

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2012-107038

(P2012-107038A)

(43) 公開日 平成24年6月7日(2012.6.7)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
AO 1 N 25/00 (2006.01)	AO 1 N 25/00 1 O 1	4 H O 1 1
AO 1 N 35/10 (2006.01)	AO 1 N 35/10	
AO 1 P 13/00 (2006.01)	AO 1 P 13/00	
AO 1 N 33/04 (2006.01)	AO 1 N 33/04	
AO 1 N 25/28 (2006.01)	AO 1 N 25/28	

審査請求 有 請求項の数 14 O L 外国語出願 (全 18 頁)

(21) 出願番号	特願2012-27308 (P2012-27308)	(71) 出願人	500371307 シンジェンタ リミテッド
(22) 出願日	平成24年2月10日 (2012.2.10)		
(62) 分割の表示	特願2006-522418 (P2006-522418) の分割		イギリス国 サリー ジーユー2 7ワイ エイチ, ギルドフォード, サリー リサー チ パーク, プリーストリー ロード, ユ アロピーアン リージョナル センター
原出願日	平成16年8月6日 (2004.8.6)		
(31) 優先権主張番号	0318448.8	(74) 代理人	100099759 弁理士 青木 篤
(32) 優先日	平成15年8月6日 (2003.8.6)	(74) 代理人	100077517 弁理士 石田 敬
(33) 優先権主張国	英国 (GB)	(74) 代理人	100087871 弁理士 福本 積
		(74) 代理人	100087413 弁理士 古賀 哲次

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アジュバント及びハイドロトロブ剤を含む農薬濃縮物

(57) 【要約】

【課題】本発明は、連続相が油性のアジュバント及び前記連続相内で前記アジュバントを可溶化させる能力をもつハイドロトロブ剤をも含んで成ることを特徴とする、連続含水単層を有する農薬濃縮物、これらの濃縮物を製造するプロセス及びこれらの濃縮物の使用方法を提供することを目的とする。

【解決手段】本発明は、連続含水相を有する農薬濃縮物であって、該連続相が油性アジュバント、及び該連続相において該アジュバントを溶解することができるハイドロトロブ剤を含み；該アジュバントが合成又は脂肪酸、アルコール及びアミンの長鎖エトキシレートバージョンから選択され；該ハイドロトロブ剤がフェノールタイプのハイドロトロブ剤であり；該アジュバント対ハイドロトロブ剤の比が1：10～10：1である、農薬濃縮物を提供する。

【選択図】なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

連続含水相を有する農薬濃縮物であって、該連続相が油性アジュバント、及び該連続相において該アジュバントを溶解することができるヒドロトロップ剤を含み；該アジュバントが合成又は脂肪酸、アルコール及びアミンの長鎖エトキシレートバージョンから選択され；該ヒドロトロップ剤がフェノールタイプのヒドロトロップ剤であり；該アジュバント対ヒドロトロップ剤の比が 1 : 10 ~ 10 : 1 である、農薬濃縮物。

【請求項 2】

ヒドロトロップ剤がサリチル酸ナトリウムである、請求項 1 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 3】

油性アジュバントが獣脂エトキシル化アミンである、請求項 2 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 4】

油性アジュバントが農薬濃縮物の 10 重量 % 以上の濃度で存在する、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の農薬濃縮物。

【請求項 5】

連続相内に分散した第 2 相を含有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の農薬濃縮物。

【請求項 6】

第 2 相が固体である、請求項 5 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 7】

第 2 相が水不混和性液体を含む、請求項 5 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 8】

第 2 相がマイクロカプセル化されている、請求項 5 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 9】

第 2 相がマイクロエマルジョンである、請求項 5 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 10】

連続相内に分散した水不混和性液体を含む第 3 相を含有する、請求項 6 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 11】

連続相内に溶解した農薬を含む、請求項 4 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 12】

第 2 相が農薬を含む、請求項 6 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の農薬濃縮物。

【請求項 13】

第 2 相が農薬を含むか又は第 3 相が農薬を含むか又は、これらの両方の相が各々同じ又は異なる農薬であり得る農薬を含む、請求項 10 に記載の農薬濃縮物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の農薬濃縮物が中に分散している連続油相。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、水性製剤特に水性製剤濃縮物、例えば水性農薬製剤濃縮物、これらの製剤の製造プロセス及びこれらの製剤の使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

カナダ特許第 1 1 8 6 2 1 7 号は、任意には低濃度の機能的助剤の存在下で水中に液体農薬を可溶化するためのヒドロトロップ剤の使用を開示している。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

農薬製剤濃縮物は往々にして水性の組成物として販売されている。製剤濃縮物は、例え

10

20

30

40

50

ば噴霧などによる散布の前に希釈するように意図されている。水性製剤濃縮物は、[乳化性濃縮物 (E C) といったような製剤タイプにおいて使用される] 溶剤の必要性を回避又は削減でき、優れた取扱い特性を有し、引火性をもたず、一般に毒性が低く、植物毒性が低く、原料が安価であり、製造コストが安く、臭いが少ないことから、望ましいものである。

【 0 0 0 4 】

水性組成物は、可溶性濃縮物 (S L)、エマルジョン (水中油形 (E W) 及び油中水形 (E O) の両方)、マイクロエマルジョン (M E)、懸濁液濃縮物 (S C) 及びカプセル懸濁液 (C S) を含む一定数の製剤タイプから選択可能であるということが知られている。いずれのケースでも選択される製剤タイプは、考慮対象の特定の目的及びその組成物の成分の物理的、化学的及び生物学的特性により左右される。

10

【 0 0 0 5 】

可溶性濃縮物 (S L) は、例えば農薬といった化合物を水中に溶解させることによって調製可能である。これらの溶液は、(例えば水希釈性を改善するか又はスプレータンク中での結晶化を防ぐため) 界面活性剤を含有し得る。

【 0 0 0 6 】

水中油形エマルジョン (E W) は、例えば (任意には単数又は複数の湿潤剤、単数又は複数の乳化剤又はこれらの作用物質の混合物を含有する) 有機溶剤中に化合物、例えば農薬を溶解させることによって調製可能である。農薬 E W の調製には、液体として (それ室温で液体でない場合、標準的には 7 0 °C という合理的な温度で融解可能である) か又は溶液の形で (それを適切な溶剤中に溶解させることによる) 農薬を得る段階そしてその後、結果として得られた液体又は溶液を単数又は複数の表面活性剤 (S F A) を含有する水の中に高いせん断下で乳化させてエマルジョンを生成する段階が含まれる。E W 中での使用のための適切な溶剤には、植物油、塩素化炭化水素 (例えばクロロベンゼン)、芳香族溶剤 (例えばアルキルベンゼン又はアルキルナフタレン) 及び低い水溶性しかもたないその他の適切な有機溶剤が含まれる。油中水エマルジョン (E O) は E W と類似の要領で調製され得、非常に大量の油の投入が必要とされる場合又は成分の性質により要求される場合には、E W よりもさらに適切である可能性がある。E O 製剤は 2 相であり、水のスプレータンクに付加される時に相反転させるように設計されている。

20

【 0 0 0 7 】

S F A は、界面張力を低下させかくしてその他の特性 (例えば分散、乳化及び加湿) の変化を導くことにより界面 (例えば液体 / 固体、液体 / 空気又は液体 / 液体界面) の物性を修正することのできる化学物質である。

30

【 0 0 0 8 】

マイクロエマルジョン (M E) は、単数又は複数の S F A と単数又は複数の溶剤の配合物と水を混合して、自然発生的に熱力学的に安定した液体製剤を生成することによって調製可能である。農薬 M E を調製するためには、最初水又は溶剤 / S F A 配合物のいずれかの中に農薬が存在する。M E 中で使用するための適切な溶剤には、E W 中での使用に関して上述したものが含まれる。M E は水中油又は油中水系のいずれであってもよく (どの系が存在するかは、導電性測定によって決定可能である)、同一製剤中で水溶性及び油溶性農薬を混合するために適しているかもしれない。M E は水中への希釈に適しており、マイクロエマルジョンとして残るか又は従来の水中油形エマルジョンを形成するかのものである。

40

【 0 0 0 9 】

懸濁液濃縮物 (S C) は、細かく分割された不溶性固体粒子の水性又は非水性懸濁液を含み得る。農薬 S C は、適切な媒質中で、任意には単数又は複数の分散剤と共に固体農薬をボールミル又はビードミル粉碎して農薬の細かい粒子懸濁液を生成することによって調製可能である。組成物中には単数又は複数の湿潤剤が含まれていてよく、粒子の沈降速度を低減させるべく懸濁剤を内含させてもよい。代替的には、農薬を乾式粉碎し、以上で記述した作用物質を含有する水に添加して所望の最終生成物を生成することもできる。

50

【 0 0 1 0 】

E W 製剤の調製と類似の要領でカプセル懸濁液 (C S) を調製することができるが、ただこの場合、各油滴が重合体シェルに封入され農薬そして任意にはそのための担体又は希釈剤を含有している油滴水性分散が得られるような形の付加的な重合段階が伴う。重合体シェルは、界面重縮合反応又はコアセルベーション手順のいずれかにより生成可能である。農薬組成物は、農薬の制御放出を提供し、農薬に対する作業員の曝露を低減させることができ、そうでなければそれらを種子処理のために使用することが可能である。

【 0 0 1 1 】

一部の組成物は、単数又は複数のその他の農薬又はその他の添加剤と農薬との混合物を含有し得る。一部の混合物は、同じ従来製の剤タイプに容易に順応しないように著しく異なる物理的、化学的又は生物学的特性を有する農薬又は添加剤を含み得る。これらの状況下で、その他の剤タイプを調製することができる。例えば、1つの農薬が不水溶性固体であり、もう1つの農薬が不水溶性液体である場合、それでも、(S C のものと類似の調製を用いて) 懸濁液として固体農薬を分散させる (E W のものと類似の調製を用いて) 一方でエマルジョンとして液体農薬を分散させることによって、同じ水性相内に各々の農薬を分散させることが可能であり得る。結果として得られる組成物はサスポエマルジョン (S E) 製剤である。

【 発明を実施するための形態 】

【 0 0 1 2 】

「農薬」という用語には、除草剤、防かび剤及び殺虫剤が含まれる。

【 0 0 1 3 】

分散中に固体又は液体を維持するために、一般に分散助剤が使用され、農薬のバイオパフォーマンス (活性) を増強するために一般にアジュバントが用いられる。アジュバントは、単純な界面活性剤から油の多成分配合物に至るまで、複雑さが変動し得る。かかるアジュバントは、農薬製剤とは別に農業用スプレータンクに添加される「タンク混合」アジュバント系であってよいが、S C、E W、S E、S L、C S 又は M E といったように1つの製剤濃縮物に全ての必要な分散助剤及びアジュバントが直接取込まれている (「組込み型」) 製剤を提供することがより便利である。こうして、農業従事者は適正なアジュバントを確実に使用することになり、又農薬に対するアジュバントの比率も制御される。農薬のバイオパフォーマンスを増強する上では油性のアジュバントが特に有用であるが、これは、望ましいほどに高い濃度で水性濃縮物に組込むのが本質的に困難なものでもある。本書で使用されている「油性のアジュバント」という用語は、農薬濃縮物の水性連続相の中で実質的に不溶である液体アジュバント又はアジュバント混合物を意味する。

【 0 0 1 4 】

S C、E W、S E、S L、C S 又は M E 製剤濃縮物は、界面活性剤及び油配合物と共に処方され得るが、特に該濃縮物は長期間にわたりかつ商業的使用の間に遭遇する極度の温度下で物理的に安定している必要があるため、これが非相溶性の問題を発生させることが多い。安定性の問題には、フロキュレーション、不均一フロキュレーション、分散した固体の結晶成長、分散した液体のクリーム化、アジュバント / 界面活性剤系のクリーム化、相分離及び化学分解が含まれ得る。

【 0 0 1 5 】

従って、それが高負荷でのバイオパフォーマンス増強用油性アジュバントを含有する「タンク混合型」又は「組込み型」のいずれかの製剤であろうと、物理的に安定した農薬濃縮物を提供することが望まれる。本発明は、ハイドロトロブ剤の使用を通してこの必要性を満たしている。

【 0 0 1 6 】

本発明の状況下では、農薬濃縮物は必ずしも農薬化合物を含有しているわけではない。農薬濃縮物は、単に、正に農薬化合物を含有するもう1つの農薬濃縮物と「タンク混合する」ことを意図したアジュバント系であり得る。

【 0 0 1 7 】

10

20

30

40

50

本発明に従うと、連続相が同じく油性アジュバント及び連続相中でこのアジュバントを可溶化させる能力をもつハイドロトロブ剤を含んで成るということの特徴とする連続含水単層を有する農薬濃縮物が提供されている。

【0018】

もう一つの態様においては、本発明は、油性アジュバント及び連続相中でこのアジュバントを可溶化させる能力をもつハイドロトロブ剤を含んで成る水性農薬懸濁濃縮物を提供している。

【0019】

ハイドロトロブ剤は、高濃度で水中の非極性化合物（油）の溶解度を増強させる物質である。文献中には、ハイドロトロブ剤の特性についてのいくつかの一貫性のない論述が存在する。本発明の目的では、ハイドロトロブ剤は、きわめて水溶性が高く両親媒性でかつ50重量%未満の濃度で水中に単独で存在する場合にミセルを形成しない物質であると考えられている。ハイドロトロブ剤による油の可溶化は、必要とされるハイドロトロブ剤の濃度が比較的高いこと及び従来のミセル界面活性剤について観察されるものと比較して可溶化される油の量が多いことを特徴とする。本発明で使用できるハイドロトロブ剤の例としては、アニオン性安息香酸塩、アニオン性ベンゾスルホン酸塩、アニオン性リン酸塩及びホスホン酸塩、アニオン性ベンゾリン酸塩、アルキルアリアルリン酸塩及びホスホン酸塩、カテコール及びレゾシノールなどの中性フェノール、脂肪族硫酸グリコール、脂環式胆汁酸塩、脂肪族カルボン酸塩、芳香族カルボン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキナフタレンスルホン酸塩、重合体ナフタレンスルホン酸塩及びそれらの共それらの共重合体、アルキルアリアルスルホン酸塩及びカルボン酸塩及びそれらの重合体及び共重合体、ナフタレン及びアルキルナフタレンリン酸塩及びホスホン酸塩及びそれらの重合体及び共重合体、グリコール及びグリセロールエーテル及びアミノ酸プロリンがある。一般に、一定の与えられたハイドロトロブ剤は、特定の油又は油配合物群を可溶化することになる。単純な試験管実験により、潜在的ハイドロトロブ剤/油混合物を迅速かつ容易に査定することが可能となる。ハイドロトロブ剤混合物は、目で検出可能な単層を形成する。

【0020】

上述のハイドロトロブ剤と組合わせた使用に適した油性農薬アジュバントの例としては、種子油、メチル化種子油、脂肪酸トリグリセリド及び脂肪族アミン、脂肪酸及び脂肪族アミンのメチルエステル、線状、有枝又は線状と有枝の混合物であり得る鉱油、芳香族油、脂肪アルコール、脂肪酸、脂肪アミン、脂肪アルコール、脂肪族アミン、脂肪族エステル、脂肪族カルボン酸、脂肪族ケトン、脂肪族アルデヒド、脂肪族アミド、芳香族カルボン酸、芳香族アルコール及びフェノール、芳香族ケトン、芳香族アルデヒド、芳香族アミン又はアニリン又はアニリド、芳香族アミド、テルペン、セスキテルペン及びジテルペンといった天然産物、アルキル又はアリアル又はアルキルアリアルリン酸塩及びホスホン酸塩を挙げることができる。同様に含まれているのは、上述の油のハロゲン化変異体である。同様に、エトキシ化度が過度に長くなく、例えば4未満の平均エトキシ化度を有することを条件として、言及されたアルコール、アミン及び酸のエトキシ化された変異体も適切である。Brij 92 [BRIJは商標である]、平均2モルのエトキシレートに伴うエトキシ化オレイルアルコール、が適切なエトキシ化脂肪アルコールの一例であり、Ethomeen S 12 [ETHOMEENは商標である]、が短鎖エトキシ化脂肪族アミンの一例である。シリコン油も同様に適切である。例えば、油と短鎖エトキシレートの独自開発の配合物であるTurbocharge (TurbochargeはSyngenta Limitedの商標である)といったように、油配合物も同様に使用可能である。油及び短鎖エトキシレートのその他の市販の配合物としては、Merge、Dash、Break Thru 464及びAgridex [これは全て商標である]が含まれる。市販の製品Agral 90 [AGRALは商標である]は、エトキシ化ニルフェノールの配合物である。

【0021】

油アジュバントのもう一つのグループとしては、合成又は脂肪酸、アルコール及びアミ

10

20

30

40

50

ンの長鎖エトキシレートバージョンが含まれる。これらのアジュバントは、それらが水中において高濃度で粘性の六角形又は立方体相を形成するという点で普通ではない。ハイドロトロブ剤を使用して、このようなことが起こるのを防止し、かくして本発明の農薬濃縮物内で高い負荷を達成することが可能である。農薬のバイオパフォーマンスを改善すべく使用するのに適したハイドロトロブ剤と油性アジュバントの好ましい組合せの例としては、次のものに言及することができる：

(a) 脂肪アルコール、脂肪酸又は脂肪族アミン及びそれらの単純な誘導体例えばメチルエステル及び植物テルペンから誘導されたアジュバント油と組合せた形のアンモニウムクメンシルホン酸塩及びアンモニウムキシレンシルホン酸塩といったようなベンゾシルホン酸塩とハイドロトロブ剤。

(b) 特に線状又は有枝鉱油とも配合されている場合の、脂肪アルコール、脂肪酸又は脂肪族アミン及びそれらの単純な誘導体例えばメチルエステル及び短鎖エトキシレートと組合せた形の、5(6)-カルボキシ-4-ヘキシル-2-シクロヘキサン-1-オクタン酸のカリウム塩(WESTVACCOH 240の商標名で市販されている)といったようなアニオン性アルキルアリアルカルボン酸塩ハイドロトロブ剤。

(c) 合成又は脂肪酸、アルコール及びアミンの長鎖エトキシレートバージョンと組合せた形のサリチル酸ナトリウムといったようなフェノールタイプのハイドロトロブ剤。

【0022】

上述のタイプ(a)の好ましい例としては、オレイルアルコール又は植物テルペンフィトール又は植物テルペンゲラニオールと組合せた形のハイドロトロブ剤アンモニウムクメンシルホン酸塩及び植物テルペンゲラニオールと組合せた形のハイドロトロブ剤アンモニウムキシレンシルホン酸塩を挙げることができる。上述のタイプ(b)の好ましい組合せとしては、オレイルアルコール又は市販のアジュバントTurbochargeと組合せた形のハイドロトロブ剤5(6)-カルボキシ-4-ヘキシル-2-シクロヘキサン-1-オクタン酸に言及することができる。上述のタイプ(c)の好ましい組合せとしては、ETHOMEENT 25[獣脂エトキシ化アミン; ETHOMEENは商標である]と組合せた形のハイドロトロブ剤サリチル酸ナトリウムに言及することができる。我々は、標的植物に害を与えないことを意図している選択的除草剤、殺虫剤及び防かび剤といった農薬については、油性アジュバントとハイドロトロブ剤の組込み型組合せが、同等の生物活性を送達しながら、従来のタンク混合型アジュバント系に比べ標的植物に対する薬害が少ない可能性が高い、ということを見出した。ハイドロトロブ剤系は同様に、本発明の農薬濃縮物が同様に、さらに少量の油性アジュバントを使用しているにもかかわらず従来の製剤濃縮物と等価の生物活性を送達することもできるという生物学的利点をも提供する。

【0023】

従って、該発明のもう1つの態様においては、低い植物毒性を提供するための本発明の農薬濃縮物の使用が提供されている。

【0024】

ハイドロトロブ剤によって、任意には本発明の濃縮物内で農薬を分散される水性媒質内へと油性アジュバントが可溶化される、ということは言うまでもない。該水性媒質は必ずしも物理的意味での真の溶液である必要はなく、目にそして顕微鏡で単層であるように見え、長期にわたりかつ数多くのケースで基本的に無期限でその状態にとどまることになる。本発明のハイドロトロブ剤で可溶化された系のさらなる利点は、比較的高レベルの油性アジュバントを取込むことができるだけでなく結果として得られる組成物が比較的低い粘度を有するという点にある。かかる組成物は、難なく又容器中に過度の残渣を残すことなく容器から注がれる。該組成物は、スプレータンク内で容易に希釈され、空の容器中に残っているあらゆる残渣は単純かつ容易に洗い流される。該発明の組成物は標準的に、室温で1000cp未満の粘度を有するニュートン流体である。

【0025】

本発明は、製剤濃縮物内に存在する農薬の性質に決定的に左右されることはない。当業者であれば、一定の与えられた農薬が特定の製剤タイプに適するための基準を充分認識す

10

20

30

40

50

ることだろう。濃縮物としての製剤に適した除草剤の例としては、メソトリオン、フォメサフェン、トラルコキシジム、ナプロパミド、アミトラズ、プロパニル、ピリメタニル、ジクロラン、テクナゼン、トクロフォスメチル、フラムプロブM、2,4-D、MCPA、メコプロブ、クロジナホップ、クロジナホップ-プロパルギル、シハロホップ-ブチル、ジクロホップメチル、ハロキシホップ、キザロホップ-P、インドール-3-イル酢酸、1-ナフチル酢酸、イソキサベン、テブタム、クロルタールジメチル、ベノミル、ベンフレセート、ジカンバ、ジクロベニル、ベナゾリン、トリアゾキシド、フルアズロン、テフルベンズロン、フェンメジファミン、アセトクロール、アラクロール、メトラクロール、プレチラクロール、テニルクロール、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、シクロジム、セトキシジム、テブラロキシジム、ペンジメタリン、ジノテルブ、ピフェノックス、オキシフルオルフェン、アシフルオルフェン、フルオログリコフェン-エチル、プロモキシニル、アオキシニル、イマザメタベンズ-メチル、イマザビル、イマザキン、イマゼタビル、イマザピック、イマザモックス、フルミオキサジン、フルミクロラク-ペンチル、ピクロラム、アモドスルフロン、クロロスルフロン、ニコスルフロン、リムスルフロン、トリアスルフロン、トリアラート、ペブラート、プロスルホカルブ、モリネート、アトラジン、シマジン、シアナジン、アメトリン、プロメトリン、テルブチラジン、テルブトリン、スルコトリオン、イソプロトロン、リヌロン、フェヌロン、クロロトルロン及びメトキシウロンを挙げることができる。

10

【0026】

濃縮物としての製剤に適した防かび剤の例としては、アゾキシストロビン、トリフロキシストロビン、クレトキシムメチル、ファモキサドン、メトミノストロビン及びピコキシストロビン、シプロダニル、カルベンダジム、チアベンダゾール、ジメトモルフ、ピンクロゾリン、イプロジオン、ジチオカルバマート、イマザリル、プロクロラズ、フルキンコナゾール、エポキシコナゾール、フルトリアフォル、アザコナゾール、ピテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ヘキサコナゾール、パクロブトラゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、トリアジメフォン、トリチコナゾール、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、マンコゼブ、メチラム、クロロタロニル、チラム、ジラム、カプタフォル、カプタン、ホルベット、フルジナム、フルトラニル、カルボキシニル、メタラキシル、ブピリマート、エチリモール、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、オリザストロビン、メトミノストロビン及びプロチオコナゾールがある。

20

30

【0027】

濃縮物としての製剤に適した殺虫剤の例としては、チアメトキサム、イミダクロプリド、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、ニテンピラム、フィプロニル、アバメクチン、エマメクチン、ベンジオカルブ、カルバリル、フェノキシカルブ、イソプロカルブ、ピリミカルブ、プロボクスール、キシリルカルブ、アスラム、クロルプロファミン、エンドスルファン、ヘプタクロール、テブフェノジド、ベンスルタブ、ジエトフェンカルブ、ピリミフォスメチル、アルジカルブ、メトミル、シブルメトリン、ピオアレトリン、デルタメトリン、ラムダシハロトリン、シハロトリン、シフルトリン、フェンバレラート、イミプロトリン、ペルメトリン、ハルフェンプロクス及びテフルトリンがある。

40

【0028】

以上のリストは網羅的なものではなく、その他の例も当業者には明らかとなると思われる。

【0029】

本発明の農薬濃縮物は同様に、水性媒質中の農薬の分散を補助するため単数又は複数の界面活性剤又は分散剤を取込むことができる(分散系)。該分散系は一般に農薬のバイオパフォーマンスの増強に貢献せず、主として分散した農薬を分散状態に維持する上で一助となるように存在している。換言すると、油性アジュバントは一般に、農薬を分散状態に維持する上で直接助けとはならない。濃縮物のための分散系を形成するのに適した数多くの個々の分散剤及びその混合物が当業者にとって既知であり、非常に広範囲の選択肢があ

50

る。分散系を形成するために用いることのできる標準的分散剤としては、酸化エチレン及び酸化プロピレンの共重合体、スルホン酸ナフタレンホルムアルデヒド共重合体といったようなホルムアルデヒドとのスルホン酸アルキルアール及びアールの共重合体、ジイソブチレン又は酸化エチレン又はスチレン又はビニルピロリドンとアクリル酸の共重合体の塩、酸化エチレン又はジイソブチレン又はビニルピロリドン又は酸化プロピレンと硫酸スチレンの共重合体の塩、フェノールがエトキシル化され任意にはスルホン化又はリン酸化されているトリスチリルフェノールタイプの分散剤、エトキシル化アルキルフェノール、ポリビニルアルコール及び置換された又は硫酸化されたポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン及びその共重合体が含まれる。

【0030】

農薬は従来5～60重量%、標準的には約10～35重量%の濃度で濃縮物中に存在する。ハイドロトロブ剤は、適切には、5～50重量%、標準的には約15～30重量%の濃度で濃縮物中に存在する。油性アジュバントは適切には、10重量%以上、好適には0～60重量%そして標準的には10～40重量%で存在する。分散系は、標準的には0～40重量%、好ましくは0～20重量%の合計分散剤濃度で存在する。該分散系は、分散剤混合物を含み得る。分散剤混合物の標準的な例としては、0～20%例えば1～9% w/wの濃度のAtlox 10/5又はBr i j 96といったようなさらなる分散剤と組合せた0～20%、例えば1～8% w/wの量のAtlox 4894又はAtlox 4896 [ATLOXは商標である]といったような酸化エチレン及び酸化プロピレンの共重合体が含まれる。

【0031】

油性アジュバント対ハイドロトロブ剤の比は適切には1:10～10:1、例えば1:3～3:1まで変動する。

【0032】

さらなる態様においては、本発明は、連続単層中に分散した第2の相を含有する上述の通りの農薬濃縮物を提供する。1つの態様においては、該第2相は固体である[この態様には、該発明のSC製剤が含まれる]。もう1つの態様においては、第2相は、水不混和性液体である[この態様には該発明のEW製剤が含まれる]。好都合には、第2相はマイクロ封入されている[この態様には該発明のCS製剤が含まれる]。代替的には、第2相はマイクロエマルジョンであり得る[この態様には、該発明のMEEMが含まれる]。

【0033】

さらにもう1つの態様においては、本発明は連続単層内に分散した水不混和性液体を含む第3の相を含有する上述の通りの農薬濃縮物を提供する[この態様には、該発明のSE製剤が含まれる]。

【0034】

さらにもう1つの態様においては、本発明は、連続相内に溶解した農薬を含む農薬濃縮物を提供している。

【0035】

もう1つの態様においては、本発明は、第2相が農薬を含む農薬濃縮物を提供する。

【0036】

さらにもう1つの態様においては、本発明は、第2相が農薬を含むか又は第3相が農薬を含むか又はこれらの両方の相が各々同じ又は異なる農薬であり得る農薬を含む上述の通りの農薬濃縮物を提供する。

【0037】

さらにもう1つの態様では、本発明は、上述の通りの農薬濃縮物が中に分散している連続相を提供している[この態様には、該発明のEO製剤が含まれる]。

【0038】

本発明の製剤濃縮物は、従来技術により調製可能である。ただし以前は、従来技術では、粘度に関係する問題に起因して、油性アジュバントをプロセスの早い時点で容易に導入することはできなかつた。油性アジュバントと共にハイドロトロブ剤を使用するこ

10

20

30

40

50

とでこれらの粘度の問題を削減させることができるため、本発明の連続相をまず最初に調製して次にその前記連続相内で任意の後続処理を行なうことが可能であることが現在わかっている。こうして、高濃度の製品の調製、より高速での生産、より少ない生産容器の使用が可能となり、プロセス全体のコスト削減へとつながる。

【0039】

従って、本発明のもう一つの態様に従うと、連続相がまず最初に調製され、次に任意の後続処理が前記連続相中で行なわれる、本発明の農薬濃縮物の製造のためのプロセスが提供されている。

【0040】

懸濁液濃縮物は従来の技術を用いて作製できる。標準的には、商業的実践においては、所望の粒度に達するまで水中で固体除草剤が摩砕される。粒度は標準的には体積平均径で0.5~15ミクロン、例えば1~5ミクロンである。ハイドロトロブ剤及び油性アジュバントを添加する段階は、さほど重要ではない。摩砕の前、途中又は後に水性系に対し油と共にハイドロトロブ剤を添加することが一般に好都合である。

10

【0041】

本発明のもう一つの態様に従うと、任意には分散系の存在下で水中で固体農薬を摩砕する段階を含む懸濁液濃縮物の製造プロセスにおいて、組成物中にはハイドロトロブ剤及び農薬のための油性アジュバントが取込まれていることを特徴とするプロセスが提供されている。

20

【実施例】

【0042】

該発明は、全ての部分及び百分率が相反する記述のないかぎり重量単位である以下の制限的意味のない実施例により説明される。実施例の大部分は水性農薬懸濁液濃縮物に関するものであるが、これらをその他の製剤タイプへと容易に修正することができる。

【0043】

実施例中に使用されている製品の組成は、以下のとおりであった：

Morwet D 4 2 5 - Crompton Corporationが販売している市販のアニオン性スルホン酸ナフタレンホルムアルデヒド凝縮物共重合体。

Synperonic 1 0 / 5 - 5モルの酸化エチレンと共に短鎖有枝アルコールを含む市販の界面活性剤。Uniqema Ltdより販売。

30

Atlox 4 8 9 6 - Uniqema Ltdにより販売されているエチレン及びプロピレン酸化物の共重合体凝縮物。

Atlox 4 9 1 3 - Uniqema Ltdにより販売されている、メタクリル酸メチルと酸化エチレンの共重合体凝縮物。

Atlox 4 8 9 4 - Uniqema Ltdにより販売されているエチレン及び酸化プロピレンの共重合体凝縮物。

Brij 9 6 - 平均10モルの酸化エチレンで凝縮された脂肪アルコール。Uniqema Ltdより販売。

Eltesolac 6 0 - Albright及びWilson Ltdにより供給されるアンモニウムクメンスルホン酸塩。

40

【0044】

実施例 1

合計重量5gになるまで約50ミクロンの粒度をもつ除草剤トラルコキシジム(10%)、Morwet D 4 2 5(8%)、Westvacco H 2 4 0(29%)、Turbocharge(30%)、Synperonic 1 0 / 5(6%)及び水(17%)をガラスびんに加えた。Westvacco H 2 4 0はハイドロトロブ剤であり、Turbochargeは油性アジュバントであった。Morwet D 4 2 5及びSynperonic 1 0 / 5は合わさって分散系を形成した。混合物を穏やかに旋回し、Ystralミキサーを用いて1分間せん断し、こうして25ミクロンの体積平均までトラルコキシジムの粒度を低減させた。等体積のNo. 4ジルコニアビーズをガラスびんに添加し、次に30分間実験室振とう機内で30分間振とうした。

50

【0045】

試料は、容易に注いだりピペットで取ったりすることができ、これを、粘度が満足のいくものであることの標示と考えることができた（粘度試験）。試料は、10分の放置時間、1%の希釈度で、攪拌無く水中で容易に分散した（希釈度試験）。

【0046】

試料は同様に標準フロキュレーション試験に合格した。この試験では、CIPAC硬水Cを用いて1%の希釈度の試料を作った。該試料を反転させて均質性を確保し、1時間放置した。この時間の経過後、それを顕微鏡で検査してあらゆるフロキュレーションの兆候を観察した。いかなるフロキュレーションの兆候もなかった場合、試料はフロキュレーション試験を満たしたことになる。

10

【0047】

実施例2～5

実施例1で記述した手順を、表1に示した試料について反復した。これらの試料は全て市販のノク混合型アジュバントTurbochargeと共に市販の除草剤トラルコキシジムを含有していた。全ての試料は粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。

【0048】

表1 - 重量%で表わした組成

【0049】

【表1】

20

例番号	Tralkoxydim	Morwet D425	Westvacco H240	Turbocharge	Synperonic 10/5	水
2	12	4	25	38	0	21
3	16	5	27	25	0	27
4	15	5	25	25	5	25
5	16	2	25	22	0	35

30

【0050】

実施例6～11

表2でリストアップした組成物を、実施例1の手順を用いて調製した。ただし、各ケースにおいて、分散剤Morwet D425をAtlox4894で置換した。全ての試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。

【0051】

表2 - 重量%で表わした組成

【0052】

40

【表 2】

例番号	Tralkoxydim	Westvacco H240	Turbocharge	Synperonic 10/5	Atlox 4894	水
6	10	25	17	9	8	31
7	10	30	25	8	6	21
8	10	20	30	3	8	29
9	13	19	26	3	8	31
10	10	22	11	5	0	52
11	20	31	20	7	8	14

10

【0053】

実施例 12 ~ 15

表 3 でリストアップした組成物を、実施例 1 の手順を用いて調製した。実施例は、異なる分散系の使用を例示している。全ての試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。表 3 中、D 1 は Atlox 4 8 9 6、D 2 は Atlox 4 9 1 3、D 3 は Atlox 4 8 9 4 そして D 4 は Morwet D 4 2 5 である。

20

【0054】

表 3 - 重量%で表わした組成

【0055】

【表 3】

例番号	Tralkoxydim	Westvacco H240	Turbocharge	Synperonic 10/5	水	D1	D2	D3	D4
12	20	31	20	7	14	8	0	0	0
13	20	31	20	7	14	4	4	0	0
14	20	31	20	7	14	0	0	4	4
15	20	31	20	7	14	0	0	8	0

30

【0056】

実施例 16 ~ 17

表 4 でリストアップした組成物を、実施例 1 の手順を用いて調製した。実施例は、異なる分散系の使用を例示している。全ての試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。表 4 では C 1 は Synperonic 1 0 / 5、C 2 は Brij 9 6 である。

40

【0057】

表 4 - 重量%で表わした組成

【0058】

【表 4】

例番号	Tralkoxydim	Morwet D425	Westvacco H240	Turbocharge	水	C1	C2
16	15	5	25	25	25	0	5
17	15	5	25	25	25	5	0

10

【0059】

実施例 18 及び 19

表 5 でリストアップした組成物を、実施例 1 の手順を用いて調製した。ただし、トラルコキシジムの代わりに市販の除草剤ジウロンを使用した。全ての試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。

【0060】

表 5 - 重量%で表わした組成

【0061】

【表 5】

20

例番号	Diuron	Atlox 4894	Westvacco H240	Turbocharge	Synperonic 10/5	水
18	13	8	19	26	3	31
19	10	8	20	30	3	29

30

【0062】

実施例 20 ~ 23

表 6 でリストアップした組成物を、実施例 1 の手順を用いて調製した。ただし、トラルコキシジムの代わりに市販の防かび剤ピコキシトロピンを使用した。全ての試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。

【0063】

表 6 - 重量%で表わした組成

【0064】

【表 6】

例番号	Picoxystrobin	Atlox 4894	Westvacco H240	Turbocharge	Synperonic 10/5	水
20	21	6	27	19	4	23
21	24	5	27	17	3	24
22	19	8	26	17	3	27
23	30	8	31	17	3	11

10

【0065】

実施例 2 4

この実施例は、ハイドロトロブ剤アンモニウムクメンスルホン酸塩と共に油オレイルアルコールを含有するハイドロトロブ剤製剤の形成を例示する。

【0066】

ガラスびんに対し、合計重量 5 g になるまで、トラルコキシジム (10%)、Atlox 4894 (8%)、Eltesol 農薬 60 (13%)、オレイルアルコール (30%)、Synperonic 10/5 (3%) 及び水 (36%) を加えた。混合物を穏やかに旋回し、Ystral ミキサーを用いて 1 分間せん断した。等体積の No. 4 ジルコニアビーズをガラスびんに添加し、次に実験室振とう機内で 30 分間振とうした。

20

【0067】

結果として得た試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格した。

【0068】

実施例 2 5

実施例 1 に概略説明した方法を用いて 3 つのハイドロトロブ剤製剤を調製した。表 7 は使用された成分を示す。

30

【0069】

表 7 - 重量% で表わした組成

【0070】

【表 7】

組成	Tralkoxydim	Westvacco H240	Atlox 4894	Turbocharge	Synperonic 10/5	水
H 1	20	31	8	20	7	14
H 2	13	19	8	26	3	31
H 3	10	20	8	30	3	29

40

【0071】

これらの試料は、粘度、希釈度及びフロキュレーション試験に合格し、生物学的試験に使用された。

【0072】

商標名「Achieve 2 5 S C」として入手可能である市販のトラルコキシジム懸濁液濃縮

50

物を基準材料として使用した。懸濁液濃縮物の強さは25% w/wであった。基準材料を、スプレータンク体積の0.2%及び0.5% v/vという2つの割合で市販のTurbochargeとタンク混合した。組成物中のトラルコキシジムに対するTurbochargeの重量比は、50g/haの散布率で以下の表11に示されている。植物の種(トラルコキシジムが有効である雑草)を温室条件下で成長させテストした。Alopecurus myosuroides (ALOMI)、Avena fatua (AVEFA)、Echinochloa crusgalli (ECHCG) 及び Lolium rigidum (LOLR1)を2, 3葉期まで成長させ、Setaria viridis (SETVI)を2, 3葉期まで成長させ、実験用トラックスプレーヤーを用いて100リットル/haの噴霧溶液を噴霧した。農薬散布率は50g/haであった。トラルコキシジムは小麦及び大麦に対して使用するための選択的除草剤であり、従ってこれらの種に対する植物毒性は望ましくない。小麦種Triticum aestivum (TRZAS)「Barrie」品種及び大麦変異株Hordeum vulgare (HORVU)「Bonanza」には、50、100、200及び400g/haの率で噴霧した。作物被害百分率を、散布後11日目及び22日目に査定し、散布後22日目に雑草検査をした。

10

【0073】

表8は、処置から11日後の2つの作物種に対する葉の損害百分率として評定した各々の製剤の植物毒性を示す。評点は、各々の率について3回反復して、全ての率からとった平均値を表わしている。

【0074】

表8 ; 葉の損害 11 DAT %

【0075】

20

【表8】

組成	TRZAS	HORVU
	'Barrie'	'Bonanza'
H1	5	2
H2	3	4
H3	10	2
Achieve SC' + 0.2 % Turbocharge	13	7
Achieve SC' + 0.5 % Turbocharge	15	12

30

【0076】

表9は、5つの雑草種についての各々の製剤の枯れ百分率を示す。トラルコキシジムの最高率(50g/ha)を用い、結果は、3回の反復の平均である。この散布率で、5つの製剤についてのトラルコキシジムに対するTurbochargeの比は、表10に示されている。

40

【0077】

表9 - 雑草種に対する枯れ%

【0078】

【表 9】

処方	ALOMY	AVEFA	LOLRJ	SETVI
H 1	75.0	80.0	63.3	61.7
H 2	88.3	85.0	43.3	46.7
H 3	86.7	93.3	68.3	73.3
Achieve SC' + 0.2 % Turbocharge	86.7	86.7	68.3	65.0
Achieve SC' + 0.5 % Turbocharge	86.7	90.0	83.3	66.7

10

【 0 0 7 9 】

表 1 0 - Turbocharge対トラルコキシジムの比

【 0 0 8 0 】

【表 1 0】

処方	Turbocharge/Tralkoxydimの比
H1	1
H2	2
H3	3
Achieve SC' + 0.2 % Turbocharge	3.5
Achieve SC' + 0.5 % Turbocharge	8.75

20

30

【 0 0 8 1 】

除草薬としての各製剤の生物学的効能は、統計的に同じである。ハイドロトロップ剤製剤は全て、タンク混合された製剤よりもトラルコキシジムの関係において少ないTurbochargeを含有していたことから、これらは、タンク混合型製剤に比べて、作用種に対する植物毒性がより低いと同時にこれと同じ位又はそれ以上に優れていた。

【 0 0 8 2 】

実施例 2 6

この実施例は、ハイドロトロップ剤Westvacco H 2 4 0 と共に油アジュバントオレイルアルコールを含有するハイドロトロップ剤製剤の形成を例示している。オレイルアルコールとWestvacco H 2 4 0 を 1 : 1 の重量比で室温で混合し、重量比で 3 0 : 5 0 : 2 0 の水、オレイルアルコール及び 5 (6) - カルボキシ - 4 - ヘキシル - 2 - シクロヘキセン - 1 オクタン酸のカリウム塩 [Westvacco H 2 4 0 のハイドロトロップ剤] の混合物を導いた；均質の単層液体が自然に形成した。

40

【 0 0 8 3 】

実施例 2 7

この実施例は、ハイドロトロップ剤サリチル酸ナトリウムと共に油アジュバントEthomeen T 2 5 を含有するハイドロトロップ剤製剤の形成を例示している。水、Ethomeen T 2 5 及びサリチル酸ナトリウムを 2 5 : 5 0 : 2 5 の重量比で室温で混合した。このハイドロトロップ剤製剤は水で希釈でき、比較的粘度が低くなったが、そのハイドロトロップ剤と

50

しての性質は保持していた。これとは対照的にEthomeen T 2 5 単独では、水で希釈した場合に粘性ゲル相を形成した。

【 0 0 8 4 】

実施例 2 8

この実施例は、ハイドロトロブ剤Westvacco H 2 4 0 と共に油アジュバントTurbochargeを含有するハイドロトロブ剤製剤の形成を例示している。TurbochargeとWestvacco H 2 4 0 を 1 : 1 の重量比で室温で混合し、重量比で 3 0 : 5 0 : 2 0 の水、Turbocharge 及び 5 (6) - カルボキシ - 4 - ヘキシル - 2 - シクロヘキセン - 1 オクタン酸のカリウム塩 [Westvacco H 2 4 0 のハイドロトロブ剤] の混合物を導いた ; 均質の単層液体が自然に形成した。このハイドロトロブ剤製剤は、水で希釈しても、高希釈度でそれが細かいエマルジョンを形成するまで、そのハイドロトロブ剤としての性質を保持することができた。

フロントページの続き

(74)代理人 100117019

弁理士 渡辺 陽一

(74)代理人 100141977

弁理士 中島 勝

(74)代理人 100150810

弁理士 武居 良太郎

(72)発明者 ベル, ゴードン アラスター

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イーワイ, ブラックネル, ジェロッツ ヒル リ
サーチ ステーション, シンジエンタ リミテッド

(72)発明者 ラムセイ, ガイ

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イーワイ, ブラックネル, ジェロッツ ヒル リ
サーチ ステーション, シンジエンタ リミテッド

Fターム(参考) 4H011 AB01 BA01 BB04 BB05 BC06 DA16 DC05 DD03 DF04

【外国語明細書】
2012107038000001.pdf