

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6748081号
(P6748081)

(45) 発行日 令和2年8月26日(2020.8.26)

(24) 登録日 令和2年8月11日(2020.8.11)

(51) Int.Cl.		F I	
AO 1 N 43/40	(2006.01)	AO 1 N 43/40	I O 1 E
AO 1 P 3/00	(2006.01)	AO 1 P 3/00	
AO 1 N 43/653	(2006.01)	AO 1 N 43/653	Q
AO 1 N 47/24	(2006.01)	AO 1 N 47/24	G

請求項の数 22 (全 37 頁)

(21) 出願番号 特願2017-534551 (P2017-534551)
 (86) (22) 出願日 平成27年12月30日(2015.12.30)
 (65) 公表番号 特表2018-502102 (P2018-502102A)
 (43) 公表日 平成30年1月25日(2018.1.25)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2015/068019
 (87) 国際公開番号 W02016/109641
 (87) 国際公開日 平成28年7月7日(2016.7.7)
 審査請求日 平成30年12月17日(2018.12.17)
 (31) 優先権主張番号 62/098,224
 (32) 優先日 平成26年12月30日(2014.12.30)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 62/098,199
 (32) 優先日 平成26年12月30日(2014.12.30)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 米国 (US)

(73) 特許権者 501035309
 ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ
 ー
 アメリカ合衆国 インディアナ州 462
 68, インディアナポリス, ジオンス
 ヴィレ ロード, 9330
 (74) 代理人 100092783
 弁理士 小林 浩
 (74) 代理人 100095360
 弁理士 片山 英二
 (74) 代理人 100120134
 弁理士 大森 規雄
 (74) 代理人 100139310
 弁理士 吉光 真紀

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺真菌性組成物

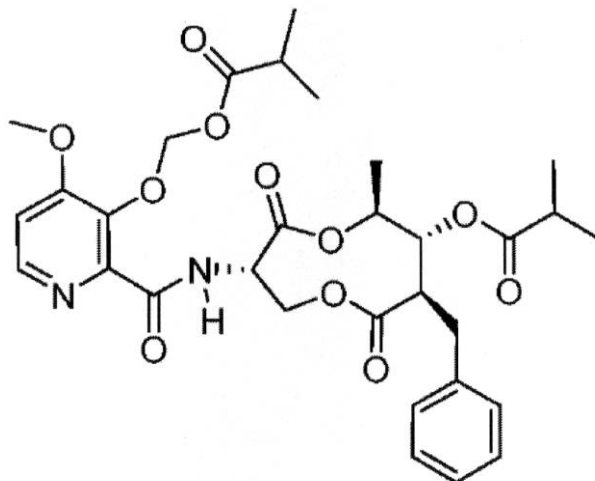
(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

真菌性植物病原体または病害を防除する方法であって、真菌病原体の増殖または病害を予防するために、植物またはその隣接領域を、

a) 式

【化1】



の殺真菌性化合物と；

b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と；

c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と；

d) 50 g / L から 700 g / L までの酢酸ベンジルと；

e) 少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドと；

f) アセトフェノン、シクロヘキサノン、2 - ヘプタノン、2 - ヘプタノール、2 - エチルヘキサノール、およびオレイルアルコールからなる群から選択される、25 g / L から 150 g / L までの少なくとも1種の有機溶媒と

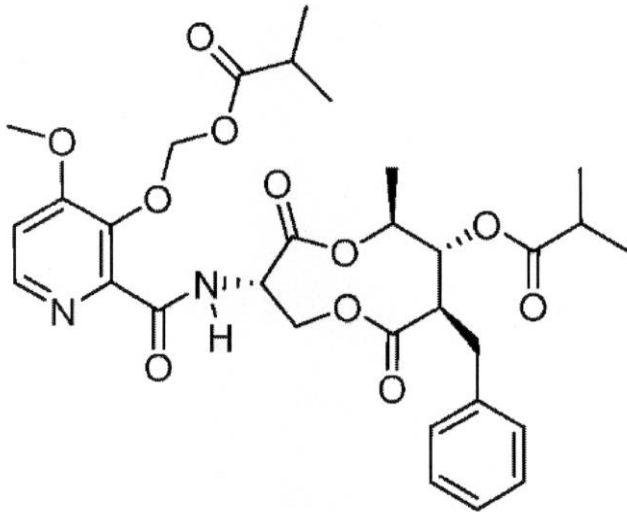
を含む殺真菌性組成物の殺真菌的に有効な量と接触させるステップを含む方法。

10

【請求項2】

前記殺真菌性組成物が、1グラム / リットル (g / L) から 200 g / L までの式

【化2】



20

の前記殺真菌性化合物を含む、請求項1に記載の方法。

30

【請求項3】

前記殺真菌性組成物が、1 g / L から 100 g / L までの少なくとも1種のイオン性界面活性剤を含み、前記少なくとも1種のイオン性界面活性剤は、少なくとも1種の陰イオン性界面活性剤を含む、請求項1または2に記載の方法。

【請求項4】

前記殺真菌性組成物が、1 g / L から 200 g / L までの前記少なくとも1種の非イオン性界面活性剤を含む、請求項1から3のいずれかに記載の方法。

【請求項5】

前記殺真菌性組成物が、300 g / L から 500 g / L までの酢酸ベンジルを含む、請求項1から4のいずれかに記載の方法。

40

【請求項6】

前記殺真菌性組成物が、25 g / L から 300 g / L までの前記少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドを含み、前記少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドは、N, N - ジメチル脂肪酸アミドを含む、請求項1から5のいずれかに記載の方法。

【請求項7】

前記殺真菌性組成物が、酢酸ベンジルと、前記少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドと、水不混和性有機溶媒を共に形成する前記少なくとも1種の有機溶媒とを含む、請求項1から6のいずれかに記載の方法。

【請求項8】

50

酢酸ベンジル：前記少なくとも1種のN，N - ジアルキルカルボキサミド：前記少なくとも1種の有機溶媒の重量比が、1 ~ 10 : 1 ~ 10 : 1 ~ 10の範囲である、請求項1から7のいずれかに記載の方法。

【請求項9】

酢酸ベンジル：前記N，N - ジアルキルカルボキサミド：前記少なくとも1種の有機溶媒の重量比が、4 ~ 6 : 1 ~ 3 : 1 ~ 2の範囲である、請求項1から8のいずれかに記載の方法。

【請求項10】

前記少なくとも1種のN，N - ジアルキルカルボキサミドが、N，N - ジメチルヘキサ
ンアミド、N，N - ジメチルオクタンアミド、N，N - ジメチルデカンアミドおよびN，
N - ジメチルドデカンアミドからなる群から選択される、請求項1から9のいずれかに記
載の方法。

10

【請求項11】

前記少なくとも1種の有機溶媒が、アセトフェノン、シクロヘキサノン、2 - エチルヘ
キサノールおよび2 - ヘプタノールからなる群から選択される、請求項1から10のい
ずれかに記載の方法。

【請求項12】

前記水不混和性有機溶媒が、酢酸ベンジル、脂肪酸N，N - ジアルキルカルボキサミド
の1種または複数およびシクロヘキサノンを含む、請求項1から11のいずれかに記載の
方法。

20

【請求項13】

殺真菌性組成物が、少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物をさらに含む、請求項1か
ら12のいずれかに記載の方法。

【請求項14】

前記少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物が、アゾキシストロビン、ビフジュンジ (bifujunzhi)、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネ
ストロプリン、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フェナミンストロビン、フェノキ
シストロビン、フルフェノキシストロビン、フルオキサストロビン、ジアシャンジュンジ
(jiaxiangjunzhi)、クレソキシム - メチル、マンデストロビン (mandestrobin)、メト
ミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメ
トストロビン、ピラオキシストロビン、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、トリフ
ロキシストロビン、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、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、エポ
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
アホール、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、オキシポコナゾール、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、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、ピリミジン、フェナリモール、ヌア
リモール、ピリフェノックス、およびトリホリンからなる群から選択される、請求項13
に記載の方法。

30

40

【請求項15】

前記少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物が、アゾキシストロビン、クレソキシム -
メチル、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、エポキシ
コナゾール、フェンブコナゾール、ミクロブタニル、プロピコナゾール、プロチオコナゾ
ール、およびテブコナゾールからなる群から選択される、請求項13または14に記載の
方法。

【請求項16】

前記少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物が、ピラクロストロビン、プロチオコナゾ

50

ールおよびプロピコナゾールからなる群から選択される、請求項 13 から 15 のいずれかに記載の方法。

【請求項 17】

殺真菌性組成物が、非イオン性界面活性剤、ポリエーテル変性オルガノポリシロキサンおよびアルキルホスホネートからなる群から選択される、前記殺真菌性組成物の殺真菌性を改善するアジュバントをさらに含む、請求項 1 から 15 のいずれかに記載の方法。

【請求項 18】

前記真菌性植物病原体が、コムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、コムギ黄さび病 (*Puccinia striiformis*)、ヴェンチュリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*)、ウスティラゴ・マイデイス (*Ustilago maydis*)、ウンシヌラ・ネカトル (*Ucinula necator*)、雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*)、ふ枯病菌 (*Leptosphaeria nodorum*)、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*)、モニリニア・フルクティコラ (*Monilinia fructicola*)、シュードペロノスポラ・キューベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)、眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*)、ムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis tritici*)、オオムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis hordei*)、エリシフェ・シコラセアルム (*Erysiphe cichoracearum*)、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*)、グロメララ・ラゲナリウム (*Glomerella lagenarium*)、セルコスポラ・ベティコーラ (*Cercospora beticola*)、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*)、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、プラスモパラ・ヴィティコーラ (*Plasmopara viticola*)、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)、および網斑病菌 (*Pyrenophora teres*) を含む、請求項 1 から 17 のいずれかに記載の方法。

【請求項 19】

前記真菌の植物病害が、炭疽病、イモチ病、ボトリチス病、赤さび病、火ぶくれ病、褐色腐れ、べと病、フザリウム病、ウドンコ病、さび病、ふ枯病、汚斑病、網斑病、根茎腐敗病、黄さび病、黒星病、眼紋病、斑点病、夏疫病および葉枯れ病を含む、請求項 1 から 18 のいずれかに記載の方法。

【請求項 20】

前記少なくとも 1 種のイオン性界面活性剤が、アルキルアリアルスルホン酸のアルカリ塩、アルカリ土類塩およびアンモニウム塩からなる群から選択される陰イオン性界面活性剤である、請求項 1 から 19 のいずれかに記載の方法。

【請求項 21】

前記少なくとも 1 種の非イオン性界面活性剤が、アルコール開始 EO / PO ブロックコポリマーおよびアルコールエトキシレートからなる群から選択される、請求項 1 から 20 のいずれかに記載の方法。

【請求項 22】

前記殺真菌性組成物が、酢酸ベンジル、1 種または複数の脂肪酸 N, N - ジアルキルカルボキサミド、シクロヘキサノン、および 2 - エチルヘキサノールを含む、請求項 1 から 21 のいずれかに記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

優先権主張

本出願は、それらの全ての完全な開示が参照により本明細書に明示的に組み込まれている 2014 年 12 月 30 日に出願された米国仮特許出願第 62 / 098, 199 号、2014 年 12 月 30 日に出願された米国仮特許出願第 62 / 098, 202 号、および 2014 年 12 月 30 日に出願された米国仮特許出願第 62 / 098, 224 号の利益を主張

10

20

30

40

50

する。

【0002】

本発明の一部の態様は、農業での使用に適した、殺真菌剤の使用方法に関する。

【背景技術】

【0003】

2種以上の活性成分を含む液体プレミックス濃縮物は、多種多様な農業用途で有用である。例えば、個々の活性成分単独と比較して、より広範囲の有害生物を防除するためにまたは複数の作用機序を利用するために、2種以上の殺有害生物活性成分を組み合わせることができる。

【0004】

水不溶性の殺有害生物剤活性成分は、水性懸濁液濃縮物（SC）として水中で、または有機溶媒中に水不溶性殺有害生物剤を溶解させ、乳剤（EC）を形成することによって製剤化することができる。これらの液体プレミックス濃縮物を調製することは、化学的および/または物理的不安定性の問題のために困難な場合がある。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

エマルジョン濃縮物またはECとしても公知の乳剤製剤は、作物保護において広く使用されている。一部の乳剤の欠点としては、濃縮物中の一部の活性成分の溶解度が低いことにより、それらの低温安定性が劣ること、および活性成分の結晶化傾向が顕著であることが挙げられる。本開示は、これらの欠点を克服する乳剤を提供することを一目的とした。

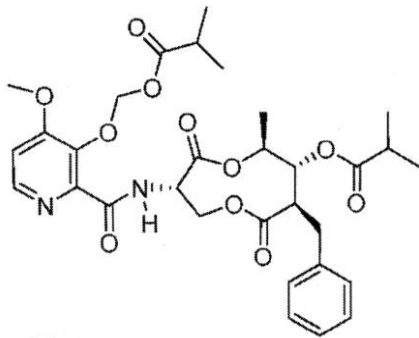
【課題を解決するための手段】

【0006】

a) 式

【0007】

【化1】



の殺真菌性化合物と； b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と； c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と； d) 酢酸エステルと； e) N, N - ジアルキルカルボキサミドと； f) ケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む殺真菌性組成物が、本明細書に提供される。

【0008】

ある特定の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物を含むことができる。

【0009】

ある特定の実施形態では、少なくとも1種の酢酸エステルと、少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドと、ケトンおよびアルコールの少なくとも一方とが、上述の殺真菌性組成物向けに水不混和性有機溶媒を共に形成している。

【0010】

ある特定の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、水に添加されると、殺真菌性化合物が結晶化することなく、容易に乳化しかつ安定なエマルジョンを形成する、安定で均一

10

20

30

40

50

な乳剤を形成する。

【0011】

ある特定の実施形態では、上述の組成物は組成物の殺真菌性能を改善するアジュバントを含むことができる。

【0012】

ある特定の実施形態では、上述の組成物は、追加の活性成分および/または不活性製剤成分を含むことができる。

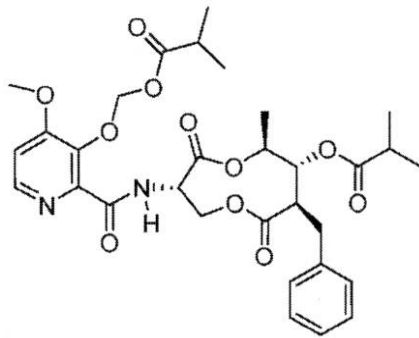
【0013】

植物由来の真菌病原体または病害を防除する方法であって、真菌病原体の増殖または病害を予防するために、植物またはその隣接領域を、a)式

10

【0014】

【化2】



20

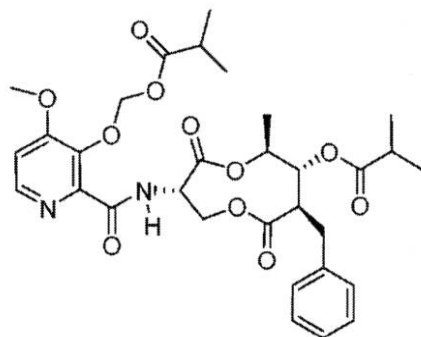
の殺真菌性化合物と； b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と； c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と； d) 酢酸エステルと； e) N, N - ジアルキルカルボキサミドと； f) ケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む殺真菌性組成物の殺真菌的に有効な量と接触させるステップを含む方法も本明細書に提供される。

【0015】

真菌性植物病原体または植物の病害を防除する方法であって、真菌病原体の増殖または病害を予防するために、植物またはその隣接領域を、a)式

【0016】

【化3】



40

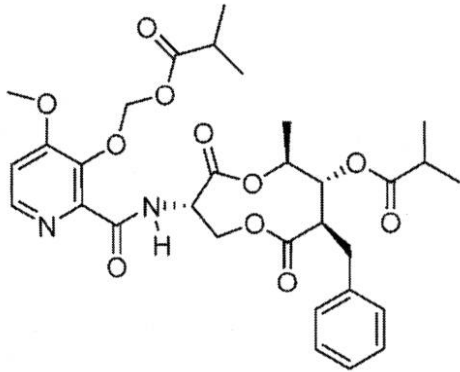
の殺真菌性化合物と； b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と； c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と； d) 少なくとも1種の酢酸エステルと； e) 少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドと； f) ケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む殺真菌性組成物の殺真菌的に有効な量と接触させるステップを含む方法を含む第1の実施形態。

【0017】

殺真菌性組成物が、約1グラム/リットル(g/L)から約200g/Lまでの式

【0018】

【化4】



10

の殺真菌性化合物を含む、第1の実施形態の方法を含む第2の実施形態。

【0019】

殺真菌性組成物が、約1g/Lから約100g/Lまでの少なくとも1種のイオン性界面活性剤を含み、少なくとも1種のイオン性界面活性剤は、少なくとも1種の陰イオン性界面活性剤を含む、第1または第2の実施形態のいずれかの方法のいずれかを含む第3の実施形態。

【0020】

殺真菌性組成物が、約1g/Lから約200g/Lまでの少なくとも1種の実施形態の非イオン性界面活性剤を含む、第1から第3の実施形態のいずれかの方法のいずれかを含む第4の実施形態。

20

【0021】

殺真菌性組成物が、約50g/Lから約700g/Lまでの少なくとも1種の酢酸エステルを含む、第1から第4の実施形態の方法のいずれかを含む第5の実施形態。

【0022】

殺真菌性組成物が、約25g/Lから約300g/Lまでの少なくとも1種のN,N-ジアルキルカルボキサミドを含み、少なくとも1種のN,N-ジアルキルカルボキサミドは、N,N-ジメチル脂肪酸アミドを含む、第1から第5の実施形態の方法のいずれかを含む第6の実施形態。

30

【0023】

殺真菌性組成物が、約25g/Lから約150g/Lまでのケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む、第1から第6の実施形態の方法のいずれかを含む第7の実施形態。

【0024】

殺真菌性組成物が、少なくとも1種の酢酸エステルと、少なくとも1種のN,N-ジアルキルカルボキサミドと、ケトンおよびアルコールの少なくとも一方とを含み、水不混和性有機溶媒を共に形成している、第1から第7の実施形態の方法のいずれかを含む第8の実施形態。

【0025】

少なくとも1種の酢酸エステル：少なくとも1種のN,N-ジアルキルカルボキサミド：ケトンおよびアルコールの少なくとも一方の重量比が約1~10：1~10：1~10の範囲である、第1から第8の実施形態の方法のいずれかを含む第9の実施形態。

40

【0026】

少なくとも1種の酢酸エステル：N,N-ジアルキルカルボキサミド：ケトンおよびアルコールの少なくとも一方の重量比が約4~6：1~3：1~2の範囲である、第1から第9の実施形態の方法のいずれかを含む第10の実施形態。

【0027】

少なくとも1種の酢酸エステルが、酢酸ベンジル、酢酸シクロヘキシルメチルおよび酢酸フェニルからなる群から選択される、第1から第10の実施形態の方法のいずれかを含

50

む第 1 1 の実施形態。

【 0 0 2 8 】

少なくとも 1 種の N , N - ジアルキルカルボキサミドが、N , N - ジメチルヘキサミアミド、N , N - ジメチルオクタミアミド、N , N - ジメチルデカミアミドおよび N , N - ジメチルドデカミアミドからなる群から選択される、第 1 から第 1 0 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 2 の実施形態。

【 0 0 2 9 】

ケトンおよびアルコールの少なくとも一方が、アセトフェノン、シクロヘキサノン、2 - エチルヘキサノールおよび 2 - ヘプタノールからなる群から選択される、第 1 から第 1 2 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 3 の実施形態。

10

【 0 0 3 0 】

水不混和性有機溶媒が酢酸ベンジル、脂肪酸 N , N - ジアルキルカルボキサミドの 1 種または複数およびシクロヘキサノンを含む、第 1 から第 1 3 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 4 の実施形態。

【 0 0 3 1 】

殺真菌性組成物が少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物をさらに含む、第 1 から第 1 4 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 5 の実施形態。

【 0 0 3 2 】

少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物が、アゾキシストロビン、ピフジュンジ (bifujunzhi)、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロブリン、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フェナミンストロビン、フェノキシストロビン、フルフェノキシストロビン、フルオキサストロビン、ジアシャンジュンジ (jiaxiangjunzhi)、クレソキシム - メチル、マンDESTロビン (mandestrobin)、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、トリフロキシストロビン、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、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、エポキシコナゾール、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、イプコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、オキシポコナゾール、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、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、ピリミジン、フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノックス、およびトリホリンからなる群から選択される、第 1 5 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 6 の実施形態。

20

30

【 0 0 3 3 】

少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物が、アゾキシストロビン、クレソキシム - メチル、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、ミクロブタニル、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、およびテブコナゾールからなる群から選択される、第 1 5 または第 1 6 の実施形態の方法のいずれかを含む第 7 の実施形態。

40

【 0 0 3 4 】

少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物が、ピラクロストロビン、プロチオコナゾールおよびプロピコナゾールからなる群から選択される、第 1 5 から第 1 7 の実施形態の方法のいずれかを含む第 1 8 の実施形態。

【 0 0 3 5 】

殺真菌性組成物が、非イオン性界面活性剤、ポリエーテル変性オルガノポリシロキサンおよびアルキルホスホネートからなる群から選択される、殺真菌性組成物の殺真菌性能を改善するアジュバントをさらに含む、第 1 から第 1 8 の実施形態の方法のいずれかを含む

50

第 19 の実施形態。

【 0 0 3 6 】

真菌性植物病原体が、コムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、コムギ黄さび病 (*Puccinia striiformis*)、ヴェンチュリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*)、ウスティラゴ・マイデイス (*Ustilago maydis*)、ウンシヌラ・ネカトル (*Ucinula necator*)、雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*)、ふ枯病菌 (*Leptosphaeria nodorum*)、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*)、モニリニア・フルクティコラ (*Monilinia fructicola*)、シュードペロノスポラ・キューベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)、眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*)、ムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis tritici*)、オオムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis hordei*)、エリシフェ・シコラセアルム (*Erysiphe cichoracearum*)、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*)、グロメララ・ラゲナリウム (*Glomerella lagenarium*)、セルコスポラ・ベティコーラ (*Cercospora beticola*)、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*)、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、プラスモパラ・ヴィティコラ (*Plasmopara viticola*)、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)、および網斑病菌 (*Pyrenophora teres*) を含む、第 1 から第 19 の実施形態の方法のいずれかを含む第 20 の実施形態。

10

20

【 0 0 3 7 】

真菌の植物病害が、炭疽病、イモチ病、ボトリチス病、赤さび病、火ぶくれ病 (*blistersm*)、褐色腐れ、べと病、フザリウム病、ウドンコ病、さび病、ふ枯病 (*glume blotch*)、汚斑病、網斑病、根茎腐敗病、黄さび病、黒星病、眼紋病、斑点病、夏疫病および葉枯れ病を含む、第 1 から第 20 の実施形態の方法のいずれかを含む第 21 の実施形態。

【 0 0 3 8 】

少なくとも 1 種のイオン性界面活性剤が、アルキルアリアルスルホン酸のアルカリ塩、アルカリ土類塩およびアンモニウム塩からなる群から選択される陰イオン性界面活性剤である、第 1 から第 21 の実施形態の方法のいずれかを含む第 22 の実施形態。

【 0 0 3 9 】

少なくとも 1 種の非イオン性界面活性剤が、アルコール開始 EO / PO ブロックコポリマーおよびアルコールエトキシレートからなる群から選択される、第 1 から第 22 の実施形態の方法のいずれかを含む第 23 の実施形態。

30

【 発明を実施するための形態 】

【 0 0 4 0 】

少なくとも 1 種の殺真菌性化合物と、2 種以上の界面活性剤と、酢酸エステル、N, N - ジアルキルカルボキサミドならびにケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む有機化合物の混合物で構成される水不混和性有機溶媒とを含む、乳剤 (すなわち、エマルジョン濃縮物または EC) の形態にある殺真菌性組成物が本明細書に記載される。上述の殺真菌性組成物は、良好な貯蔵安定性を示し、噴霧水溶液中に希釈すると、安定で均一なエマルジョンを容易に形成する。上述の殺真菌性組成物は、噴霧施用で利用されるとき、重要な真菌性病害であるコムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*) (コムギの汚斑病) およびコムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*) (コムギ赤さび病) の保護的および治療的防除を示す。

40

【 0 0 4 1 】

他に明示的または暗黙的に記載されていない限り、本明細書で使用される用語「約」とは、プラスまたはマイナス 10 パーセントを意味する。例えば、「約 1.0」は 0.9 ~ 1.1 の範囲を包含する。

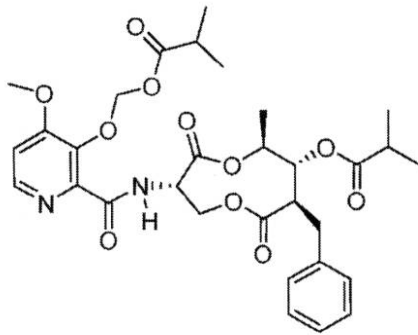
【 0 0 4 2 】

a. 式

50

【 0 0 4 3 】

【 化 5 】



10

の殺真菌性化合物と； b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と； c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と； d) 少なくとも1種の酢酸エステルと； e) 少なくとも1種のN, N - ジアルキルカルボキサミドと； f) ケトンおよびアルコールの少なくとも一方とを含む殺真菌性組成物が、本明細書に提供される。

【 0 0 4 4 】

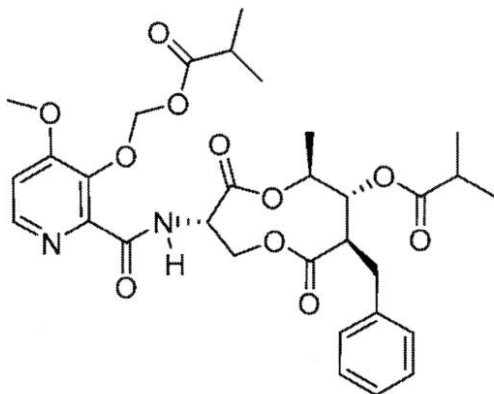
A . 第1の殺真菌性化合物

本明細書に記載の殺真菌性組成物は、式

【 0 0 4 5 】

20

【 化 6 】



30

の第1の殺真菌性化合物で構成され、これは、米国特許第6,861,390号明細書(その開示は、参照によりその全体が本明細書に組み込まれている)に記載の天然物UK-2Aの化学的誘導体であり、かつChemical Abstracts(CAS)番号517875-34-2およびCAS名:プロパン酸、2-メチル-, [[4-メトキシ-2-[[[(3S,7R,8R,9S)-9-メチル-8-(2-メチル-1-オキソプロポキシ)-2,6-ジオキソ-7-(フェニルメチル)-1,5-ジオキソナン-3-イル]アミノ]カルボニル]-3-ピリジニル]オキシ]メチルエステルを有する。第1の殺真菌性化合物は、例えば、コムギ葉枯病菌(*Septoria tritici*)(SEPTTR; コムギの汚斑病)およびコムギ赤さび病菌(*Puccinia triticina*)(PUCCRT; コムギ赤さび病)などのある特定の真菌性病害の生物学的防除を示す。第1の殺真菌性化合物は、本明細書では化合物Aという。

40

【 0 0 4 6 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、組成物に対して、化合物Aの、約1グラム活性成分毎リットル(g ai / L)から約200 g ai / Lまで、約5 g ai / Lから約175 g ai / Lまで、約10 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約125 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約100 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約30 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約40 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約40 g ai / Lから約80

50

g a i / L まで、約 4 5 g a i / L から約 7 5 g a i / L まで、または約 5 0 g a i / L から約 7 0 g a i / L までを含むことができる。本明細書に記載の殺真菌性組成物はまた、組成物に対して、化合物 A の、約 3 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 4 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 6 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 7 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 8 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 9 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 1 0 0 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 1 2 5 g a i / L から約 1 5 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 4 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 3 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 2 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 1 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 1 0 0 g a i / L まで、約 5 0 g a i / L から約 9 0 g a i / L まで、または約 5 0 g a i / L から約 8 0 g a i / L までを含むことができる。

【 0 0 4 7 】

B . 界面活性剤

本明細書に記載の殺真菌性組成物は、イオン性界面活性剤および非イオン性界面活性剤のそれぞれの 1 種または複数を含み得る複数の界面活性剤を含むことができる。そのような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透剤、保護コロイドとして、または他の目的に使用され得る。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.) に列記されている。上述の殺真菌性組成物は乳剤 (E C) であるので、E C を噴霧水に添加する場合これを乳化するために界面活性剤が使用され、したがって、この E C は、標的有害生物を防除するために噴霧施用により容易に適用し得る安定で均一なエマルジョンを形成する。

【 0 0 4 8 】

本明細書に記載の殺真菌性組成物で使用するのに適したイオン性界面活性剤としては、スルホネート (sulfonate)、サルフェート (sulfate)、ホスフェート (phosphate)、カルボキシレート (carboxylate) のアルカリ塩、アルカリ土類塩またはアンモニウム塩、およびそれらの混合物などの陰イオン性界面活性剤を挙げることができる。スルホネート (sulfonate) の例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ - オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸および油のスルホネート、エトキシ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシルベンゼンおよびトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホネート、スルホサクシネート (sulfosuccinate) またはスルホサクシナメート (sulfosuccinamate) である。サルフェート (sulfate) の例は、脂肪酸および油のサルフェート、エトキシ化アルキルフェノールのサルフェート、アルコールのサルフェート、エトキシ化アルコールのサルフェート、または脂肪酸エステルのサルフェートである。ホスフェート (phosphate) の例は、ホスフェートエステルである。カルボキシレート (carboxylate) の例は、アルキルカルボキシレート、およびカルボキシ化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレートである。好ましい陰イオン性界面活性剤は、サルフェート (sulfate) およびスルホネート (sulfonate) である。

【 0 0 4 9 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物で使用するイオン性界面活性剤としては、アルキルアリールスルホン酸のアルカリ塩、アルカリ土類塩またはアンモニウム塩、例えば、ドデシルベンゼンおよび / またはトリデシルベンゼンのスルホネート塩、ナフタレンおよび / またはアルキルナフタレンのスルホネート塩、ならびにスルホサクシネート (sulfosuccinate) および / またはスルホサクシナメート (sulfosuccinamate) の塩などの、陰イオン性界面活性剤を挙げることができる。一部の実施形態では、イオン性界面活性剤は、アルキルアリールスルホネートのアルカリ土類塩である。一部の実施形態では、イオン性界面活性剤は、Huntsman International LLC

10

20

30

40

50

製 (The Woodlands, TX) の Nansa (登録商標) EVM 70/2E として入手可能なドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムである。

【0050】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約1グラム/リットル (g/L) から約100 g/Lまで、約5 g/Lから約100 g/Lまで、約10 g/Lから約100 g/Lまで、約20 g/Lから約100 g/Lまで、約30 g/Lから約100 g/Lまで、約30 g/Lから約90 g/Lまで、約30 g/Lから約80 g/Lまで、約40 g/Lから約70 g/Lまで、約50 g/Lから約70 g/Lまで、または約55 g/Lから約65 g/Lまでのイオン性界面活性剤の少なくとも1種を含むことができる。

10

【0051】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、非イオン性界面活性剤である界面活性剤を含むことができる。本明細書に記載の殺真菌性組成物で使用するのに適した非イオン性界面活性剤としては、アルコキシレート (alkoxylate)、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖をベースとした界面活性剤、ポリマー界面活性剤およびそれらの混合物を挙げることができる。アルコキシレート (alkoxylate) の例は、1から50モル当量までのアルコキシル化剤、例えばエチレンオキシド (EO) および/またはプロピレンオキシド (PO) でアルコキシル化された、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸、または脂肪酸エステルなどの化合物である。

20

【0052】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、例えばアルコール開始EO/POブロックコポリマー、例えばブタノール開始EO/POブロックコポリマー (これは、ポリアルキレングリコールモノブチルエーテル、ポリ (エチレングリコール-コ-プロピレングリコール) モノブチルエーテル、またはプロピレンオキシドエチレンオキシドポリマーモノブチルエーテルとしても公知の場合もある) などのアルコキシレート (alkoxylate) である非イオン性界面活性剤を含むことができる。一部の実施形態では、ブタノール開始EO/POブロックコポリマーは、約20から約30までのエトキシル化度および約20から約30までのプロポキシル化度を有することができる。これらのEO/POブロックコポリマーの適例としては、Stepan (Northfield, IL) から入手可能なToximul (登録商標) 8320、Huntsman International LLC (The Woodlands, TX) から入手可能なTermul (登録商標) 5429、Dow Chemical (Midland, MI) から入手可能なTergitol (商標) XD、およびAkzoNobel (Chicago, IL) から入手可能なEthylan (商標) NS 500LQを挙げることができる。

30

【0053】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、例えば、4-プトキシ-1-ブタノール開始EO/POブロックコポリマー (CAS番号99821-01-9) (Atlas (商標) G5000およびAtlas (商標) G5002Lがその例であり、Croda (Edison, NJ) から入手可能である) のようなアルコール開始EO/POブロックコポリマーなどのアルコキシレート (alkoxylate) である非イオン性界面活性剤を含むことができる。一部の実施形態では、4-プトキシ-1-ブタノール開始EO/POブロックコポリマーは、約20から約30までのエトキシル化度および約20から約30までのプロポキシル化度を有することができる。

40

【0054】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物で使用する、アルコール開始EO/POブロックコポリマーである非イオン性界面活性剤は、活性成分の改善された安定性を組成物にもたらすことができる。

【0055】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、トリデシルアルコールエト

50

キシレート (Croda (Edison, NJ) から入手可能である Synperonic (商標) 13/10 がその適例であるが、これは 10EO ユニット (エトキシ化度 10) を含む) などのアルコールエトキシレートである非イオン性界面活性剤を含むことができる。

【0056】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、陰イオン性界面活性剤である少なくとも 1 種のイオン性界面活性剤および少なくとも 2 種の非イオン性界面活性剤からなる群から選択される界面活性剤を含むことができる。

【0057】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約 1 グラム / リットル (g / L) から約 200 g / L まで、約 10 g / L から約 190 g / L まで、約 10 g / L から約 180 g / L まで、約 20 g / L から約 160 g / L まで、約 30 g / L から約 150 g / L まで、約 40 g / L から約 140 g / L まで、約 50 g / L から約 130 g / L まで、約 60 g / L から約 120 g / L まで、約 70 g / L から約 110 g / L まで、約 80 g / L から約 100 g / L まで、または約 85 g / L から約 95 g / L までの非イオン性界面活性剤の少なくとも 1 種を含むことができる。

【0058】

C. 水不混和性有機溶媒

ある特定の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、水不混和性有機溶媒を含む。本明細書で規定する「水不混和性有機溶媒」とは、低い水溶性を有し、等しい容量の水と混合された場合に、2 つの分離した液体層を形成する有機溶媒を意味する。一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、約 500 mg / L 以下、約 600 mg / L 以下、約 700 mg / L 以下、約 800 mg / L 以下、約 900 mg / L 以下、または約 1000 mg / L 以下の水における溶解度を有する、水不混和性有機溶媒を含む。一部の実施形態では、上述の組成物は、約 1250 mg / L 以下、約 1500 mg / L 以下、約 1750 mg / L 以下、約 2000 mg / L 以下、約 3000 mg / L 以下、約 5000 mg / L 以下、約 10,000 mg / L 以下、約 20,000 mg / L 以下、約 30,000 mg / L 以下、約 40,000 mg / L 以下、または約 50,000 mg / L 以下の水における溶解度を有する、水不混和性有機溶媒を含む。

【0059】

一部の実施形態では、水不混和性有機溶媒は、水に添加されると安定なエマルジョンを形成する安定な溶液 (すなわち、乳剤) を形成するように、上述の殺真菌性組成物の活性および不活性成分を溶解する液体媒体として機能している。

【0060】

一部の実施形態では、水不混和性有機溶媒は、少なくとも 3 種の有機化合物または有機化合物のクラスの混合物で構成されている。これらの有機化合物は、エステル化合物、アミド化合物、ケトン化合物、およびアルコール化合物の化学クラスから選択することができる。水不混和性有機溶媒を構成する有機化合物は、野菜、種子もしくは動物油などの天然源に、および / または石油化学源に由来することができる。

【0061】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、酢酸エステル、N, N - ジアルキルカルボキサミドのそれぞれの少なくとも 1 種ならびにケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含む有機化合物の混合物からなる水不混和性有機溶媒を含む。

【0062】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、酢酸エステルおよび N, N - ジアルキルカルボキサミドのそれぞれ少なくとも 1 種を含む有機化合物の混合物からなる水不混和性有機溶媒を含む。

【0063】

本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒を構成し得る適切な有機化合物は、酢酸エステルであり、例えば、酢酸 n - ブチル、酢酸イソ - ブチル、酢酸 n - ペンチ

10

20

30

40

50

ル、酢酸イソペンチル、酢酸 n - ヘキシル、酢酸イソヘキシル、酢酸シクロヘキシル、酢酸フェニル、酢酸 n - ヘプチル、酢酸イソヘプチル、酢酸シクロヘキシルメチル、酢酸ベンジル、またはそれらの混合物を挙げるができる。酢酸ベンジルは、Huntsman (The Woodlands, TX) から Jeffsol AG - 1705 として入手可能である。

【0064】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約 50 g / L から約 700 g / L まで、約 100 g / L から約 700 g / L まで、約 150 g / L から約 700 g / L まで、約 200 g / L から約 700 g / L まで、約 250 g / L から約 700 g / L まで、約 275 g / L から約 650 g / L まで、約 300 g / L から約 600 g / L まで、約 350 g / L から約 550 g / L まで、約 375 g / L から約 550 g / L まで、約 375 g / L から約 500 g / L まで、または約 400 g / L から約 475 g / L までの酢酸エステルを含むことができる。

10

【0065】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒を構成し得る適切な有機化合物としては、酢酸ベンジル、酢酸シクロヘキシルメチル、酢酸フェニル、またはそれらの混合物を挙げるができる。

【0066】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒を構成し得る適切な有機化合物としては、酢酸ベンジルを挙げるができる。

20

【0067】

本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒を構成し得る適切な有機化合物は、N, N - ジアルキルカルボキサミドであり、例えば N, N - ジメチルカプリルアミド (N, N - ジメチルオクタンアミド)、N, N - ジメチルカプラミド (N, N - ジメチルデカンアミド) およびそれらの混合物などの天然由来の脂肪酸ジメチルアミドが挙げられ、それらはまた、N, N - ジメチル脂肪酸アミドとしても公知であり、BASF Corp. (Florham Park, NJ) から Agnique (登録商標) AMD 810 および Agnique (登録商標) AMD 10 として、Clariant (Charlotte, NC) から Genegen (登録商標) 4166、Genegen (登録商標) 4231 および Genegen (登録商標) 4296 として、Stepan (Northfield, IL) から Hallcomid M - 8 - 10 および Hallcomid M - 10 として、ならびに Akzo Nobel (Chicago, IL) から Armid DM10 および Armid DM810 として市販されている。これらの製品はまた、少量の N, N - ジメチルヘキササンアミドおよび / または N, N - ジメチルドデカンアミドも含んでいる場合もある。N, N - ジアルキルカルボキサミドである天然に由来する有機化合物の追加の例としては、カプリル / カプリン脂肪酸 (C₈ / C₁₀) のモルホリンアミドが挙げられ、それらは、Huntsman International LLC (The Woodlands, TX) から JEFFSOL (登録商標) AG - 1730 Solvent として市販されている。

30

【0068】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約 25 g / L から約 300 g / L まで、約 25 g / L から約 300 g / L まで、約 50 g / L から約 300 g / L まで、約 75 g / L から約 300 g / L まで、約 100 g / L から約 300 g / L まで、約 125 g / L から約 300 g / L まで、約 150 g / L から約 300 g / L まで、約 175 g / L から約 300 g / L まで、約 175 g / L から約 250 g / L まで、約 175 g / L から約 200 g / L まで、約 200 g / L から約 250 g / L まで、約 225 g / L から約 300 g / L まで、約 250 g / L から約 300 g / L まで、または約 270 g / L から約 300 g / L までの少なくとも 1 種の N, N - ジアルキルカルボキサミドを含むことができる。

40

【0069】

50

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、N, N - ジメチルカプリルアミド、N, N - ジメチルカプラミド (N,N-dimethylcapramide) またはそれらの混合物からなる群から選択されるN, N - ジアルキルカルボキサミドの1種または複数を含むことができる。

【0070】

本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒を構成し得る適切な有機化合物は、ケトンおよびアルコールの少なくとも一方であり、アセトフェノン、シクロヘキサノン、エチルイソプロピルケトン、2 - ヘプタノン、2 - ヘキサノン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、3 - メチル - 2 - ペンタノン、2 - ペンタノン、3 - ペンタノン、トリメチルシクロヘキサノン (ジヒドロイソホロン)、シクロヘキサノール、2 - ヘプタノール、2 - エチルヘキサノール、および例えば1 - ヘキサノール、1 - ヘプタノール、1 - オクタノール、1 - ノナノール、1 - デカノール等などの直鎖アルコール、オレイルアルコール等などの脂肪アルコール、ならびにそれらの混合物などの化合物を挙げることができる。

10

【0071】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約25 g/Lから約150 g/Lまで、約50 g/Lから約150 g/Lまで、約50 g/Lから約125 g/Lまで、約60 g/Lから約120 g/Lまで、約70 g/Lから約120 g/Lまで、約70 g/Lから約110 g/Lまで、約70 g/Lから約100 g/Lまで、または約70 g/Lから約90 g/Lまでのケトンおよびアルコールの少なくとも一方を含むことができる。

20

【0072】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物に含まれるケトンおよびアルコールの少なくとも一方は、アセトフェノン、シクロヘキサノン、2 - エチルヘキサノール、2 - ヘプタノール、およびそれらの混合物からなる群から選択することができる。

【0073】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物に含まれるケトンおよびアルコールの少なくとも一方は、アセトフェノン、シクロヘキサノン、およびそれらの混合物からなる群から選択することができる。

【0074】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物に含まれるケトンおよびアルコールの少なくとも一方は、シクロヘキサノンとすることができる。

30

【0075】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物に含まれるケトンおよびアルコールの少なくとも一方は、上述の殺真菌性組成物における化合物Aの溶解度の改善をもたらす得る。

【0076】

一部の実施形態では、シクロヘキサノンである上述の殺真菌性組成物に含まれるケトンおよびアルコールの少なくとも一方は、上述の殺真菌性組成物において化合物Aの溶解度の改善をもたらす得る。

【0077】

一部の実施形態では、水不混和性有機溶媒は、例えば、(1) 植物への噴霧施用での適用時に組成物の殺真菌性能を改善する、(2) 上述の組成物において活性成分の溶解度を改善する、および/または(3) 貯蔵中、上述の組成物において化合物Aの化学的安定性を改善するなどの、予期せぬ有益なまたは相乗的な効果を上述の殺真菌性組成物にもたらすことができる。

40

【0078】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒は、組成物を水に添加すると、成分のいずれも目立った結晶化または沈殿をすることなく容易に乳化し、かつ安定な水中油型エマルジョンを形成する、安定で均一な乳剤の形成などの、予期せぬ有益なまたは相乗的な効果をもたらすことができる。

50

【 0 0 7 9 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒は、酢酸ベンジル、脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドおよびシクロヘキサノンの1種または複数を含むことができる。

【 0 0 8 0 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒は、酢酸ベンジル、および脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数を含むことができる。

【 0 0 8 1 】

予期せぬ有益なまたは相乗的な効果を本明細書に記載の殺真菌性組成物にもたらすことができる水不混和性有機溶媒は、水不混和性有機溶媒を構成する有機化合物の選択および/または相対比によって異なることができる。

10

【 0 0 8 2 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒に含まれている有機化合物の比は、重量基準で、酢酸エステル：脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数：ケトンおよびアルコールの少なくとも一方に関して約1～10：1～10：1～10の範囲とすることができる。一部の実施形態では、有機化合物の比は、重量基準で、酢酸エステル：脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数：ケトンおよびアルコールの少なくとも一方に関して約1～8：1～5：1～5、約1～6：1～3：1～2、約2～6：1～3：1～2、約3～6：1～3：1～2、約4～6：1～3：1～2、約4～5：1.5～2.5：0.5～1.5、または約4.5～5：1.8～2.2：0.8～1.2の範囲とすることができる。

20

【 0 0 8 3 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒に含まれている有機化合物の比は、重量基準で、酢酸ベンジル：脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数：シクロヘキサノンに関して約4～6：1～3：1～2、約4～5：1.5～2.5：0.7～1.2、または約4.5～5：1.9～2.3：0.8～1.1の範囲とすることができる。

【 0 0 8 4 】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物の水不混和性有機溶媒中の有機化合物の比は、重量基準で、酢酸エステル：脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数に関して約1～10：1～10の範囲とすることができる。一部の実施形態では、水不混和性有機溶媒中の有機化合物の比は、酢酸ベンジル：脂肪酸N，N - ジメチルカルボキサミドの1種または複数に関して約1～5：1～5、約1～5：1～2、約1～4：1～2、約1～3：1～2、約1～3：1、約4：1、約3：1、約2：1、または約1：1の範囲とすることができる。

30

【 0 0 8 5 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、真菌病原体の増殖または病害を予防するために植物またはその隣接領域に組成物を噴霧施用した後に殺真菌性の効能改善などの、水不混和性有機溶媒の組成と関係した有益なまたは相乗的な特性を示す。

40

【 0 0 8 6 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、真菌病原体の増殖または病害を予防するために植物またはその隣接領域に組成物を噴霧施用した後に、コムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*) (SEPTTR；コムギの汚斑病) およびコムギ赤さび病菌 (*Puccinia tritica*) (PUCCTR；コムギ赤さび病) の殺真菌性防除の改善などの、水不混和性有機溶媒の組成と関係した有益なまたは相乗的な特性を示す。

【 0 0 8 7 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、貯蔵中の活性成分の化学的安定性の改善などの、水不混和性有機溶媒の組成と関係した有益なまたは相乗的な特性を示す。

【 0 0 8 8 】

50

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、組成物における活性成分の溶解度の改善などの、水不混和性有機溶媒の組成と関係した有益なまたは相乗的な特性を示す。

【 0 0 8 9 】

D . 追加の殺真菌性化合物

ある特定の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物を含むことができる。適切な少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物として、例えば、アゾキシストロビン、ピフジュンジ (bifujunzhi)、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロプリン、エノクサストロビン (enoxastrobin)、フェナミンストロビン、フェノキシストロビン、フルフェノキシストロビン、フルオキサストロビン、ジアシャンジュンジ (jiaxiangjunzhi)、クレソキシム - メチル、
 マンデストロビン (mandestrobin)、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、トリフロキシストロビン、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、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ (triclopyricarb) / クロロジンカルブ、ファモキサドン、フェナミドン、シアゾファミド、アミスルプロム、ベノダニル、ピクサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルオピラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピラザム、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサシン、テクロフタラム、チフルザミド、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 - 1 H - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - [9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、ジフルメトリム、ピナパクリル、ジノブトン、ジノカップ、メブチル - ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、アメトクトラジン、シルチオファム、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、フルトリアホール、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、マイクロブタニル、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、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、ピリミジン、フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノックス、トリホリン、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、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン、フェンヘキサミド、ベナラキシル、ベナラキシル - M、キララキシル、メタラキシル、メタラキシル - M (メフェノキサム)、オフレース、オキサジキシル、ヒメキサゾール、オクチリノン、オキソリン酸、プピリメート、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、チオファネート - メチル、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、ジエトフェンカルブ、エタボキサム、ペンシクロン、フルオピコリド、ゾキサミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、シプロジニル、メバニピリム、ピリメタニル、フルオロイミド、イブロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン、フェンピクロニル、フルジオキソニル、キノキシフェン、エディフェンホス、イブロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン、ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホス - メチル、ビフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール、ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロパミド、ピリモルフ、ベンチアパリカルブ、イブロバリカルブ、パリフェナレートおよび 4 - フルオロフェニル N - (1 - (1 - (4 - シアノフェニル) エタンホルニル) ブタ - 2 - イル) カルバメート、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ファーバム、マンコゼブ、マネブ、メチラム、プロピネブ

10

20

30

40

50

、チラム、ジネブ、ジラム、アニラジン、クロロタロニル、カプタフォル、キャプタン、フォルベット、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、ペンタクロロフェノール、フタリド、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、グアニジン、ジチアノン、バリダマイシン、ポリオキシシン B、ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジシクロメット、フェノキサニル、およびそれらの混合物を挙げることができる。

【 0 0 9 0 】

一部の実施形態では、上述の組成物は、アゾキシストロピン、ピフジュンジ (bifujunzhi)、クメトキシストロピン、クモキシストロピン、ジモキシストロピン、エネストロブリン、エノキサストロピン (enoxastrobin)、フェナミンストロピン、フェノキシストロピン、フルフェノキシストロピン、フルオキサストロピン、ジアシャングジュンジ (jiaxiangjunzhi)、クレソキシム - メチル、マンデストロピン (mandestrobin)、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、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、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、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、エポキシコナゾール、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、フルトリアホール、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、オキシポコナゾール、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、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、ピリミジン、フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノックス、トリホリン、およびそれらの混合物から選択される、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物を含むことができる。

【 0 0 9 1 】

一部の実施形態では、上述の組成物は、ベノダニル、ピクサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルオピラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピラザム、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、チフルザミド、およびそれらの混合物から選択される、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物を含むことができる。

【 0 0 9 2 】

一部の実施形態では、上述の組成物は、アゾキシストロピン、クレソキシム - メチル、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、トリフロキシストロピン、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、ミクロブタニル、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、テブコナゾールおよびそれらの混合物から選択される、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物を含むことができる。

【 0 0 9 3 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、殺真菌性化合物ピラクロストロピンを含むことができる。

【 0 0 9 4 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、殺真菌性化合物プロチオコナゾールを含むことができる。

【 0 0 9 5 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、殺真菌性化合物プロピコナゾールを含むことができる。

【 0 0 9 6 】

一部の実施形態では、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物を含む上述の殺真菌性組成物は、相乗的な殺真菌性の活性を示すことができる。

10

20

30

40

50

【0097】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、組成物に対して、少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物の、約1グラム活性成分毎リットル(g ai / L)から約200 g ai / Lまで、約5 g ai / Lから約175 g ai / Lまで、約10 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約125 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約100 g ai / Lまで、約20 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約30 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約40 g ai / Lから約90 g ai / Lまで、約40 g ai / Lから約80 g ai / Lまで、約45 g ai / Lから約75 g ai / Lまで、または約45 g ai / Lから約70 g ai / Lまでを含むことができる。本明細書に記載の殺真菌性組成物はまた、少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物の、約30 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約40 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約50 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約60 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約70 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約80 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約90 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約100 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約110 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約120 g ai / Lから約150 g ai / Lまで、約125 g ai / Lから約140 g ai / Lまで、または約125 g ai / Lから約135 g ai / Lまでを含むこともできる。

10

【0098】

E. アジュバント

20

アジュバントとは、それら自体は無視できる殺有害生物剤活性を有しているかまたはさらには殺有害生物剤活性を有さず、かつ1種または複数の標的有害生物に対する殺有害生物組成物の生物学的性能を改善する化合物である。そのようなアジュバントの例としては、アルコールエトキシレート、アルキルナフタレンのスルホネート、アルキルホスホネート、アルキルベンゼンスルホネート、ベンジルジメチルコクアルキル(benzyl dimethylalkyl)アンモニウム塩、ソルピタンエステルエトキシレート、および変性オルガノシリコンなどの界面活性剤；また、鉱物または植物油、および他の助剤を挙げることができる。アジュバントのさらなる例は、Knowles in, "Adjuvants and Additives," Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, Chapter 5により列記されている。

【0099】

30

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、殺真菌性能を改善するアジュバントを含むことができる。

【0100】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、例えば、Evonik Industries (Parshippany, NJ) から入手可能であるBreak-through (登録商標) S233などのポリエーテル改変オルガノポリシロキサンなどの改変オルガノシリコン界面活性剤のクラスから選択される、殺真菌性能を改善するアジュバントを含むことができる。

【0101】

40

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、例えば、Rhodia (Cranberry, NJ) から入手可能であるビス(2-エチルヘキシル)2-エチルヘキシルホスホネート(BEEPとしても公知)などのアルキルホスホネートアジュバントのクラスから選択される、殺真菌性能を改善するアジュバントを含むことができる。

【0102】

一部の実施形態では、例えば、トリデシルアルコールエトキシレート(すなわち、Synperonic (商標) 13/10)などの非イオン性界面活性剤は、本明細書に記載の殺真菌性組成物の殺真菌性能を改善するアジュバントとして機能することができる。

【0103】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物は、組成物に対して、約1 g / Lから約200 g / Lまでの殺真菌性能を改善するために使用される1種または複数のア

50

ジュバントを含むことができる。一部の実施形態では、殺真菌性組成物は、約 1 g / L から約 150 g / L まで、約 5 g / L から約 150 g / L まで、約 10 g / L から約 150 g / L まで、約 20 g / L から約 150 g / L まで、約 25 g / L から約 140 g / L まで、約 30 g / L から約 130 g / L まで、約 35 g / L から約 125 g / L まで、約 40 g / L から約 120 g / L まで、約 40 g / L から約 110 g / L まで、約 40 g / L から約 100 g / L まで、約 40 g / L から約 90 g / L まで、約 40 g / L から約 80 g / L まで、約 40 g / L から約 70 g / L まで、約 50 g / L から約 70 g / L まで、約 40 g / L から約 130 g / L まで、約 50 g / L から約 120 g / L まで、約 60 g / L から約 120 g / L まで、約 70 g / L から約 120 g / L まで、約 80 g / L から約 120 g / L まで、約 90 g / L から約 120 g / L、または約 100 g / L から約 120 g / L までの殺真菌性能を改善するために使用される 1 種または複数のアジュバントを含むことができる。

10

【 0 1 0 4 】

F . 貯蔵安定性

本明細書において使用する場合、安定な組成物とは、それらが生産、輸送および/または貯蔵される環境に対して、規定の時間期間、物理的および/または化学的に安定である組成物である。安定な組成物の態様としては、これらに限定されないが、約 0 から約 54 までの範囲の温度での物理的安定性、均一性、注ぎ性、沈殿固体もしくは結晶をほとんどもしくは全く形成しないか、または相分離をほとんどもしくは全く示さない液体、水の噴霧タンクへ注がれると容易に乳化し、例えば標的有害生物への噴霧施用により適用される場合にそれらの生物学的効能を保持する組成物が挙げられる。

20

【 0 1 0 5 】

一部の実施形態では、上述の組成物は、貯蔵条件下で目立った相分離を示さない安定で均一な乳剤を形成する。一部の実施形態では、上述の組成物は、貯蔵条件下で、粘度の変化をほとんど示さない。一部の実施形態では、上述の組成物は、貯蔵条件下で、単一の活性成分または複数の活性成分の化学的分解をほとんど示さない。

【 0 1 0 6 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、約 25 超またはそれに等しい温度で、少なくとも 2、4、6 または 8 週の期間安定である。一部の実施形態では、上述の組成物は、約 40 超またはそれに等しい温度で、少なくとも 2、4、6 または 8 週の期間安定である。一部の実施形態では、上述の組成物は、約 54 超またはそれに等しい温度で、少なくとも約 2 週の期間安定である。

30

【 0 1 0 7 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、低温でいずれの構成成分の分離、沈殿もしくは結晶化を示さないか、またはそれらを顕著には示さない。一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、約 20 未満、約 10 未満、または約 5 以下、または約 0 以下、または約 - 5 以下、または約 - 10 以下の温度で、少なくとも約 2 週間貯蔵した後、依然として均一な乳剤である。ある特定の実施形態では、組成物は、これらの温度で、少なくとも約 2、4、6 または 8 週間安定である。

【 0 1 0 8 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、24 時間毎に約 - 10 から約 40 へと温度が循環される凍結/融解 (F / T) 条件に少なくとも約 2 または 4 週間、これを付した後に、依然として均一な濃縮物である。

40

【 0 1 0 9 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物の貯蔵安定性は、1 種または複数の成分および組成物中のそれらの濃度によって異なり得る。そのような成分としては、これらに限定されないが、水不混和性有機溶媒を構成する有機化合物、非イオン性界面活性剤、少なくとも 1 種の追加の殺真菌性化合物、N, N - ジアルキルカルボキサミドに存在するかまたはそれから形成されるジメチルアミンなどのジアルキルアミン、および水を挙げることができる。

50

【0110】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物中の単一の活性成分または複数の活性成分の化学的安定性は、組成物の中にケトンまたはアルコールを含めることによって改善することができる。

【0111】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物中の単一の活性成分または複数の活性成分の化学的安定性は、組成物の中に非イオン性界面活性剤を含めることによって改善することができる。

【0112】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物中の単一の活性成分または複数の活性成分の化学的安定性は、組成物中のジアルキルアミンの量を削除するかまたは低下させることによって改善することができる。

10

【0113】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物中の単一の活性成分または複数の活性成分の化学的安定性は、組成物中の水の量を削除するかまたは低下させることによって改善することができる。

【0114】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物中の第1の活性成分の化学的安定性は、組成物に少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物を添加することによって低下する場合もある。

20

【0115】

G. 調製および使用の方法

水に添加すると、容易に乳化して安定で均一なエマルジョンを形成する、安定で均一な乳剤を形成するように、1種または複数の殺真菌剤の活性成分、不活性成分、および水不混和性有機溶媒と一緒に混合するステップを含む、上述の殺真菌性組成物を調製するためのプロセスまたは方法についても本明細書に記載する。

【0116】

一部の実施形態では、本明細書に記載の殺真菌性組成物（乳剤）は、

(1) 第1の殺真菌性化合物の水不混和性有機溶媒中の溶液を調製するステップ、

(2) ステップ(1)で調製された溶液に1種または複数の界面活性剤を添加して、溶液を形成するステップ、

30

(3) ステップ(2)で調製された溶液に少なくとも1種の追加の殺真菌性化合物を添加するステップを含んでもよく；および

(4) ステップ(3)で調製された溶液に任意の追加の相溶性活性成分または不活性成分を添加して、溶液を形成するステップを含んでもよい

によって調製することができる。

【0117】

上述の殺真菌性組成物はまた、当業者によって容易に決定され得るように、ステップの相対順序を変更することによって、または本明細書に記載の調製にステップを追加するかもしくは除外することによっても調製することができる。

40

【0118】

本開示はさらに、本明細書に記載の乳剤と水を混合することによって得られる（好ましくは得られた）エマルジョンに関する。エマルジョンは通常、混合すると自然に発生する。ほとんどの場合、エマルジョンは水中油型エマルジョンである。水と濃縮物の混合比は、1000：1から最大1：1まで、好ましくは200：1から最大3：1までの範囲内とすることができる。

【0119】

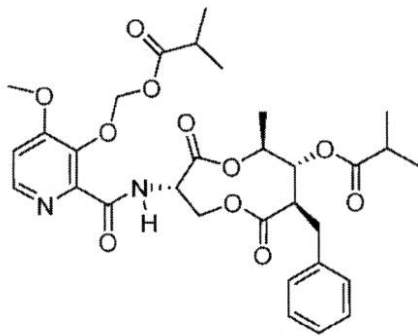
植物由来の真菌病原体または病害を防除する方法であって、真菌病原体の増殖または病害を予防するために、植物またはその隣接領域を、

a) 式

50

【 0 1 2 0 】

【化 7】



10

の殺真菌性化合物と；

- b) 少なくとも1種のイオン性界面活性剤と；
- c) 少なくとも1種の非イオン性界面活性剤と；
- d) 酢酸エステルと；
- e) N, N - ジアルキルカルボキサミドと；
- f) ケトンおよびアルコールの少なくとも一方と

を含む殺真菌性組成物の殺真菌的に有効な量と接触させるステップを含む方法も本明細書に提供される。

20

【 0 1 2 1 】

上述の殺真菌性組成物によって防除し得る植物の真菌病原体として、コムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*)、コムギ黄さび病 (*Puccinia striiformis*)、ヴェンチュリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*)、ウスティラゴ・マイディス (*Ustilago maydis*)、ウンシヌラ・ネカトール (*Ucinula necator*)、雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*)、ふ枯病菌 (*Leptosphaeria nodorum*)、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*)、モニリニア・フルクティコラ (*Monilinia fructicola*)、シュードペロノスポラ・キューベンシス (*Pseudopezizomyces cubensis*)、眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ファコブソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*)、ムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis tritici*)、オオムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis hordei*)、エリシフェ・シコラセアルム (*Erysiphe cichoracearum*)、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*)、グロメレラ・ラゲナリウム (*Glomerella lagenarium*)、セルコスポラ・ベティコーラ (*Cercospora beticola*)、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*)、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、プラスモパラ・ヴィティコラ (*Plasmopara viticola*)、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)、および網斑病菌 (*Pyrenopeziza teres*) が挙げられる。

30

【 0 1 2 2 】

上述の殺真菌性組成物によって防除し得る植物の真菌性病害として、炭疽病、イモチ病、ボトリチス病、赤さび病、火ぶくれ病、褐色腐れ、べと病、フザリウム病、ウドンコ病、さび病、ふ枯病、汚斑病、網斑病、根茎腐敗病、黄さび病、黒星病、眼紋病、斑点病、夏疫病および葉枯れ病が挙げられる。

40

【 0 1 2 3 】

一部の実施形態では、上述の殺真菌性組成物は、植物の表面に噴霧施用後に、雨またはその他の水分によって生じる事象への曝露後に良好な殺真菌性の効能を示すことによって、耐雨特性を示す。

【 0 1 2 4 】

この上述の方法には、植物病原性生物体による攻撃に対して植物を保護するため、また

50

は植物病原性生物体が既に感染した植物を処置するための上述の殺真菌性組成物の使用が含まれ、上述の殺真菌性組成物を病害阻害であり植物学的に許容可能である量にて土壌、植物、植物の一部、葉、花、果実および/もしくは種子、または植物に隣接する任意の表面に施用するステップが含まれる。用語「病害阻害であり植物学的に許容可能である量」とは、防除が所望される植物の病害を、処置対象の植物に著しく毒性のない量にて鎮圧または抑制する、化合物の量を指す。当分野において周知のように、必要とされる活性化化合物の正確な濃度は、防除の対象となる真菌性病害、使用される製剤の種類、施用方法、個々の植物種、気候条件などに応じて異なる。

【 0 1 2 5 】

本明細書に記載の殺真菌性組成物は、作物畑における植物病原性菌類の防除のためなどの農業的用途向けに水性噴霧混合物中に希釈してもよい。そのような組成物は、施用前に、水などの不活性担体で典型的には希釈される。例えば、作物、作物の場所または植物病原性菌類が最終的に出現する恐れがある場所に通常施用される希釈組成物は、一部の実施形態では、約 0 . 0 0 0 1 ~ 約 1 重量パーセントまでの活性成分、または 0 . 0 0 1 から約 1 重量パーセントまでの活性成分を含む。本組成物は、例えば、従来の地面または空気噴霧器を使用することにより、および当業者に公知である従来の他の手段により、作物植物またはそれらの場所に施用することができる。

【 0 1 2 6 】

H . 選択可能な成分

本明細書において開示の組成物は、これらに限定されないが、分散剤、界面活性剤および湿潤剤などの選択可能な不活性製剤成分を含んでいてもよい。これらの選択可能な不活性成分として、とりわけ“McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual,” MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1998に、およびthe“Encyclopedia of Surfactants,” Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81に記載されている製剤の業界で従来使用される界面活性剤を挙げることができる。これらの表面活性剤は、性質が陰イオン性、陽イオン性または非イオン性であってもよく、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または他の目的で用いることができる。

【 0 1 2 7 】

上に記載の特定の方法および組成物に加えて、本明細書に記載の方法および組成物はまた、1種または複数の追加の相溶性成分を含む組成物を含むことができる。これらの追加の成分としては、例えば、組成物中に溶解または分散させることができ、かつ殺ダニ剤、殺藻剤、摂食抑制物質、殺鳥剤、殺細菌剤、鳥忌避剤、化学不妊薬、落葉剤、乾燥剤、消毒剤、殺真菌剤、除草剤安全化剤、除草剤、昆虫誘引剤、殺虫剤、昆虫忌避剤、哺乳動物忌避剤、交配攪乱物質、殺軟体動物剤、殺線虫剤、植物活性化剤、植物成長調節剤、殺げっ歯類剤、セミオケミカル剤、相乗剤および殺ウイルス剤から選択することができる1種または複数の殺有害生物剤または他の成分を挙げることができる。また、例えば、消泡剤、抗微生物剤、緩衝剤、腐食阻害剤、分散剤、染料、芳香物、凝固点降下剤、中和剤、付臭剤、浸透助剤、金属イオン封鎖剤、スプレードリフト軽減剤(spray drift control agent)、拡散剤、安定剤、固着剤、粘度改質添加剤、水溶性溶媒等などの機能的有用性を提供する任意の他の追加の成分も、これらの組成物中に含ませることができる。

【 0 1 2 8 】

上述の組成物が、例えば、殺虫剤活性成分などの追加の活性成分と組み合わせて使用される場合、本明細書に記載の組成物は、プレミックス濃縮物として単一の他の活性成分もしくは複数の他の活性成分とともに製剤化するか、噴霧施用向けに単一の他の活性成分もしくは複数の他の活性成分と水中でタンクミックスするか、または別個の噴霧施用で単一の他の活性成分もしくは複数の他の活性成分と順次に施用することができる。

【 0 1 2 9 】

本明細書に記載の組成物および方法は、単一または複数の作用機序を備える1種または複数の除草剤化学物質および/または阻害剤に対する耐性を付与する、単一の、複数の、または積層した遺伝形質を保有する作物において真菌性病害を防除するのに使用すること

10

20

30

40

50

ができる。

【0130】

I. 実施例

下記実施例は、本明細書に記載の組成物の種々の態様を説明するために提示されるものであり、特許請求の範囲に対する限定と解釈されるべきものではない。

【実施例1】

【0131】

上述の殺真菌性組成物の代表的サンプルの調製

【0132】

【表1】

10

表1. 本明細書に記載の殺真菌性組成物

成分	役割	量(g/L)
第1の殺真菌剤化合物	活性成分	1~250
第2の殺真菌剤化合物	活性成分	0~200
界面活性剤	乳化剤	1~100
界面活性剤	乳化剤	1~100
界面活性剤	乳化剤	1~100
オルガノシリコン	アジュバント	10~100
ケトン	溶媒	0~500
酢酸エステル	溶媒	10~750
N,N-ジアルキルカルボキサミド ¹	溶媒	10~500
ポリジメチルシロキサン	消泡	0.01~1

20

¹ N,N-ジメチル脂肪酸アミドとしても公知。

サンプル1:

活性成分として化合物Aを含むエマルジョン濃縮物を表2の成分を使用して、下のステップに記載のように調製した(示される値は製剤100mL当たりのgである):

【0133】

30

【表2】

表2. サンプル1 殺真菌性組成物

第1の殺真菌剤化合物	化合物A、85%工業用	5.88
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	6.00
界面活性剤	Toximul 8320	4.50
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
オルガノシリコン	Breakthru S233	5.00
ケトン	シクロヘキサノン	9.89
酢酸エステル	酢酸ベンジル	46.81
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	19.03
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.01

40

(1) シクロヘキサノン、酢酸ベンジル、Hallcomid M-8-10および化合物Aの活性成分プレミックスを調製した。(2) (1)由来のプレミックスを35~40に温め、澄んだ溶液が得られるまで攪拌した。(3) 残りの成分をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。

【0134】

サンプル2:

化合物Aおよびプロチオコナゾールの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表3の成分

50

を使用して、下のステップに記載のように調製した（示される値は製剤100mL当たりのgである）：

【0135】

【表3】

表3. サンプル2 殺真菌性組成物

第1の殺真菌剤化合物	化合物A、85%工業用	5.88
第2の殺真菌剤化合物	プロチオコナゾール96% 工業用	10.42
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	6.00
界面活性剤	Toximul 8320	4.50
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
オルガノシリコン	Breakthru S233	5.00
ケトン	シクロヘキサノン	8.90
酢酸エステル	酢酸ベンジル	42.11
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	17.11
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.01

(1)シクロヘキサノン、酢酸ベンジル、Hallcomid M-8-10、プロチオコナゾールおよび化合物Aの活性成分プレミックスを調製した。(2)(1)由来のプレミックスを澄んだ溶液が得られるまで攪拌した。(3)残りの成分をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。

【0136】

サンプル3：

化合物Aおよびピラクロストロピンの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表4の成分を使用して、下のステップに記載のように調製した（示される値は製剤100mL当たりのgである）：

【0137】

【表4】

表4. サンプル3 殺真菌性組成物

第1の殺真菌剤化合物	化合物A、85%工業用	5.88
第2の殺真菌剤化合物	ピラクロストロピン98% 工業用	6.38
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	6.00
界面活性剤	Toximul 8320	4.50
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
オルガノシリコン	Breakthru S233	5.00
ケトン	シクロヘキサノン	9.29
酢酸エステル	酢酸ベンジル	43.82
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	17.86
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.01

(1)シクロヘキサノン、酢酸ベンジル、およびHallcomid M-8-10、の溶媒プレミックスを調製した。(2)(1)由来のプレミックスを澄んだ溶液が得られるまで攪拌した。(3)界面活性剤、アジュバントおよび消泡剤をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。(4)ピラクロストロピン工業用の活性成分を溶解するまで加熱し(70)、次いで混合しながらステップ(3)で調製したプレミックスに添加した。(5)化合物A工業用の活性成分をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。

【0138】

サンプル4：

化合物 A およびプロチオコナゾールの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表 5 の成分を使用して、下のステップに記載のように調製した（示される値は製剤 100 mL 当たりの g である）：

【 0 1 3 9 】

【表 5】

表 5. サンプル 4 殺真菌性組成物

第 1 の殺真菌剤化合物	化合物 A、85% 工業用	7.85
第 2 の殺真菌剤化合物	プロチオコナゾール、98% 工業用	13.89
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	6.00
界面活性剤	Toximul 8320	4.50
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
オルガノシリコン	Breakthru S233	5.00
ケトン	シクロヘキサノン	6.67
酢酸エステル	酢酸ベンジル	38.71
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	15.72
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.01

（ 1 ）シクロヘキサノン、酢酸ベンジル、および Hallcomid M - 8 - 1 0 の溶媒プレミックスを調製した。（ 2 ）（ 1 ）由来のプレミックスを澄んだ溶液が得られるまで攪拌した。（ 3 ）界面活性剤、アジュバントおよび消泡剤をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。（ 4 ）プロチオコナゾールおよび化合物 A 工業用の活性成分をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した。

【 0 1 4 0 】

サンプル 5：

化合物 A およびピラクロストロピンの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表 6 に列記の成分および量を使用してサンプル 3 について記載のそれに類似の方法で調製した（示される値は製剤 1 L 当たりの g である）。

【 0 1 4 1 】

【表 6】

表 6. サンプル 5 殺真菌性組成物

第 1 の殺真菌剤化合物	化合物 A、85% 工業用	66.7g/L
第 2 の殺真菌剤化合物	ピラクロストロピン 98% 工業用	83.3
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	60
界面活性剤	Toximul 8320	45
界面活性剤	Synperonic 13/10	45
オルガノシリコン	Breakthru S233	66.7
ケトン	シクロヘキサノン	86.9
酢酸エステル	酢酸ベンジル	410.2
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	181.2
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.1

【 0 1 4 2 】

サンプル 6：

化合物 A およびプロチオコナゾールの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表 7 に列記の成分および量を使用してサンプル 3 について記載のそれに類似の方法で調製した（示される値は製剤 100 mL 当たりのグラムである）。

【 0 1 4 3 】

【表 7】

表 7. サンプル 6 殺真菌性組成物

第 1 の殺真菌剤化合物	化合物 A、84%工業用	5.95
第 2 の殺真菌剤化合物	プロチオコナゾール 96% 工業用	7.81
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	7.50
界面活性剤	Toximul 8320	3.00
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
酢酸エステル	酢酸ベンジル	48.1
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	25.9

10

【 0 1 4 4 】

サンプル 7 :

化合物 A およびプロチオコナゾールの活性成分を含むエマルジョン濃縮物を表 8 に列記の成分および量を使用してサンプル 3 について記載のそれに類似の方法で調製した（示される値はグラム単位である）。

【 0 1 4 5 】

【表 8】

表 8. サンプル 7 殺真菌性組成物

第 1 の殺真菌剤化合物	化合物 A、84%工業用	1.15
第 2 の殺真菌剤化合物	プロチオコナゾール 96% 工業用	1.51
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	1.49
界面活性剤	Toximul 8320	0.60
界面活性剤	Synperonic 13/10	0.89
オルガノシリコン	Breakthru S233	2.42
酢酸エステル	酢酸ベンジル	8.95
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	2.98

20

【 0 1 4 6 】

サンプル 8 :

シクロヘキサノン、酢酸ベンジル、Hallcomid M-8-10、プロピコナゾールおよび化合物 A の活性成分プレミックスを、表 9 に示されている量を使用して調製した。プレミックスを澄んだ溶液が得られるまで攪拌した。残りの成分をプレミックスに添加し、続いて、均一な組成物が得られるまで混合した（示される値は製剤 100 mL 当たりの g である）。

【 0 1 4 7 】

30

【表 9】

表 9. サンプル 8 殺真菌性組成物

殺真菌剤化合物 1	化合物 A、85%工業用	5.88
殺真菌剤化合物 2	プロピコナゾール 92%工業用	9.05
界面活性剤	Nansa EVM 70/2E	6.00
界面活性剤	Atlas G5002L	4.50
界面活性剤	Synperonic 13/10	4.50
オルガノシリコン	Breakthru S233	5.00
ケトン	シクロヘキサノン	9.2
酢酸エステル	酢酸ベンジル	43.10
N,N-ジアルキルカルボキサミド	Hallcomid M-8-10	16.76
ポリジメチルシロキサン	SAG 1572	0.01

10

【実施例 2】

20

【0148】

殺真菌性活性成分の有機溶媒中での溶解度

a) 水中で低溶解度を有する化合物 A およびプロチオコナゾールの有機溶媒中での相対的溶解度。

化合物 A およびプロチオコナゾールを含む効果的な EC 組成物を調製するためには、以下の溶媒属性を得なければならない：

- ・ 化合物 A の溶解度は 10 wt % 超である必要がある
- ・ プロチオコナゾールの溶解度は 20 wt % 超である必要がある
- ・ 溶媒候補物の水溶性は、EC を水に添加すると、良好なエマルジョン安定性が得られるように、約 5 g / L または 0.5 % 未満であるべきである。

30

【0149】

試験方法：化合物 A のほぼ正確な溶解度を、この活性成分の既知の質量を、各溶媒の質量を増加させながら各溶媒と周囲温度にて混合することにより決定した。例えば、化合物 A 0.2 g をシクロヘキサノン 1.38 g と混合し、化合物 A 12.6 % w / w を含む澄んだ溶液を得た。それゆえ、シクロヘキサノンは、「高」溶解度を示したので（以下の表を参照のこと）、化合物 A 向けの極めて良好な溶媒に分類するとともに、さらなる評価へと組み込んだ。本スクリーニング手順において使用した溶媒中での化合物 A の溶解度については、以下の濃度範囲内で全体的に分類した。

【0150】

【表 1 0】

<u>化合物 A</u> <u>溶解度 (wt%)</u>	<u>相対的溶解度</u>
>8.4	高
8.4~5.6	中
5.6~3.0	低
<3.0	極低

10

<u>プロチオコナゾール</u> <u>溶解度 (wt%)</u>	<u>相対的溶解度</u>
>30	高
>20~30	中
10~2.0	低
<10	極低

20

【 0 1 5 1】

表 9 . 1 は、種々の有機溶媒中での化合物 A およびプロチオコナゾールの相対的溶解度を示す。

【 0 1 5 2】

【表 1 1】

表 9.1 周囲温度での有機溶媒における化合物 A および
プロチオコナゾールの相対的溶解度

溶媒	化合物 A の相対的溶解度	プロチオコナゾールの相対的溶解度	S 水における溶媒の溶解度 (g/L) ¹
シクロヘキサノン	高	高	8.6~25
メチル-5-(ジメチルアミノ)-2-メチル-5-オキソペンタノエート	高	高	79
ベンジルアルコール	高	中	43
N-ホルミルモルホリンおよびプロピレンカルボネート	高	中	混和性 ²
酢酸ベンジル	高	低	1.0~3.1
スルホラン	高	低	379
サルチル酸メチル	高	極低	<5
安息香酸ブチル	中	低	1.7e ⁻⁴
2-ヘプタノン	中	低	4.28
ペンタン二酸、2-メチル-1,5-ジメチルエステル	中	低	25
乳酸ブチル	中	低	42
安息香酸イソプロピル	中	極低	0.64
N,N ジメチル脂肪酸アミド	低	高	1.9~5.3
リン酸トリブトキシエチル	低	高	混和性
ジエチレングリコールモノエチルエーテル	低	高	混和性
アジピン酸、グルタル酸およびコハク酸のジメチルエステル	低	低	53
エチルジグリコールアセテート	低	極低	混和性
乳酸 2-エチルヘキシル ³	極低	中	1.9
ポリエチレングリコール	極低	中	混和性
ポリプロピレングリコール	極低	低	混和性
2-エチルヘキサノール	極低	極低	0.88
オレイン酸メチル	極低	極低	0.0011
イソパラフィン	極低	極低	<5
アルキルナフタレン混合物	極低	極低	<5
炭酸ブチレン	極低	極低	7
大豆油	極低	極低	<5
炭酸プロピレン	極低	極低	17.5
安息香酸 2-エチルヘキシル	極低	極低	0.0004
炭酸ジ-n-ブチル	極低	極低	0.82

¹ 文献の調査から推定;² 混和性とは、全ての量において水中で完全に可溶性であることを意味する;³ 乳酸 2-エチルヘキシル/化合物 A の混合物は 0°C にて凍る。

【 0 1 5 3】

b) 10 での酢酸ベンジル / AMD 8 1 0 ブレンドにおける化合物 A およびプロチオコナゾールの溶解度。

酢酸ベンジル / AMD 8 1 0 のブレンドにおける化合物 A およびプロチオコナゾールの溶解度に関する研究を実施した。各溶媒ブレンドに双方の活性物をそれぞれが飽和するまで添加し、次いで平衡が得られるまで生成した混合物を 10 にて貯蔵した。この上澄み

10

20

30

40

50

層の一分量を各サンプルから分取し、ろ過し(0.45 μmメッシュ)、HPLCにより分析して、ブレンドにおける各活性物の溶液濃度を決定した。表10は結果を示す。

【0154】

【表12】

表 10. 10°Cでの酢酸ベンジル-AMD810 のブレンドにおける化合物 A およびプロチオコナゾールの混合物の溶解度

ブレンド中の AMD810 に対する酢酸ベンジルの割合(wt%)	10°Cでのプロチオコナゾールの溶解度(% w/w)	10°Cでの化合物 A の溶解度(% w/w)
0	31.3	3.3
20	32.3	4.3
40	33.1	6.5
60	32.1	11.0
80	26.6	12.0
100	16.2	14.3

10

【0155】

c) 10 での酢酸ベンジル / AMD 8 1 0 / シクロヘキサノンブレンドにおける化合物 A およびプロチオコナゾールの溶解度。

各溶媒の重量分率を、表 1 1 に示した様々なブレンドにおける種々のレベル(0 から 1 まで)にて試験した。1 サンプル当たり、計 2 0 g の各溶媒ブレンドを調製した。例えば、ブレンドのうち1つは(ブレンド 4)、シクロヘキサノン 0.2 (4 g)、酢酸ベンジル 0.2 (4 g) および AMD 8 1 0 0.6 (12 g) を組み合わせることにより調製した。ブレンド 4 に化合物 A およびプロチオコナゾール工業用の活性成分のある量を添加して、それぞれの飽和濃度を得た。次いで、サンプルは 1 0 にて 1 週間貯蔵し、次いで可溶性活性成分の含量について分析した。結果を表 1 1 に示す。

20

【0156】

【表13】

表 11. 10°Cでの酢酸ベンジル/AMD810/シクロヘキサノンのブレンドにおける化合物 A およびプロチオコナゾールの溶解度

ブレンド番号	溶媒比(重量分率)			化合物 A	プロチオコナゾール
	シクロヘキサノン ²	酢酸ベンジル	AMD810	溶解度(% w/w) @10°C	
1	0	0	1	3.3	34.3
2	0	0.2	0.8	4.3	32.3
3	0.2	0	0.8	4.5	33.9
4	0.2	0.2	0.6	6.2	32.9
5	0	0.4	0.6	6.5	33.1
6	0.2	0.4	0.4	10.5	32.1
7	0	0.6	0.4	11	32.1
8	0	0.8	0.2	12	26.6
9	0.13	0.62	0.25	未試験	未試験
10	0.2	0.6	0.2	13.6	29.9
11	0	1	0	14.3	16.2
12	0.2	0.8	0	15.2	18.4

30

40

【実施例 3】

【0157】

上述の殺真菌性組成物の代表的サンプルの貯蔵安定性

a) 酢酸ベンジル、AMD 8 1 0 および第 3 の溶媒を含む液体組成物での化合物 A の加速貯蔵安定性試験。

50

54にて2週間貯蔵された、種々の液体組成物での化合物Aの安定性を表12に示す。試験組成物は、化合物A、プロチオコナゾール、ピラクロストロピン、酢酸ベンジル、およびAMD810のうち1種または複数、ならびにシクロヘキサノン、アセトフェノン、2-ヘプタノン、2-ヘプタノール、オレイルアルコールまたは2-エチルヘキサノールから選択される第3の溶媒を使用して、実施例1に記載のそれに類似の方法で調製した。

【0158】

【表14】

表 12. 54°Cにて2週間貯蔵後の、酢酸ベンジル、AMD810 および
第3の溶媒を含む液体組成物における化合物Aの安定性

組成物(wt%)						第3の溶媒	貯蔵後の 化合物A (%保存) ¹
化合物 A	プロチオコ ナゾール	ピラクロス トロピン	酢酸 ベンジル	AMD 810	第3の 溶媒		
4.9	-	-	94.1	-	-	無し	85
3.4	-	-	-	96.0	-	無し	49
12.0	-	-	-	-	85.7	シクロヘキサノン	96
4.9	7.4	-	46.8	25.2	-	無し	91 ²
4.9	-	5.0	48.4	26.0	-	無し	92 ²
4.1	-	5.2	37.0	20.0	8.2	シクロヘキサノン	93 ²
4.9	-	6.3	44.4	23.9	4.9	アセトフェノン	94 ²
4.9	-	6.3	44.4	23.9	4.9	2-ヘプタノン	93 ²
4.9	-	6.3	44.4	23.9	4.9	オレイルアルコール	92 ²
4.9	-	6.3	44.4	23.9	4.9	2-エチルヘキサノール	96 ²
4.9	-	6.3	44.4	23.9	4.9	2-ヘプタノール	94 ²
7.7	-	9.8	37.1	20.0	9.6	シクロヘキサノン	97
4.9	-	6.3	41.2	22.2	9.8	シクロヘキサノン	98
5.0	-	6.4	40.9	22.0	10.0	2-エチルヘキサノール	95
7.8	-	9.9	36.7	19.8	9.7	2-エチルヘキサノール	97

¹HPLC分析により決定した;²組成物には、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、ブタノールエチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックポリマー、およびトリデシルアルコールエトキシレートを含む乳化剤ブレンド(14.7wt%)が含まれている。

【実施例4】

【0159】

サンプル1の水中での貯蔵安定性および希釈

a) サンプル1の貯蔵安定性:

サンプル1を密閉容器中54にて2週間貯蔵した。サンプルは、貯蔵期間中、固形物を形成せずにかつ相分離をせずに依然として澄んだ均一の黄色液体であった。HPLC分析は、貯蔵期間後、化合物Aの97.6%の保存を示した。

【0160】

CIPAC Method 39.3に従って、サンプル1を密閉容器中-10にて1週間貯蔵した。サンプルは、結晶化を生じることなく依然として澄んだ均一の黄色液体であった。

【0161】

サンプル1を、24時間毎に-10と40の間で温度が循環される凍結-融解条件にて密閉容器中に4週間貯蔵した。貯蔵後、サンプルは依然として均一な液体であった。

【0162】

b) 室温水におけるサンプル1の希釈

CIPAC Method 36.3に従って、サンプル1の1mL分量を室温にて342ppm硬水100mLに希釈すると、均一な水中油型エマルジョンを容易に形成したが、これは、その安定性を室温にて少なくとも24時間維持した。化合物Aが結晶化しな

10

20

30

40

50

いことはエマルジョンにおいて明らかであった。

【0163】

c) 5 の水におけるサンプル1の希釈

CIPAC Method 36.3に従って、サンプル1の1mL分量を5にて342ppm硬水100mLに希釈すると、均一な水中油型エマルジョンを容易に形成し、これは、その安定性を室温にて少なくとも24時間維持した。化合物Aが結晶化しないことはエマルジョンにおいて明らかであった。

【0164】

d) サンプル6の貯蔵安定性：

サンプル6を密閉容器中54にて2週間貯蔵した。サンプルは、貯蔵期間中、固形物を形成せずにかつ相分離をせずに依然として澄んだ均一の黄色液体であった。HPLC分析は、貯蔵期間後、化合物Aの91%の保存を示した。

10

【0165】

e) サンプル7の貯蔵安定性：

サンプル7を密閉容器中54にて2週間貯蔵した。サンプルは、貯蔵期間中、固形物を形成せずにかつ相分離をせずに依然として澄んだ均一の黄色液体であった。HPLC分析は、貯蔵期間後、化合物Aの91%の保存を示した。

【実施例5】

【0166】

病害防除に関する上述の殺真菌性組成物の評価

20

a) 水不混和性有機溶媒の組成を異にする、活性成分化合物Aを含む3種のEC製剤を使用する病害防除の比較。

方法：化合物Aを含む殺真菌剤製剤を、200l/haに等しい噴霧量でトラック噴霧器(Devris)を使用して小麦幼苗(葉期2)に施用した。5種の濃度の活性成分を使用した。使用した濃度は、40.3、13.4、4.48および1.49gai/haであった。植物体には、3日治療試験(3DC)および1日保護試験(1DP)において植菌した。植物体は、PUCCRT(コムギ赤さび病菌(*Puccinia triticina*))；コムギ赤さび病)およびSEPTTR(コムギ葉枯病菌(*Septoria tritici*))；コムギの汚斑病)真菌病原体の両方で攻撃した。タイミングと病原体の各組合せに対して計3回繰り返しを使用した。PUCCRTによっておこる病害については植菌して7日後に、SEPTTRによっておこる病害については植菌して18~21日後に評価した。感染した%組織を決定し、次いで次式を使用して%病害防除を算出した： $\%病害防除 = (1 - \text{観察された病害} / \text{無処理に由来する病害}) * 100$ 。

30

【0167】

材料：表13に示した乳剤(EC)製剤を、コムギ植物体上のコムギ葉枯病菌(*Septoria tritici*) (コムギの汚斑病)およびコムギ赤さび病菌(*Puccinia triticina*) (コムギ赤さび病)の防除向けに殺真菌剤噴霧施用で使用した。サンプルAおよびサンプルB比較製剤は、それぞれ、水不混和性有機溶媒としてシクロヘキサノン/Aromatic 100およびN-メチルピロリドン/Aromatic 200NDで構成され、一方、サンプルC製剤は水不混和性有機溶媒として酢酸ベンジル/N,N-ジメチル脂肪酸アミドで構成されていた。

40

【0168】

【表 15】

表 13. 殺真菌剤噴霧施用において使用される EC 製剤の組成

製剤	タイプ	構成成分	役割	濃度 g-L
サンプル A	EC	化合物 A	活性成分	70.0
		Tensiofix N9811HF	乳化剤	14
		Tensiofix N9839HF	乳化剤	98
		シクロヘキサノン	溶媒	223.9
		Aromatic 100	溶媒	527.1
サンプル B	EC	化合物 A	活性成分	100.0
		Sponto 300T	乳化剤	11
		Sponto 500T	乳化剤	43
		N-メチルピロリドン	溶媒	423
		Aromatic 200ND	溶媒	423
サンプル C	EC	化合物 A	活性成分	50
		co/po ブロックコポリマー	乳化剤	30
		ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	乳化剤	75
		トリデシルアルコール、エトキシ化	乳化剤	45
		酢酸ベンジル	溶媒	517.3
		N,N-ジメチル脂肪酸アミド	溶媒	287.7

10

20

【0169】

病害防除データ：表 14 はコムギ植物体上のコムギ葉枯病菌 (*Septoria tritici*) (SEPTTR；コムギの汚斑病) およびコムギ赤さび病菌 (*Puccinia triticina*) (PUCCRT；コムギ赤さび病) の防除向けの殺真菌剤噴霧施用に関する平均病害防除を示す。

【0170】

【表 16】

表 14. 化合物 A を含む種々の噴霧施用の製剤によるコムギ植物体上での病害防除

施用製剤	病原体および 施用タイミング	化合物 A の施用量(g ai/ha)			
		1.47	4.48	13.4	40.3
		%病害防除の平均値			
無し-植菌	PUCCRT 1DP	0	0	0	0
無し-クリーン	PUCCRT 1DP	100	100	100	100
サンプル A-比較	PUCCRT 1DP	17	27	97	99
サンプル B-比較	PUCCRT 1DP	19	44	90	98
サンプル C	PUCCRT 1DP	50	90	99	100
サンプル C+Trycol 5941	PUCCRT 1DP	80	99	100	100
無し-植菌	PUCCRT 3DC	0	0	0	0
無し-クリーン	PUCCRT 3DC	100	100	100	100
サンプル A-比較	PUCCRT 3DC	0	0	0	22
サンプル B-比較	PUCCRT 3DC	0	0	0	18
サンプル C	PUCCRT 3DC	0	0	16	73
サンプル C+Trycol 5941	PUCCRT 3DC	0	0	22	87
無し-植菌	SEPTTR 1DP	0	0	0	0
無し-クリーン	SEPTTR 1DP	100	100	100	100
サンプル A-比較	SEPTTR 1DP	21	19	59	67
サンプル B-比較	SEPTTR 1DP	4	13	29	90
サンプル C	SEPTTR 1DP	17	45	97	100
サンプル C+Trycol 5941	SEPTTR 1DP	47	83	91	96
無し-植菌	SEPTTR 3DC	0	0	0	0
無し-クリーン	SEPTTR 3DC	100	100	100	100
サンプル A-比較	SEPTTR 3DC	86	93	95	97
サンプル B-比較	SEPTTR 3DC	75	87	88	97
サンプル C	SEPTTR 3DC	71	93	100	100
サンプル C+Trycol 5941	SEPTTR 3DC	90	100	100	100

¹Trycol5941(BASF:トリデシルアルコール-(EO)₉)は、殺真菌剤の効能をブーストするため、0.05wt%の濃度でそれぞれの噴霧溶液に添加されたアジュバントである。

【 0 1 7 1 】

b) 施用組成物の耐雨性を評価するための模擬降雨事象前後での、化合物 A、および、プロチオコナゾールまたはピラクロストロピンのいずれかを含んでもよい上述の組成物を使用する病害防除。

方法: 「Yuma」コムギをこれらの殺真菌剤効能試験における宿主植物として使用した。第2葉が完全に広がったとき(播種して8日後)に幼苗に噴霧した。真菌コムギ赤さび病菌(*Puccinia triticina*) (PUCCRT; コムギ赤さび病)を効能生物検定において試験生物体として使用した。殺真菌剤の施用後に適用された降雨の量は10mmとした。4回の別々の降雨処理を各殺真菌剤処理に対して使用した。降雨処理は、降雨無し、および殺真菌剤を施用して1、30、または60分後の降雨とした。殺真菌剤、量および降

10

20

30

40

50

雨間隔の各組合せについて3回繰り返しとした。殺真菌剤製剤全ては水で希釈して、所望の噴霧濃度を得た。殺真菌剤は、150リットル毎ヘクタール送達容積、2.1atmおよび速度1.9km/hにセットしたトラック噴霧器を使用して施用した。フラットファンTeeJet 8003ノズルチップを使用した。ノズルチップは幼苗の頂点の50cm上とした。全ての殺真菌剤製剤は推奨圃場量(1X)の1/4、1/8および1/16で施用した。表15はこれら試験の結果を示す。

【0172】

【表17】

**表 15. 模擬降雨事象後の化合物 A を含む種々の噴霧施用の
製剤によるコムギ植物体上での病害防除**

活性成分 (1×量)	製剤	天気事象	示されている施用量での PUCCRT 1DP の%病害防除 ¹		
			1/4X	1/8X	1/16X
化合物 A (130g ai/ha)	サンプル 1	降雨無し	100	100	98
		1 分後に降雨	100	99	95
		30 分後に降雨	100	98	92
		60 分後に降雨	100	98	92
化合物 A + プロチオコナゾール (100+200g ai/ha)	サンプル 2	降雨無し	100	100	99
		1 分後に降雨	100	99	91
		30 分後に降雨	100	96	81
		60 分後に降雨	100	97	91
化合物 A + プロチオコナゾール (100+200g ai/ha)	サンプル 4	降雨無し	100	100	89
		1 分後に降雨	100	99	61
		30 分後に降雨	100	98	56
		60 分後に降雨	100	99	50
化合物 A + ピラクロストロビン (100+125g ai/ha)	サンプル 5	降雨無し	100	100	99
		1 分後に降雨	100	100	83
		30 分後に降雨	100	100	90
		60 分後に降雨	100	99	89

¹各活性成分の施用量は、それぞれの活性成分につき第1列に示されている1×量の、それぞれ1/4、1/8および1/16である。

【0173】

本発明は、本明細書において開示されている実施形態によって範囲において限定されるものではなく、本明細書において開示されている実施形態は、本発明の複数の態様の説明として意図されているものであり、機能的に等価である任意の実施形態は、本発明の範囲内である。本明細書において示されているものおよび記載されているものに加えて、プロセス、方法および組成物の様々な改変は、当業者に明らかになり、付属の特許請求の範囲に包含されることを意図するものである。さらに、本明細書において開示されているプロセスおよび方法ステップならびに組成物構成成分のある特定の代表的な組合せのみが、上記実施形態で具体的に論述されているが、本組成物構成成分ならびにプロセスおよび方法ステップの他の組合せは、当業者にとって明らかになり、付属の特許請求の範囲に包含されることも意図するものである。したがって、構成成分またはステップの組合せは、本明細書において明白に記述し得る。しかし、明白に言明されていなくても、構成成分およびステップの他の組合せが包含される。本明細書で使用する、含む(comprising)という用語およびその変形は、含む(including)という用語およびその変形と同義に使用され、かつ開いた非限定的な用語である。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(31)優先権主張番号 62/098,202

(32)優先日 平成26年12月30日(2014.12.30)

(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(74)代理人 100104282

弁理士 鈴木 康仁

(72)発明者 ホブキンス, デレク ジェイ.

ニュージーランド国 4620, ニュー プリマス, パリトゥトゥ ロード 89

(72)発明者 キャシー, シェリル アン

ニュージーランド国 4620, ニュー プリマス, パリトゥトゥ ロード 89

(72)発明者 マシソン, トッド

アメリカ合衆国 インディアナ州 46268, インディアナポリス, ザイオンズヴィル ロード
9330

(72)発明者 フォスター, ネイル

フランス国 ドリュゼナウム 67410, ルート ドゥ ヘルリスハイム 8, エスピー 20
ゾーン インダストリエル

審査官 神谷 昌克

(56)参考文献 国際公開第2013/116251(WO, A1)

国際公開第2014/149603(WO, A1)

国際公開第00/026191(WO, A1)

国際公開第99/040081(WO, A1)

特表2013-507372(JP, A)

特表2013-532732(JP, A)

特開昭56-020503(JP, A)

国際公開第2014/106254(WO, A1)

特表2005-507921(JP, A)

米国特許出願公開第2014/0187590(US, A1)

米国特許出願公開第2014/0187587(US, A1)

国際公開第2013/126948(WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N

CAplus/REGISTRY(STN)