

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4101660号
(P4101660)

(45) 発行日 平成20年6月18日 (2008.6.18)

(24) 登録日 平成20年3月28日 (2008.3.28)

(51) Int. Cl.	F I
AO 1 N 57/12 (2006.01)	AO 1 N 57/12 G
AO 1 N 25/02 (2006.01)	AO 1 N 25/02
AO 1 N 25/04 (2006.01)	AO 1 N 25/04 I O I
AO 1 N 25/22 (2006.01)	AO 1 N 25/22
AO 1 P 7/04 (2006.01)	AO 1 P 7/04

請求項の数 12 (全 8 頁)

(21) 出願番号	特願2002-586727 (P2002-586727)	(73) 特許権者	503407546
(86) (22) 出願日	平成14年5月2日 (2002.5.2)		ケミノヴァ・アクティーゼルスカブ
(65) 公表番号	特表2004-532238 (P2004-532238A)		デンマーク国 デーカー-7620 レム
(43) 公表日	平成16年10月21日 (2004.10.21)		ヴィ, ピー・オー・ボックス 9
(86) 国際出願番号	PCT/DK2002/000285	(74) 代理人	100105647
(87) 国際公開番号	W02002/089574		弁理士 小栗 昌平
(87) 国際公開日	平成14年11月14日 (2002.11.14)	(74) 代理人	100105474
審査請求日	平成16年6月15日 (2004.6.15)		弁理士 本多 弘徳
(31) 優先権主張番号	PA 2001 00708	(74) 代理人	100108589
(32) 優先日	平成13年5月7日 (2001.5.7)		弁理士 市川 利光
(33) 優先権主張国	デンマーク (DK)	(74) 代理人	100115107
			弁理士 高松 猛
		(72) 発明者	ウェンゲル, アニタ
			デンマーク国 デーカー-7620 レム
			ヴィ, ノレヴァン 6

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 保存安定性改善殺虫組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ジメトエートが無水マレイン酸により安定化することを特徴とする保存安定性の改善されたジメトエート含有殺虫組成物。

【請求項 2】

該組成物が、ジメトエート 100 重量部を基準として計算し、無水マレイン酸 0.1 ~ 2.0 重量部を含有する請求項 1 記載の殺虫組成物。

【請求項 3】

該組成物が、ジメトエート 100 重量部を基準として計算し、無水マレイン酸 1 ~ 1.5 重量部を含有する請求項 1 記載の殺虫組成物。

【請求項 4】

該組成物が、ジメトエート 100 重量部を基準として計算し、無水マレイン酸 2 ~ 1.0 重量部を含有する請求項 1 記載の殺虫組成物。

【請求項 5】

該組成物を、使用前に適切な希釈剤にて希釈するように濃厚液として調製する前記請求項のいずれか一項に記載の殺虫組成物。

【請求項 6】

該濃厚液が乳化可能な濃厚液を得るように、乳化剤と溶剤とを含有する請求項 5 記載の殺虫組成物。

【請求項 7】

ジメトエート含量が製剤重量にもとづいて95重量%までのものである請求項5または6記載の殺虫組成物。

【請求項8】

ジメトエート含量が製剤重量にもとづいて10ないし70重量%である請求項5ないし7いずれか一項に記載の殺虫組成物。

【請求項9】

ジメトエート含量が製剤重量にもとづいて20ないし60重量%である請求項5ないし8いずれか一項に記載の殺虫組成物。

【請求項10】

請求項1ないし9いずれか一項に記載の殺虫組成物を、可能な限り希釈した後に、少なくとも昆虫の成長を妨害するために適切な量で、作物の生育する地域に散布することを特徴とする昆虫の抑制方法。

10

【請求項11】

該殺虫組成物をジメトエートが1ヘクタールあたり1kgまでの量となるように作物の生育する地域に散布する請求項10記載の方法。

【請求項12】

該殺虫組成物をジメトエートが1ヘクタールあたり0.5kgまでの量となるように作物の生育する地域に散布する請求項10または11記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【0001】

本発明は保存安定性の改善された、活性化化合物としてジメトエート(Dimethoate)を含有する殺虫組成物ならびに昆虫の抑制方法に関する。本発明による殺虫組成物は農業作物および農園作物の耕作地域内での害虫、例えば、吸虫および嚙み虫などの抑制に特に有用である。

【背景技術】

【0002】

ジメトエートはその化学名がO,O-ジメチル・S-メチル・カルバモイル・メチル・ホスホラス・ジチオエートであり、望ましくない昆虫を抑制する既知化合物である。該化合物は農業作物および農園作物を攻撃する吸虫および嚙み虫の抑制に主として使用されるが、全身的に、また接触により作用する。ジメトエートを使用する場合、その主たる欠点は該化合物が熱に不安定であり、約50℃を超える温度では制御不能に分解し、最悪の場合、爆発するに至る。ジメトエートは低温でも分解し、その活性を低下させる。従って、特に温暖な気候の環境下で長期保存しても活性を失わずに抵抗するように、ジメトエート製剤を安定化することが必須である。

30

放置すると、ジメトエートは以下のメカニズムに従って、対応するS-メチル異性体に分解する：

【0003】

【化1】

40



【0004】

S-メチル異性体は哺乳類に対して毒性であることが証明されており、従って、最終産物としては望ましくない。

ジメトエートを様々な安定化剤で安定化した数種の製剤が先行文献に記載されている。

50

例えば、米国特許第 3, 090, 719 号は、芳香族炭化水素、脂肪族ケトン、環状ケトン（シクロパラフィンケトンとしても知られる）、一級アルコールの酢酸エステル、グリコールエーテルアセテート、およびリン酸トリアルキルエステルなどによりジメトエート製剤を安定化することにつき開示している。

【0005】

米国特許第 5, 234, 919 号はジメトエートを含有する安定化製剤を開示しており、そこでは低級アルキルアルコールと酢酸低級アルキルエステルからなる溶媒系を使用している。

【0006】

米国特許第 4, 892, 866 号では、シクロプロペン脂肪酸をジメトエートの安定化剤として使用しており、英国特許第 2050170-A 号ではジメトエート製剤における種々の有機酸の使用について記載がある。一方、英国特許第 1043006 号は特に、ジメトエート含有製剤の安定化のための、種々の無水物、無水酢酸、無水プロピオン酸および無水酪酸の使用に関する。

【0007】

米国特許第 3, 278, 369 号は有機リン酸系殺虫剤のジクロロボス（Dichlorvos）の乳化濃厚液の、例えば、無水酢酸または無水マレイン酸による安定化につき開示している。当該公報の実施例 2 から分かるように、無水酢酸は無水マレイン酸よりもより良好な安定化効果を示す。

【特許文献 1】米国特許第 3, 090, 719 号公報

【特許文献 2】米国特許第 5, 234, 919 号公報

【特許文献 3】米国特許第 4, 892, 866 号公報

【特許文献 4】英国特許第 2050170-A 号公報

【特許文献 5】英国特許第 1043006 号公報

【特許文献 6】米国特許第 3, 278, 369 号公報

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0008】

本発明の目的は、通常の外気温以上の温度でも保存安定性の改善された殺虫剤組成物を提供することにある。十分な保存安定性は市販用の殺虫剤にとって必須であり、最終使用時まで放置した場合に、製品の分解が低減することは財政的に非常に有利である。

【課題を解決するための手段】

【0009】

この度確立されたことは、ジメトエートを無水マレイン酸により熱分解に対して安定化し得たことである。従って、本発明はジメトエートを無水マレイン酸により安定化した殺虫組成物に関する。

【0010】

本発明はまた昆虫の抑制方法に関し、当該方法は、本発明による殺虫組成物を、可能な限り希釈した後に、少なくとも昆虫の成長を妨害するため適切な量で、作物の生育する地域に散布することを特徴とする。

【発明を実施するための最良の形態】

【0011】

以下の実施例に示すように、無水マレイン酸は無水酢酸よりも非常に良好な安定化効果を示す。関連化合物についての米国特許第 3, 278, 369 号から導かれる技術教示に照らして、無水マレイン酸が相当量の無水酢酸と比較して、ジメトエートに対し有意に良好な安定化効果を示すことは驚くべきことと見なければならぬ。無水酢酸と比較して、無水マレイン酸は従って高温での長期間の放置においても安定性を損なうことなく、少量でジメトエート製剤の安定化に使用し得る。無水マレイン酸の改善された安定化効果に加えて、不快な臭気の度合いが、製造工程に際して、またその使用時に、無水酢酸の場合に比べてより低い。

10

20

30

40

50

【 0 0 1 2 】

本発明による殺虫剤組成物は、好ましくはジメトエート100重量部を基準として計算し、無水マレイン酸0.1~20重量部を含有する。0.1重量部未満量の無水マレイン酸を使用することが、ある種の製剤では適切である可能性がある；その理由は無水マレイン酸の安定化効果の下限が確定していないからである。しかし、通常は、0.1重量部以上の無水マレイン酸濃度が十分な安定化持続性を確かなものとする上で好ましい。一部の例では、製剤中、20重量部を超える無水マレイン酸量を使用することが適切である可能性がある；その理由は無水マレイン酸の安定化効果上限が確定していないからである。しかし、一般には、ジメトエート各100重量部に対し20重量部までの無水マレイン酸含量とすれば、高い保存安定性を確保するのに十分である。より好ましくは、該殺虫剤組成物は、100重量部ジメトエートを基準として計算して、1~15重量部の無水マレイン酸を含有し、最も好ましくは該殺虫剤組成物は2~10重量部の無水マレイン酸を含有する。

10

【 0 0 1 3 】

本発明による殺虫剤組成物は、保存安定性効果を得るために、多くの異なる方法で製剤化することができる。例えば、該殺虫組成物は粒状のジメトエートと無水マレイン酸のみを含有する固形製剤として製剤化し得る。

【 0 0 1 4 】

しかし、通常は、ジメトエートと無水マレイン酸に加えて少なくとも1種のさらなる成分とともに製剤化するのが好ましい。当該少なくとも1種のさらなる成分とは、もう一つの生物学的に活性化化合物またはジメトエートに関して不活性である化合物である。不活性成分は固体または液体であり、また有機または無機のいずれでもよい。当該成分がジメトエートに関して不活性である場合には、少なくとも1種のさらなる成分は、ジメトエートを溶解、分散または乳化するのに特に適当である。

20

【 0 0 1 5 】

本発明による殺虫剤組成物は、例えば、水または油ベースの溶液、粉末、散粉物質、糊状剤、水性または油ベースの懸濁液、乳化可能濃縮液、マイクロエマルジョン、マイクロカプセル、粒剤、および水分散性粒剤などに調製し得る。剤形の選択は今後の適用に大いに左右される。本発明の一態様において、該殺虫組成物は、使用前に適当な希釈剤で希釈する濃縮液として製剤化する。取分け、該殺虫組成物は乳化可能な濃縮液として製剤化するのが好ましい。

30

【 0 0 1 6 】

液状製剤用の代表的な成分を一覧すると、取分け、鉱油、脂肪族、環状および芳香族炭化水素化合物、例えば、キシレン、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またはその誘導体化合物、アルキル化ベンゼンならびにその誘導体化合物、脂肪族、環状および芳香族アルコール、シクロヘキサノン、または高極性溶媒などである。

【 0 0 1 7 】

一部の剤形では、製剤の物理的安定性を確実にし、その製剤を使用した作物/植物が製剤を迅速に吸収するのを確かなものとするとして予測される1種以上の界面活性化合物を添加するのが望ましい。該界面活性化合物はイオン性でも非イオン性でもよい。適当な界面活性化合物を一覧すると、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の塩、および芳香族スルホン酸のアンモニウム塩、例えば、リグノ酸、フェノール酸、ナフタレン酸、またはジブチルナフタレンスルホン酸ならびに脂肪酸；アルキル酸、アルキルアリアルスルホン酸；脂肪族アルコールスルホン酸の塩；スルホン化ナフタレンとホルムアルデヒドからなる誘導体化合物との縮合物；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ならびに脂肪族アルコール/エチレンオキシド縮合物、およびソルビトールエステルである。

40

【 0 0 1 8 】

粉末および散粉物質は、ジメトエートおよび無水マレイン酸を、可能であれば1種以上の固形賦形剤とともに混合または粉碎することにより、または固形賦形剤をジメトエート

50

および無水マレイン酸との揮発性溶媒の溶液で飽和させ、溶媒を蒸発させ、可能な限り生成物を粉碎して粉末とすることにより得ることができる。粒剤は上記のように調製した粉末を顆粒化するか、またはジメトエートと無水マレイン酸を固形賦形剤に吸収させることにより得ることができる。適当な固形賦形剤の例は、アルミノ-シリケート、タルカム、か焼酸化マグネシウム、珪藻土およびカオリン、ベントナイトなどの粘土タイプである。

【0019】

本発明による殺虫組成物は、所望により、消泡剤、保護コロイド、濃厚化剤、UV-吸収剤、色素、腐食抑制剤、および他の殺虫剤活性化化合物を含有していてもよい。

【0020】

本発明による殺虫組成物は、昆虫を抑制しようとする地域に拡散することによる即時使用のために、固形および液状の製剤からなり、高濃縮液状製剤は通常その使用前に希釈する。

【0021】

該濃縮液は製剤の重量を基準に95重量%までのジメトエートを、好ましくは10~70重量%、より好ましくは20~60重量%のジメトエートを含有し得る。多くの場合、使用前に選択した適切な組成物、通常は水で希釈した後のジメトエート含量は当面の目的により変わり得るが、一般には、その使用量は1ヘクタール当たり1kgまでのジメトエート、好ましくは1ヘクタール当たり0.5kgまでの散布に相当する。

【0022】

本発明による製剤は非常に多くの昆虫類、特に農作物および農園作物の地域に成育する吸虫および嚙み虫の抑制に適用するが、望ましくない昆虫で汚染された他の場所、例えば、昆虫が生息するか、または卵が孵化している区域にも有利に使用し得る。

【0023】

以下の実施例は本発明の実施方法を説明するが、如何なる方法でもその境界を限定するものではない。

【実施例1】

【0024】

下記表の成分を指示量混合することにより、ジメトエートを含有する3種の乳化可能な濃縮液(Ia、IbおよびIc)を調製した。当該量は重量部である。

【0025】

【表1】

成分	I a	I b	I c
ジメトエート	38.8	38.7	38.7
シクロヘキサノン	43.2	43.1	43.1
キシレン	13.2	12.5	12.5
ベロール992 (アルコキシル化アルコール-乳化剤)	4.8	4.75	4.75
無水マレイン酸	0	0	0.95
無水酢酸	0	0.95	0

【0026】

製剤Iaはジメトエートを安定化する化合物を一切含まず、一方、製剤Ibでは無水酢酸を安定剤として使用する。製剤IaおよびIbは本発明によるものではないが、製剤I

10

20

30

40

50

c (本発明製剤)との比較例とする。

これらの製剤を異なる温度で様々な期間保存し、それに基づき、ジメトエートの分解を比例案分して判定した。その結果を表1に示す。

【0027】

【表2】

表1

ジメトエートの分解%							
54℃で14日間			40℃で3ヶ月間			30℃で1年間	
I a	I b	I c	I a	I b	I c	I a	I c
8.0	2.4	1.2	7.8	7.2	1.3	9.1	5.8

10

【0028】

表1の結果は、54で14日間保存した後のジメトエートで、無水酢酸と比較したとき、無水マレイン酸により2倍の安定化効果が得られたことを示す。40で3ヶ月間保存した場合、得られる保存安定性が無水マレイン酸では、無水酢酸よりも5倍以上良好であった。30で1年間の保存後、その産物は安定剤を使用しない産物と比べて、なお分解度が低いことを示す。

【実施例2】

20

【0029】

数種の製剤を実施例1の方法と同様に調製した。この場合、無水物含量を変化させ、製剤重量を基準に、0.5重量%、1重量%、2重量%、および3重量%とした。当該無水マレイン酸濃度は、ジメトエート100重量部に対して、それぞれ1.2重量部、2.5重量部、4.9重量部および7.4重量部の無水マレイン酸に相当する。安定性を比較するという理由で、対応する製剤では無水マレイン酸を無水酢酸に置換えて調製した。結果は表2から明らかである。

【0030】

【表3】

30

表2

製剤中の安定剤含量	ジメトエートの分解%			
	無水酢酸		無水マレイン酸	
	54℃14日	40℃3ヶ月	54℃14日	40℃3ヶ月
0.5重量%	4.2	13.5	4.1	3.4
1重量%	2.4	7.2	1.2	1.3
2重量%	2.1	4.3	—	1.1
3重量%	1.6	4.1	0	1.1

40

【0031】

表2の結果は0.5重量%の無水マレイン酸含量ですでに安定化効果が明白となることを示す。無水酢酸と比較して、40で3ヶ月保存した場合、0.5重量%という低い濃度で無水マレイン酸の安定化効果が特に明瞭である。無水マレイン酸の安定化効果は、見かけ上完全な分解抑制が5414日間という比較的短期間で得られるまで製剤中の濃度を上げることで改善する。40で3ヶ月間の保存に基づき、最大可能な安定化が2重量%の無水マレイン酸濃度で得られるように思われる；その理由は無水マレイン酸の量を増やしても、ジメトエートの分解量がさらに低下することがないからである。

50

【実施例 3】

【0032】

乳化剤を含まない濃縮液は、最初に 547 g のジメトエートを 444 g のシクロヘキサノンに溶解することにより調製した。次いで、安定剤として 1 重量%の無水マレイン酸を添加混合するが、これはジメトエート 100 重量部を基準として無水マレイン酸 1.6 重量部に相当する。3 重量%および 5 重量%の無水マレイン酸を含む相当する化合物を調製したが、この場合はジメトエート 100 重量部を基準として、それぞれ無水マレイン酸 4.9 重量部および 8.2 重量部に相当する。安定性を比較するという理由で、安定剤を含まない化合物も調製した。

【0033】

調製した化合物は 54 で 14 日間保存し、それに基づき、ジメトエートの分解を比例案分して判定した。その結果を表 3 に示す。

【0034】

【表 4】

表 3

製剤中安定剤含量	54℃ 14 日後のジメトエート分解比
0	9.0
1 重量%	1.7
3 重量%	1.2
5 重量%	0.7

【0035】

表 3 から明らかなように、安定剤含量が増加するにつれ、ジメトエート、溶媒（シクロヘキサノン）および安定剤（無水マレイン酸）を含む液状組成物は、より低い分解とそれによる長期の耐久性を示す。最大可能な安定化の上限は確立されていない。

10

20

30

フロントページの続き

(72)発明者 ニールセン, ヴィタ
デンマーク国 デーカー - 7 6 2 0 レムヴィ, アルモセヴェ 6 2

審査官 櫛引 智子

(56)参考文献 特公昭42 - 025439 (JP, B1)
特開昭56 - 002903 (JP, A)
特開平03 - 086891 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 25/22
A01N 57/12
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)
JST7580(JDream2)
JSTPlus(JDream2)