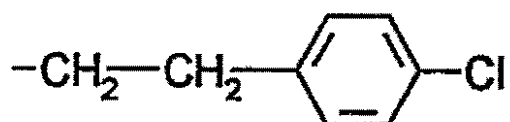


10

〔式中、

 $R^6$  は

【化 3】



20

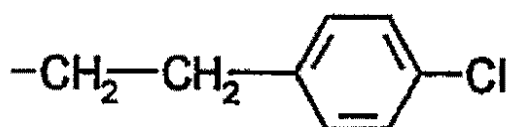
であり、 $R^7$  はtert.-ブチルであり、 $R^8$  はヒドロキシルであるか、または、  
 $R^6$  は4-フルオロフェニルであり、 $R^7$  は2-フルオロフェニルであり、 $R^8$  はヒドロキシルであるか、または、

$R^6$  は2,4-ジクロロフェニルであり、 $R^7$  はn-ブチルであり、 $R^8$  はヒドロキシルであるか、または、

 $R^6$  は

30

【化 4】



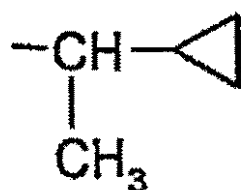
であり、 $R^7$  はフェニルであり、 $R^8$  はシアノであるか、または、  
 $R^6$  は2-クロロ-ベンジルであり、 $R^7$  は1-クロロ-シクロプロプ-1-イルであり、 $R^8$  はヒドロキシルであるか、または、

$R^6$  は4-クロロフェニルであり、

 $R^7$  は

40

【化 5】



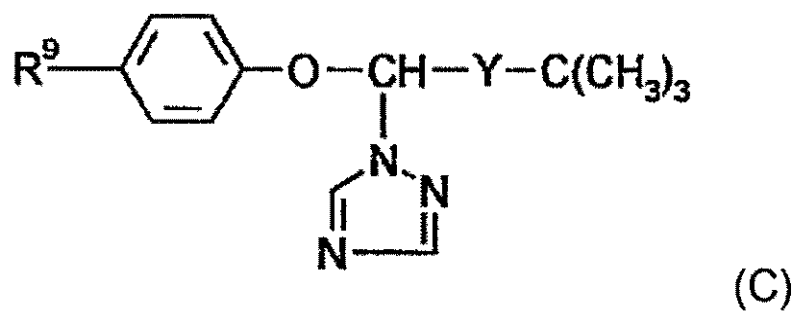
であり、

 $R^8$  はヒドロキシルである〕

で示されるアゾール誘導体、および/または、式 (C) :

50

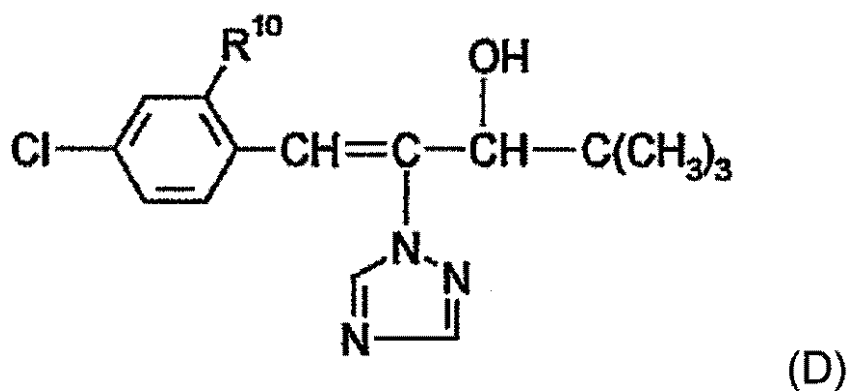
【化 6】



10

〔式中、  
Yは-CH(OH)であり、R<sup>9</sup>はクロルまたはフェニルであるか、または、  
YはCOであり、R<sup>9</sup>はクロルである〕  
で示されるアゾール誘導体、および/または、式(D)：

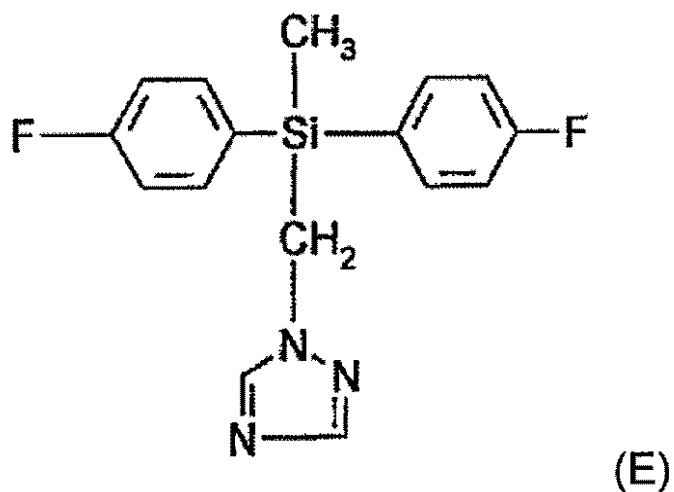
【化 7】



20

〔式中、R<sup>10</sup>は水素またはクロルである〕  
で示されるアゾール誘導体、および/または、式(E)：

【化 8】

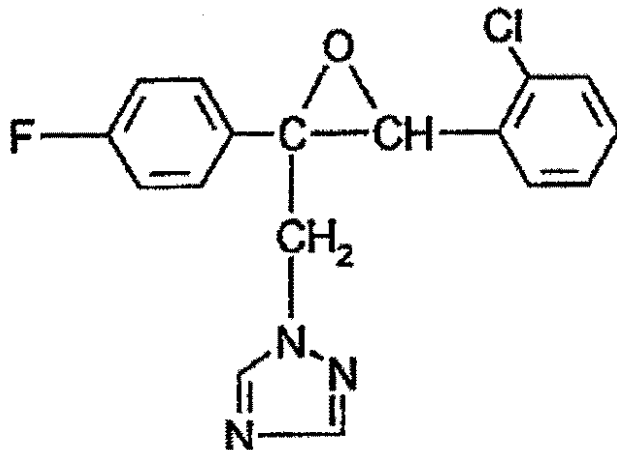


30

40

で示される1-([ビス-(4-フルオロフェニル)-メチル-シリル]-メチル)-1H-(1,2,4-  
トリアゾール)、および/または、式(F)：

【化 9】



(F).

で示される 1-[3-(2-クロロフェニル)-2-(4-フルオロフェニル)-オキシラン-2-イル-メチル]-1H-(1,2,4-トリアゾール)ではない、前記水性組成物。

【請求項 2】

R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は直鎖状 C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub> は直鎖状 C<sub>7</sub>-アルキルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

農薬は、殺菌剤、除草剤および殺虫剤から選択される、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

0.1 重量% ~ 90 重量% のカルボン酸アミドを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 5】

5 ~ 60 重量% の農薬、  
1 ~ 30 重量% の界面活性物質、  
0 ~ 50 重量% の油成分および / または共溶媒、および、  
0.1 ~ 90 重量% のカルボン酸アミドを、  
該量が水と合計して 100 重量% であるという条件で含む、  
請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の組成物。

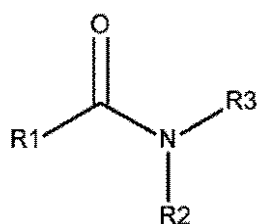
【請求項 6】

植物病原菌および / または望ましくない植物成長および / または望ましくない昆虫またはダニのまん延を制御するための、および / または、植物の成長を調節するための方法であって、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物を、それぞれの有害生物、それらの環境に対して、または、それぞれの有害生物から保護すべき植物に対して、土壌に対して、および / または、望ましくない植物に対して、および / または、作物に対して、および / または、それらの環境に対して作用させる方法。

【請求項 7】

式 (A) :

【化 10】



(A)

10

20

30

40

50

〔式中、  
R 1 は  $C_7$ -アルキルであり、  
R 2 および R 3 は、 $C_4$ -アルキルである。〕  
で示されるカルボン酸アミドの、無毒性または低毒性を有する、農薬用の溶媒としての使用。

【請求項 8】

植物を処理するための方法であって、該方法によって植物の健康を維持し、請求項 1 または 2 に記載のカルボン酸アミドと 1 種以上の農薬とを混合するステップを含む、方法。

【請求項 9】

請求項 1 または 2 に記載のカルボン酸アミドと 1 種以上の農薬とを混合するステップを含む、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、農薬および所定のカルボン酸アミドを含む水性組成物に関する。本発明はさらに、植物病原菌および／または望ましくない植物成長および／または望ましくない昆虫またはダニのまん延を制御するための、および／または、植物の成長を調節するための方法に関し、ここで、該組成物は、それぞれの有害生物、それらの環境に対して、または、それぞれの有害生物から保護すべき作物に対して、土壌に対しておよび／または望ましくない植物に対しておよび／または作物に対しておよび／またはそれらの環境に対して作用させる方法にも関する。さらに本発明は、無植物毒性または低植物毒性を有する、農薬用の溶媒としての、カルボン酸アミドの使用に関する。本発明は、好ましい特徴と、他の好ましい特徴との組合せを包含する。

【背景技術】

【0002】

農産物市場に対して数多くの液状濃縮物が入手可能であり、個々のタイプの製品が利点および欠点を有している。例えば農業用農薬は高濃度の活性原料を含有し、種々の原料を組成物中に組み込むことができ、該組成物の効能を高めることができるという利点を有する。しかし、多くの農薬、特に農薬工業グレードのものは、これらを使用前に溶解させねばならず、溶媒が低引火点を有し環境的に毒性であるために有害であり得り、実質的な混合および長い溶解時間を必要とするという欠点を有する。

【0003】

農薬産業において、高価であり、供給しにくく、および／または、その内在する植物毒性、毒性（例えば催奇形性）または規制のために、環境的に魅力的でないイソホロン、M B K、N M P 等の通常使用される溶媒の代替品を見出すことに関する大きな要望が存在する。

実地試験により、特定の環境的に好ましい溶媒が、過剰の植物毒性を伴う否定的な作物反応を示し得ることが示された。

【0004】

したがって、農工業において、幅広い種類の農薬を溶液状態で保持することができ、環境およびこれを散布された作物の両方に対して低減された毒性反応を有する溶媒に対する要求が存在する。

【0005】

アミド、および、農薬製剤における結晶形成を阻害するための溶媒としてのその使用は、一般に知られている：

【0006】

欧州特許出願公開第 0 0 4 4 9 5 5 号には、ピリダゾン-誘導体およびビス-カーバメートを含む液状除草剤組成物のための溶媒としてのアミドの使用が記載されている。

【0007】

独国特許出願公開第 4 3 4 1 9 8 6 号には、アゾール誘導体を含む農業用組成物の結

10

20

30

40

50

晶形成を阻害するためのアミドの使用が記載されている。

【 0 0 0 8 】

国際公開第 2 0 0 8 / 1 0 1 6 2 9 号には、オレイン酸またはリノール酸に基づく少なくとも 1 種のジアルキルアミド、および、少なくとも 1 種の殺生物剤を含み、ここで、該ジアルキルアミドは結晶形成の傾向を低減する、殺生物剤組成物が記載されている。

【 0 0 0 9 】

国際公開第 2 0 1 0 / 0 0 9 8 2 9 号には、殺生物剤および  $C_8 - C_{12}$  脂肪酸ジアルキルアミドを含む農業用組成物が記載され、ここで、該  $C_8 - C_{12}$  脂肪酸ジアルキルアミドは、幅広い範囲の種々の除草剤、殺虫剤および殺菌剤について優れた溶媒であるとされている。

10

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

【 0 0 1 0 】

【 特許文献 1 】 欧州特許出願公開第 0 0 4 4 9 5 5 号明細書

【 特許文献 2 】 独国特許出願公開第 4 3 4 1 9 8 6 号明細書

【 特許文献 3 】 国際公開第 2 0 0 8 / 1 0 1 6 2 9 号パンフレット

【 特許文献 4 】 国際公開第 2 0 1 0 / 0 0 9 8 2 9 号パンフレット

【 発明の概要 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 1 1 】

20

先行技術文献に開示されるアミドは、良好な溶媒特性を有し、結晶形成を阻害することができることが記載されている。しかし、本発明者らは、当技術分野で既知の特定のカルボン酸アミドが植物に対し植物毒性を有することを見出した。

【 0 0 1 2 】

したがって、本発明の主題は、農薬を溶解するのに良好に適する一方、植物に対してほとんど植物毒性がないカルボン酸アミドを特定することであった。さらに、該カルボン酸アミドは農薬の製剤を貯蔵安定にすることができ得るべきである。

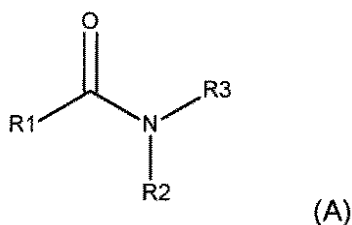
【 課題を解決するための手段 】

【 0 0 1 3 】

本発明の主題は、農薬および式 ( A ) :

30

【 化 1 】



[ 式中、

R 1 は  $C_2 - C_8$  アルキルであり、

40

R 2 および R 3 は、互いに独立して、 $C_1 - C_6$  アルキルであり、但し、R 3 が  $C_1$  - アルキル

ルである場合、R 2 は  $C_1$  - アルキルではなく、

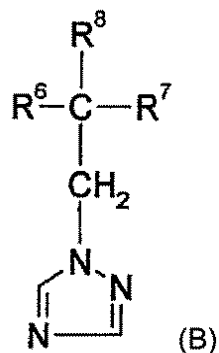
但し、R 2 および R 3 が  $C_4$  - アルキルであり、R 1 が  $C_2$  - アルキルである場合、または、R 2 および R 3 が  $C_2$  - アルキルであり、R 1 が  $C_3$  - アルキルである場合、または、R 2 および R 3 が  $C_3$  - アルキルであり、R 1 が  $C_3$  - アルキルである場合、該農薬はクロリダゾン、プロムピラゾンまたはカーバメートではなく、

但し、R 2 および R 3 が  $C_2$  - アルキルであり、R 1 が  $C_7 - C_8$  - アルキルである場合、または、R 2 および R 3 が  $C_3$  - アルキルであり、R 1 が  $C_3 - C_5$  - アルキルまたは  $C_7 - C_8$  - アルキルである場合、または、R 2 および R 3 が  $C_4$  - アルキルであり、R 1 が  $C_2$

50

-C<sub>5</sub>-アルキルまたはC<sub>7</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルである場合、該農薬は、式(B)：

【化2】

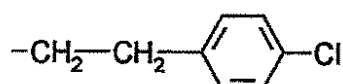


10

〔式中、

R<sup>6</sup>は

【化3】



であり、R<sup>7</sup>はtert.-ブチルであり、R<sup>8</sup>はヒドロキシルであるか、または

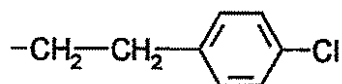
R<sup>6</sup>は4-フルオロフェニルであり、R<sup>7</sup>は2-フルオロフェニルであり、R<sup>8</sup>はヒドロキシルであるか、または、

20

R<sup>6</sup>は2,4-ジクロロフェニルであり、R<sup>7</sup>はn-ブチルであり、R<sup>8</sup>はヒドロキシルであるか、または、

R<sup>6</sup>は

【化4】



であり、R<sup>7</sup>はフェニルであり、R<sup>8</sup>はシアノであるか、または、

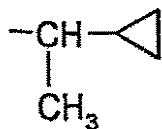
R<sup>6</sup>は2-クロロ-ベンジルであり、R<sup>7</sup>は1-クロロ-シクロプロプ-1-イルであり、R<sup>8</sup>はヒドロキシルであるか、または、

30

R<sup>6</sup>は4-クロロフェニルであり、

R<sup>7</sup>は

【化5】



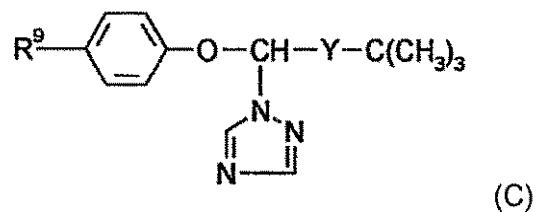
であり、

R<sup>8</sup>はヒドロキシルである〕

40

で示されるアゾール誘導体、および/または、式(C)：

【化6】

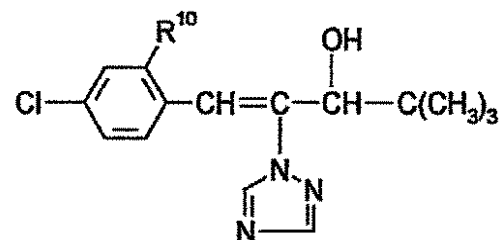


〔式中、

50

Y は -CH(OH) であり、R<sup>9</sup> はクロルまたはフェニルであるか、または、  
Y は CO であり、R<sup>9</sup> はクロルである]

で示されるアゾール誘導体、および/または、式 (D) :

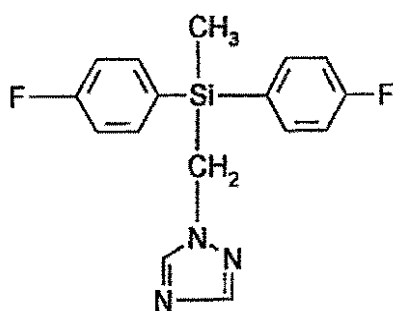


(D)

10

[ 式中、R<sup>10</sup> は水素またはクロルである ]

で示されるアゾール誘導体、および/または、式 (E) :

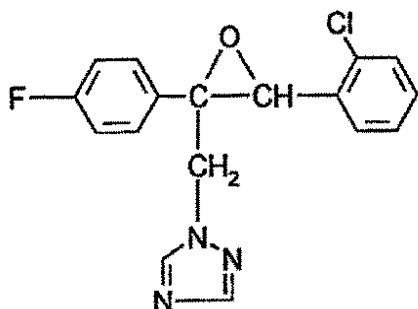


(E)

20

で示される 1 - ([ビス-(4-フルオロフェニル)-メチル-シリル]-メチル)-1H-(1,2,4-  
トリアゾール)、および/または、式 (F) :

【化 9】



(F).

30

で示される 1 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (4 - フルオロフェニル) - オキシラン - 2 - イル  
- メチル] - 1H - (1,2,4 - トリアゾールではない]

で示されるカルボン酸アミドを含む水性組成物により達成された。

【発明の効果】

40

【0014】

本発明者らは、驚くべきことに、所定のアミドが幅広い範囲の農薬を溶解する特性を維持しながら、植物に対する植物毒性を有さないか、または、最小限の植物毒性を有するのみであることを見出した。

【発明を実施するための形態】

【0015】

好ましい態様において、R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、R<sub>1</sub> は C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> アルキルである。より好ましくは、R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、R<sub>1</sub> は C<sub>2</sub> - C<sub>7</sub> アルキルである。さらにより好ましい態様において、R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、R<sub>1</sub> は C<sub>2</sub> - アルキルであり、特に R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は C<sub>4</sub> - アルキル

50



であり、R<sub>1</sub>はC<sub>2</sub>-アルキルである。さらなる好ましい態様において、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>はC<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>はC<sub>7</sub>-アルキルである。

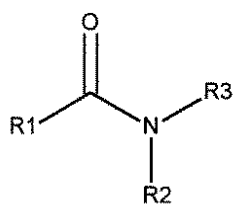
【0016】

本明細書で使用する用語「アルキル」は、それぞれの場合において、直鎖状または分枝状アルキル基を表す。本発明に関し、「直鎖状 (straight-chain) アルキル」は、線状 (linear) のアルキルも意味する。アルキル基の例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、2-ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジ-メチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピル等である。

【0017】

別の好ましい態様において、本発明は、農薬および式 (A) :

【化10】



(A)

〔式中、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は直鎖状C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>は直鎖状C<sub>7</sub>-アルキルである〕

で示されるカルボン酸アミドを含む水性組成物に関する。このようなカルボン酸アミドは、N,N-ジ-n-ブチル-n-オクタンアミドまたはN,N-ジ-n-ブチルカプリルアミドとしても知られている。

【0018】

農薬なる用語は、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、除草剤、毒性緩和剤、軟体動物駆除剤、殺鼠剤および/または成長調整剤の群から選択される少なくとも1種の活性物質を表す。好ましい農薬は、殺菌剤、殺虫剤、除草剤および成長調整剤である。特に好ましい農薬は、除草剤、殺菌剤および殺虫剤である。上記の分類の2種またはそれ以上から選択される農薬の混合物を使用してもよい。当業者はこのような農薬に精通しており、これらは例えば、「Pesticide Manual」、第14版(2006)、The British Crop Protection Council、ロンドンに見られ得る。上記に開示された農薬を、本発明の任意のカルボン酸アミドと組み合わせることができる。本発明のカルボン酸アミドと組み合わせることができる適当な農薬は以下である：

【0019】

A) ストロビルリン系：

アゾキシストロピン、ジモキシストロピン、クモキシストロピン、クメトキシストロピン、エネストロプリン、フルオキサストロピン、クレソキシム-メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ピラメトストロピン、ピラオキシストロピン、ピリベンカルブ、トリフロキシストロピン、メチル 2-[2-(2,5-ジメチルフェニルオキシメチル)フェニル]-3-メトキシアクリレート、2-(2-(3-(2,6-ジ-クロロフェニル)-1-メチルアリリデンアミノオキシメチル)フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチルアセトアミド；

【0020】

B) カルボキサミド系：

・カルボキシアニリド系：ベナラキシル、ベナラキシル-M、ベノダニル、ピキサフェン

、ボスカリド、カルボキシシ、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルトラニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、キララキシル、メプロニル、メタラキシル、メタラキシル-M (メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル、オキシカルボキシシ、ペンフルフェン (N-(2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)、ベンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、チアジニル、2-アミノ-4-メチルチアゾール-5-カルボキシアニリド、N-(3',4',5'-トリフルオロビフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(4'-トリフルオロメチルチオビフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(2-(1,3,3-トリメチルブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；

10

- ・カルボン酸モルホリド系：ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ；
- ・ベンズアミド系：フルメトベル、フルピコリド、フルオピラム、ゾキサミド；
- ・他のカルボキサミド系：カルプロパミド、ジクロシメット、マンジプロパミド、オキシテトラサイクリン、シルチオフアム、N-(6-メトキシピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボキサミド；

#### 【0021】

C) アゾール系：

- ・トリアゾール系：アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エボキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、オキスポコナゾール、パクロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール；

20

- ・イミダゾール系：シアゾファミド、イマザリル、硫酸イマザリル、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール；

- ・ベンズイミダゾール系：ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール；

- ・その他：エタボキサム、エトリジアゾール、ヒメキサゾール、2-(4-クロロフェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシフェニル)イソオキサゾール-5-イル]-2-プロプ-2-イニルオキシアセトアミド；

30

#### 【0022】

D) 窒素複素環化合物系

- ・ピリジン系：フルアジナム、ピリフェノックス、3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチルイソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、3-[5-(4-メチルフェニル)-2,3-ジメチルイソオキサゾリジン-3-イル]ピリジン；

- ・ピリミジン系：ブピリメート、シプロジニル、ジフルメトリム、フェナリモル、フェリムゾン、メパニピリム、ニトラピリン、ヌアリモル、ピリメタニル；

40

- ・ピペラジン系：トリホリン；

- ・ピロール系：フルジオキサニル、フェンピクロニル；

- ・モルホリン系：アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ；

- ・ピペリジン系：フェンプロピジン；

- ・ジカルボキシイミド系：フルオリミド (fluorimid)、イプロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン；

- ・非芳香族5員環複素環系：ファモキサドン、フェンアミドン、フルチアニル、オクチリノン、プロベナゾール、S-アリル 5-アミノ-2-イソプロピル-3-オキソ-4-オルトリル-2,3-ジヒドロ-ピラゾール-1-チオカルボキシレート；

- ・その他：アシベンゾラル-S-メチル、アミスルプロム、アニラジン、ブラストサイジン

50

-S、カプタホール、キャプタン、キノメチオネート、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチルスルフェート、フェノキサニル、ホルベット、オキサリジン酸、ピペラリン、プロキナジド、ピロキロン、キノキシフェン、トリアゾキシド、トリシクラゾール、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンズイミダゾール、5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、5-エチル-6-オクチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イルアミン；

【0023】

E) カーバメート系およびジチオカーバメート系

10

・チオ-およびジチオカーバメート系：ファーバム、マンゼブ、マンネブ、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム；  
・カーバメート系：ジエトフェンカルブ、ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、プロパモカルブ、プロパモカルブヒドロクロリド、バリフェナール (valiphenal)、(4-フルオロフェニル)N-(1-(1-(4-シアノフェニル)エタンスルホニル)-プト-2-イル)カーバメート；

【0024】

F) その他の殺菌剤

・グアニジン系：ドジン、ドジン遊離塩基 (dodine free base)、グアザチン、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジントリス(アルベシレート)；

20

・抗生物質系：カスガマイシン、カスガマイシンヒドロクロリド水和物、ポリオキシン系、ストレプトマイシン、バリダマイシン A；

・ニトロフェニル誘導体系：ピナバクリル、ジクロラン、ジノブトン、ジノカップ、ニトロタル-イソプロピル、テクナゼン；

・有機金属化合物系：フェンチン塩系、例えばフェンチンアセテート、フェンチンクロリド、フェンチン水酸化物；

・硫黄複素環化合物系：ジチアノン、イソプロチオラン；

・有機リン化合物系：エジフェンホス、ホセチル、ホセチル-アルミニウム、イプロベンホス、亜リン酸およびその塩、ピラゾホス、トルクロホス-メチル；

30

・有機塩素化合物：クロロタロニル、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンシクロン、ペンタクロロフェノールおよびその塩、フタリド、

キントゼン、チオファネート-メチル、トリルフルアニド、N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド；

・無機活性物質系：亜リン酸およびその塩、ボルドー混液、銅塩、例えば酢酸銅、水酸化銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄；

・菌類を制御するための生物由来物質、植物強化物質：枯草菌株 NRRL No. B-21661 (例えばAgraQuest, Inc. (USA) 製の製品、RHAPSODY (登録商標)、SERENADE (特六商標) MAXおよびSERENADE (登録商標) ASO)、パチルス プミルス株 NRRL No. B-30087 (例えばAgraQuest, Inc. (USA) 製の製品、SONATA (登録商標) およびBALLAD (登録商標) Plus)、ウロクラジウム オウデマンシー (例えばBotriZen Ltd. (ニュージーランド) 製のBOTRY-ZEN)、キトサン (例えばBotriZen Ltd. (ニュージーランド) 製のARMOUR-ZEN)。

40

・その他：ピフェニル、プロノポール、シフルフェナミド、シモキサニル、ジフェニルアミン、メトラフェノン、ミルジオマイシン、オキシニル-銅、プロヘキサジオン-カルシウム、スピロキサミン、トリルフルアニド、N-(シクロ-プロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロメトキシ-2,3-ジフルオロフェニル)メチル)-2-フェニル-アセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,

50

5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニルプロボキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニルプロボキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N-メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル)-2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)アセチル]ピペリジン-4-イル}チアゾール-4-カルボキシレート、N-メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル)-2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)アセチル]ピペリジン-4-イル}チアゾール-4-カルボキシレート、6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチルキノリン-4-イルアセテート、6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチルキノリン-4-イルメトキシアセテート、N-メチル-2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)アセチル]ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド；

# 【0025】

## G) 成長調整剤系

アブシシン酸、アミドクロル、アンシミドール、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、ブトルアリン、クロルメコート(クロルメコートクロリド)、クロリンクロリド、シクラニリド、ダミノジッド、ジケグラック、ジメチピン、2,6-ジメチルプリジン(puridine)、エテホン、フルメトラリン、フルルプリミドール、フルチアセト、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール-3-酢酸、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メピコート(メピコートクロリド)、メトコナゾール、ナフタレン酢酸、N-6-ベンジルアデニン、パクロブトラゾール、プロヘキサジオン(プロヘキサジオン-カルシウム)、プロヒドロジャスモン、チジアズロン、トリアペンテノール、トリブチルホスホロトリチオエート、2,3,5-トリヨード安息香酸、トリネキサバック-エチルおよびウニコナゾール；

# 【0026】

## H) 除草剤系

・アセトアミド：アセトクロル、アラクロル、ブタクロル、ジメタクロル、ジメテナミド、フルフェナセト、メフェナセト、メトラクロール、メタザクロール、ナプロパミド、ナプロアニリド、ペトキサミド、プレチラクロール、プロパクロール、テニルクロール；

・アミノ酸類似体系：ピラナホス、グリホサート、グルホシネート、スルホサート(sulfosate)；

・アリールオキシフェノキシプロピオネート系：クロジナホップ、シハロホップ-ブチル、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、メタミホップ、プロパキサホップ、キサロホップ、キサロホップ-P-テフリル；

・ビピリジル系：ジクワット、パラコート；

・カーバメート系およびチオカーバメート系：アシュラム、ブチレート、カルベタミド、デスメディファム、ジメピペレート、エプタム(EPIC)、エスプロカルブ、モリネート、オルベンカルブ、フェンメディファム、プロスルホカルブ、ピリブチカルブ、チオベンカルブ、トリアレート；

・シクロヘキサジノン系：ブトロキシジム、クレトジム、シクロキシジム、プロホキシジム、セトキシジム、テブラロキシジム、トラルコキシジム；

・ジニトロアニリン系：ベンフルラリン、エタルフルラリン、オリザリン、ペンディメタリン、プロジアミン、トリフルラリン；

・ジフェニルエーテル系：アシフルオルフェン、アクロニフェン、ピフェノックス、ジクロホップ、エトキシフェン、ホメサフェン、ラクトフェン、オキシフロフェン；

・ヒドロキシベンゾニトリル系：プロモキシニル、ジクロベニル、アイオキシニル；

・イミダゾリノン系：イマザメタベンズ、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル；

10

20

30

40

50

・フェノキシ酢酸系：クロメプロップ、2,4-ジクロロフェノキシ酢酸(2,4-D)、2,4-D B、ジクロロプロップ、MCPA、MCPA-チオエチル、MCPB、メコプロップ；

・ピラジン系：クロリダゾン、フルフェンピル-エチル、フルチアセット、ノルフルラゾン、ピリデート；

・ピリジン系：アミノピラリド、クロピラリド、ジフルフェニカン、ジチオピル、フルリドン、フルロキシピル、ピクロラム、ピコリナフェン、チアゾピル；

・スルホニル尿素系：アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファミロン、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フルセト-スルフロン、フルピルスルフロン、フォラムスルフロン、ハロスルフロン、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン、メソスルフロン、メトスルフロン-メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、プリミスルフロン、プロスルフロン、ピラゾスルフロン、リムスルフロン、スルホメツロン、スルホスルフロン、チフェンスルフロン、トリアスルフロン、トリベニユロン、トリフロキシスルフロン、トリフルスルフロン、トリトスルフロン、1-((2-クロロ-6-プロピル-イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)スルホニル)-3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)ウレア；

・トリアジン系：アメトリン、アトラジン、シアナジン、ジメタメトリン、エチオジン(ethiozine)、ヘキサジノン、メタミトロン、メトリブジン、プロメトリン、シマジン、テルブチラジン、テルブトリン、トリアジフラム；

・尿素系：クロロトルロン、ダイムロン、ジウロン、フルオメツロン、イソプロツロン、リニュロン、メタベンズ-チアズロン、テブチウロン；

・その他のアセト乳酸シンターゼ阻害剤系：ビスピリバック-ナトリウム、クロランスラム-メチル、ジクロスラム、フロラスラム、フルカルバゾン、フルメツラム、メトスラム、オルトスルファミロン、ペノキススラム、プロボキシカルバゾン、ピリバムベンズ(pyribambenz)-プロピル、ピリベンゾキシム、ピリフタリド(pyrifthalide)、ピリミノバック-メチル、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピロキサスルホン、ピロキススラム；

・その他：アミカルバゾン、アミノトリアゾール、アニロホス、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベンカルバゾン、ベンフルレセート(benfluresate)、ベンゾフェナップ、ベントゾン、ベンゾビシクロン、プロマシル、プロモブチド、ブタフェナシル、ブタミホス、カフェンストロール、カルフェントラゾン、シニドン-エチル、クロルタール、シンメチリン、クロマゾン、クミルロン、シプロスルファミド、ジカンバ、ジフェンゾコート、ジフルフェンゾピル、ドレックスレラ・モノセラス(Drechslera monoceras)、エンドタール、エトフメセート、エトベンザニド、フェントラザミド、フルミクロラック-ペンチル、フルミオキサジン、フルボキサム、フルオロクロリドン、フルルタモン、インダノファン、イソキサベン、イソキサフルトール、レナシル、プロパニル、プロピザミド、キンクロラック、キンメラック、メソトリオン、メチルヒ酸(methylarsenic acid)、ナプタラム、オキサジアルギル、メトキサジアゾン、オキサジクロメホン、ペントキサゾン、ピノキサデン、ピラクロニル、ピラフルフェン-エチル、ピラスルホトール、ピラゾキシフェン、ピラゾリネート、キノクラミン、サフルフェナシル、スルコトリオン、スルフェントラゾン、ターバシル、テフリルトリオン、テンボトリオン、チエンカルバゾン、トブラメゾン、4-ヒドロキシ-3-[2-(2-メトキシエトキシメチル)-6-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル]ビシクロ[3.2.1]オクタ-3-エン-2-オン、

エチル(3-[2-クロロ-4-フルオロ-5-(3-メチル-2,6-ジオキソ-4-トリフルオロメチル-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イル)フェノキシ]ピリジン-2-イルオキシ)アセテート、メチル 6-アミノ-5-クロロ-2-シクロ-プロピルピリミジン-4-カルボキシレート、6-クロロ-3-(2-シクロプロピル-6-メチルフェノキシ)-ピリダジン-4-オール、4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロフェニル)-5-フルオロピリジン-2-カルボン酸、メチル 4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)ピリジン-2-カルボキシレートおよびメチル 4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-3-ジメチ

10

20

30

40

50

ルアミノ-2-フルオロフェニル)ピリジン-2-カルボキシレート；

【0027】

# I) 殺虫剤系

・有機(チオ)ホスフェート系：アセフェート、アザメチホス、アジンホス-メチル、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クロルフェンビホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、フェントロチオン、フェンチオン、イソキサチオン、マラチオン、メタミドホス、メチダチオン、メチル-パラチオン、メビンホス、モノクロトホス、オキシジメトン-メチル、パラオキソン、パラチオン、フェントエート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロチオホス、スルプロホス、テトラクロルビンホス、テルブホス、トリアゾホス、トリクロルホン；

10

・カーバメート系：アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、フェノキシカルブ、フラチオカルブ、メチオカルブ、メトミル、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、トリアザメート；

・ピレトロイド系：アレスリン、ピフェントリン、シフルトリン、シハロトリン、シフェノトリン、シベルメトリン、アルファ-シベルメトリン、ベータ-シベルメトリン、ゼータ-シベルメトリン、デルタメトリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロバトリン、フェンバレレート、イミプロトリン、ラムダ-シハロトリン、ベルメトリン、ブラレトリン、ピレトリンIおよびII、レスメトリン、シラフルオフエン、タウフルバリネート、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、プロフルトリン、ジメフルトリン、

20

・昆虫成長制御剤：a) キチン合成阻害剤：ベンゾイルウレア系：クロルフルアズロン、シラマジン(cyramazin)、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン；ブプロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンタジン(clofentazin)；b) エクジソンアンタゴニスト系：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テプフェノジド、アザジラクチン；c) ジュベノイド系：ピリプロキシフェン、メトブレン、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト；

30

・ニコチン受容体アゴニスト/アンタゴニスト：クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、チアメトキサム、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、1-(2-クロロチアゾール-5-イルメチル)-2-ニトリミノ-3,5-ジメチル-[1,3,5]トリアジナン；

・GABAアンタゴニスト：エンドスルファン、エチプロール、フィプロニル、パニリプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、N-5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-メチルフェニル)-4-スルフィナモイル-1H-ピラゾール-3-チオカルボキサミド；

・大環状ラクトン：アバメクチン、エマメクチン、ミルベメクチン、レピメクチン、スピノサド、スピネトラム；

・ミトコンドリアの電子伝達鎖阻害剤(METI)Iダニ駆除剤系：フェナザキン、ピリダベン、テプフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム；

40

・METI IIおよびIII物質系：アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノン；

・デカップラ(decouplers)：クロルフェナピル；

・酸化的リン酸化阻害剤：シヘキサチン、ジアフェンチウロン、酸化フェンブタスズ、プロパルギット；

・昆虫脱皮阻害剤：シロマジン；

・「複合機能オキシダーゼ」阻害剤系：ピペロニルブトキシド；

・ナトリウムチャネル遮断剤：インドキサカルブ、メタフルミゾン；

・その他：ベンクロチアズ、ピフェナゼート、カルタップ、フロニカミド、ピリダリル、

50

ピメトロジン、硫黄、チオシクラム、フルベンジアミド、クロラントラニリプロール、サイアジピル（HGW86）；シエノピラフェン、フルピラゾホス、シフルメトフェン、アミドフルメト、イミシアホス、ピストリフルロンおよびピリフルキナゾン。

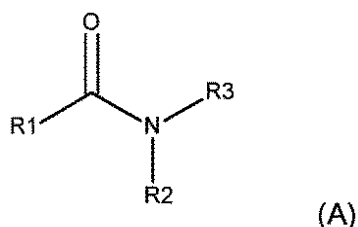
【0028】

好ましい態様において、本発明の組成物は、上記に述べたカルボン酸アミド、および、アニリド、ニトロフェニルエーテル、ピリジン、トリアゾール、メトキシカーバメート、ストロビルリン、ピラゾールからなる群から選択される農薬を含む。さらなる好ましい態様において、本発明の組成物は、上記述べたカルボン酸アミド、および、テブコナゾール、ピラクロストロピンおよびフルキサピロキサドからなる群から選択される農薬を含む。

【0029】

別の好ましい態様において、本発明は、農薬および式（A）：

【化11】



〔式中、R2およびR3は直鎖状C<sub>4</sub>-アルキルであり、R1は直鎖状C<sub>7</sub>-アルキルである〕

で示されるカルボン酸アミドを含む水性組成物に関し、ここで、該農薬は殺菌剤、除草剤および殺虫剤から選択され、好ましくはアニリド、ニトロフェニルエーテル、ピリジン、トリアゾール、メトキシカーバメート、ストロビルリンおよびピラゾールからなる群から選択され、さらにより好ましくはテブコナゾール、ピラクロストロピンおよびフルキサピロキサドからなる群から選択される。

【0030】

本発明の組成物は、農薬製剤に通常使用される助剤もさらに含んでよく、助剤の選択は特定の用途形態、製剤または活性物質の種類によって決定してよい。適当な助剤の例は以下である：溶媒、固体キャリア、界面活性物質（例えば界面活性剤、可溶化剤、保護コロイド、湿潤剤および粘着付与剤）、有機または無機増粘剤、殺菌剤、不凍剤、消泡剤、任意の着色剤および接着剤（例えば種を処理するため）または餌製剤に慣用の助剤（例えば誘因剤、摂食剤（feedants）、苦味物質）。

【0031】

本発明の組成物は、上記に述べたカルボン酸アミドの他に、さらに油成分および/または共溶媒をも含み得る。適当な油成分および共溶媒は、水または有機溶媒、例えば中～高沸点の鉱物油留分、例えば灯油およびディーゼル油、さらにコールタール油、ならびに、野菜または動物由来の油、脂肪族、環状および芳香族炭化水素、例えばパラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンおよびその誘導体、アルキル化ベンゼンおよびその誘導体、アルコール、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールおよびシクロヘキサノール、グリコール、ケトン、例えばシクロヘキサノン、ガンマ-ブチロラクトン、脂肪酸および脂肪酸エステル、および、高極性溶媒、例えばN-メチルピロリドンなどのアミンである。原則として、溶媒混合物、および、上記溶媒と水との混合物を使用することも可能である。

【0032】

本発明の組成物は固形キャリアも含み得る。固形キャリアは鉱物土類（mineral earths）、例えばシリカ、シリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、ライムストーン、石灰、白亜、赤土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、カルシウムおよびマグネシウムスルフェート、酸化マグネシウム、粉碎合成材料、肥料、例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素および植物性産物、例えば穀物粉末、樹皮粉末、木材

10

20

30

40

50

粉末および堅果の殻の粉末、セルロース粉体または他の固形キャリアである。

【 0 0 3 3 】

本発明の組成物は、界面活性物質を追加的に含み得る。本発明の組成物と組合せて適当に使用され得る界面活性物質（助剤、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤）は、芳香族スルホン（例えばリグノスルホン酸（Borresperse（登録商標）型、Borregaard、ノルウェー）、フェノールスルホン酸、ナフタレンスルホン酸（Morwet（登録商標）型、Akzo Nobel、USA）およびジブチルナフタレンスルホン酸（Nekal（登録商標）型、BASF、ドイツ））酸のアルカリ金属、アルカリ土類金属およびアンモニウム塩、ならびに脂肪酸の塩、アルキルおよびアルキルアリアルスルホネート、アルキルエーテル、ラウリルエーテルおよび脂肪アルコールスルフェート、ならびに、硫酸化ヘキサ-、ヘプタ-およびオクタデカノールの塩、ならびに脂肪アルコールグリコールエーテルの塩、スルホン化ナフタレンおよびその誘導体とホルムアルデヒドとの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドとの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェノールエーテル、エトキシ化イソオクチル-、オクチル-またはノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール類、イソトリデシルアルコール、脂肪アルコール/エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ひまし油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル類またはポリオキシプロピレンアルキルエーテル類、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセテート、ソルビトールエステル類、リグノ亜硫酸廃液、ならびにタンパク質、変性タンパク質、多糖（例えばメチルセルロース）、疎水性に修飾されたでんぷん、ポリビニルアルコール（Mowiol（登録商標）型、Clariant、スイス）、ポリカルボキシレート類（Sokalan（登録商標）型、BASF、ドイツ）、ポリアルコキシレート類、ポリビニルアミン（Lupamin（登録商標）型、BASF、ドイツ）、ポリエチレンイミン（Lupasol（登録商標）型、BASF、ドイツ）、ポリビニルピロリドンおよびそのコポリマーである。

【 0 0 3 4 】

本発明の組成物は、カルボン酸アミドの量は考慮せず、0.1 ~ 40 重量%、好ましくは1 ~ 30、特に2 ~ 20 重量%の（上記のような）界面活性物質を含んでよい。

【 0 0 3 5 】

本発明の組成物において使用し得る適当な増粘剤は、製剤に改善された流動挙動（すなわち、静止状態で高粘性であり、攪拌状態で低粘性である）を付与する化合物である。例えば、多糖類、タンパク質（例えばカゼインまたはゼラチン）、合成ポリマー、または無機層状鉱物である。このような増粘剤は市販され入手可能であり、例えばキサンタンガム（Kelzan（登録商標）、CP Kelco、USA）、Rhodopol（登録商標）23（Rhodia、フランス）またはVeegum（登録商標）（R.T. Vanderbilt、USA）またはAttaclay（登録商標）（Engelhard Corp.、NJ、USA）である。製剤中の増粘剤含量は増粘剤の効力によって決まる。当業者であれば、製剤の所望の粘度を得るに適当な量を選択するであろう。含量は、大抵の場合において、0.01 ~ 10 重量%の量であり得る。

【 0 0 3 6 】

本発明の組成物を安定化するために、殺細菌剤を添加してもよい。殺細菌剤の例は、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールに基づくもの、ならびにイソチアゾリノン誘導体、例えばアルキルイソチアゾリノン類およびベンゾイソチアゾリノン類（Thor Chemie製のActicide（登録商標）MBS）である。適当な凍結防止剤の例は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素およびグリセロールである。消泡剤の例は、シリコーンエマルジョン（例えば、Wacker（ドイツ）製のSilikon（登録商標）SREまたはRhodia（フランス）製のRhodorsil（登録商標））、長鎖アルコール、脂肪酸、脂肪酸の塩、有機フッ素化合物およびこれらの混合物である。

【 0 0 3 7 】

本発明の組成物は、好ましくは農薬製剤の形態で存在し得る。このような製剤およびその処方の例は以下である：

i) 水溶性濃縮物（SL、LS）：10 重量部の活性物質を90 重量部の水又は水溶性溶

10

20

30

40

50



媒を用いて溶解させる。代替として、湿潤剤または他の助剤を加える。水で希釈すると、該活性物質が溶解する。これによって、10重量%の活性物質含量を有する組成物が得られる。

i i) 分散性濃縮物(DC): 20重量部の活性物質を、10重量部の分散剤(例えばポリビニルピロリドン)を添加すると共に、70重量部のNMPに溶解させる。水で希釈すると、分散体を得られる。活性物質含量は20重量%の量である。

i i i) 乳化性濃縮物(EC): 15重量部の活性物質を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びエトキシ化ヒマシ油(それぞれの場合において5重量部)を添加すると共に、75重量部の溶媒ナフサに溶解させる。水で希釈すると、乳化物を得られる。該組成物は15重量%の活性物質含量を有する。

i v) エマルジョン(EW、EO、ES): 25重量部の活性物質を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びエトキシ化ヒマシ油(それぞれの場合において5重量部)を添加すると共に、35重量部のキシレンに溶解させる。乳化装置(例えばUltra-Turrax)を用いて、この混合物に30重量部の水を導入し、均質なエマルジョンを得る。水で希釈すると、エマルジョンが得られる。該組成物は25重量%の活性物質含量を有する。

v) 懸濁液(SC、OD、FS): 攪拌させたボールミル中で、10重量部の分散剤および湿潤剤ならびに70重量部の水または有機溶媒を添加すると共に、20重量部の活性物質を粉碎し、微細に分散された活性物質懸濁液を得る。水で希釈すると、活性物質の安定な懸濁液が得られる。組成物中の活性物質含量は20重量%の量である。

v i) 水分散性顆粒および水溶性顆粒(WG、SG): 50重量部の活性物質を50重量部の分散剤および湿潤剤を添加すると共に微細に粉碎し、技術的装置(例えば、押出機、噴霧塔、流動床)を用いて、水分散性または水溶性顆粒として製剤化する。水で希釈すると、活性物質の安定な分散体または溶液が得られる。該組成物は50重量%の活性物質含量を有する。

v i i) 水分散性紛体および水溶性紛体(WP、SP、SS、WS): 75重量部の活性物質を、25重量部の分散剤および湿潤剤ならびにシリカゲルの添加を伴い、ローターステーターミルにおいて粉碎する。水で希釈すると、活性物質の安定な分散体または溶液が得られる。該組成物の活性物質含量は75重量%の量である。

v i i i) ゲル(GF): 20重量部の活性物質、10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤および70重量部の水または有機溶媒を、ボールミル中で粉碎し、微細な懸濁液を得る。水で希釈すると、20重量%の活性物質含量を有する、活性物質の安定な懸濁液が得られる。

i x) ダスト(DP、DS): 5重量部の活性物質を微細に粉碎し、95重量部の微細に分割したカオリンと密に混合する。これにより、5重量%の活性物質含量を有するダストが得られる。

x) 顆粒(GR、FG、GG、MG): 0.5重量部の活性物質を微細に粉碎し、99.5重量部の担体と合わせる。このための通常の方法は、押出、噴霧乾燥または流動床である。これにより、0.5重量%の活性物質含量を有する直接適用するための顆粒が得られる。

x i) ULV溶液(UL): 10重量部の活性物質を、90重量部の有機溶媒(例えばキシレン)中に溶解させる。これにより、10重量%の活性物質含量を有する直接適用するための組成物が得られる。

【0038】

好ましい態様において本発明の組成物は乳化性濃縮物(EC)である。

【0039】

該して本発明の組成物は、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%の農薬を含む。

【0040】

多くの場合において、本発明の組成物は、0.1~90重量%、好ましくは10~80重量%、特に20~70重量%の上記に述べたようなカルボン酸アミドを含む。

10

20

30

40

50

## 【0041】

好ましい態様において、本発明の組成物は以下：

5 ~ 60 重量%の上記に述べた農薬、  
1 ~ 30 重量%の上記に述べた界面活性物質、  
0 ~ 50 重量%の油成分および/または共溶媒、および  
0.1 ~ 90 重量%の上記に述べたカルボン酸アミド  
を、該量が水と合計して100重量%であるという条件で含む。

## 【0042】

ユーザーは、本発明の組成物を通常、予備計量装置、背負噴霧器、スプレータンクまたはスプレー飛行機中で使用する。ここで、水および/または緩衝液を用いて該組成物は所望の使用濃度となり、場合によりさらなる助剤が添加され、これによって即時使用可能なスプレー混合物が得られる(タンク混合として知られる)。通常、50 ~ 500リットル(好ましくは100 ~ 400リットル)の即時使用可能なスプレー混合物が、農業有効面積1ヘクタールあたりに適用される。特定の区分においては、該量はかかる量を超えるか(例えば果実成長)、または、それより少なく(例えば飛行機適用)あり得る。即時使用可能な製剤における該活性物濃度は、実質的な範囲へ様々であってよい。一般には、0.0001 ~ 10%、好ましくは0.01 ~ 1%である。

10

## 【0043】

種々のタイプの油、湿潤剤、吹き溜まり低減剤、粘着剤、散布剤、助剤、肥料、植物強化製品、微量元素、除草剤、殺細菌剤、殺菌剤および/または農薬を、該活性物質またはこれを含む製剤に、場合により使用直前にタンク混合物にも、添加してよい。これらの生成物を本初美絵の組成物中に、1:100 ~ 100:1、好ましくは1:10 ~ 10:1の重量比で混合し得る。これに関して適当な助剤は、特に以下である：有機修飾ポリシロキサン、例えばBreak Thru S 240(登録商標)；アルコールアルコキシレート、例えばAtplus(登録商標) 245、Atplus(登録商標) MBA 1303、Plurafac(登録商標) LF 300およびLutensol(登録商標) ON 30；EO/POPブロックポリマー、例えばPluronic(登録商標) RPE 2035およびGenapol(登録商標) B；アルコールエトキシレート、例えばLutensol(登録商標) XP 80；およびジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、例えばLeophen(登録商標) RA。

20

## 【0044】

活性物質の適用量は目的とする効果の性質によって決まり、作物保護に使用する場合、1haあたり0.001 ~ 2.0kg、好ましくは1haあたり0.005 ~ 2kg、とりわけ好ましくは1haあたり0.05 ~ 0.9kg、特に1haあたり0.1 ~ 0.75kgの活性物質である。

30

## 【0045】

本発明はさらに、植物病原菌および/または望ましくない植物成長および/または望ましくない昆虫またはダニのまん延を制御するための、および/または、植物の成長を調節するための方法であって、上記に述べた本発明の組成物を、それぞれの有害生物、それらの環境に対して、または、それぞれの有害生物から保護すべき作物に対して、土壌に対しておよび/または望ましくない植物に対しておよび/または作物に対しておよび/またはそれらの環境に対して作用させる方法にも関する。

40

## 【0046】

適当な農作物の例は、穀類、例えばコムギ、ライムギ、オオムギ、ライコムギ、オートムギまたはイネ；ビート、例えばサトウダイコンまたは飼料ビート；リンゴ類の果実、核果およびソフトフルーツ、例えば、リンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ、イチゴ、ラズベリー、スグリまたはグーズベリー；マメ科植物、例えば、豆、レンティルマメ、エンドウマメ、ルーサンまたはダイズ；油植物、例えばアブラナ、カラシナ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、カカオ、トウゴマ、アブラヤシ、ラッカセイまたはダイズ；ウリ科植物、例えば、カボチャ/トウナス、キュウリまたはメロン；繊維植物、例えば、ワタ、アマ、アサまたはジュート；柑橘類果実、例えばオレンジ、レモン、グレープフルーツまたはマンダリン；野菜植物、例えばハウレンソウ、レタス、アスパ

50

ラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、カボチャ/トウナスまたはピーマン；月桂樹植物、例えばアボカド、ニッケイまたはショウノウ；エネルギー作物および産業原料植物、例えば、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、アブラナ、サトウキビまたはアブラヤシ；トウモロコシ；タバコ；木の実；コーヒー；茶；バナナ；ブドウ（食用のブドウおよびワイン製造用のブドウ）；ホップ；草、例えばシバ；スイートリーフ（*Stevia rebaudania*）；ゴムノキおよび森林植物、例えば花、低木、落葉樹および針葉樹、ならびに繁殖材料、例えば種子、およびこれらの植物の収穫した材料である。

#### 【 0 0 4 7 】

作物の用語は、品種改良、突然変異または遺伝子工学により改変されたこれら植物も含み、市販されているまたは開発途中の生物工学的農産品をも含む。遺伝子組換え植物は、その遺伝物質を、交差、突然変異または天然の組換えにより、自然の条件下では起こらない方法（すなわち遺伝物質の組換え）で改変された植物である。ここで、原則として、植物の特性を改善するために、植物の遺伝物質に 1 またはそれ以上の遺伝子が組み入れられる。このような組換え変性は、例えばプレニル化残基、アセチル化残基、ファルネシル化残基または P E G 残基等のポリマーのグリコシル化または結合化などの方法による、タンパク質、オリゴペプチドまたはポリペプチドの翻訳後修飾も含む。

#### 【 0 0 4 8 】

例として挙げられ得るものは、作物品種改良および遺伝子組換え法の結果として、あるクラスの除草剤、例えば以下に対する耐性を獲得した植物である：ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（H P P D）阻害剤、アセト乳酸シンターゼ（A L S）阻害剤、例えばスルホニル尿素類（E P - A 2 5 7 9 9 3、U S 5, 0 1 3, 6 5 9）またはイミダゾリノン類（例えば U S 6, 2 2 2, 1 0 0、W O 0 1 / 8 2 6 8 5、W O 0 0 / 2 6 3 9 0、W O 9 7 / 4 1 2 1 8、W O 9 8 / 0 2 5 2 6、W O 9 8 / 0 2 5 2 7、W O 0 4 / 1 0 6 5 2 9、W O 0 5 / 2 0 6 7 3、W O 0 3 / 1 4 3 5 7、W O 0 3 / 1 3 2 2 5、W O 0 3 / 1 4 3 5 6、W O 0 4 / 1 6 0 7 3）、エノールピルビルシキメート 3 - ホスフェートシンターゼ（E P S P S）阻害剤、例えばグリホセート（例えば、W O 9 2 / 0 0 3 7 7 参照）、グルタミンシンセターゼ（G S）阻害剤、例えば、グルホシネート（例えば、E P - A 2 4 2 2 3 6、E P - A 2 4 2 2 4 6 参照）、またはオキシニル除草剤（例えば、U S 5, 5 5 9, 0 2 4 参照）。例えば、品種改良および突然変異により、イミダゾリノン類（例えばイマザモックス）に耐性を有する Clearfield（登録商標）アブラナ（BASF SE、ドイツ）が生じた。遺伝子組換え法を用いて、グリホセートまたはグルホシネートに耐性である作物、例えばダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビートおよびアブラナが作られ、これらは RoundupReady（登録商標）（グリホセート耐性、Monsanto、U.S.A.）および Liberty Link（登録商標）（グルホシネート耐性、Bayer CropScience、ドイツ）の商品名で入手可能である。遺伝子組換え法により 1 種以上の毒素を生じる植物（例えばバチルス菌種に由来するもの）もまた包含される。このような遺伝子組換え植物により生産される毒素としては、例えば、バチルス属の殺虫タンパク質（特に B . スリンギエンシス由来）、例えばエンドトキシン Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9c、Cry34Ab1 or Cry35Ab1；または、植物殺虫タンパク質（VIP）、例えば VIP1、VIP2、VIP3、または VIP3A；線虫コロニー形成細菌（例えばフォトラブダス属の種（*Photorhabdus* spp.）またはゼノラブダス属の種（*Xenorhabdus* spp.）由来の殺虫タンパク質；動物生物体由来の毒素、例えばスズメバチ、クモまたはサソリ毒；菌類の毒素、例えばストレプトミセス（*Streptomyces*）由来のもの；植物レクチン、例えばエンドウ豆またはオオムギ由来のもの；アグルチニン；プロテイナーゼ阻害剤、例えばトリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチンまたはババイン阻害剤；リボソーム不活性化タンパク質（R I P）、例えばリシン、トウモロコシ R I P、アブリン、ルフィン、サボリンまたはプリオジン；ステロイド代謝酵素、例えば、3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド I D P グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、または H M G - C o A レダクターゼ；イオンチャンネル遮断剤、例えばナトリウムチャンネルまたはカルシウムチャンネル阻害剤；幼若モルモ

10

20

30

40

50

ンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体（ヘリコキニン受容体）；スチルベンシンターゼ、  
ピベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。植物において、こ  
れらの毒素はプレトキシシン、ハイブリッドタンパク質または切り取られたまたは他の方法  
により修飾されたタンパク質として生産されてもよい。ハイブリッドタンパク質は、異な  
るタンパク質ドメインの新規の組み合わせを特徴とする（例えば、WO 2002/01  
5701参照）。このような毒素またはこれらの毒素を生産する遺伝子組換え植物のさら  
なる例は、EP-A 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、E  
P-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/18810およびWO 03/  
52073に開示されている。これらの遺伝子組換え植物を作り出す方法は当業者に既知  
であり、例えば上記の文献に記載されている。上記に言及した多くの毒素は、それらを生  
産した植物に、節足動物のすべての分類上のクラスに属する有害生物、特に甲虫(Coelero  
pta)、双翅類生物(Diptera)およびチョウ(Lepidoptera)、ならびに線虫(Nematoda)に対す  
る耐性を付与する。殺虫毒素をコードする1以上の遺伝子を有する遺伝子組換え植物は、  
例えば、上記の文献に記載されており、それらのいくつかは市販され入手可能であり、例  
えば、YieldGard(登録商標)（毒素Cry1Abを生産するトウモロコシ変種）、YieldGard(登  
録商標) Plus（毒素Cry1AbおよびCry3Bb1を生産するトウモロコシ変種）、Starlink(登  
録商標)（毒素Cry9cを生産するトウモロコシ変種）、Herculex(登録商標) RW（毒素Cry34Ab  
1、Cry35Ab1および酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ[PAT]を  
生産するトウモロコシ変種）；NuCOTN(登録商標) 33B（毒素Cry1Acを生産するワタ変種）  
、Bollgard(登録商標) I（毒素Cry1Acを生産するワタ変種）、Bollgard(登録商標) II（  
毒素Cry1AcおよびCry2Ab2を生産するワタ変種）；VIPCOT(登録商標)（VIP毒素を生産する  
ワタ変種）；NewLeaf(登録商標)（毒素Cry3Aを生産するジャガイモ変種）；Syngenta See  
ds SAS（フランス）製のBt-Xtra(登録商標)、NatureGard(登録商標)、KnockOut(登録商標  
）、BiteGard(登録商標)、Protecta(登録商標)、Bt11（例えば、Agrisure(登録商標) CB）  
およびBt176（毒素Cry1AbおよびPAT酵素を生産するトウモロコシ変種）、Syngenta Seeds  
SAS（フランス）製のMIR604（修正された毒素Cry3Aを生産するトウモロコシ変種、これ  
に関してWO03/018810参照）、Monsanto Europe S.A.（ベルギー）製のMON 863（毒素Cry3  
Bb1を生産するトウモロコシ変種）、Monsanto Europe S.A.（ベルギー）製のIPC 531（修  
正された毒素Cry1Acを生産するワタ変種）およびPioneer Overseas Corporation（ベルギ  
ー）製の1507（毒素Cry1FおよびPAT酵素を生産するトウモロコシ変種）である。

#### 【0049】

次の植物もまた包含される：組換え法により、細菌、ウィルスまたは真菌の病原体に対  
して、増大した耐性をもたらすか、または、対抗性である1以上のタンパク質を生産する  
植物、例えばいわゆる感染特異的タンパク質（PRタンパク質、EP A 0 392 225参照）、  
抵抗タンパク質（例えば、メキシコ野生ジャガイモ ソラヌム・ブルボカスタヌム(Solan  
um bulbocastanum)から得られたフィトフトラ・インフェスタンス(Phytophthora infesta  
ns)に対する2つの耐性遺伝子を生産するジャガイモ変種）またはT4リゾチーム（例え  
ば、このタンパク質を生産することにより、エルウィニア・アミルボラ(Erwinia amylovor  
a)などの細菌に対して耐性を有するジャガイモ品種）を生産する植物。

#### 【0050】

次の植物もまた包含される：組換え法を用いて、例えば収穫能力（例えばバイオマス、  
穀類の収穫高、でんぷん含量、油またはタンパク質含量）、干ばつ、塩または他の限定的  
環境因子に対する耐性、または、有害生物ならびに真菌、細菌およびウィルス病原体に対  
する抵抗性を増大させることにより、生産性が改善された植物。

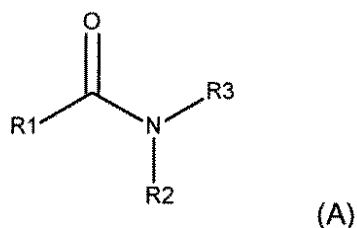
#### 【0051】

次の植物もまた包含される：組換え法を用いて、特に人または動物の食餌を改善するた  
めに、その成分が改変された植物（例えば、健康を増進する長鎖オメガ-3-脂肪酸または  
一不飽和オメガ-9-脂肪酸を生産する油植物（例えば、Nexera(登録商標)アブラナ、DOW  
Agro Sciences、カナダ）。

#### 【0052】

本発明は、式 (A) :

【化 1 2】



〔式中、

R 1 は C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> アルキルであり、  
R 2 および R 3 は、互いに独立して、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり、但し、R 3 が C<sub>1</sub> - アルキルである場合、R 2 は C<sub>1</sub> - アルキルではない〕

で示されるカルボン酸アミドの、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒としての使用にも関する。好ましい態様において、R 2 および R 3 が C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、R 1 が C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> アルキルであるカルボン酸アミドが、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒として使用される。より好ましくは、R 2 および R 3 が C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、R 1 が C<sub>2</sub> - C<sub>7</sub> アルキルであるカルボン酸アミドが、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒として使用される。さらにより好ましい態様において、R 2 および R 3 が C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、R 1 が C<sub>2</sub> - アルキルである、特に R 2 および R 3 が C<sub>4</sub> - アルキルであり、R 1 が C<sub>2</sub> - アルキルであるカルボン酸アミドが、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒として使用される。さらなる好ましい態様において、R 2 および R 3 が C<sub>4</sub> - アルキルであり、R 1 が C<sub>7</sub> - アルキルであるカルボン酸アミドが、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒として使用される。より好ましい態様において、R 2 および R 3 が直鎖状 C<sub>4</sub> - アルキルであり、R 1 が直鎖状 C<sub>7</sub> - アルキルであるカルボン酸アミドが、農薬用の無毒性または低毒性を有する溶媒として使用される。

【0053】

好ましい態様において無毒性とは、以下に記載するような植物毒性法を用いて測定して、未処理の植物と比較して処理された植物の 0 % が植物損傷を有することを意味する。

【0054】

好ましい態様において低毒性とは、以下に記載するような植物毒性法を用いて測定して、未処理の植物と比較して処理された植物の 1 ~ 10 % が植物損傷を有することを意味する。

【0055】

本発明に関し、植物毒性は、水 (蒸留水) およびカルボン酸アミド (1 ha あたり 1500 ml のカルボン酸アミドを含む、200 l / ha) を含むスプレーを調製し、3 - 4 葉期にあるオオムギ (cultivar Lawina) の植物に、1.5 l / ha の水適用速度で適用する際の評価により決定する。試験期間は 10 日間続く。この期間に、試験植物に、散水に使用する水を介して供給される栄養素と共に、最適な散水が行われる。

【0056】

植物毒性は、処理された植物に対し未処理の植物 (すなわち、水のみで処理されたもの) との比較においてスコアを与えることによって評価される。評価尺度は、0 % ~ 100 % の植物毒性の範囲である。評価は外観検査によってなされる。0 % の植物毒性は、処理された植物と未処理の植物との間に違いがないことを意味する。したがって、本発明による無植物毒性とは、処理された植物が植物損傷を有さず、処理された植物と未処理の植物との間に違いがないことを意味する。本発明による低植物毒性とは、処理された植物の 1 ~ 10 % のみが、未処理の植物と比較して、植物損傷を有することを意味する。

【0057】

本発明はまた、植物の処理方法であって、上記に述べたカルボン酸アミドと、本発明の開示に記載される 1 種以上の農薬とを混合するステップを含み、該方法により植物の健康

を維持するための方法にも関する。

【0058】

好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキルであるカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合することを含む。より好ましくは、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>アルキルであるカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合することを含む。さらにより好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-アルキルである、特にR<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合することを含む。さらなる好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>7</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合することを含む。さらなる好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が直鎖状C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>が直鎖状C<sub>7</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合することを含む。

10

【0059】

好ましくは、10重量%~90重量%、好ましくは30重量%~80重量%の上記に述べたカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合する。

【0060】

最後に、本発明は、上記に述べたカルボン酸アミドと1種以上の農薬とを混合するステップを含む、本発明の組成物の製造方法に関する。

20

【0061】

より好ましくは、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>アルキルであるカルボン酸アミドと1種以上の農薬とを混合することを含む。さらにより好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-アルキルである、特にR<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと1種以上の農薬とを混合することを含む。さらなる好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>がC<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>がC<sub>7</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと1種以上の農薬とを混合することを含む。さらなる好ましい態様において、該方法は、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が直鎖状C<sub>4</sub>-アルキルであり、R<sub>1</sub>が直鎖状C<sub>7</sub>-アルキルであるカルボン酸アミドと1種以上の農薬とを混合することを含む。

30

【0062】

好ましくは、10重量%~90重量%、好ましくは30重量%~80重量%の量の上記に述べたカルボン酸アミドと、1種以上の農薬とを混合する。

【0063】

上記に述べたようなカルボン酸アミドの製造は、当技術分野で一般に知られており、例えば以下に記載されるように、例えばアミンとカルボン酸、エステルまたは酸クロライドとを反応させることにより製造される：Mitchell、JA；Reid、EE、J. Am. Chem. Soc. 1931、1879；US 2472900；DE19650107；King、JF.；Rathore、R.、J. Am. Chem. Soc. 1992、3028。

【実施例】

40

【0064】

以下の実施例は、本発明を何ら限定することなく説明するためのものである。

【0065】

〔実験例1-カルボン酸アミドの合成〕

N,N-ジブチル-プロピオンアミド（以下、ジブチルプロピオンアミド）を、25重量%のNaOH水溶液（625g）、トルエン（160ml）およびジブチルアミン（342g）からなる2相系において合成した。この氷冷混合物に、プロピオン酸クロリド（189g）を滴下した。添加後、該反応混合物を室温で30分間攪拌した。2相を分離した。有機相を真空下で分別蒸留して、精製した生成物を得た（335g、90%収率）。

【0066】

50

N,N-ジブチル-オクタンアミド（以下、C<sub>8</sub>-ジブチルアミド）を、ディーン・スターク装置中、ジブチルアミン（194 g）およびオクタン酸（147 g）を用いて合成した。該反応混合物を、160℃まで、65時間で加熱した。続く真空蒸留により、所望の生成物を得た（212 g、83%収率）。

【0067】

N,N-ジメチル-プロピオンアミド（以下、ジメチルプロピオンアミド）はSigma Aldrichから購入し、N,N-ジエチル-プロピオンアミド（以下、ジエチルプロピオンアミド）はTCI Europeから購入した。

【0068】

〔実験例2-植物毒性〕

温室試験のために、オオムギ（品種 Lawina）を標準土壌（タイプP、細粒）中に蒔き、3週間栽培した。スプレー混合物を、実験用ドラフトにおいて、3-4葉期にある植物にミニコンプレッサーを用いて（4回）散布した。

【0069】

水（蒸留水）および実験例1で得たジブチルプロピオンアミドを含むスプレー（200 l / ha、1 haあたり1500 mlのジブチルプロピオンアミドを含む）を調製し、1.5 l / haの水散布速度で散布した。実験期間は10日間続いた。この期間中、試験植物に、散水に使用する水を介して供給される栄養素と共に、最適な散水を行った。

【0070】

植物毒性は、処理された植物に対し、未処理の植物（すなわち、水のみで処理されたもの）との比較においてスコアを与えることによって評価した（表1参照）。評価尺度は、0%～100%の植物毒性の範囲である。評価は外観検査によって行った。したがって、0%の植物毒性は、処理された植物と未処理の植物との間に違いがなかったことを意味する。溶媒添加の結果として表1に示される結果は、溶媒（すなわちカルボン酸アミド）の植物毒性を示す。0%の植物毒性の評価は、作物損傷が全くないことを意味する。1～10%の植物毒性の評価は、植物が顕著に悪影響を及ぼされず、迅速かつ完全に回復することを表し、農業従事者にとって許容されると考えられる損傷の限度である。したがって、本発明による無植物毒性とは、処理された植物が植物損傷を有さず、処理された植物と未処理の植物との間に違いがないことを意味する。本発明による低植物毒性とは、処理された植物の1～10%のみが、未処理の植物と比較して、植物損傷を有することを意味する。100%の評価は、全ての植物の完全な破壊を意味する。本発明によるカルボン酸アミドは、10%以下の植物毒性を示し、10%より少ない植物が壊死損傷を示したことを意味する。したがって、1500 ml / haの投与量において該カルボン酸アミドを植物に適用した場合、10%より少ない植物が影響を受けた。しかし、本発明のカルボン酸アミドではないジメチルプロピオンアミドを植物に適用することにより、43%までの植物が壊死損傷を示した。したがって、N,N-アルキル基が2つより多くの炭素原子を有するカルボン酸アミドは、植物に対して無植物毒性またはほぼ無植物毒性であると考えられるため、農業用組成物において、このような組成物における植物毒性を低減するために、使用され得る。

【0071】

10

20

30

40

## 【表 1】

表 1：植物毒性 [%] 処理後 10 日

カルボン酸アミド	植物毒性 [%]
— a)	0
ジメチルプロピオンアミド <sup>b)</sup>	43
ジエチルプロピオンアミド	6
ジブチルプロピオンアミド	0
C <sub>8</sub> -ジブチルアミド	5

a) 対照実験、本発明でない、カルボン酸アミドなし。

b) 比較実験、本発明でない。

10

## 【0072】

〔実験例 3 - 最大溶解性の測定〕

過飽和溶液を得るために、個々の殺菌剤をかかる溶媒に溶解させた。沈殿物をろ過により除去した。上澄み中の殺菌剤の濃度を、定量的 <sup>1</sup>H-NMR スペクトルにより測定した。

## 【表 2】

表 2：カルボン酸アミド中への異なる殺菌剤の溶解性 [%]

カルボン酸アミド	溶解性 [%] テブコナゾール	溶解性 [%] ピラクロ ストロビン	溶解性 [%] フルキサ ピロキサド
ジメチルプロピオンアミド	54	70	53
ジエチルプロピオンアミド	49	62	13
ジブチルプロピオンアミド	38	42	28
C <sub>8</sub> -ジブチルアミド	27	24	13

20



## フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I
A 0 1 P	3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04
A 0 1 P	13/00 (2006.01)	A 0 1 P 13/00
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02

(72)発明者 アレクサンダー・キUNKEL  
 ドイツ6 8 1 6 3 マンハイム、アイヒェルスハイマーシュトラッセ1 4 番

(72)発明者 ガブリエレ・シュテツフェン  
 ドイツ5 6 2 9 0 ベルトハイム、アム・ニーメスパウム4 番

審査官 高橋 直子

(56)参考文献 国際公開第2 0 1 0 / 0 7 8 8 5 2 ( W O , A 1 )  
 特表2 0 0 8 - 5 1 5 9 3 8 ( J P , A )  
 カナダ国特許出願公開第0 2 8 4 4 6 4 3 ( C A , A 1 )  
 特表2 0 0 7 - 5 0 5 8 4 4 ( J P , A )  
 特表2 0 0 7 - 5 3 4 7 1 6 ( J P , A )  
 特表2 0 0 9 - 5 3 8 9 2 9 ( J P , A )  
 国際公開第2 0 1 3 / 0 0 4 7 0 7 ( W O , A 1 )  
 中国特許出願公開第1 0 1 0 6 9 5 0 1 ( C N , A )  
 国際公開第9 5 / 0 1 5 6 8 5 ( W O , A 1 )

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

A 0 1 N	2 5 / 0 2
A 0 1 N	2 5 / 0 0
A 0 1 N	4 3 / 5 6
A 0 1 N	4 3 / 6 5 3
A 0 1 N	4 7 / 2 4
A 0 1 P	3 / 0 0
A 0 1 P	7 / 0 2
A 0 1 P	7 / 0 4
A 0 1 P	1 3 / 0 0

C A p l u s / R E G I S T R Y ( S T N )