



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 102355817 B

(45) 授权公告日 2016.05.11

(21) 申请号 201080012393.8

A01N 25/04(2006.01)

(22) 申请日 2010.03.12

A01N 25/12(2006.01)

(30) 优先权数据

A01N 25/14(2006.01)

0904659.0 2009.03.18 GB

A01N 25/26(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2011.09.16

(56) 对比文件

WO 2007053760 A2, 2007.05.10,

US 5939089 A, 1999.08.17,

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/GB2010/000464 2010.03.12

审查员 曹猛猛

(87) PCT国际申请的公布数据

W02010/106314 EN 2010.09.23

(73) 专利权人 辛根塔有限公司

地址 英国萨里郡

专利权人 先正达参股股份有限公司

(72) 发明人 A·M·赫明 A·J·皮尔斯

J·M·威廉姆斯

(74) 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专

利商标事务所 11038

代理人 李华英

(51) Int. Cl.

A01N 25/22(2006.01)

A01N 43/90(2006.01)

权利要求书1页 说明书14页

(54) 发明名称

包含被覆有光保护剂的阿维菌素颗粒的配制剂

(57) 摘要

一种包含选自阿维菌素的农药(A)和光保护剂的组合物,其中农药(A)颗粒的平均直径为0.1-100 μm,而且该组合物中光保护剂的含量不超过农药(A)颗粒及光保护剂总重量的20%,以及该组合物在农业中的应用。阿维菌素颗粒优选被覆有光保护剂。

1. 一种包含甲氨基阿维菌素苯甲酸盐农药 (A) 和光保护剂的组合物, 其中:
每个甲氨基阿维菌素苯甲酸盐颗粒都被覆有该光保护剂,
该农药 (A) 颗粒的平均直径为 1-10 μm ,
该组合物中光保护剂的含量是甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (A) 颗粒及该光保护剂总重量的 1 至 15%, 和
其中所述光保护剂是亚乙基双(氧亚乙基)二-(3-(5-叔丁基-4-羟基-间-甲基)-丙酸酯)。
2. 如权利要求 1 所述的组合物, 其中该组合物进一步包含除阿维菌素之外的一种或多种农药 (B), 并且每个农药 (B) 颗粒都被覆有该光保护剂。
3. 如权利要求 2 所述的组合物, 其中农药 (B) 颗粒的平均直径为 0.1-100 μm 。
4. 如权利要求 2 所述的组合物, 其中该组合物中光保护剂的总重量不超过农药 (A) 和 (B) 颗粒及该光保护剂的总重量的 20%。
5. 一种配制剂, 其是悬浮剂、水分散粒剂、可湿性粉剂或可分散油悬剂, 并包含如权利要求 1 到 4 中任一项所定义的组合物。
6. 如权利要求 1 所定义的组合物或如权利要求 5 所限定的配制剂在控制或防治病虫害中的应用。
7. 一种制备如权利要求 1 所限定的组合物或如权利要求 5 所定义的配制剂的方法, 其包括被覆步骤, 在该步骤中以受控方式在农药颗粒表面被覆包衣而不造成所述颗粒结块。
8. 一种被覆有光保护剂的甲氨基阿维菌素苯甲酸盐颗粒, 其中该颗粒的直径为 1-10 μm , 其中光保护剂的含量是经被覆的颗粒总重量的 1 至 15%, 并且其中所述光保护剂是亚乙基双(氧亚乙基)二-(3-(5-叔丁基-4-羟基-间-甲基)-丙酸酯)。

包含被覆有光保护剂的阿维菌素颗粒的配制剂

[0001] 本发明涉及含有低含量光保护剂的确定的农药组合物,特别涉及包含被覆有光保护剂的农药颗粒的组合物、包含此类组合物的配制剂、此类组合物和配制剂的用途,以及制备此类组合物和配制剂的方法。

[0002] 农药通常用于农作物,并在控制植物叶子上或叶子内的病虫害方面具有生物活性。在叶子表面或叶子内的许多农药化合物由于太阳光照射或因与太阳光的活动而产生的活性物质(例如单线态氧)发生化学反应而被降解(光解)。有时,光降解率非常快,以至于会过早地失去对病虫害必要的生物控制。光降解造成的农药化合物的损失必须在最初施用于农作物的农药化合物的数量上得到补偿。其结果是,所施用的农药化合物的数量超过了进行有效病虫害生物控制所需要的实际数量,从而带来商业和环境方面的影响。因此,需要可以使农药的光降解率降低的农药组合物。

[0003] 常见的做法是在农用化学品产品中添加抗氧化剂,以延长其存放期。这种做法不同于把农用化学品产品施用于农田作物时有意添加光保护化合物以便降低光降解率。

[0004] 现有技术中有一些使用光保护化合物以减少农药的光降解率并提高其药效的例子。

[0005] 《农药控释施药系统(Controlled-Release Delivery Systems for Pesticides)》第8章(主编 Scher, H., Marcel Dekker, New York, 1999 年)介绍了含有木质素或改性木质素的颗粒农药组合物。这些组合物的制备方法包括农药与木质素共融、冷却生成的熔化物以形成玻璃状,然后进一步处理以形成颗粒。

[0006] W003005816 描述了在木质素基质中包含农药颗粒的微颗粒,其制备方法包括形成共溶于有机溶剂中的农药和木质素的油包水型乳液,然后除去溶剂得到固态微颗粒。公开的组合物中木质素的含量是农药化合物的七倍多。光保护剂与农药的比例如此之高是必要的,因为只有这样才能形成球状微颗粒以充分包埋所有农药颗粒。

[0007] US5965123 介绍了农药组合物,其中农药组合物形同被包埋在基质中的颗粒,而基质由“pH 依赖型高分子”、增塑剂和紫外线保护剂组成。

[0008] W00213608 介绍了被覆有木质素的农药化合物的油基分散剂。农药颗粒是采用常用的方法与木质素共同配制的,例如把农药颗粒悬浮于木质素水溶液中,然后喷雾干燥,得到包含包埋在木质素基质中的多个农药颗粒的固态物质。

[0009] Demchak 和 Dybas 证明,阿巴丁(abamectin),一种主要用于农业的杀虫剂,可被包埋在植物源性蛋白的玉米蛋白基质中,形成光稳定性提高了的组合物(《农业与食品化学杂志(Journal of Agricultural and Food Chemistry)》;45,1,1997,260-262,美国化学学会出版)。

[0010] 在所有这些例子中,光保护化合物都是形成于固体基质中,其中组合物的每个颗粒或微颗粒都包含多个农药颗粒。即使在固体组合物被进一步处理的那些方法中,农药颗粒也不是分散的,而是具有光保护化合物的单独包衣,但是却以借助基质结合的团簇的形式存在。这些方法的缺点是,相对于农药的含量,所需光保护化合物的含量非常高。在所有情况中,光保护化合物与农药的重量比都超过 1 : 1。使用相对农药的大量光保护化合物不

仅成本很高而且体积也庞大。

[0011] W00226040 描述了利用颗粒表面上自然的静电电荷以吸引和约束带相反电荷的聚合物,并借以被覆悬浮在水中的颗粒的过程。在此过程中,光保护颗粒被束缚在这些颗粒的表面。对于本领域的技术人员显而易见的是,因为结果高度依赖颗粒和聚合物的性质,因此这种凝聚方法很难实施。比较常见的是利用凝聚过程制备与聚合物粘合在一起的颗粒团簇,而不是制备离散颗粒,而且颗粒团簇的大小也很难控制。另外,必须非常仔细地选择光保护颗粒的大小和性质,以便使其堆积在农药颗粒周围,并提供有效的光保护,而这也是此种方法的一个缺点。

[0012] W006077394 介绍了聚合物微胶囊的用途,其中光保护染料与农药或其它具有生物活性的化合物共溶;US2007275853 描述了聚合物微胶囊,其包含了被束缚在微胶囊壁中或与该微胶囊内部具有生物活性的化合物共溶的光保护稳定剂;US5455048 介绍了包含油状液体核心的微胶囊,其中“遮光剂”无机颗粒是分散的。

[0013] 对许多农药化合物而言,微囊法不是一种合适的方法,因为它们必须溶于适当的溶剂中,并且对于采用的包裹过程具有化学惰性,而这也是微囊法的一个缺点。另外,微囊法也有成本方面的问题,如处理成本的增加,以及能被掺入产品中的农药化合物总载药量相对较低。

[0014] EP1306008 介绍了传统的水分散粒剂,其包括作为填充物的植物基材料,以及可选的颗粒状光保护材料,如碳黑或粘土。虽然没有提供数据,但是本领域的技术人员应该知道,相对于农药而言,含量较低的颗粒状光保护材料不能有效地对在叶面上干喷附着的农药进行光保护,因为离散的光保护剂没有和农药颗粒紧密相连,相反地,却可能相互并列,从而使农药颗粒暴露在阳光下。

[0015] W007053760 介绍了被单线态氧降解的农药组合物。单线态氧降解是一种常见的光化学降解机理。这些农药组合物是与保护或稳定农药使其不与单线态氧反应的活性增强剂,亦即抗氧化剂共同配制的。在所给的例子中,农药和抗氧化剂化合物或者只是简单地共同配制,或者是在喷洒(桶混)之前直接混合在一起。所采用的重量比是 2-80 份的抗氧化剂比 1 份的农药。

[0016] 因此,需要一种农药组合物,其包含被相对于农药而言含量较低的光保护化合物进行了光保护的农药,特别是其中的光保护化合物和农药彼此紧密结合以便达到最佳效果,而且可以通过对多种农药都有效的工艺制备而成。

[0017] 本发明涉及包含平均直径为 0.1-100 μm 的成分明确的农药颗粒和光保护剂的组合物,其中在该组合物中,该光保护剂的总重量不超过该农药颗粒和该光保护剂总重量的 20%。另外,人们惊奇地发现这些组合物可以克服现有技术的缺点。

[0018] 因此,本发明一方面提供了一种由阿维菌素农药(A)和光保护剂组成的组合物,其中农药(A)颗粒的平均直径为 0.1-100 μm ,而且光保护剂在该组合物中的含量不超过该农药(A)颗粒和该光保护剂总重量的 20%。

[0019] 在一个实施例中,该第一方面的组合物可以这样获得:把每个农药(A)颗粒被覆上光保护剂,从而使光保护剂和农药相互间紧密相连。

[0020] 在一优选的实施例中,每个农药(A)颗粒都被覆有光保护剂。在这种情况下,颗粒的平均直径是指经被覆颗粒的平均直径;同样,农药(A)颗粒和光保护剂的总重量是指经

被覆的农药 (A) 颗粒的总重量。

[0021] 该组合中存在的这些颗粒,无论是经被覆或未经被覆,都是单一的固体颗粒或单核的固体颗粒。

[0022] 现有技术中介绍了由作为离散颗粒而经被覆的农药颗粒组成的组合物。US2007275853 描述了被覆有选自各种碳水化合物或纤维素材料的粉末包衣的颗粒;W09707676 描述了用于作物保护的固体颗粒,特别是被覆有各种不溶于水的材料的除草剂,以防止用于作物保护的被包裹的固体颗粒被其它用于作物保护的化学品降解。

[0023] 适合本发明使用的农药是阿维菌素杀虫剂。

[0024] 本发明特别适合当暴露在阳光下便容易降解的农药,尤其是阿维菌素或阿维菌素的化学衍生物(如阿巴丁、依维菌素、司拉克丁(selamectin)、依立诺克丁、多拉克丁和甲氨基阿维菌素苯甲酸盐)。

[0025] 如果光保护剂被覆在农药上,则农药的物理性质,如熔点或软化点必须适合所选的包衣工艺。例如,当包衣工艺是基于 W004054718 所描述的工艺时,则农药必须是一种软化点不低于液体被覆材料的固体。优选的农药是一种熔点超过 80°C 的农药。

[0026] 在一个实施例中,根据本发明的组合物的农药 (A) 是阿维菌素,例如阿巴丁或甲氨基阿维菌素苯甲酸盐。优选的农药 (A) 是甲氨基阿维菌素苯甲酸盐。

[0027] 在一个实施例,农药 (A) 可以是阿维菌素的混合物,如阿巴丁和甲氨基阿维菌素苯甲酸盐的混合物。

[0028] 在一个实施例中,以组合物的重量计,本发明的组合物中农药 (A) 的含量为 0.1-98%,优选为 0.5-99%,最好为 1-95%。

[0029] 如果农药 (A) 颗粒被覆有光保护剂,则农药颗粒至少部分被覆有光保护剂(或包衣),以便离散的农药颗粒被分别包裹,从而避免严重结块或使农药颗粒被包埋在被覆材料基质中。这些颗粒可以是单一的固体颗粒或单核的固体颗粒。在这种情况下,术语“部分被覆有”是指平均而言,这些颗粒几乎被完全包裹起来,但包衣可以不完全连续地包裹每个颗粒整个表面(即可能仍有一些颗粒的部分表面尚未被包裹)。因此,“至少部分被覆有”一词涵盖的情况是:(一)所有颗粒都被完全包裹;(二)一些颗粒被完全包裹,而其他颗粒则是部分(几乎完全)被包裹;(三)所有颗粒都是被部分(几乎完全)包裹。本发明的农药颗粒包衣具有光保护作用;这些颗粒必须被充分包裹起来,以便包衣使农药颗粒能够有效防止光降解。

[0030] 光保护剂是一种或多种化合物,该化合物能够降低太阳光作用所造成或催化的反应对农药的降解。本领域的技术人员都了解这些化合物种类繁多,而且具有不同的作用机理。例如,木松香、松香衍生物、蜡、脂肪衍生物、甾醇,长链甾醇酯、竞争性光子吸收剂和抗氧化剂中的一种或多种都可能适合用作本发明的光保护剂。

[0031] 松香衍生物的例子包括部分二聚松香、部分氢化松香、二价金属盐、三价金属盐、马来酸/酐加合物、延胡索酸/酐加合物或季戊四醇加合物中的任何一种或其混合物。二价或三价金属盐类来源于钙、镁、铁、锌、铝、锰和钡中的任何一种或其混合物。

[0032] 蜡的例子可以包括天然的蜡,也即源自动物、植物或矿物的蜡。动物蜡包括蜂蜡、羊毛脂、虫胶蜡和中国虫蜡。植物蜡包括棕榈蜡、小烛树蜡、杨梅蜡和甘蔗蜡。矿物蜡包括化石蜡或地蜡,如石蜡、白地蜡和褐煤蜡,或者石油蜡,包括石蜡和微晶蜡。另外,这些蜡也

可以是合成蜡,或是天然蜡和合成蜡的混合物。例如,在光保护剂经被覆的情况下,尤其是包衣材料可能包括低分子量的部分氧化的聚乙烯,则最好与石蜡、低分子量的聚(乙烯/丙烯酸)或低分子量的聚(乙烯/甲基丙烯酸)共熔。应该指出,包衣材料可以是本段落所述的任何一种蜡,或是其中任何蜡的混合物。

[0033] 脂肪酸衍生物的例子包括脂肪酸、这些脂肪酸的脂肪酸金属盐、脂肪酸酰胺、脂肪醇和脂肪酯,或者任一前述物质的混合物。此处“脂肪”是指长链脂肪。尤其是,酸可以是羧酸,如硬脂酸,而盐可以是钙、镁、锌或铝盐。酰胺可以是硬脂酰胺。醇可以是硬脂醇。酯是由长链酸与长链醇反应形成的。酯也可以是脂肪醇的脂肪酸酯或甘油的脂肪酸酯。

[0034] 甾醇本身或长链甾醇酯(指由甾醇形成的酯)也可以用作光保护剂,特别是用作包衣材料。在任何情况下,甾醇都可以是动物源性的(如胆固醇)或植物源性的(例如,麦角固醇)。

[0035] 具竞争性的适当光子吸收剂包括羟基二苯甲酮、羟苯基苯并三氮唑、羟苯基三嗪、二苯基丙烯酸酯、肉桂酸衍生物、类胡萝卜素、类黄酮、单偶氮和双偶氮染料、吡啶染料、葱醌染料、茛染料、吡啶染料、引杜林染料、噁嗪酮染料、三芳基甲烷染料和咕吨染料。

[0036] 抗氧化剂或自由基捕获剂的例子包括受阻胺光稳定剂(HALS)、非交互受阻胺光稳定剂(NOR-HALS)、硫代酸酯抗氧化剂、亚磷酸盐抗氧化剂、亚硫酸盐抗氧化剂、受阻酚、多酚、生育酚、芳香胺、氨基苯酚、类胡萝卜素、稳定的硝基氧以及抗坏血酸。

[0037] 如果光保护剂用作包衣,则包衣材料的熔点要在 55-220℃ 的范围内。当熔点在 20℃ 内的范围时,熔融的包衣材料就会成膜而不会分解,而且不会成丝。

[0038] 优选的光保护剂是 2,6-二叔丁基-4-甲基苯酚(俗称 BHT);亚乙基双(氧亚乙基)二-(3-(5-叔丁基-4-羟基-间-甲苯基)-丙酸酯)(如 Irganox™245);偶氮染料(如 Sigma Aldrich 公司生产的 Oil Red O™);合成蜂蜡(如 Croda 生产的 Syncrowax™ BB4);羟苯基苯并三唑类紫外线吸收剂(如, BASF 生产的 Tinuvin™328)。

[0039] 在包衣中使用的光保护剂的类型应能够有效降低太阳光作用造成的农药降解率。

[0040] 如果光保护剂是包裹在农药上,而不受任何特定的理论所限,那么目前人们相信本发明中使用的光保护剂包衣将会特别有效,因为在每个颗粒的表面,光保护剂都与农药化合物紧密相连,而光降解最有可能在颗粒表面发生,因此颗粒表面最需要光保护剂。

[0041] 按照农药颗粒和光保护剂的总重量计,优选的包裹在本发明的农药颗粒上的光保护剂在组合物中的含量优选为 0.1-20%,较适合的是 0.5-18%,较有利的是 1-15%,最适合的是 2-10%。在任何特定的组合物中,所需的起作用的光保护物质的重量取决于许多变量,如农药的光敏感性、对使用的光保护化合物的选择,以及农药颗粒的大小。熟练的用户将能够为每种所需的农药和颗粒大小的组合选择合适的包衣材料。

[0042] 本发明的农药颗粒,优选经被覆农药颗粒的平均直径为 0.1-100 μm,较好的是 0.5-50 μm,最好是 1-10 μm,特别是 2-6 μm。因此,在 D[0.9](粒子数的 90%会落在该粒径以下——详情见方法 ISO13320-1:1999)的优选粒径是 4-10 μm。熟悉本领域的技术人员了解被覆之前制备优选粒径范围内的农药颗粒的方法,例如空气喷射磨、微细化、干磨、锤磨、针磨、珠磨或超声波粉碎。本发明的目的不受限于被覆之前用于制备农药颗粒的工艺。在这种情况下,平均直径是指如动态光散射之类适当的粒径测量技术所测定的数量平均的平均直径。熟悉本领域的技术人员会了解平均粒径在各种统计定义中的差异,以及如何对其

进行测量。

[0043] 制备本发明的组合物的方法包括适当混合具有限定颗粒大小的农药以及限定重量的光保护剂。熟练的人员都了解这些混合方法。

[0044] 因此,本发明包衣工艺是这样的适宜工艺,其中能够把光保护剂以受控的方式传送到农药颗粒的表面,而不会造成颗粒的结块。本发明更适合的包衣工艺是这样的技术,其中农药颗粒以干粉的形式被引入该工艺,然后用液态光保护剂包衣材料被覆;液态的光保护剂包衣材料在此过程中变成颗粒上的固体包衣,而被覆颗粒则以干燥、非凝聚状态离开该工艺。这种包衣工艺必须包括使颗粒均匀混合及运动的手段,例如气流或流化床,以及把液态包衣材料以热熔物、挥发性溶剂中的溶液或液体的方式引入的方法,使其反应变成固态,从而把液体均匀分布在颗粒表面。这通常是通过把气体流或流化床中的液体喷洒到成团的颗粒中的方式实现的。这种工艺的例子在 W09707676 或底喷流化床包衣 (Wurster 包衣) 技术中均有披露。

[0045] W004054718 描述了最适合用于制备本发明优选粒度范围的农药颗粒并将其被覆的方法。在该工艺中,固体颗粒的原始物料通过高压气体喷射引入离心研磨腔,同时,用作包衣材料的熔融液体通过单独的喷嘴引入同一个离心研磨腔中。液体和固体的比例由调节装置控制。这样,经过粉碎后固体颗粒的粒度得以减小,并在此操作过程中被覆了液态包衣材料。包覆颗粒一旦处于一定的粒度范围便会立即离开粉碎机,并被收集到分离装置中。

[0046] 因此,本发明最适合的实施例中使用的光保护剂包衣材料必须具有用于该工艺中所需的特性。也即在此工艺中,它必须能够被溶解或溶化、泵送和雾化,然后必须固化以便在颗粒上形成在室温下不软也不粘的包衣,而且最终产品在预期贮存期间保持复原能力。包衣材料也可适当地包括两种或两种以上的光保护化合物,或一种或一种以上的光保护化合物和惰性化合物的组合物,以便加入后增强包衣工艺的效果。本发明中使用的包衣材料适合的熔点为 50-150°C,更适合的为 60-120°C,最适合的为 70-100°C;特别适合的包衣材料是 2,6-二叔丁基-4-甲基酚(俗称 BHT),其熔点为 70-73°C;以及亚乙基双(氧乙烯)二-(3-(5-叔丁基-4-羟基-间-甲基)-丙酸酯(例如可以购得的 Irganox™245),其熔点为 76-79°C。

[0047] 本发明的组合物可以被配制用于特定用途。优选地,该组合物的配制剂用于保护栽培作物或其繁殖材料。因此,本发明的组合物可以按照传统的方式,例如以叶面喷施的方式施用于植物。此外,可以配制用于种子处理的组合物,以便控制或防止病虫害和/或病原体造成的损害。这些病虫害和/或病原体在农业和林业中都存在,而且尤其会对处于发育早期阶段的植物造成损害。还应考虑把农药施用于土壤中的方法。可以通过任何合适的方法施用农药,以确保其渗入土壤中,例如,通过育苗盘施用、沟施、土壤灌注、土壤注入、滴灌、通过喷洒器或中心枢轴施用,以及混合到土壤中(撒施或者条带施药)等方法施药。

[0048] 本发明的组合物可在农业中使用,以促进植物生长。目标作物的例子尤其包括大田作物水果、蔬菜、坚果、浆果、热带人造林、观赏植物和其他植物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、大米、玉米、高粱、菜豆、小扁豆、豌豆、大豆、油菜、芥菜、罂粟、糖用甜菜和饲料甜菜、棉花、亚麻、大麻、黄麻、向日葵、蓖麻、花生、马铃薯、红薯、烟草、甘蔗、苹果、梨、李子、桃、油桃、杏、樱桃、橙子、柠檬、葡萄柚、柑橘、橄榄藤蔓、蛇麻草、杏仁、核桃、榛子、鳄梨、香蕉、茶叶、咖啡、椰子、可可、天然橡胶植物、油料植物、葡萄、草莓、覆盆子、黑莓、菠菜、莴苣、芦笋、

卷心菜、芥蓝、胡萝卜、洋葱、番茄、黄瓜、胡椒、茄子、瓜类、甜辣椒、红辣椒、玫瑰、菊花、棉花和康乃馨。这些植物也可以是转基因植物。

[0049] 对植物施用该组合物的量和频率变化范围很大,并取决于具体的农药、使用类型、土壤性质、施用方法(苗前或苗后等)、要控制的植物或病虫害、主要气候条件及受施用方法、施用时间以及目标植物影响的其它因素。一个熟练的技术人员将能够为该组合物的施用选择合适的参数。

[0050] 包括本发明的农药的组合物通常会得到进一步的处理以制备配制剂,如通常用于农业生产的配制剂,例如水可分散性浓剂,如悬浮剂(SC)、水分散粒剂(WG)、可湿性粉剂(WP)或可分散油悬剂(oil flowable dispersions,OD)。本领域的技术人员将能够为目标产品选择合适的配制剂类型及制备所需的共配制剂和处理条件。由本发明的被覆农药颗粒制备的组合物,除了颗粒上的包衣之外,还可适当地进一步包含光保护剂。例如,除颗粒包衣之外,颗粒状组合物中作为分散剂使用的木质素磺酸钠可以对农药颗粒提供进一步的光保护。

[0051] 在一优选的实施例中,本发明的组合物是一种 pepite 水分散粒剂(WG),其中配制剂中的共配制剂为木质素磺酸钠(例如,商业上俗称的木质素磺酸钠 H(Polyfon H))。

[0052] 在一个实施例中,以配制剂的重量计,本发明的配制剂中农药(A)的含量为0.1-50%,优选为0.5-20%,最好为0.95-10%。

[0053] 本发明的组合物也可以制成浓缩产品,用于制备通常在农业产业中使用的配制剂。在此情况下,以组合物的重量计,组合物中农药(A)的含量将会更高,例如50-99%,优选为75-98%,最好为85-95%。

[0054] 虽然商用产品最好制成浓缩品(例如,预混组合物(配制剂)),而最终用户通常会使用稀释配制剂(如桶混组合物)。

[0055] 桶混组合物的制备方法通常是用溶剂(例如水)稀释含有农药及更多可选的辅剂的一种或多种预混合组合物。在这种情况下,预混物之一是根据本发明的组合物。第二种预混物可以是含有不同农药的另一种组合物。

[0056] 此外,本发明的组合物(包括配制剂)都含有除阿维菌素或拟除虫菊酯之外的另一种农药(B)。

[0057] 农药(B)的例子包括杀菌剂和其他杀虫剂,例如虱螨脲、噻虫嗪、氟虫腈、吡虫啉和氯虫苯甲酰胺。

[0058] 在一个实施例中,独立于农药(A)的农药(B)颗粒的平均直径与上述农药(A)颗粒的平均直径相对应。

[0059] 在一个实施例中,独立于农药(A)的包衣或农药(A)上的涂布量,每个农药(B)颗粒都被覆了光保护包衣,而且如本文所定义的那样,包衣的含量不超过农药(B)颗粒和包衣总重量(即带有包衣的农药(B)颗粒的重量)的20%。按照带有包衣的农药(B)颗粒的重量计,光保护包衣的含量优选为0.01-20%,例如0.5-18%,更优选的是1-15%,最好是2-10%。

[0060] 因此,按照本发明的组合物中光保护剂与农药的重量比(不论只含有农药(A)还是既含有农药(A)也含有农药(B))绝不会超过20:100,而且重量比优选为0.01-20:100,更优选为0.5-18:100;特别是1-15:100,比较有利的是2-10:100。

[0061] 在一个实施例中,如果农药 (B) 经被覆,则农药 (A) 和农药 (B) 的光保护包衣可以相同或不同。

[0062] 如果组合物中含有不止一种农药 (A) 和 / 或不止一种农药 (B),则每种农药 (A) 和每种农药 (B) 的光保护包衣可以相同或不同。

[0063] 本发明的组合物在农业及相关行业中具有特殊的用途。这些组合物适用于控制病虫害,如昆虫、真菌及杂草对植物所造成的损害,并促进植物生长。

[0064] 昆虫的例子包括鳞翅目昆虫,例如长翅卷蛾属 (*Acleris* spp.)、褐带卷蛾属 (*Adoxophyes* spp.)、透翅蛾属 (*Aegeria* spp.)、地夜蛾属 (*Agrotis* spp.)、棉叶波纹叶蛾 (*Alabama argillaceae*)、*Amylois* spp.、大豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、黄卷蛾属 (*Archips* spp.)、带卷蛾属 (*Argyrotaenia* spp.)、*Astylus atromaculatus*、丫蚊夜蛾属 (*Autographa* spp.)、玉米干夜蛾 (*Busseola fusca*)、干果斑螟 (*Cadra cautella*)、桃小食心虫 (*Carposina nipponensis*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.)、色卷蛾属 (*Choristoneura* spp.)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、纵卷叶野螟属 (*Cnaphalocrocis* spp.)、云卷蛾属 (*Cnephasia* spp.)、细卷蛾属 (*Cochylis* spp.)、鞘蛾属 (*Coleophora* spp.)、泛非绒毛螟 (*Crocidolomia binotalis*)、桃异形小卷蛾 (*Cryptophlebia leucotreta*)、小卷蛾属 (*Cydia* spp.)、杆草螟属 (*Diatraea* spp.)、苏丹棉铃虫 (*Diparopsis castanea*)、金钢钻属 (*Earias* spp.)、玉米苗斑螟属 (*Elasmopalpus* spp.)、粉斑螟属 (*Ephestia* spp.)、花小卷蛾属 (*Eucosma* spp.)、女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、黄毒蛾属 (*Euproctis* spp.)、切夜蛾属 (*Euxoa* spp.)、小食心虫属 (*Grapholita* spp.)、云雾广翅小卷蛾 (*Hedya nubiferana*)、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)、菜心野螟 (*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟 (*Heteronychus arator*)、美国白蛾 (*Hyphantria cunea*)、番茄茎麦蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、旋纹潜蛾 (*Leucoptera scitella*)、细蛾属 (*Lithocolletis* spp.)、鲜食葡萄小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、*Lymantha* spp.、潜蛾属 (*Lyonetia* spp.)、天幕毛虫属 (*Malacosoma* spp.)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、烟草天蛾 (*Manduca sexta*)、秋尺蛾属 (*Operophtera* spp.)、欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、超小卷蛾属 (*Pammene* spp.)、褐卷蛾属 (*Pandemis* spp.)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*)、马铃薯麦蛾 (*Phthorimaea operculella*)、菜粉蝶 (*Pieris rapae*)、粉蝶属 (*Pieris* spp.)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、小白巢蛾属 (*Prays* spp.)、白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属 (*Sesamia* spp.)、长须卷蛾属 (*Sparganothis* spp.)、贪夜蛾属 (*Spodoptera* spp.)、透翅蛾属 (*Synanthedon* spp.)、带蛾属 (*Thaumetopoea* spp.)、卷蛾属 (*Tortrix* spp.)、粉斑夜蛾 (*Trichoplusia ni*) 和巢蛾属 (*Yponomeuta* spp.) ;鞘翅目 (*Coleoptera*) 昆虫,例如叩甲属 (*Agriotes* spp.)、花象属 (*Anthonomus* spp.)、甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*)、蚤凹胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、*Conotrachelus* spp.、根颈象属 (*Cosmopolites* spp.)、象虫属 (*Curculio* spp.)、皮蠹属 (*Dermestes* spp.)、叶甲属 (*Diabrotica* spp.)、*Dilopoderus* spp.、食植瓢虫属 (*Epilachna* spp.)、*Eremnus* spp.、欧麻蝇属 (*Heteronychus* spp.)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属 (*Lissorhoptrus* spp.)、鳃金龟属 (*Melolontha* spp.)、五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*)、锯谷盗属 (*Oryzaephilus* spp.)、耳象属 (*Otiorhynchus* spp.)、斑象属 (*Phlyctinus* spp.)、云粉蝶属 (*Popillia*

spp.)、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、蚤跳甲属 (*Psylliodes* spp.)、谷蠹属 (*Rhizopertha* spp.)、金龟科 (*Scarabeidae*)、*Somaticus* spp.、米象属 (*Sitophilus* spp.)、麦蛾属 (*Sitotroga* spp.)、*Tanymecus* spp.、粉甲属 (*Tenebrio* spp.)、拟谷盗属 (*Tribolium* spp.)、斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.)、菜跳甲属 (*Phyllotreta* spp.)、龟象属 (*Ceutorhynchus* spp.)、*Cyclocephala hirta*、*Cyclocephala pasadenae*、蔷薇刺鳃角金龟 (*Macroductylus subspinosus*)、*Macroductylus uniformis* 和距步甲属 (*Zabrus* spp.)；直翅目 (*Orthoptera*) 昆虫, 例如蜚蠊属 (*Blatta* spp.)、小蠊属 (*Blattella* spp.)、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属 (*Locusta* spp.)、大蠊属 (*Periplaneta* spp.) 和沙漠蝗属 (*Schistocerca* spp.)；啮虫目 (*Psocoptera*) 昆虫, 例如粉啮虫属 (*Liposcelis* spp.)；虱目 (*Anoplura*) 昆虫, 例如血虱属 (*Haematopinus* spp.)、长颚虱属 (*Linognathus* spp.)、人虱属 (*Pediculus* spp.)、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.) 和倭蚜属 (*Phylloxera* spp.)；等翅目 (*Isoptera*) 昆虫, 例如散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.) 比如欧美散白蚁 (*R. flavipes*)、*R. 13hallus*、*R. tibialis*、美小黑散白蚁 (*R. virginicus*)、桑特散白蚁 (*R. santonensis*)、*R. hageni*、乳白蚁属 (*Coptotermes* spp.)、比如台湾乳白蚁 (*C. formosanus*)、*Nasutitermes* spp. 和 *Macrotermes* spp.；食毛目 (*Mallophaga*) 昆虫, 例如畜虱属 (*Damalinea* spp.) 和嚼虱属 (*Trichodectes* spp.)；缨翅目 (*Thysanoptera*) 昆虫, 例如花蓟马属 (*Frankliniella* spp.)、篱蓟马属 (*Hercinothrips* spp.)、带蓟马属 (*Taeniothrips* spp.)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*) 和橘硬蓟马 (*Scirtothrips aurantii*)；半翅目 (*Heteroptera*) 昆虫, 例如臭虫属 (*Cimex* spp.)、可可狄盲蝽 (*Distantiella theobroma*)、棉红蝽属 (*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属 (*Euchistus* spp.) 扁盾蝽属 (*Eurygaster* spp.) 稻缘蝽属 (*Leptocorisa* spp.)、绿蝽属 (*Nezara* spp.)、皮蝽属 (*Piesma* spp.)、红猎蝽属 (*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽 (*Sahlbergella singularis*)、黑蝽属 (*Scotinophara* spp.) 和椎猎蝽属 (*Triatoma* spp.)；同翅目 (*Homoptera*) 昆虫, 例如软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、菜粉虱 (*Aleyrodes brassicae*)、肾圆盾蚧属 (*Aonidiella* spp.)、蚜科 (*Aphididae*)、蚜属 (*Aphis* spp.)、圆盾蚧属 (*Aspidiotus* spp.)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、蜡蚧属 (*Ceroplaster* spp.)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus aonidium*)、橙褐圆盾蚧 (*Chrysomphallus dictyospermi*)、广食褐软蚧 (*Coccus hesperidum*)、绿小叶蝉属 (*Empoasca* spp.)、苹果棉蚜 (*Eriosoma larigerum*)、斑叶蝉属 (*Erythroneura* spp.)、*Gascardia* spp.、灰飞虱属 (*Laodelphax* spp.)、东方球蜡蚧 (*Lecanium corni*)、蛎盾蚧属 (*Lepidosaphes* spp.)、长管蚜属 (*Macrosiphus* spp.)、瘤蚜属 (*Myzus* spp.)、黑尾叶蝉属 (*Nephotettix* spp.)、褐飞虱属 (*Nilaparvata* spp.)、*Paratoria* spp.、瘿绵蚜属 (*Pemphigus* spp.)、臀纹粉蚧属 (*Planococcus* spp.)、白盾蚧属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、粉蚧属 (*Pseudococcus* spp.)、木虱属 (*Psylla* spp.)、棉蚧 (*Pulvinaria aethiopia*)、笠圆盾蚧属 (*Quadraspidotus* spp.)、缢管蚜属 (*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧属 (*Saissetia* spp.)、带叶蝉属 (*Scaphoideus* spp.)、二叉蚜属 (*Schizaphis* spp.)、谷网蚜属 (*Sitobion* spp.)、温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、柑个木虱 (*Trioza erytraeae*) 和柑橘尖盾蚧 (*Unaspis citri*)；膜翅目 (*Hymenoptera*) 昆虫, 例如刺切叶蚁 (*Acromyrmex*)、切叶蚁 (*Atta* spp.)、茎蜂属 (*Cephus* spp.)、松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、

松叶蜂科 (Diprionidae)、云杉吉松叶蜂 (*Gilpinia polytoma*)、实叶蜂属 (*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、小家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、新松叶蜂属 (*Neodiprion* spp.)、火蚁属 (*Solenopsis* spp.) 和胡蜂属 (*Vespa* spp.) ; 双翅目 (Diptera) 昆虫, 例如伊蚊属 (*Aedes* spp.)、高粱芒蚊 (*Antherigona soccata*)、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、丽蝇属 (*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属 (*Ceratitis* spp.)、金蝇属 (*Chrysomyia* spp.)、库蚊属 (*Culex* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属 (*Dacus* spp.)、黑腹果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、虱蝇属 (*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属 (*Lucilia* spp.)、黑潜蝇属 (*Melanagromyza* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.)、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瘦蚊属 (*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、菠菜泉蝇 (*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、苹绕实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)、尖眼蕈蚊属 (*Sciara* spp.)、螫蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、*Tannia* spp.、地种蝇属 (*Delia* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.) 和大蚊属 (*Tipula* spp.) ; 蚤目 (Siphonaptera) 昆虫, 例如角叶蚤属 (*Ceratophyllus* spp.) 和印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*) ; 缨尾目 (Thysanura) 昆虫, 例如西洋衣鱼 (*Lepisma saccharina*) ; 和蜱螨目 (Acarina) 的代表, 例如粗脚粉螨 (*Acarus siro*)、柑橘瘤瘿螨 (*Aceria sheldoni*)、斯氏针刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*)、花蜱属 (*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、牛蜱属 (*Boophilus* spp.)、短须螨属 (*Brevipalpus* spp.)、苜蓿苔螨 (*Bryobia praetiosa*)、上三节瘿螨属 (*Calipitrimerus* spp.)、痒螨属 (*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、鹅耳枥始叶螨 (*Eotetranychus carpini*)、瘿螨属 (*Eriophyes* spp.)、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、草地小爪螨 (*Olygonychus pratensis*)、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.)、柑橘皱叶刺瘿螨 (*Phyllocoptruta oleivora*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、瘙螨属 (*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、根嗜螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.) 和叶螨属 (*Tetranychus* spp.)。

[0065] 如果一种或多种农药 (B) 与农药 (A) 组合使用, 则本发明的组合物将适用于控制更广范围的病虫害, 如真菌、杂草或线虫。

[0066] 由英国作物保护委员会于 2006 年出版的第 14 版《农药手册》可以提供有关农药的详细资料。

[0067] 下述实施例对本发明进行了详细说明, 并涉及以下材料: *Atlox*TM 4913 是一种丙烯酸接枝共聚物分散剂, 可以从 *Croda* 购买; *Celite*TM 209 是一种硅藻土, 可以从 *Celite* 购买; *Dispergator*TM B 是二丁基萘磺酸钠, 是从 *Ledertechnik GmbH* 购买的; 2,6-二叔丁基-4-甲基酚 (BHT) 是从 *Sigma Aldrich* 购买的; 工业级甲氨基阿维菌素苯甲酸盐是从 *Syngenta* 购买的一种杀虫剂; *Geropon*TM T77 是 N-甲基-N-油烯基牛磺酸钠, *Geropon*TM TA72 是聚羧酸酯分散剂, 两者均可从 *Rhodia* 公司购买; *Irganox*TM 245 是一种从 *Ciba Specialties* 购买的抗氧化剂; 使用的无水制片级乳糖是从 *Fonterra Excipients GmbH* 购买的; *Morwet*TM D425 是萘磺酸钠甲醛缩合物, 可以从 *Akzo Nobel* 公司购买; *Oil Red O*TM 是一种从 *Sigma Aldrich* 购买的偶氮染料; *Pergopak*TM M 是一种脲醛聚合物颗粒, 可以从 *Albermarle* 公司购买; *Polyfon*TM H 是一种高分子量木质素磺酸钠, 可以从 *Meadwestvaco*

购买;Proxel™ GXL是一种可从Arch Biocides公司购买的1,2-苯并异噻唑-3(2H)-酮水分散液;Rhodopol™ 23是一种可从Rhodia购买的多糖生物聚合物;Rhodorsil™ EP6703是一种可从Rhodia购买的硅消泡剂粉末;SAG™ 1572是可从GE Specialty Materials购买的硅油乳剂;Sellogen™ DFL是一种可从Cognis购买的烷基萘磺酸钠;Syncrowax™ BB4是一种可从Croda公司购买的合成蜂蜡;Tinuvin™ 328是一种可从BASF购买的羟苯基苯并三唑类的紫外线吸收剂;Ufoxane™ 3A和Ultrazine™ NA是可从Borregaard Industries购买的木质素磺酸钠;工业级尿素是从Atochem购买的。

[0068] 实施例 1

[0069] 该实施例介绍了使用如W004054718所描述的改进后的空气气流研磨机、利用光保护化合物包裹农药颗粒的工艺。该工艺在氮气下操作,其中注射器压力为6.0巴,研磨腔压力为5.0巴。使用双螺杆送粉器以每小时5.0千克的通量把工业级甲氨基阿维菌素苯甲酸盐送入研磨机。液体注射喷嘴和泵被加热到所需温度,使包衣材料保持为可喷涂液体(表1给出了泵和喷嘴的温度)。改变液体注射速率来控制包衣厚度,而且液体的喷射压力保持在4.5-5.0巴之间。利用激光散射(Malvern Mastersizer X型粒度分析仪)在水分散体中测得被覆颗粒样本的数量平均粒径为1.5-3.0 μm, D[0.9] (90%的颗粒会落在该粒径以下)为4-7 μm。

[0070] 表 1

[0071]

例子	% w/w 包衣 ^(a)	包衣组合物	泵温度(°C)	喷嘴温度(°C)	注入速率 ^(b)
1A	-	无(对比例)	-	-	-
1B	5.0	Irganox 245	100	110	260
1C	2.5	Irganox 245	100	110	125
1D	2.0	Irganox 245	100	110	100
1E	0.2	Irganox 245	100	110	10
1F	2.0	2,6-二叔丁基-4-甲基酚(BHT)	90	100	100

[0072]

例子	% w/w 包衣 ^(a)	包衣组合物	泵温度(°C)	喷嘴温度(°C)	注入速率 ^(b)
1G	10.0	1份 Irganox 245, 9份 Syncrowax BB4	90	130	560
1H	2.5	1份 Irganox 245, 9份 Syncrowax BB4	90	130	125
1I	2.5	3份 Irganox 245, 1份 Oil Red O	120	120	125
1J	0.2	3份 Irganox 245, 1份 Oil Red O	120	120	10
1K	10	1份 Oil Red O, 9份 Syncrowax BB4	120	120	560
1L	5.0	Tinuvin 328	100	110	260
1M	10	Syncrowax BB4	120	120	560

[0073] (a) 以经被覆颗粒总重量的重量%表示；

[0074] (b) 控制重量的注入速率,以克/小时为单位。

[0075] 实施例 2

[0076] 该实施例描述了利用实施例 1 的被覆颗粒制备悬浮剂 (SC) 配制剂的工艺。样品是按照下列配制剂 [表 2a] 和方法制备的：

[0077] 表 2a

[0078]

成分	重量份
经被覆颗粒	10 份
Atlox 4913	2 份
Morwet D425	1.25 份
SAG 1572	0.3 份
丙二醇	1 份
Rhodopol 23	0.4 份
Proxel GXL	0.1 份
自来水	84.95 份

[0079] 把 Morwet D425 和 Atlox4913 溶解在自来水中,加入 SAG1572,然后利用高能量混和方法 (Polytron 转子-定子混合机) 按表 1 混合已被覆的农药粉末;加入其余的成分并混合,直到完全分散。表 2b 表示该实施例中使用了表 1 中的哪种被覆农药粉末：

[0080] 表 2b

[0081]

例子	使用的被覆颗粒
2A	1A
2B	1C

[0082]

例子	使用的被覆颗粒
2C	1E
2D	1I
2E	1J
2F	1H
2G	1K
2H	1L
2I	1M

[0083] 实施例 3

[0084] 该实施例描述了利用实施例 1 中的被覆颗粒制备可溶性颗粒 (SG) 的配制剂。首先使用粉末搅拌机 (Eirich, 实验室规模) 彻底混合这些组分,然后加入 9 重量份的水并混合,形成具有团粒一致性的浆料。使用装有一个 0.6 毫米滤网的圆顶挤出机 (Fuji) 将浆料挤出,然后将颗粒在流化床干燥器 (Aeromatic) 中、入口温度为 60°C 条件下干燥。继续干燥,直到出口温度达到 40°C。表 3a 和 3b 显示了使用的配制剂以及涉及了实施例 1 中的哪些样品：

[0085] 表 3a

[0086]

例子	3A	3B	3C	3D
实施例 1 中的经被覆颗粒	1A 5 份	1B 5.25 份	1B 5.25 份	1A 5 份
Geropon T77	7.5 份	7.5 份		7.5 份
Sellogen DFL	1 份	1 份	1 份	1 份
Polyfon H			7.5 份	
Rhodorsil EP6703	0.1 份	0.1 份	0.1 份	0.1 份
Irganox 245				5 份
乳糖	到 100 份	到 100 份	到 100 份	到 100 份

[0087] 表 3b

[0088]

例子	3E	3F	3G	3H	3I
实施例 1 中的经被覆颗粒	1A 5 份	1D 5.1 份	1D 5.1 份	1D 5.1 份	1G 5.5 份
Sopropon TA72	2 份	2 份	2 份	2 份	2 份
Dispergator B	5 份	5 份	5 份	5 份	5 份
Ufoxane 3A	10 份	10 份		10 份	10 份
Polyfon H			10 份		
Rhodorsil EP6703	1 份	1 份	1 份	1 份	1 份
Pergopak M	10 份	10 份	10 份	10 份	10 份
工业级尿素	到 100 份	到 100 份	到 100 份	到 100 份	到 100 份

[0089] 实施例 4

[0090] 本实施例介绍了采用喷雾干燥造粒技术自实施例 1 中的被覆颗粒制备水分散剂 (WG) 的工艺。使用高剪切的转子-定子混合机,把 Ultrazine NA 和硅藻土 209 按照下表中给定的比例与 25-30 重量份的水混合,然后通过珠磨机 (Dynomill, 2mm 玻璃珠, 填充 80% 的珠)。加入 Rhodorsil EP6703, 然后加入被覆颗粒, 并使用高剪切混合机使其完全分散到浆料中。把浆料通过 1.8mm 的共轴喷嘴喷入喷雾干燥器 (Glatt, WG4) 中, 其中流量为 18 升/小时 (1.8 巴), 干燥空气通量为 250m³/小时, 入口温度为 90℃。继续干燥, 直到出口温度达到 55℃。

[0091] 表 4 显示采用的配制剂以及所涉及的实施例 1 中的样品:

[0092] 表 4

[0093]

例子	4A	4B
实施例 1 中的经被覆颗粒	1A 5 份	1D 5.1 份
Ultrazine NA	30 份	30 份
Rhodorsil EP6703	1 份	1 份
硅藻土 209	到 100 份	到 100 份

[0094] 实施例 5

[0095] 本实施例介绍了含有经被覆颗粒的农药组合物经改进的光稳定性。把实施例 2、3 和 4 中制备的配制剂以每升 50mg 甲氨基阿维菌素苯甲酸盐的比例在去离子水中稀释。对于每个测试的配制剂, 把 8 个 2 μl 的液滴滴到一个干净的玻璃制的显微镜用载玻片上, 干燥,

然后用透明的二氧化硅载玻片覆盖,并置于 Suntest (Hanau) 氙弧灯测试仪中,将这些液滴显露在模拟太阳光线的氙灯下。之后,用 10ml 的乙腈 / 四氢呋喃 / 0.1% 磷酸水溶液 (重量比为 40/10/50) 清洗载玻片,随后利用与质谱仪联用的高效液相色谱法分析清洗液中甲氨基阿维菌素苯甲酸盐的含量。每个配制剂制备了 5 到 8 个载玻片,并采用了不同的曝光时间,以形成一个光降解损失曲线,用于计算每个配制剂的半衰期 (T_{50})。每个配制剂的光稳定性的改进利用该配制剂的半衰期与一个类似的不具备光稳定性的对照样本的半衰期之比来表示。Proclaim™ 05SG 是 Syngenta 的产品,是一种含有 50g/kg 甲氨基阿维菌素苯甲酸盐的可溶性颗粒状组合剂。表 5 显示了所使用的配制剂,以及每个配制剂的半衰期除以对照样本的半衰期:

[0096] 表 5

[0097]

例子	光保护包衣	T_{50}/T_{50} (对比) ^(a)
Proclaim 05SG	无	与 2B-F 对比
2B	2.5%的 Irganox 245	12.7
2C	0.2%的 Irganox 245	8.9
2D	3 份 2.5%的 Irganox 245, 1 份 Oil Red O	22.5
2E	3 份 0.2%的 Irganox 245, 1 份 Oil Red O	10.0
2F	1 份 2.5%的 Irganox 245, 9 份 Syncrowax BB4	14.2
2A	无	与 2G 对比
2G	1 份 10%的 Oil Red O, 9 份 Syncrowax BB4	2.3
2H	5%的 Tinuvin 328	2.5
2I	10%的 Syncrowax BB4	1.4
3A	无	与 3B-D 对比
3B	5%的 Irganox 245	3.6
3C	5%的 Irganox 245 包衣(配制剂中含 7.5%木素磺酸钠盐 H)	7.1
3D	无包衣, 配制剂中含 5%的 Irganox 245	2.8
3E	无	与 3F-I 对比
3F	2%的 Irganox 245	1.1
3G	2%的 Irganox 245 包衣(配制剂中含 10%木素磺酸钠盐 H)	3.6
3H	2%的 BHT	1.3
3I	1 份 10%的 Irganox 245, 9 份 Syncrowax BB4	2.8
4A	无(配制剂中含 30% Ultrazine NA)	与 4B 对比
4B	2%的 Irganox 245 包衣(配制剂中含 30% Ultrazine NA)	2.2

[0098] (a) 经被覆农药的半衰期与对照例的半衰期之比。