

申請日期	90 年 5 月 9 日
案 號	90111059
類 別	AcIN ²⁵ / ₈

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	由農作物保護用劑與有機或無機載體物質構成之組合物
	英 文	Combinations of crop protection agents with organic or inorganic carrier materials
二、發明 人	姓 名	(1) 漢斯／彼德·克勞斯 Krause, Hans-Peter (2) 嘉哈德·費理希 Frisch, Gerhard (3) 賀勤·沃茲 Wurtz, Jochen
	國 籍	(1) 德國 (2) 德國 (3) 德國
	住、居所	(1) 德國霍夫漢金貝奇威格二號 Goldbachweg 2, 65719 Hofheim, Germany (2) 德國威爾翰·威斯特華德街七號 Westerwaldstraße 7, D-61273 Wehrheim, Germany (3) 德國萊因河畔賓根葛羅伯霍爾三樓 Große Hohl 3F, 55411 Bingen am Rhein, Germany
	三、申請人	
	姓 名 (名稱)	(1) 艾文提斯人體科學股份有限公司 Aventis CropScience GmbH
	國 籍	(1) 德國
	住、居所 (事務所)	(1) 德國法蘭克福 D-65929 Frankfurt, Germany
	代 表 人 姓 名	(1) 漢斯·瑞培爾 Rippel, H. 委伯特 WeiBert,

申請日期	90 年 5 月 9 日
案 號	90111059
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書		
一、發明 新型名稱	中 文	
	英 文	
二、發明 創作人	姓 名	(4) 優度·比克斯 Bickers, Udo (5) 艾爾溫·海格 Hacker, Erwin (6) 湯馬士·奧樂 Auler, Thomas
	國 籍	(4) 德國 (5) 德國 (6) 德國 (4) 德國威特馬奇根豎德街二號 Sudstraße 2, 49835 Wietmarschen, Germany
	住、居所	(5) 德國赫屈罕市瑪嘉登街十六號 Margarethenstraße 16, D-65239 Hochheim, Germany (6) 德國凱白撒頓波那街十五號 Bonner Strasse 15, 65812 Bad Soden, Germany
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

裝
訂
線

申請日期	90 年 5 月 9 日
案 號	90111059
類 別	

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書		
一、發明 名稱	中 文	
	英 文	
二、發明人 創作	姓 名	(7) 吉爾哈德·史納波 Schnabel, Gerhard (8) 艾凡諾·麥樂德茲 Melendez, Alvaro (9) 達特列夫·哈斯 Haase, Detlev
	國 籍	(7) 德國 (8) 哥倫比亞 (9) 德國
	住、居所	(7) 德國艾爾森菲德安塞爾路十號 Amselweg 10, 63820 Elsenfeld, Germany
		(8) 德國史瓦貝奇蘇茲貝契街十六號 Sulzbacher StaBe 16, 65824 Schwalbach, Germany (9) 德國法蘭克福德洛塞爾三號 Drosselweg 3, 65929 Frankfurt, Germany
三、申請人	姓 名 (名稱)	
	國 籍	
	住、居所 (事務所)	
	代 表 人 姓 名	

裝

訂

線

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6
B6

本案已向：

國 (地區) 申請專利，申請日期： 案號： ， ☐有 ☐無主張優先權
德國 2000 年 5 月 11 日 100 22 989.1 ☒有主張優先權

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

本發明係關於農作物用保護劑與有機或無機載體物質所構成的組合物，其可使活性化合物緩釋。藉由該組合物的使用，在除草劑的情況下，可防止對抗作用且達到特別好的結果，尤其係在除草劑與生長控制劑及解毒劑之混合物的情況下。

在施用各種農化產物（例如，除草劑、殺菌劑、殺蟲劑、植物生長控制劑、解毒劑或肥料）的過程中，已知會發生各種施用問題，例如，因二或多種活性化合物之間的對抗作用所產生之活性降低。此外，亦已知此等現象在葉面施藥的過程中常可觀察到，且尤其係在除草劑的情況下或除草劑與解毒劑及／或生長控制劑之混合物的情況下。

爲了避免此等問題的發生，在因對抗性所造成之活性降低的情況下，例如，「分施法」或引起對抗之活性化合物的過量用藥法已被建議使用。然而，基於各項理由，所有的此等程序皆不具吸引力且不經濟。在使用分施法時，活性化合物製劑必須施用至少二次；此乃耗時且費力的。活性化合物的過量用藥法會造成額外的花費。

美國專利第 5, 428, 000 號揭示包含了闊葉雜草之除草劑及禾草之除草劑的活性化合物組合物。該禾草的除草劑係帶有中性電荷；反之，該闊葉雜草係陰離子性的且係與親水性聚合物組合，該聚合物係由含鉍的化合物與不含任何鉍之化合物所形成的共聚物。該含有鉍的化合物通常係由芳族及非芳族的氮雜環、丙烯酸之鉍衍生物及苄基鉍化合物衍生得的。因此，該聚合物係限於其中之四

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明(2)

級氮原子不含於聚合物之主鏈上的聚合物。所用之禾草的除草劑為西殺草 (sedoxydim)、阿落希頂 (alloxidim)、伏寄普 (fluazifop)、快扶草 (quizalofop) 或芬殺草 (fenoxaprop)；而所記載之用於闊葉雜草的除草劑為滅草松 (bentazone)、依馬奎 (imazaquin)、亞喜芬 (acifluorfen)、福草醚 (fomesafen)、氯嘧黃隆 (chlorimuron)、咪草煙 (imazethapyr)、希芬舒福隆 (thifensulfuron) 及 2, 4 - D。

DE 1 9 8 3 3 0 6 6 揭示了帶有陽離子官能之聚合物的水分散液以及由該分散液所得到之可再分散的粉劑，以及彼等的用途，尤其係用於任何種類之活性化合物之緩釋的用途。

本發明的目的在於提供可使得分施法及過量用藥法廢棄不用之植物保護劑的製劑。

本發明之目的係藉由將農化活性化合物（尤指除草劑）與圍繞該活性化合物之固態載體物質所構成的緩釋組合物用於抑制被載體物質所圍繞之活性化合物與至少一種其他農化活性化合物之混合物中的對抗交互作用的，而達成。

經發現，因對抗性所造成之活性降低等問題，可藉由將某些有機或無機載體物質與一或多種農化活性化合物組合在一起而消除。

本發明還提供將本發明之組合物用於控制不合需要的有害生物體（尤指不合需要的禾草及闊葉雜草）的施用法

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明(3)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

在新穎之載體／活性化合物組合物中，農化活性化合物係併入適當之有機或無機來源的載體物質。此等載體物質圍繞著活性化合物，俾使該活性化合物無法直接通過圍繞的區域。該活性化合物在物理上與圍繞的區域及其他的活性化合物隔離。該活性化合物僅有藉由某些機轉才來釋離出來，例如，載體物質的降解、圍繞該活性化合物之載體的破裂或滲透。

完全或部分併入載體之活性化合物可為在預定之活性化合物混合物中呈現對抗作用的活性化合物。在一活性化合物混合物中，亦可有二或多個活性化合物併入載體中。

將活性化合物併入載體物質中以提供緩釋製劑的方法，在理論上係已知的且可見於文獻中。其例可見於 C. L. Foy, D. W. Pritchard, "Pesticide Formulation and Technology", CRC Press, 1996, page 273 ff.以及其中所引用的文獻，以及 D. A. Knowles, "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", Kluwer Academic Press, 1998, page 132 ff以及其中所引用的文獻。

圍繞或覆蓋在活性化合物上的載體物質係選用在適當的溫度範圍內（宜在約 0 - 50 °C 的範圍內）呈固態的者。所謂固態物質應被瞭解為硬的、具有如蠟一般之彈性、呈無定形或晶狀但非或尚未呈液態的物質。該載體物質可為無機或有機性且可為合成或天然的。

將農化活性化合物併入適當之載體物質的可能方法之

五、發明說明(4)

一為，例如，微囊化法。此等微囊可由合成及／或天然來源的聚合性物質所組成。適當之物質的例子包括：聚脲類、聚胺基甲酸酯類、聚醯胺類、蜜胺樹脂、明膠、蠟及澱粉。

某些此等物質的微囊可藉由，例如，界面縮聚法製得。藉由單體量、活性化合物量、水及溶劑量以及製程參數的控制，可輕易地控制粒子大小及壁厚 (wall thickness)。

在由聚胺基甲酸酯或聚脲類所製得之微囊的情況下，用於構築所提到之圍繞著所覆蓋活性化合物之膠囊壁的方法中，最常用的為以水包油式乳液所進行的界面聚合法，其中，有機相除了活性化合物之外，還含有油溶性之具有自由異氰酸根的預聚物。

適當之預聚物係習於此藝之士已知的習用異氰酸酯類，例如，基於2，4－二異氰酸甲苯酯、2，6－二異氰酸甲苯酯、亞甲基雙(4－異氰酸苯酯)以及二異氰酸己二酯。

該聚合法，亦即，微囊之覆蓋物 (mantel) 的合成，通常可藉由習於此藝之士已知的習用方法來進行。

構成微囊覆蓋物的膠囊形成物質宜由油溶性之含異氰酸根基團的預聚物 (其為一群工業用的混合產物) 獲得，在各情況下，該預聚物係由基於苯胺及甲醛之縮合物的聚異氰酸酯類所組成。此等工業用混合產物相互在縮合程度及化學改性 (視需要) 上，各有不同。對於使用者而言，

五、發明說明 (5)

重要的特性為黏度及自由異氰酸根基團的量。典型的商業產物為 Desmodur[®] 品牌 (Bayer AG) 以及 Voranate[®] 品牌 (Dow Chemicals)。就本發明而言，所用之帶有異氰酸根基團之預聚物的量宜 ≤ 5 重量 % (基於整個製劑)；以 0.5 - 5 重量 % 較佳，尤指 1 - 2 重量 %。

膠囊形成物質係藉由在 0 - 95 °C (宜為 20 - 65 °C)、水存在下，或是較佳地，藉由使用所需量之二 - 或多元胺，將異氰酸根預聚物固化而得到。

若微囊係藉由使用二 - 或多元胺而製得，則適當的二 - 或多元胺為，例如，烷二胺類、二仲烷基三胺類及三仲烷基四胺類，彼等之碳鏈單位包含 2 至 8 個碳原子。以己二胺較佳。在此，可使用相當於所用預聚物之量的化學計量的量，或是較佳地，使用達化學計量之三倍的過量，尤指達二倍之量。

文獻中還記載了由聚胺基甲酸酯類或聚脲類製備微囊的方法，彼等方法同樣亦適用於製備本發明之微囊。此等方法記述於下文。

U S - A - 3 5 7 7 5 1 5 記載了在導入水溶性多元胺類後，如是之乳液的微滴表面如何因含異氰酸根基團之預聚物的添加而固化。此方法形成聚脲的外覆蓋物。

U S - A - 4 1 4 0 5 1 6 揭示了，即使沒有外在之水溶性胺類存在的情況下，具有聚脲類型之外壁的微囊還是可藉由令帶有異氰酸根官能之預聚物乳液部分水解，而製得。在該方法過程中，有某些胺基自異氰酸根基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(6)

團再形成且由於加成聚合反應及後續的固化反應，而同樣可形成所要的膠囊覆蓋物。該文獻記載了甲苯二異氰酸酯、己二異氰酸酯、亞甲基雙(苯基異氰酸酯)以及其更高聚合度類似物的使用。若固化係要以外在的多元胺來進行，則該多元胺通常係選自：乙二胺、丙二胺、己二胺、二伸乙基三胺及四伸乙基五胺。

D E - A - 2 7 5 7 0 1 7 揭示了內部構建的 (internally structured) 微囊，其外壁物質係由尿素及胺基甲酸酯單元交聯所產生的混合聚合物。活性化合物係位於膠囊的內部，溶於有機溶劑中。一般而言，構成此處之膠囊壁所需者為 1 0 % 的預聚物 (基於整個製劑)。

同樣的預聚物亦用於 W O - A - 9 6 / 0 9 7 6 0 ，以使，例如，安殺番 (endosulfan)，膠囊化。

W O - A - 9 5 / 2 3 5 0 6 揭示了裝有安殺番的聚脲微囊，其中該活性化合物係以冷熔體的形式存在。亞甲基雙(苯基異氰酸酯)及其更高聚合度的類似物的混合物被記載為預聚物；所用之預聚物的量係超過 6 % (基於整個製劑)。固化係藉由使用多元胺類來進行的。

就其中所記載之微囊壁的材料及製備方法而言，前文所列之專利及專利申請案乃本發明之重要且不可缺的一部分，並併於本案作為參考。

另一個可行之膠囊化方法係採用，例如，蜜胺 / 甲醛或尿素 / 甲醛的膠囊形成法。

為達到上述目的，首先係將蜜胺或前述異氰酸酯預聚

五、發明說明(7)

物裝於水中並與不溶於水的活性化合物摻合。在添加之前，該活性化合物已分散於或溶於非水溶性的溶劑中並乳化。藉由建立約 3 - 4 的酸性 pH (以約 3 - 5 較佳)，並在 30 - 60 °C (宜為 50 °C) 的升高溫度下攪拌數小時，膠囊壁可藉由聚縮合反應而形成。相關例子記載於 U S 4, 157, 983 及 U S 3, 594, 328，就膠囊製備的部分，該二專利併於本案為參考。

另一適用於將農化活性化合物微囊化的方法係凝聚法。為達前述目的，茲將非水溶性的農化活性化合物分散於水中並與陰離子性水溶性聚合物及陽離子性物質摻合。藉由所謂的「凝聚法」所形成之含有本來為水溶性之聚合物為外壁物質的微囊係非水溶性的。在最後一個步驟中，膠囊係藉由與醛類縮合而固化。就此目的而言，適合的為，例如，明膠／阿拉伯膠 (1 : 1) 及甲醛的組合物。藉由凝聚法所進行之微囊化方法係習於此藝之士已知者。該方法詳細地記載於，例如，J. A. Bahan "Microencapsulation using Coacervation/Phase Separation Techniques, Controlled Released Technology: Methods Theory and Application", Vol. 2, Kydoniens, A. F, Ed. CRC Press, Inc., Boca Raton, FL. 1980, Chapter 4。

為達到微囊化，最後，可利用一適當的界面活性劑，將活性化合物及聚合物予以乳化，其在水中會形成膠囊壁。然後，在攪拌下，將溶劑蒸發。當水被去除後，聚合物會在乳化滴的表面形成一層聚合物層。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(8)

另一種適用於製備微囊的物質為蠟。為達該目的，藉由加熱及施加剪切力，將自動乳化的蠟溶於水中，或藉由添加界面活性劑及加熱，並同時施加剪切力，將自動乳化的蠟轉化為乳液。將親脂性的農化活性化合物溶於熔融且乳化的蠟中。在冷卻的過程中，小滴會固化，而形成蠟分散液。

另外，亦可能藉由將活性化合物／蠟擠出顆粒分散於水或油中，接著予以細研磨至，例如， $< 20 \mu m$ 的粒子大小。

適當的蠟為，例如，與非親水性之蠟混合為混合物的 P E G 6 0 0 0，Synchrowachs HGLC1，Mostermont[®] CAV2，Hoechst-Wachs OP3或是此等蠟的組合物。

粒狀物（微囊或蠟粒）的水分散液可根據與 C S 製劑（膠囊懸浮液）相同的調配法得到。

由前述方法所得到的微囊可併入下文所提到的各種製劑中。亦可能將其他的活性化合物併入該製劑中，例如，將水溶性活性化合物併入膠囊分散液的水相，或是，例如，將固態的活性化合物併入 W G 製劑。

在微囊化後，可將膠囊自溶劑取出並藉由習用的方法予以乾燥，例如，噴霧乾燥法。在此狀態下的膠囊可儲存及運送。在施用於有問題的作物之前，視需要，彼等膠囊可與其他的活性化合物、助劑及習用添加劑調配為製劑。

然而，在將膠囊固化後所得的分散液在未將膠囊自分散液分離出來的情況下，亦可用於製備適當的農化製劑（

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明(9)

其包含前述的其他成份)。

在此等微囊分散液中，可使用選自下列的有機溶劑或其混合物：N-烷基脂肪醯胺類、N-烷基內醯胺類、脂肪酸酯類、環己酮類、異佛爾酮類(isophorones)、酞酸酯類及芳族烴類，以經低級烷基取代的萘衍生物特別適當。

可適用於本發明之目的且可自市面上購得的溶劑為，例如，Solvesso[®] 200、Solvesso[®] 150及Solvesso[®] 100(1)、二乙二醇乙酸丁酯、Shellsol[®] RA(2)、Acetrel[®] 400(3)、Agsolex[®] 8(4)、Agsolex[®] 12(5)、Norpar[®] 13(6)、Norpar[®] 15(7)、Isopar[®] V(8)、Exsol[®] D 100(9)、Shellsol[®] K(10)及Shellsol[®] R(11)，彼等具有下列組成

(1) 芳族化合物的混合物；製造廠商：Exxon。

(2) 烷基化苯類的混合物，沸點範圍：183-312℃，製造廠商：Shell。

(3) 芳族化合物的高沸點混合物，沸點範圍：332-355℃，製造廠商：Exxon。

(4) N-辛基吡咯啉酮，沸點(0.3 mm Hg)：100℃，製造廠商：GAF。

(5) N-十二烷基吡咯啉酮，沸點(0.3 mm Hg)：145℃，製造廠商：GAF。

(6) 脂族烴類，沸點範圍：228-243℃，製造廠商：Exxon。

(7) 脂族烴類，沸點範圍：252-272℃，製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (10)

造廠商：Exxon。

(8) 脂族烴類，沸點範圍：278 - 305 °C，製造廠商：Exxon。

(9) 脂族烴類，沸點範圍：233 - 263 °C，製造廠商：Exxon。

(10) 脂族烴類，沸點範圍：193 - 254 °C，製造廠商：Shell。

(11) 脂族烴類，沸點範圍：203 - 267 °C，製造廠商：Shell。

此等溶劑之相互混合物亦適用。特別適用者為二乙二醇乙酸丁酯、Acetrel[®] 8 及 Agsolex[®] 12。以 Solvesso[®] 200 最佳。

本發明之分散液的水相含有選自下列之具界面活性的調配助劑：乳化劑及分散劑。彼等係源自，例如，下列之化合物族群：聚乙烯醇類、聚氧烯類、甲醛與萘磺酸類及／或酚類的縮合物、聚丙烯酸酯類、順丁烯二酸酐與伸烷基烷基醚的共聚物、木質素磺酸酯類以及聚乙烯基吡咯啉酮類。此等物質的用量為0.2至10重量%（在各情況下，係基於整個分散液），以0.5至4重量%較佳。

在聚氧烯類的情況下，以分子中心及分子周邊係分別由聚氧丙烯嵌段及聚氧乙烯嵌段所形成的嵌段共聚物較佳。在此，特別較佳的是其聚氧丙烯嵌段的克分子量為2000 - 3000且聚氧乙烯嵌段之百分比為總克分子

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (11)

量之 60 至 80 % 的物質。如是之物質可得自，例如，
BASF Wyandotte，商品名為 Pluronic® F87。

其他之適當分散劑為木質素磺酸鈣、高度精製的木質
素磺酸鈉（例如，Borregaard 的 Vanisperse® CB）、
Clariant GmbH 的分散劑 S 及分散劑 S S、萘／磺酸／甲醛
縮合物鈉鹽（例如，Witco 的 Morwet® D 425 或 BASF 的
Tamol® NN 8906）、聚羧酸鈉（例如，Rhodia GmbH 的
Sopropan® T 36）。

適當的聚乙烯醇類係藉由聚乙酸乙烯酯的部分水解而
製得。彼等的水解度為 72 至 99 莫耳 % 且黏度為 2 至
18 cP（於 4 % 強度之水溶液中，在 20 °C 下，根據
DIN 53015 所測得者）。以使用水解度為 83
至 88 莫耳 % 且低黏度（尤指 3 至 5 cP）之部分水解的
聚乙烯醇類較佳。

視需要，分散液的水相可包含至少一種選自下列的其
他調配助劑：潤濕劑、抗凍劑、增稠劑、防腐劑及增黏成
份。

適當的潤濕劑為，例如，選自下列物質的代表例：烷
基化萘磺酸類、N-脂肪醯基 N-烷基牛磺酸類化合物（
taurides）、脂肪醯基醯胺基烷基甜菜鹼類、烷基多糖苷類
、 α -烯烴磺酸酯類、烷基苯磺酸酯類、磺酸基琥珀酸的
酯類、（寡聚）烷基酚乙氧基化物、脂肪醇-（C₈-
C₂₂）-乙氧基化物、以及脂肪烷基硫酸酯類（其可經伸
烷氧基團改性）。在此，所用之潤濕劑的百分比為 0 至 5

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (12)

重量 % (基於整個製劑) , 宜為 0 至 2 重量 % 。

適用的商品化產物為, 例如, Darvan[®] No. 3、Vanisperse[®] CB、Hoe S1728 (Clariant GmbH)、Luviskol[®] K 30、Reserve C、Forianit[®] P、Sokalan[®] CP 10、Maranil A、Genapol[®] PF40、Genapol[®] LRO、Genapol[®] T、Genapol[®] X、Genapol[®] O、三丁基苯酚多甘醇醚, 諸如, Sapogenat T 品牌 (Clariant GmbH)、壬基苯酚多甘醇醚, 諸如, Arkopal[®] N 品牌 (Clariant GmbH) 或三苯乙烯基多甘醇醚衍生物。

可添加至水分散液的防腐劑為下列藥劑: 甲醛或六氫基三嗪衍生物, 諸如, 例如, Mergal[®] KM 200 (Riedel de Haen) 或 Cobate[®] C (Rhone Poulenc); 異噻唑啉酮衍生物, 諸如, 例如, Mergal[®] K9N (Riedel de Haen) 或 Kathon[®] CG (Rohm and Haas); 1, 2 - 苯并異噻唑啉 - 2 - 酮類, 諸如, 例如, Nipacide[®] BIT 20 (Nipa Laboratorien GmbH) 或 Mergal[®] K10 (Riedel de Haen) 或是 5 - 溴基 - 5 - 硝基 - 1, 3 - 二噁烷 (Henkel 的 Bronidox[®] LK)。此等防腐劑的百分比為至多 2 重量 % (基於整個製劑)。

適當的抗凍劑為, 例如, 單一或多元醇類、甘醇醚類或尿素, 尤指氯化鈣、甘油、異丙醇、丙二醇單甲基醚、二 - 或三丙二醇單甲基醚或環己醇。此等抗凍劑的百分比為至多 20 重量 % (基於整個分散液)。

增稠劑可為無機或有機性的, 彼等亦可併合在一起。適當的增稠劑為, 例如, 基於鋁矽酸鹽類、蒼耳烷 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (13)

xanthane) 、 甲 基 纖 維 素 、 多 醣 類 、 鹼 金 屬 矽 酸 鹽 、 明 膠 及 聚 乙 烯 基 醇 者 ， 諸 如 ， 例 如 ， Bentone[®] EW 、 Vegum[®] 、 Rodopol[®] 23 或 Kelzan[®] S 。 彼 等 之 百 分 比 為 0 - 0 . 5 重 量 % (基 於 整 個 分 散 液) ， 較 佳 為 0 . 3 重 量 % 。

本發明亦關於製備本發明之微囊分散液的方法，其包含：先製備有機且含水相（無二胺）的粗製預乳液，然後，令該預乳液通過一混合器（其宜為連續操作者，例如，靜態混合器、齒形膠體研磨機等等），而施以剪切力。只有在此步驟中，才能達到後續之乳化油滴的微囊形成時所需的粒度。最後，視需要，在添加二胺後，藉由聚合反應，將整個物質固化。另一可行的方式為，省去添加水溶性多元胺的步驟，並在適當的溫度下，將所形成之乳液攪拌一段時間，例如，在 70 °C 下攪拌 6 小時。

為了製備緩釋的組合物，亦可將活性化合物導入有機基質（諸如，例如，蠟），以取代微囊化。亦可使用無機基質，例如，矽酸鹽類、鋁矽酸鹽類或氧化鋁類或是基於前述物質的礦物。將農化活性化合物導入如是之有機或無機基質，造成該農化活性化合物的物理結合。

可能的釋出機轉為，例如無菌及／或生物降解（風化）、基質或囊壁的破裂、或是活性化合物自基質或膠囊滲透或溶解出來。該緩釋出作用的發生可取決於與液體（例如，水）的接觸，或取決於溫度。

一般而言，活性化合物的主要量係在施用後的前四個星期中，自基質或微囊釋出，以在前七天內較佳，尤指在

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (14)

前二天內。

無法以緩釋方式釋出的活性化合物可以市販產物的形式來使用，或是藉由理論上已知的技術，調配為製劑，或是與對應之緩釋製劑在槽中組合。

可包埋於依本發明所使用之載體物質的適當活性化合物並不侷限於某些種類且包括所有已知類別的農化活性化合物。其例包括有：除草劑、殺菌劑、殺蟲劑、生長控制劑、解毒劑、殺蟎蟲劑、殺軟體動物劑及殺線蟲劑。

特別適用者為除草劑，其中，尤指乙醯乳酸酯合成酶（A L S）抑制劑（例如，磺醯脲類及其鹽類）；羥基苯甲腈類（例如，溴苯腈及碘苯腈（ioxynil））及其衍生物（諸如，酯類或鹽類）；滅草松（bentazone）；所謂的「芳氧基烷基羧酸類」及其衍生物（尤指酯類），諸如，M C P A、2，4-D、C M P P、2，4-D P、2，4-D B；所謂的「雜芳氧基芳氧基烷基羧酸類」及其衍生物（尤指酯類），例如，芬殺草-p-乙基（fenoxaprop-p-ethyl）、代克羅普-甲基（dichlofop-methyl）、克羅丁普-炔丙基（clodinafop-propargyl）、伏寄普（fluazifop）；H P P D O抑制劑，例如，美索三酮（mesotrione）或蘇可三酮（sulcotrione）；三嗪類；環己烷二酮肟類，例如，西殺草（sethoxidim）、剋草同（clethodim）或翠克西定（trialkoxidim）；生長控制劑或似激素的物質，例如，吲哚基乙酸或吲哚基丁酸或其化學衍生物（諸如，酯類）或生長素（auxins）；解毒劑，例如，美分派-二乙基

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (15)

(mefenpyr-diethyl) 或類似的酯類及 5 , 5 - 聯苯基 - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸或類似的酯類。

在前述所有農化活性化合物的情況下，視需要，當然亦可能使用習於此藝之士已知為適用的對應衍生物，諸如，該活性化合物的酸類、酯類或鹽類。

本發明之組合物使得活性化合物對於混合物中其他活性化合物的對抗性遭到抑制。因此，可依本發明組合的活性化合物可與其他活性化合物一起使用且視需要，還可與習用的添加劑及助劑併用。本發明之較佳組合物的例子係記述於下文中。在所有此等的組合物中，在前文中被敘述為特別適或最適當之活性化合物的使用當然亦為較佳者，即使未有明示。

與依本發明來使用之載體組合的農化活性化合物可與其他活性化合物調配在一起（該其他的活性化合物，視需要，可依本發明與適當的載體組合），以提供可產生有利結果的混合物。

本發明的較佳體系之一係其中之農化活性化合物（例如，除草劑）有某些或全部依本發明與載體（諸如，聚合物）組合的組合物，該組合物另外包含至少一種其他的農化活性化合物，例如，除草劑或解毒劑。

在本發明之另一較佳體系中，除草劑係與解毒劑及／或生長調節劑連同依本發明之載體制一起調配為製劑，其中，農化活性化合物中至少有一者已依本發明與載體部份或完全組合。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (16)

本發明之組合物的另一較佳體系包含一或多種禾本科除草劑與一或多種對抗闊葉雜草之除草劑的混合物，其中，農化活性化合物中至少有一者已依本發明部分或完全組合。

在本發明之另一較佳體系中，一或多種禾本科除草劑係與解毒劑混合，其中，農化活性化合物中至少有一者已依本發明部分或完全組合。

依本發明，更佳的是，將一或多種具有快速作用機轉的除草劑與一或多種具有相對較慢之作用機轉的除草劑組合，其中，農化活性化合物中至少有一者已依本發明部分或完全組合。

在許多情況下，添加助劑或助劑混合物係有利的，例如，油類，特殊溶劑、界面活性劑或界面活性劑混合物。在此，助劑應被瞭解為活性化合物／聚合物組合物的助劑，其本身不具活性，但會增強活性化合物的性質。適當的助劑為非離子界面活性劑，例如，式

$\text{R O (C H}_2\text{ C H}_2\text{ O)}_n\text{H}$ 所示者，其中 R 為 (C₁₀ - C₂₂) - 脂肪醇自由基、三苯乙烯基酚自由基、丁基酚自由基、(C₁ - C₁₄) - 烷基酚自由基、三癸基醇自由基、甘油酯自由基或衍生自蓖麻子油的自由基，且 n 為 1 至 500 的整數，以 3 至 200 較佳。

如是之物質可得自，例如，Clariant GmbH(Genapol[®]、Sapogenat[®]以及 Arkopal[®]系列)以及 Rhodia GmbH(Soprophor[®]系列)。亦可能採用以環氧乙烷、環氧丙烷及／

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (17)

或環氧丁烷的嵌段聚合物，例如， BASF AG 以 Pluronic[®]或 Tetronic[®]之名販售的化合物。

陰離子或 β 離子 (betainic) 界面活性劑亦可被使用。陰離子界面活性劑的例子包括有：十二碳烷基苄基磺酸鈣、琥珀酸鹽、磷酸鹽、硫酸化及磺酸化非離子界面活性劑 (例如，前文所述類型的界面活性劑) 以及山梨酸鹽，此等陰離子化合物係以鹼金屬、鹼土金屬或銨離子予以中和。如是之界面活性劑可得自 Genapol[®] LRO(Clariant GmbH)。

β 離子界面活性劑可得自 Goldschmidt AG(商品名：Tegotain[®])。

陽離子界面活性劑亦可適用，例如，以四級銨、鎘及三級銻鹽類，例如， Uniquema 的 Atlas[®] G3634。

界面活性劑的用量係在 1 0 至 2 0 0 0 g / h a 之間，以在 5 0 至 2 0 0 0 g / h a 之間較佳。氮的添加，例如，以脲、硝酸銨、硫酸銨、硫酸氫銨或彼等之混合物的形式，通常亦為有利的。

在下文的表中，以例示的方式說明包含本發明之組合物的製劑。在此，較佳的載體為聚脲類。在付諸實行時，將下列製劑與其他活性化合物一起施用，亦為有利的。

活性化合物 1 (完全或部分與載體組合)	活性化合物 2 (未組合)	其他添加劑
-------------------------	------------------	-------

五、發明說明 (18)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

解毒劑,諸如,美分派-二乙基(10-50 g/ha)	脂肪酸合成抑制劑,諸如,雜芳氧基苯氧基烷基羧酸類及環己二酮肟,例如,芬殺草-p-乙基(20-100 g/ha)	添加助劑(例如,Genapol® LRO)係有利的
解毒劑,諸如,5, 5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸或其鹽類或酯類	脂肪酸合成抑制劑,諸如,雜芳氧基苯氧基烷基羧酸類及環己二酮肟,例如,芬殺草-p-乙基	添加助劑(例如,Genapol® LRO)係有利的
原卞啉原氧化酶抑制劑,諸如,例如,服盧西瑟-甲基(fluthiacet-methyl)	固殺草(glufosinate)或畢拉草(bialaphos)	添加助劑(例如,Genapol® LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的
原卞啉原氧化酶抑制劑,諸如,例如,服盧西瑟-甲基(fluthiacet-methyl)	嘉磷塞(glyphosate)	添加助劑(例如,Genapol® LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的
對羥基苯基丙酮酸酯二加氧酶抑制劑,諸如,艾受沙路透(isoxaflutole)、蘇可三酮或美索三酮	固殺草(glufosinate)或畢拉草(bialaphos)	添加助劑(例如,Genapol® LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的

五、發明說明 (19)

對羥基苯基丙酮酸酯二加 氧酶抑制劑,諸如,艾受沙 路透(isoxaflutole)、蘇可三 酮或美索三酮	嘉塞啉(glyphosate)	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)及/或氮肥料(例如,硫 酸銨、硫酸氫銨、尿素)係 有利的
溴苯腈或其化學衍生物(酯 類、鹽類)與解毒劑(例如, 美分派-二乙基)的組合物	脂肪酸合成抑制劑,諸如, 雜芳氧基苯氧基烷基羧酸 類及環己二酮肟	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)係有利的
芳氧基烷基羧酸類或其化 學衍生物(酯類、鹽類),例 如,2, 4-D	脂肪酸合成抑制劑,諸如, 雜芳氧基苯氧基烷基羧酸 類及環己二酮肟,例如,芬 殺草-p-乙基	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)係有利的
芳氧基烷基羧酸類或其化 學衍生物(酯類、鹽類)(例 如,2, 4-D)與解毒劑(例如 ,美分派-二乙基)的組合物	脂肪酸合成抑制劑,諸如, 雜芳氧基苯氧基烷基羧酸 類及環己二酮肟,例如,芬 殺草-p-乙基	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)係有利的
溴苯腈或其化學衍生物(酯 類、鹽類)	脂肪酸合成抑制劑,諸如, 雜芳氧基苯氧基烷基羧酸 類及環己二酮肟(例如,芬 殺草-p-乙基)與磺醯脲類(例如,甲基舒福隆(metsulfur on)或碘基舒福隆(iodosulfu ron))的組合物	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)係有利的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (20)

溴苯腈或其化學衍生物(酯類、鹽類)與解毒劑(例如,美分派-二乙基)的組合物	脂肪酸合成抑制劑,諸如,雜芳氧基苯氧基烷基羧酸類及環己二酮肟(例如,芬殺草-p-乙基)與磺醯脲類(例如,甲基舒福隆(metsulfuron)或碘基舒福隆(iodosulfuron))的組合物	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)係有利的
解毒劑,例如,美分派-二乙基或 5 , 5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸或其鹽類或酯類	對羥基苯基丙酮酸酯二加氧酶抑制劑,諸如,艾受沙路透(isoxaflutol)、蘇可三酮或美索三酮	
解毒劑,例如,美分派-二乙基或 5 , 5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸或其鹽類或酯類	磺醯脲類,例如,佛牡舒福隆(foramsulfuron)、淋舒福隆(rimsulfuron)	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的
脂肪酸合成抑制劑,例如,芬殺草-p-乙基	解毒劑,例如,5 , 5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸乙酯	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂

五、發明說明 (21)

溴苯腈酯(辛酸酯、庚酸酯、丁酸酯或彼等之混合物)	磺醯脲類(諸如,佛牡舒福隆(foramsulfuron))與解毒劑(例如,5 , 5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸乙酯)的組合物	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的
三嗪除草劑(纖維素生物合成抑制劑)	磺醯脲類(諸如,碘基舒福隆及/或美索舒福隆(mesosulfuron))與解毒劑(例如,美分派-二乙基或類似酯類)的組合物	添加助劑(例如,Genapol [®] LRO)及/或氮肥料(例如,硫酸銨、硫酸氫銨、尿素)係有利的

各種製劑內的活性化合物百分比可在廣範圍內變動。製劑可包含，例如，約 0 . 1 至 9 5 重量 % 的活性化合物、約 9 0 至 1 0 重量 % 的液態或固態載體以及視需要包含至多 3 0 重量 % 的界面活性劑，其中，彼等百分比的和必須為 1 0 0 % 。

依本發明所製得之載體物質、一或多種活性化合物以及非必要的助劑及其他佐劑的混合物既可呈各別的槽混合物形式，亦可存在於其他的製劑中。

可能的適當製劑為，例如：

可潤濕的散劑 (W P) 、水溶性散劑 (S P) 、基於油或水的懸浮濃體 (S C) 、水溶性濃體 (S L) 、可乳化濃體 (E C) 、微乳劑及巨乳劑 (E W / M E) (諸如

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (22)

，水包油式及油包水式乳劑）、可噴灑的溶液、懸浮乳劑（S E）、油可溶混的溶液、膠囊懸浮劑（C S）、粉劑（D P）、浸種組成物、供撒播及土壤施用的粒劑、呈微粒劑形式的粒劑（G R）、噴灑粒劑、包衣粒劑及吸附粒劑、水可分散性粒劑（W D G）、水溶性粒劑（W S G）、U L V 製劑、微囊劑及蠟製劑。此等各別的製劑型在原理上係已知的且已記載於，例如，Winnacker-Küchler，“Chemische Technologie” [Chemical Technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Edition, 1986; Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulations”, Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, “Spray Drying” Handbood, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London。

製劑佐劑，諸如，惰性物質、界面活性劑、溶劑及其他添加劑同樣係為已知者且已記述於，例如，Watkins, “Handbook of Insectide Dust Diluents and Carriers”, 2nd Ed., Darland Books; Caldwell N.J., H.V. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry”, 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Mardsen, “Solvents Guid”, 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's “Detergents and Emulsifiers Annual”, MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, “Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte [Surface-Active Ethylene Oxide Adducts]”, Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (23)

Küchler, "Chemische Technologie", Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Edition 1986。

可潤濕的散劑係均勻分散於水中的製劑且除了本發明之組合物及稀釋劑或惰性物質之外，還含有離子性及／或非離子性的界面活性劑（潤濕劑、分散劑），例如，聚乙氧基化烷基酚類、聚乙氧基化脂肪醇類、聚乙氧基化脂肪胺類、脂肪醇聚乙醇醚硫酸鹽類、烷磺酸類、烷基苯磺酸類、木質素磺酸鹽類、2，2'-二萘基甲烷-6，6'-二磺酸鈉、二丁基萘磺酸鈉或油基甲基胺乙磺酸鈉。可潤濕散劑的製備方法如下：於習用的裝置中（諸如，錘磨機、扇式研磨機或噴氣式研磨機），將活性化合物磨碎，並同時或依序先後與製劑佐劑及依本發明所使用之聚合物混合。

可乳化濃體係藉由下列方法製得：在有機溶劑中（例如，丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯或沸點相對較高的芳族化合物或烴類或有機溶劑的混合物），將活性化合物與聚合物組合，並添加一或多種離子性及／或非離子性的界面活性劑（乳化劑）。可採用之乳化劑的例子有：烷基芳基磺酸類，諸如，十二碳烷基苯磺酸鈣，或非離子性乳化劑，諸如，烷基芳基聚乙二醇醚（不同於乙氧基化對-烷基酚）、脂肪酸聚乙二醇酯類、脂肪酸聚乙二醇醚類、環氧丙烷-環氧乙烷縮合產物、烷基聚醚類、山梨聚糖酯類（例如，山梨聚糖脂肪酸酯類）或聚氧乙烯山梨聚糖酯類（例如，聚氧乙烯山梨聚糖脂肪酸酯類）。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (24)

粉劑係藉由以下方法得到：將與依本發明使用之聚合物組合的活性化合物連同細碎的固體物質，例如，滑石、天然石膏（諸如，高嶺土、膨潤土及皂石〔pyrophyllite〕）或矽藻土，一同研磨。

懸浮濃體可為水基或油基者。彼等可，例如，藉由使用工業上習用的珠粒式研磨機（bead mills），在有或無添加其他製劑類型部分已提到之界面活性劑的情況下，進行濕式研磨而製得。

乳劑（例如，水包油式乳劑（E W））可，例如，藉助攪拌機、膠體研磨機及／或靜態混合器，使用含水溶劑及視需要使用的界面活性劑（例如，在其他製劑類型部分已提及者）而製得。

粒劑可藉由下列二方法之製得：將依本發明使用之活性化合物與聚合物的組合物噴灑至吸附性、粒化的惰性物質上；或是藉由黏合劑，例如，糖類（諸如，戊醣及己醣）及礦油類，將該組合物塗覆在載體的表面上，諸如，砂、高嶺土或粒化的惰性物質。依本發明使用之適當活性化合物與聚合物的組合物亦可依照肥料粒製備所習用的方式（視需要，可以與肥料所形成之混合物的形式），進行粒化。

水可分散的粒劑通常係藉由習用的程序，諸如噴霧乾燥法、流化床成粒法、圓盤成粒法、採用高速混合機的混合法以及未使用固體惰性物質的擠壓法。

關於圓盤狀、流化床、擠壓及噴霧粒劑的製備，可參

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (25)

見，例如，“Spray-Drying Handbook” 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd, London; J.E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff.; “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57 的方法。

植物保護產物之製劑的更進一步詳細資料可參見，例如，G.C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J. D. Freyer, S.A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103。

此外，前述本發明組合物之製劑可包含增黏劑、潤濕劑、分散劑、乳化劑、滲透劑、防腐劑、防凍劑、溶劑、填料、載體、色料、防泡劑、蒸發抑制劑以及 pH 及黏度調節劑，彼等皆為習用者。

基於此等製劑，亦可製備彼等與其他具農藥活性之化合物（諸如，除草劑、殺蟲劑、殺菌劑及解毒劑、肥料及／或生長控制劑）的混合物，該混合物係呈，例如，成品製劑的形式或用作為槽混合物。

本發明之組合物具有顯著的活性。若除草劑係與聚合物組合以產生本發明的組合物，則該組合物具有優良的除草活性，以對抗廣範圍之在經濟上具重要性的單子葉及雙子葉有害植物。該活性化合物組合物亦可有效地作用於多年生雜草，其自種子或地下莖、根莖或其他多年生器官產

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (26)

生嫩枝且難以控制。在本文中，本發明之組合物不論在播種前、萌前或萌後，皆可施用。本發明之組合物宜施用於植物的地上部。本發明之組合物亦適用於乾化農作物，諸如，馬鈴薯、棉花及向日葵。

就具有除草活性的化合物而言，本發明的組合物可用於，例如，控制下列有害植物：

歸於下列屬別的雙子葉雜草：芥屬、豬殃殃屬、繁縷屬、母菊屬、小米菊屬、藜屬、蕁苔屬、蓴麻屬、黃菀屬、莧屬、馬齒莧屬、蒼耳屬、旋花屬、薯屬、蓼屬、田菁屬、薊屬、Carduus、苣實屬、茄屬、芫麻屬、Veronica、苧麻屬、曼陀蘿屬、莖菜屬、鴉舌草屬、鴉跖草屬、Sphenoclea、婆婆納屬、Heteranthera、罌粟屬、大戟屬及鬼針屬。

歸於下列屬別的單子葉雜草：水楊梅屬、看麥娘屬、野稗屬、狗尾草屬、匍黍屬、指草屬、早熟禾屬、牛筋草屬、臂形草屬、黑麥草屬、雀草屬、莎草屬、Elytrigia、Sorghum、Apera及Scirpus。

若包含本發明之組合物的除草組成物係在發芽前施用，則可完全防止雜草幼苗的出土，或是雜草只會生長到子葉的階段，然後即停止生長且最後，在經過三至四星期後，會完全死亡。

若包含本發明之組合物的除草組成物係在萌後施用至植物的綠色部分 (green part)，則在施用後的非常短時間內，生長會徹底地停止且雜草植物會停留在施用時點的發

五、發明說明 (27)

育階段，或是在某段時間後（多少有些快速），彼等雜草會完全死亡，因此，藉由採用本發明之組合物，對於農作物有害之且與產量之定量及定性損失有相關聯之雜草的競爭會在非常早期的時點且以緩釋的方式被除去。

雖然此等本發明之組合物對於單子葉及雙子葉雜草具有極佳的除草活性，但是對於農作物的損害即使有，也是無足輕重的。

此等效果尤其可使施用量降低、使廣範圍的闊葉雜草及禾草類被控制、縮小活性差異（activity gaps）〔亦指相對於抗性物種而言〕、提供更快速且安全的作用、使得作用持續期變長、僅以一或幾次的施用即可完成控制有害植物，且若有多個活性化合物同時存在，則可使施用期間延長。

前述性質乃實際上雜草控制所需者，可使農作物免於非所要的競爭植物且保護及／或增加收成的品質及量。就前述性質而言，本發明之組合物優於先前技藝者甚多。此外，本發明之組合物控制其他有害植物的效果亦極佳。

由於具有農化性質（尤指除草性質、植物生長控制性質及解毒劑性質），宜用於除草組成物之本發明的組合物亦可用於已知農作物或尚待開發之基因工程改良植物。轉基因的植物通常具有特別有利的性質，例如，對於某些農藥的抗性（尤指對於某些除草劑的抗性）、對於植物病害或植物病害之致病有機體（諸如，某些害蟲或微生物，例如，真菌、細菌或病毒）的抗性。其他之特性性質係，例

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (28)

如，與收穫產物之品質、量、儲存安定性、組成及特殊成份有關。因此，澱粉含量增加或澱粉的品質獲改良之轉基因的植物或收穫產物的脂肪酸組成不同之轉基因植物係已知者。

本發明之組合物宜用於有用及觀賞植物之具經濟價值的轉基因農作物，例如，穀類（諸如，小麥、大麥、裸麥、燕麥、粟、稻米、木薯及玉米）或甜菜、棉花、大豆、油菜、馬鈴薯、蕃茄、豌豆及其他蔬菜類的農作物。

本發明之與除草劑、植物生長控制劑及／或解毒劑的組合物宜用於對於除草劑之植物毒性具有抗性或經遺傳工程改良而具有抗性之有用植物的農作物。

供製備具有改良性質之新穎植物的習用方法包含，例如，傳統的育種方法及突變種的分生。另外，具有改良性質之新穎植物亦可藉助遺傳工程法來產生（例如，E P - A - 0 2 2 1 0 4 4、E P - A - 0 1 3 1 6 2 4）。例如，已發表者有下列幾種情形：

— 以遺傳工程對農作物植物進行改變，以改良農作物內所合成的澱粉（例如，W O 9 2 / 1 1 3 7 6、W O - 2 / 1 4 8 2 7、W O 9 1 / 1 9 8 0 6），

— 對於下列種類之除草劑具有抗性的轉基因農作物植物：固殺草（參見，例如，E P - A - 0 2 4 2 2 3 6、E P - A - 0 2 4 2 2 4 6）或嘉磷塞（W O 9 2 / 0 0 3 7 7）或磺酰脲（E P -

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (29)

A - 0 2 5 7 9 9 3 、 U S - A -
5 , 0 1 3 , 6 5 9) ,

— 具有產生蘇力菌毒素 (B t 毒素) 之能力而賦予植物對抗某些害蟲之抗性的轉基因農作物植物，例如，棉花 (E P - A - 0 1 4 2 9 2 4 、 E P - A -
0 1 9 3 2 5 9) ,

— 具有改良之脂肪酸組成的轉基因農作物 (W O
9 1 / 1 3 9 7 2) 。

有多種可用於製備具有改良性質之新穎轉基因植物的分子生物技術在理論上係已知者；參見，例如， Sambrook et al., Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd Ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY, 或 Winnacker "Genes and Clones", VCH Weinheim 2nd Edition 1996 或 Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431 。

爲了進行如是之遺傳工程操作，可將核酸分子導入細胞質，在細胞質內藉由 D N A 序列的重組而發生突變或序列的改變。使用前述標準程序，可能進行，例如，鹼基的交換、部份序列的去除或是天然或合成序列的添加。可將連接子附接在 D N A 片段上，以將 D N A 片段相互連接。

具有基因產物之降低活性的植物細胞可藉由，例如，表現至少一個反義 R N A 、順義 R N A 以達到共抑制 (cosupression) 的效果，或是表現至少一個專門裂解前述基因產物之轉錄本的經適當構築的地下莖。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (30)

爲達該目的，可採用包含了基因產物之全部編碼序列（包括任何可能存在的周圍序列（flanking sequences））的DNA分子，或是採用僅包含了部分編碼基序列的DNA分子（該部分序列必須有足夠的長度，俾能在細胞中產生反義效果）。亦可採用與基因產物之編碼序列具有高度同質性但卻非完全相同的DNA序列。

當在植物內表現核酸分子時，合成出來的蛋白質可集中於植物細胞內之任何所企求的區間內。然而，爲了達到在特定區間內的集中化，例如，可將編碼區域與DNA序列連接以確保在某一特定區間內的集中化。如是之序列係習於此藝之士所熟知的（參見，例如，Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Aca. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106）。

採用已知的技術，可在整個植物內再產生出轉基因的植物細胞。該轉基因的植物理論上可爲任何所企求的植物種類，即不論是單子葉或雙子葉植物皆可。

依此方式，可得到藉由同質（天然）基因或基因序列之過度表現、壓抑或抑制或異質（外來）基因或基因序列之表現而具有改良性質的轉基因植物。

本發明之組合物宜用於對於下列除草劑具有抗性之轉基因農作物：磺醯脲類、固殺草—鉍或嘉磷塞—異丙基鉍以及類似的活性化合物。

在使用本發明之組合物時，特別是在用於除草劑組成

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (31)

物、轉基因農作物時，除了對於可在其他農作物發現到之有害植物的對抗效果外，還常有施用於各個轉基因農作物時所特有的效果，例如，可被控制之雜草的範圍獲得改善或特別地擴大了；可用於施用之噴布量獲改善；與轉基因農作物所對抗之除草劑的溶混性或可組合性較佳；以及對於轉基因農作物植物之生長及產量的影響。

本發明更進一步例示於下列實施例中。

實施例 1 - 17 記載了活性化合物與適當載體的組合物。

實施例 1

將 10.7 g 之芬殺草 - p - 乙基 (93.6 % D +) 溶於 40.0 g 之 Solvesso[®] 200 並攪拌加入 3.0 % 之 Voranate[®] M220 (Dow Chemicals , 工業級的亞甲基雙 (苯基異氰酸酯)) , 直至達到完全均勻為止。此外，製備含有下列成份的水溶液：2.0 g 之 Mowiol[®] 3-83 (Clariant , 聚乙烯醇) 、 1.8 g 之 Genapol[®] V4829 (Clariant , 環氧乙烷 / 環氧丙烷共聚物) 、 0.5 % 之 Morwet[®] D425 (Witco , 萘磺酸 / 甲醛縮合物) 、 0.1 g 之 Rodorsil[®] 432 (Rhodia , 基於聚矽氧的去泡沫劑) 、 0.1 g 之 Mergal[®] K9N (防腐劑) 以及 36.3 g 的水。先將該水相置於裝備有滴液漏斗及攪拌棒馬達 / 槳式攪拌器之 250 ml 的三頸燒瓶中，並儘速地添加該有機相，且同時進行激烈的攪拌。在約 0.5 小時後，將攪拌的速度降低並由一

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (32)

導管，快速地計量喂入 1 . 5 g 己二胺的水溶液。緊接著添加 4 . 0 g 工業級的甘油。

在相同的速率下，於室溫下持續攪拌 4 小時，並取出微囊分散液成品。

如此所得到之微囊分散液包含 1 0 % 芬殺草 - p - 乙基。黏度為 6 0 0 m P a . s (1 0 0 秒)，平均膠囊直徑為 3 μ m。

實施例 2 - 1 4

依照與實施例類似的方式，可得到下列微囊分散液。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (33)

實施例	活性化合物 (微囊)	裝料率(活性 化合物%)	膠囊大小(平均: 10 ⁶ m)	異氰酸酯的量(%)
2	芬殺草-p-乙基	10	2.6	1
3	芬殺草-p-乙基	10	2.1	3
4	芬殺草-p-乙基	10	1.6	5
5	溴苯腈辛酸酯	10	2.0	1
6	溴苯腈辛酸酯	10	2.1	5
7	2, 4-D 異丁酯	10	1	5
8	2, 4-D 異丁酯	10	5	5
9	MCPA 異丁酯	10	5	1
10	MCPA 異丁酯	10	2.5	1
11	美分派-二乙基	10	3.25	1
12	美分派-二乙基	10	16.6	1
13	5, 5-聯苯基-2-異噁 唑啉-3-羧酸	10	3.1	1
14	5, 5-聯苯基-2-異噁 唑啉-3-羧酸	10	2.9	5

實施例 15

芬殺草 - p - 乙基之 E C 製劑的製備

將 8 . 2 % 之 芬殺草 - p - 乙基、53 % 之 Solvesso[®]
、16 % 之 N - 甲基吡咯啉酮、8 . 4 % 之 Genapol[®] X-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (34)

060、6.5%之 Emulsagen 1816、3.2%之苯基磺酸鈣 70 以及 4.3%之 Edenol® D-81 相互混合。

實施例 16

5,5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸之 EC 製劑的製備

將 8%之 5,5-聯苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸、53.5%之 Solvesso®、16.1%之 N-甲基吡咯啉酮、8.4%之 Genapol® X-060、6.5%之 Emulsagen 1816、3.2%之苯基磺酸鈣 70 以及 4.3%之 Edenol® D-81 組合及混合。

實施例 17

美分派-二乙基之 EC 製劑的製備

將 8%之美分派-二乙基、53.5%之 Solvesso®、16.1%之 N-甲基吡咯啉酮、8.4%之 Genapol® X-060、6.5%之 Emulsagen 1816、3.2%之苯基磺酸鈣 70 以及 4.3%之 Edenol® D-81 相互組合及混合。

實施例 18-21 記述包含有本發明之組合物的活性化合物製劑的施用。

在實施例 18-21 中，單子葉及雙子葉有害植物及有用植物的種子或地下莖塊係置於直徑 9-13 cm 之花鉢內的砂壤土中。將該花鉢存置於在最佳條件下的溫室中

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (35)

，在二葉至三葉階段，亦即，栽培開始後約三星期時，用呈水分散劑或懸浮劑或乳劑形式之本發明組合物來處理受試植物，並以各種不同的劑量，噴灑至植物的綠色部分，採用 $300\text{ l} / \text{ha}$ 的水噴布量（經轉換）。將該花鉢繼續置於在最佳條件下的溫室中，以進一步栽培植物。在前述處理後 2 - 3 星期，以肉眼對有用植物及農作物植物的損害進行評估。

實施例 18

將實施例 2 之製劑（ $60\text{ g} / \text{ha}$ ）及實施例 17 的製劑（ $15\text{ g} / \text{ha}$ ）一起施用於小麥的作物，以控制禾草。與施用未包含有本發明之載體組合物的相同製劑比較之下，可觀察到較佳之禾草控制。

實施例 19

將實施例 2 的製劑（ $30\text{ g} / \text{ha}$ ）與實施例 15 的製劑（ $30\text{ g} / \text{ha}$ ）及實施例 17 的製劑（ $15\text{ g} / \text{ha}$ ）混合並施用於小麥的作物，以控制禾草。與施用包含有相同之活性化合物但非本發明之組合物的製劑相較之下，可觀察到較佳的禾草控制。

實施例 20

將實施例 2 的製劑（ $60\text{ g} / \text{ha}$ ）及實施例 16 的製劑（ $60\text{ g} / \text{ha}$ ）的混合物施用於稻作，以控制禾草

五、發明說明 (36)

及闊葉雜草。與施用包含有相同活性化合物之組合物但非本發明之組合物的製劑相較之下，可觀察到較佳之禾草／闊葉雜草控制。

實施例 2 1

將實施例 1 5 的製劑 (6 0 g / h a)、實施例 1 1 的製劑 (1 5 g / h a) 及實施例 5 的製劑 (3 0 0 g / h a) 之混合物施用於小麥的作物，以控制禾草及闊葉雜草。與施用包含有相同用量之相同活性化合物但非本發明之組合物的製劑相較之下，可觀察到較佳的闊葉雜草及禾草控制。

實施例 2 2

將實施例 1 5 之製劑 (6 0 g / h a 之芬殺草 - p - 乙基)、實施例 1 6 的製劑 (6 0 g / h a 之 5 , 5 - 聯苯基 - 2 - 異噁唑啉 - 3 - 羧酸) 及實施例 1 之製劑 (4 0 g / h a 之芬殺草 - p - 乙基) 的混合物施用於稻作，以控制雜草。與施用包含有相同用量之相同活性化合物但非本發明之組合物的製劑相較之下，可觀察到較佳的闊葉雜草及禾草控制。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

四、中文發明摘要(發明之名稱：由農作物保護用劑與有機或無機載體物質構成之組合物)

本發明係關於農化活性化合物與圍繞該活性化合物之固態載體物質所構成之組合物用於抑制被載體物質所圍繞之活性化合物與至少一種其他農化活性化合物之混合物中的對抗交互作用的用途。包含如是之組合物的較佳製劑包括與載體物質連同解毒劑及／或生長控制劑組合在一起的除草劑。依本發明使用該製劑，可抑制不同活性化合物之間的對抗交互作用。

英文發明摘要(發明之名稱：

Combinations of crop protection agents with organic or inorganic carrier materials

The present invention describes the use of a combination of an agrochemically active compound and a solid carrier material which surrounds the active compound, to suppress antagonistic interactions in a mixture comprising the active compound surrounded by the carrier material, and at least one further agrochemically active compound. Preferred formulations comprising such a combination include herbicides combined with a carrier material together with a safener and/or a growth regulator. Using the formulations according to the present invention, it is possible to suppress antagonistic interactions between different active compounds.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

附件 2A：第 90111059 號專利申請案

中文申請專利範圍替換本

民國 94 年 8 月 8 日修正

1. 一種包含由農化活性化合物與圍繞 (surrounding) 該活性化合物之載體所構成之組合的組成物，該組合得以抑制包含該被載體物質所圍繞之活性化合物與至少一種其他農化活性化合物所構成之混合物中的對抗交互作用，其中該活性化合物係選自：除草劑、殺真菌劑、殺蟲劑、生長控制劑和解毒劑所組成之群。

2. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其中該除草劑係選自：ALS 抑制劑，(諸如，磺醯脲類)；羥基苯甲腈類(宜為溴苯腈(bromoxynil)及碘苯腈(ioxynil))；滅草松(bentazone)；芳氧基烷基羧酸類，宜為 MCPA、2,4-D、CMPP、2,4-DP、2,4-DB；雜芳氧基芳氧基烷基羧酸類，宜為芬殺草-p-乙基(fenoxaprop-p-ethyl)、代克羅普(dichlofop)、克羅丁普-炔丙基(clodinafop-propargyl)、伏寄普(fluzifop)；HPPDO 抑制劑，宜為美索三酮(mesotrione)或蘇可三酮(sulcotrione)；三嗪類；環己烷二酮肟類，宜為西殺草(sethoxidim)、剋草同(clethodim)或翠克西定(trialkoxidim)；生長控制劑係選自吲哚基乙酸或吲哚基丁酸以及生長素(auxins)；解毒劑係選自美分派-二乙基(mefenpyr-diethyl)及 5,5-聯苯基-2-異噁唑啉-3

六、申請專利範圍

— 羧酸所組成之群。

3 . 如申請專利範圍第 1 或 2 項之組成物，該載體物質係選自：合成及天然來源的物質以及有機性及無機性的物質，宜為天然及合成來源的聚合物、蠟、矽酸鹽類、鋁矽酸鹽類、氧化鋁以及基於此等物質的礦物。

4 . 如申請專利範圍第 3 項之組成物，其中該活性化合物係被作為載體的微囊所圍繞，宜為由聚脲類、聚胺基甲酸酯類、聚醯胺類、蜜胺樹脂、明膠、蠟及／或澱粉所構築的微囊。

5 . 如申請專利範圍第 4 項之組成物，其中該聚胺基甲酸酯類及聚脲類係由異氰酸酯預聚物所製得，宜由 2，4 - 二異氰酸甲苯酯、2，6 - 二異氰酸甲苯酯、亞甲基雙（4 - 異氰酸苯酯）以及二異氰酸己二酯所製得。

6 . 如申請專利範圍第 4 項之組成物，其中該微囊係由界面縮聚法或凝聚法製得。

7 . 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其包含該組合以及至少一種選自下列族群的其他成份：農化活性化合物、界面活性劑、肥料及習用的助劑。

8 . 如申請專利範圍第 7 項之組成物，其包含除草劑及載體物質連同解毒劑及／或生長控制劑所構成的組合物。

9 . 一種供控制有害之有機體（尤指有害植物）的方法，其包含依本身已知的方式，施用申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之組合物或申請專利範圍第 7 或 8 項之組成

六、申請專利範圍

物。

10 . 一種製備申請專利範圍第1至6項中任一項之組成物或申請專利範圍第7或8項之組成物的方法，其包含藉由本身已知的習用程序，宜為溶解、攪拌或混合，將活性化合物與適當的載體組合。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂