



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I501726 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：099126508

(22)申請日：中華民國 99 (2010) 年 08 月 09 日

(51)Int. Cl. : A01N43/56 (2006.01)

A01N25/30 (2006.01)

A01N25/02 (2006.01)

A01P7/04 (2006.01)

(30)優先權：2009/09/04 美國

61/239,902

(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國(72)發明人：葛茲卻 奧利佛 華特 GUTSCHE, OLIVER WALTER (DE) ; 格林 約翰 亨利
GREEN, JOHN HENRY (GB)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

(56)參考文獻：

TW 200531630A

TW 200812972A

WO 2008/069990A1

審查人員：林桂滿

申請專利範圍項數：12 項 圖式數：0 共 75 頁

(54)名稱

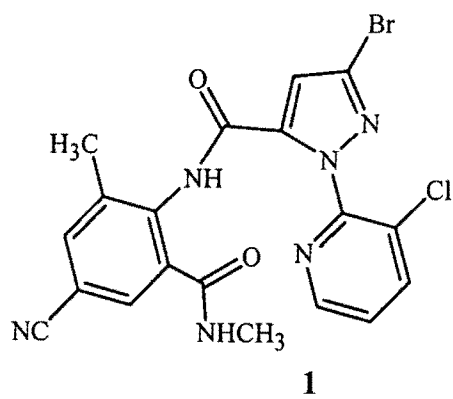
N－(苯腈)吡唑甲醯胺含水配方

N-(CYANOPHENYL)PYRAZOLECARBOXAMIDE AQUEOUS FORMULATION

(57)摘要

本發明揭露一般蟲懸浮濃縮物組合物，包含根據本組合物總重量按重量計算之：(a)自約 0.3% 至約 30% 之 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺；(b)自約 5% 至約 70% 之一於 20°C 下具有至少約 5 重量% 之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物，親水性-親油性均衡值自約 5 至約 18 且平均分子量自約 900 道耳頓至約 20000 道耳頓；及(c)自約 20% 至約 95% 之水。本發明亦揭露一控制一昆蟲害蟲之方法，包含以水稀釋該懸浮濃縮物組合物以形成稀釋組合物，並使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。

Disclosed is an insecticidal suspension concentrate composition comprising by weight based on the total weight of the composition: (a) from about 0.3 to about 30% of 3-bromo-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-N-[4-cyano-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-1H-pyrazole-5-carboxamide; (b) from about 5 to about 70% of a nonionic ethylene oxide-propylene oxide block copolymer component having a water solubility of at least about 5% by weight at 20°C, a hydrophilic-lipophilic balance value ranging from about 5 to about 18 and an average molecular weight ranging from about 900 to about 20000 daltons; and (c) from about 20 to about 95% of water. Also disclosed is a method for controlling an insect pest comprising diluting said suspension concentrate composition with water to form a diluted composition, and contacting the insect pest or its environment with an insecticidally effective amount of said diluted composition.



公告本

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：99126508

※申請日期：99.8.9

※IPC 分類：A01N ^{43/56} (2006.01)^{25/30} (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

^{25/62} (2006.01)

N-(苯腈)吡唑甲醯胺含水配方

^{7/64} (2006.01)N-(CYANOPHENYL)PYRAZOLECARBOXAMIDE AQUEOUS
FORMULATION

二、中文發明摘要：

本發明揭露一殺蟲懸浮濃縮物組合物，包含根據本組合物總重量按重量計算之：(a)自約0.3%至約30%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺；(b)自約5%至約70%之一於20°C下具有至少約5重量%之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物，親水性-親油性均衡值自約5至約18且平均分子量自約900道耳頓至約20000道耳頓；及(c)自約20%至約95%之水。本發明亦揭露一控制一昆蟲害蟲之方法，包含以水稀釋該懸浮濃縮物組合物以形成稀釋組合物，並使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。



三、英文發明摘要：

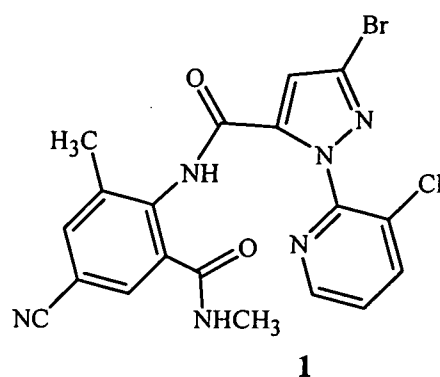
Disclosed is an insecticidal suspension concentrate composition comprising by weight based on the total weight of the composition: (a) from about 0.3 to about 30% of 3-bromo-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-*N*-[4-cyano-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazole-5-carboxamide; (b) from about 5 to about 70% of a nonionic ethylene oxide-propylene oxide block copolymer component having a water solubility of at least about 5% by weight at 20°C, a hydrophilic-lipophilic balance value ranging from about 5 to about 18 and an average molecular weight ranging from about 900 to about 20000 daltons; and (c) from about 20 to about 95% of water. Also disclosed is a method for controlling an insect pest comprising diluting said suspension concentrate composition with water to form a diluted composition, and contacting the insect pest or its environment with an insecticidally effective amount of said diluted composition.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於某些含水懸浮濃縮物 (suspension concentrate) 組合物，包含 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺。

【先前技術】

一般保護植物的化學化合物，例如殺蟲劑，係以包含(該等)活性化合物及例如載體及佐劑之惰性成分之成分(配方)配製。使用者可在該等組合物未稀釋或以水稀釋後應用於標的植物/害蟲。液態配方濃縮物係為植物化學保護最常使用的配方，因為其可輕易測量及傾倒，且當以水稀釋時通常易於形成水溶液噴灑或分散。

一般惰性成分的配方在應用時不應該導致活性成份的分解或大幅降低其生物活性，且應該是非藥害和對環境安全的。水係為一形成液態配方濃縮物之連續液體載體之特別理想的配方成分，因其價廉，對環境安全且在噴灑前可兼容與進一步以水之稀釋。配方中惰性成分可於使用前藉以水稀釋且應易於溶解或分散於水中。對於液態配方，經長期儲存之惰性成分亦應不會造成活性成份之明顯的沈澱現象或晶體生長。確實的懸浮濃縮物配方包含分散在液體介質中之活性成份固體顆粒，並經常包括惰性成分以促進懸浮顆粒和延緩其沈澱。

某些殺蟲劑可在植物的維管系統(例如，韌皮部)間傳輸，不僅是施用殺蟲劑之葉群，更提供葉面之系統性保護

(包括新出現的葉子)。另外，在一植物維管系統中之殺蟲劑的殺蟲劑濃度係對於主要通過自植物內部結構部分，例如葉子，提取植物汁液獲取營養之害蟲控制特別理想。特別值得注意之該種昆蟲害蟲係同翅目(order Homoptera)昆蟲之刺吸式害蟲，例如粉蝨科(粉蝨)、蚜蟲科(蚜蟲)、稻飛虱科(飛虱)及浮塵子科(浮塵子)成員。

儘管該系統性殺蟲劑有效成分於葉肉細胞、維管系統及其他組織中之分佈取決於殺蟲劑分子之物理性質(例如，辛醇水分配係數「log P」)，該殺蟲劑有效成分通過葉片角質層和表皮細胞之初始滲透和穿層運動亦取決於在應用之組成中的其他成分。由於該葉角質層係為蠟狀，水性組合物本質上溼潤濕角質層以促進聯繫之傾向極微小。吸收的促進可藉由包括提高接觸和付著之成份及甚至可能藉由結構性修改角質層蠟質以促進有效成分的滲透。除了促進系統傳輸，自該植物表面吸收活性成份至植物亦可改善耐清洗堅牢度。

PCT發表 WO 2008/069990 揭露某些含水懸浮濃縮物組合物，包含根據本組合物總重量按重量計算之自約 0.1% 至約 50% 之一或多種甲醯胺殺節肢動物劑，其於室溫下為固體，例如，3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺，自約 10% 至約 70% 之一或多個水不互溶液態化合物(於 20°C 下溶於水之程度低於 2 重量%)及自約 1% 至約 55% 之具有分散特性之界面活性劑成分。該案揭露包括黃豆甲酯(methyl soyate)於一

含水懸浮濃縮物組合物中作為一水不互溶液態化合物，可增加對吸血昆蟲銀葉粉蝨(*Bemisia argentifolii*)(銀葉粉蝨)的控制及增進耐雨堅牢度(耐清洗堅牢度)。

該水不互溶液態化合物例如礦物油和植物油亦可用於高濃度藉由窒息某些昆蟲害蟲以殺死他們。針對此目的，該等油一般以及在市場上稱為休眠油(dormant oils)，園藝用油(horticultural oils)和噴霧油(spray oils)。然而，如同發表於*Weekend Gardener Monthly Web Magazine*, June 2009 (2009年6月30日起可在<http://www.weekendgardener.net/garden-pests/dormantoil-010901.htm>)之文章「什麼是園藝用油和休眠油(What is Horticultural Oil and Dormant Oil)?」，該等油之主要限制係為其在某些情況下引起植物傷害(藥害)之潛在性。某些植物物種對於由特別敏感。為了最小化藥害風險，油最好在芽開始膨脹前噴灑，且一般不建議將油噴灑在盛開樹木上。商業生產者也可能不情願於噴灑油至生產植物上，例如，水果，其市場價值取決於完全沒有受傷。

於PCT發表之WO 2008/069990中所包括之水不互溶液態化合物，雖然其用量已遠低於單純害蟲防治使用劑量，該水不互溶液態化合物造成藥害之潛在性在一些情況下可能引發關注。因此一不依賴水不互溶化合物且促進該活性成分滲透之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺之含水懸浮濃縮物組合物是有其需要的。如今已發現此一組合物。



【發明內容】

本發明係針對一殺蟲懸浮濃縮物 (suspension concentrate)組合物，包含根據本組合物總重量按重量計算之：

(a) 自約0.3%至約30%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺；

(b) 自約5%至約70%之一於20°C下具有至少約5重量%之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物成分，親水性-親油性均衡值自約5至約18且平均分子量自約900道耳頓至約20000道耳頓(daltons)；且

(c) 自約20%至約95%之水。

本發明亦關於一控制一昆蟲害蟲之方法，包含以水稀釋該懸浮濃縮物組合物以形成稀釋組合物，並使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。

【實施方式】

如本文中所使用，術語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」、「特徵為」或該術語任何其他的變化，旨在涵蓋非排他性的包含，並受到任何明確表示的限制。例如，包括元素列表的組合物、混合物、製程或方法不必僅限於那些元素，而是可以包括未明確列出的或該組合物、混合物、製程或方法所固有的其他元素。

連接詞「由...組成」則排除任何未明確說明的元素、步驟或成分。如果是在申請專利範圍中，「由...組成」的用

字將會封閉申請專利範圍，使其除了在通常會與其相關的雜質之外，不包括那些在列舉以外的物質。當該連接詞「由...組成」出現在申請專利範圍主體的子句，而非緊接著序言，其只限制在該子句中提到的元素；其他元素總體上不會從申請專利範圍中被排除。

連接詞「主要由...組成」用於定義包括除了那些字面上所揭露以外的材料、步驟、特徵、成份或元素的組合物或方法，但前提是該等額外的材料、步驟、特徵、成份或元素並不會實質影響申請專利範圍所主張發明的基本和新穎特性。所謂「主要由...組成」居於「包含」與「由...組成」之間的中間地帶。

當申請人用開放式術語，像是「包含」，定義發明或其中一部分時，應易於理解(除非另有說明)該敘述應解釋為也使用術語「主要由...組成」或「由...組成」來說明該發明。

此外，除非另有明確相反陳述，否則「或」係指包含性的「或」，而不是指排他性的「或」。例如：以下任一者皆為滿足條件A或B的情況：A是真(或存在的)且B是偽(或不存在的)，A是偽(或不存在的)且B是真(或存在的)，以及A和B都是真(或存在的)。

同樣地，位於本發明之元素或成份之前的不定冠詞「一」及「一個」旨在非限制性地說明該元素或成份的實例數目(意即出現數)。因此「一」或「一個」應理解為包括一個或至少一個，且該元素或成份的單數詞形也包括複

數，除非該數目顯然是指單數。

在此揭露之內容及申請專利範圍內，保護樹葉免於植食性害蟲係指保護樹葉免於該害蟲造成之潛在的傷害或損壞。該保護係經由控制害蟲來達成。所謂「樹葉」係指一植物露出地面的部分。因此樹葉包括葉、莖、枝、花、果實和花蕾。控制害蟲係包括殺死害蟲、干擾其生長、發展或複製、及/或抑制其攝食。在此揭露之內容及申請專利範圍內，所謂「殺蟲劑」及「殺蟲的」係關於任何形式之害蟲控制。

所謂「懸浮濃縮物組合物」及衍生詞如「一殺蟲懸浮濃縮物組合物」係指包含有效成分之固體顆粒細末分散在連續液相之組合物。固體顆粒可保留識別且可藉由物理方式自連續液相分離出來。該連續液相之黏度可以從低到高，且確實可以高到使懸浮濃縮物組合物具有一凝膠樣或漿糊狀的一致性。

所謂「粒徑」係指一顆粒之等效球形直徑，意即內附同體積粒子之球體直徑。「粒徑中值」係指一半大於該粒徑中值及一半小於該粒徑中值之顆粒的對應粒徑。參考粒徑分佈，顆粒百分比亦位於一基礎量上(例如，「至少95%顆粒小於約10微米」係指至少95%總體積的顆粒係由具有小於約10微米之等效球形直徑組成)。粒徑分析原則係為熟習該領域之技藝人士所習知；一提供一總結之技術文件，見A. Rawle，「粒徑分析之基本理論(Basic Principles of Particle Size Analysis)」(Malvern設備公司第MRK034號文

件，Malvern，Worcesterhire，英國)。粉末中之顆粒體積分佈可藉由該等技術Low Angle Laser Light Scattering(亦稱為LALLS及Laser Diffraction)方便地衡量，其依賴於衍射角與粒徑成反比之事實。適合使用LALLS分析粉末中顆粒體積分佈之市售儀器包括Mastersizer 2000(Malvern Instruments)。

在此揭露文件與申請專利範圍中，「EO/PO」係為「環氧乙烷-環氧丙烷」之縮寫。在百分比範圍中，倘若該百分比符號「%」僅在第二個劃定範圍之數字後顯示，其指的是前後劃定範圍之數字二者。例如，「自約0.3至約30%」係指「自約0.3%至約30%」。

本發明之實施例包括：

實施例1. 描述於發明內容中之組合物，其中成分(a)(即該3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺)係為該組合物之至少約1重量%。

實施例2. 實施例1之組合物，其中成分(a)係為該組合物之至少約2重量%。

實施例3. 實施例2之組合物，其中成分(a)係為該組合物之至少約5重量%。

實施例4. 描述於發明內容或任何實施例1至3中之組合物，其中成分(a)係為該組合物之不多於約20重量%。

實施例5. 實施例4之組合物，其中成分(a)係為該組合物之不多於約15重量%。

實施例6. 描述於發明內容中或實施例1至5之任一組合物，其中至少90%存在於該組合物中之成分(a)係固體顆粒。

實施例7. 實施例6之組合物，其中至少95%存在於該組合物中之成分(a)係固體顆粒。

實施例8. 實施例7之組合物，其中至少98%存在於該組合物中之成分(a)係固體顆粒。

實施例9. 實施例6至8之任一組合物，其中超過95重量%之顆粒具有小於約10微米之粒徑。

實施例10. 實施例6至9之任一組合物，其中該顆粒之平均粒徑不大於約4微米。

實施例11. 實施例10之組合物，其中該顆粒之平均粒徑不大於約3微米。

實施例12. 實施例11之組合物，其中該顆粒之平均粒徑不大於約2微米。

實施例13. 實施例6至12之任一組合物，其中該顆粒之平均粒徑至少約0.1微米。

實施例13a. 實施例13之組合物，其中該顆粒之平均粒徑至少約0.4微米。

實施例14. 描述於發明內容中或實施例1至13a之任一組合物，其中成分(b)(即該非離子性環氧乙烷-環氧丙烷(EO/PO)嵌段聚合物成分)於20℃下具有至少約10%水溶性。

實施例15. 描述於發明內容中或實施例1至14之任一組合

物，其中成分(b)具有至少約6之親水性-親油性均衡(HLB)值。

實施例16. 實施例15之組合物，其中成分(b)具有至少約7之HLB值。

實施例17. 實施例16之組合物，其中成分(b)具有至少約8之HLB值。

實施例18. 描述於發明內容中或實施例1至17之任一組合物，其中成分(b)具有不大於約17之HLB值。

實施例19. 實施例18之組合物，其中成分(b)具有不大於約16之HLB值。

實施例20. 實施例19之組合物，其中成分(b)具有不大於約15之HLB值。

實施例21. 描述於發明內容中或實施例1至20之任一組合物，其中成分(b) (即該非離子性EO/PO嵌段聚合物成分)具有至少約1000道耳頓之平均分子量。

實施例22. 實施例21之組合物，其中成分(b)具有至少約2000道耳頓之平均分子量。

實施例23. 描述於發明內容中或實施例1至22之任一組合物，其中成分(b)具有不大於約15000道耳頓之平均分子量。

實施例24. 實施例23之組合物，其中成分(b)具有不大於約10000道耳頓之平均分子量。

實施例24a. 實施例24之組合物，其中成分(b)具有不大於約8000道耳頓之平均分子量。



實施例 25. 實施例 24a 之組合物，其中成分 (b) 具有不大於約 7000 道耳頓之平均分子量。

實施例 26. 描述於發明內容中或實施例 1 至 25 之任一組合物，其中成分 (b) (即該非離子性 EO/PO 嵌段聚合物成分) 係為該組合物之至少約 10 重量%。

實施例 27. 實施例 26 之組合物，其中成分 (b) 係為該組合物之至少約 15 重量%。

實施例 28. 實施例 27 之組合物，其中成分 (b) 係為該組合物之至少約 20 重量%。

實施例 29. 描述於發明內容中或實施例 1 至 28 之任一組合物，其中成分 (b) 係為該組合物之不多於約 60 重量%。

實施例 30. 實施例 29 之組合物，其中成分 (b) 係為該組合物之不多於約 50 重量%。

實施例 31. 描述於發明內容中或實施例 1 至 30 之任一組合物，其中成分 (b) 及成分 (a) 之重量比例至少為成分 (b) 比成分 (a) 約 1 : 1。

實施例 32. 實施例 31 之組合物，其中成分 (b) 比成分 (a) 之重量比例至少為約 2 : 1。

實施例 33. 實施例 32 之組合物，其中成分 (b) 比成分 (a) 之重量比例至少為約 4 : 1。

實施例 34. 實施例 33 之組合物，其中成分 (b) 比成分 (a) 之重量比例至少為約 8 : 1。

實施例 35. 描述於發明內容中或實施例 1 至 34 之任一組合物，其中成分 (b) 及成分 (a) 之重量比例不大於成分 (b)

比成分(a)約20:1。

實施例36. 實施例35之組合物，成分(b)及成分(a)之重量比例不大於約15:1。

實施例37. 描述於發明內容中或實施例1至36之任一組合物，其中成分(b)包含一或多個選自由泊洛沙姆(poloxamers)、反向泊洛沙姆、泊洛沙胺(poloxamines)及反向泊洛沙胺組成之群組之非離子性EO/PO嵌段聚合物。

實施例38. 實施例37之組合物，其中成分(b)包含一或多個選自由泊洛沙姆及泊洛沙胺組成之群組之非離子性EO/PO嵌段聚合物。

實施例39. 實施例37之組合物，其中成分(b)包含一或多個選自由泊洛沙姆及反向泊洛沙姆組成之群組之非離子性EO/PO嵌段聚合物。

實施例40. 實施例38或39之組合物，其中成分(b)包含一或多個選自泊洛沙姆之非離子性EO/PO嵌段聚合物。

實施例41. 實施例40之組合物，其中成分(b)主要由一或多個泊洛沙姆組成。

實施例42. 實施例40或41之組合物，其中該泊洛沙姆具有一具有至少約900道耳頓平均分子量之聚氧丙烯鏈。

實施例43. 實施例42之組合物，其中該聚氧丙烯鏈具有至少約1200道耳頓平均分子量。

實施例44. 實施例40至43之任一組合物，其中該泊洛沙姆具有一平均分子量不大於約9000道耳頓之聚氧丙烯

鏈。

實施例 45. 實施例 44 之組合物，其中該聚氧丙烯鏈平均分子量不大於約 4000 道耳頓。

實施例 46. 實施例 45 之組合物，其中該聚氧丙烯鏈平均分子量不大於約 3000 道耳頓。

實施例 47. 實施例 46 之組合物，其中該聚氧丙烯鏈平均分子量不大於約 2000 道耳頓。

實施例 48. 實施例 40 至 47 之任一組合物，其中泊洛沙姆具有至少約 10 重量%之聚氧乙烯含量。

實施例 49. 實施例 48 之組合物，其中該泊洛沙姆具有至少約 20 重量%之聚氧乙烯含量。

實施例 50. 實施例 37 至 49 之任一組合物，其中泊洛沙姆、反向泊洛沙姆、泊洛沙胺及反向泊洛沙胺之聚氧乙烯含量不大於約 50 重量%。

實施例 51. 描述於發明內容中或實施例 1 至 50 之任一組合物，其中成分(c)(即水)係為該組合物之至少約 25 重量%。

實施例 52. 實施例 51 之組合物，其中成分(c)係為該組合物之至少約 30 重量%。

實施例 53. 實施例 52 之組合物，其中成分(c)係為該組合物之至少約 35 重量%。

實施例 54. 實施例 53 之組合物，其中成分(c)係為該組合物之至少約 40 重量%。

實施例 55. 描述於發明內容中或實施例 1 至 54 之任一組合

物，其中成分(c)不多於55重量%。

實施例 56. 實施例 55 之組合物，其中成分(c)不多於50重量%。

實施例 57. 描述於發明內容中或實施例 1 至 56 之任一組合物進一步包含(d)高至約10重量%之一額外的界面活性劑成分。

實施例 58. 實施例 57 之組合物，其中成分(d)(即額外的界面活性劑成分)係為該組合物之至少約0.01重量%。

實施例 58a. 實施例 58 之組合物，其中成分(d)係為該組合物之至少約0.1重量%。

實施例 59. 實施例 58a 之組合物，其中成分(d)係為該組合物之至少約1重量%。

實施例 60. 實施例 59 之組合物，其中成分(d)係為該組合物之至少約2重量%。

實施例 61. 實施例 57 至 60 之任一組合物，其中成分(d)不多於該組合物之8重量%。

實施例 62. 實施例 61 之組合物，其中成分(d)不多於該組合物之6重量%。

實施例 63. 實施例 62 之組合物，其中成分(d)不多於該組合物之4重量%。

實施例 64. 描述於發明內容中或實施例 1 至 63 之任一組合物進一步包含(e)高至約25重量%之一或多個除了3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺(氰蟲醯胺)之生物活性成



分。

實施例 65. 實施例 64 之組合物，其中成分(e)(即除了氰蟲醯胺之生物活性成分)係為該組合物之至少約 0.1 重量 %。

實施例 66. 實施例 65 之組合物，其中成分(e)係為該組合物之至少約 1 重量 %。

實施例 67. 實施例 64 至 66 之任一組合物，其中成分成分(e)不多於該組合物之 20 重量 %。

實施例 68. 實施例 67 之組合物，其中成分(e)不多於該組合物之 15 重量 %。

實施例 69. 實施例 68 之組合物，其中成分(e)不多於該組合物之 10 重量 %。

實施例 70. 實施例 64 至 69 之任一組合物，其中成分(e)係選自除了生物有機體(即不包括例如、病毒、細菌和真菌)之生物活性劑。

實施例 71. 實施例 64 至 70 之任一組合物，其中(e)包含至少一殺蟲劑或殺蟎劑。

實施例 72. 實施例 64 至 71 之任一組合物，其中(e)包含至少一殺真菌劑或殺菌劑。

實施例 73. 描述於發明內容中或實施例 1 至 63 之任一組合物不包含一除了氰蟲醯胺之生物活性劑。

實施例 74. 描述於發明內容中或實施例 1 至 73 之任一組合物包含(f)高至約 15 重量 % 之一或多個額外的配方成分。

實施例 75. 實施例 74 之組合物，其中成分 (f) (即額外的配方成分) 係為該組合物之至少約 0.01 重量 %。

實施例 75a. 實施例 75 之組合物，其中成分 (f) 係為該組合物之至少約 0.1 重量 %。

實施例 76. 實施例 74、75 及 75a 之任一組合物，其中成分 (f) 包含至少一選自防凍劑、防腐劑、增稠劑及肥料之配方成分。

實施例 77. 實施例 76 之組合物，其中成分 (f) 包含至少一選自防凍劑之配方成分。

實施例 78. 實施例 77 之組合物，其中該防凍劑係選自由具有自約 200 道耳頓至約 1000 道耳頓之分子量之乙二醇、二伸乙甘醇、丙二醇、二丙烯甘醇、丁三醇、1,3-丙二醇、1,2-丙二醇及聚乙二醇組成之群組。

實施例 79. 實施例 78 之組合物，其中該防凍劑係選自乙二醇及丙二醇。

實施例 80. 實施例 76 至 79 之任一組合物，其中該防凍劑與水 (即成分 (c)) 之重量比例在範圍約 1 : 5 至約 1 : 20 間。

實施例 81. 實施例 76 至 79 之任一組合物，其中 (f) 包含一或多種其量為該組合物之自約 0.01 至約 1 重量 % 之防腐劑。

實施例 82. 實施例 76 至 80 之任一組合物，其中 (f) 包含一或多種其量為該組合物之自約 0.01 至約 1 重量 % 之增稠劑。

實施例 83. 描述於發明內容中或實施例 1 至 82 之任一組合物，其中該組合物包含不多於該組合物 5 重量 % 之水不互溶液態化合物。

實施例 84. 實施例 83 之組合物，其中該組合物包含不多於該組合物 2 重量 % 之水不互溶液態化合物。

實施例 85. 實施例 84 之組合物，其中該組合物包含不多於該組合物 1 重量 % 之水不互溶液態化合物。

實施例 86. 實施例 85 之組合物，其中該組合物包含不多於該組合物 0.1 重量 % 之水不互溶液態化合物。

實施例 87. 描述於發明內容中或實施例 1 至 86 之任一組合物，其中成分 (b) 完全溶解於成分 (c)。

實施例 88. 描述於發明內容中或實施例 1 至 87 之任一組合物，其中該組合物含有一單一液相。

實施例 89. 實施例 88 之組合物，其中該單一液相係由成分 (b) 及 (c) 所形成。

實施例 90. 實施例 88 或 89 之組合物，其中該單一液相包含成分 (b) 及 (c)。

實施例 91. 實施例 88 至 90 之任一組合物，其中成分 (a) 之顆粒係散布於該單一液相中。

實施例 92. 一控制一昆蟲害蟲之方法，包含以水稀釋描述於發明內容中或實施例 1 至 91 之任一組合物以形成稀釋組合物，並使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。

實施例 93. 實施例 92 之方法，其中昆蟲害蟲環境中之植物

葉子係與有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。

實施例94. 一保護植物樹葉免於植食性害蟲之方法，該方法包括使該樹葉與一有效殺蟲量之實施例92之稀釋組合物接觸。

實施例95. 實施例92至94之任一方法，其中該昆蟲害蟲係選自粉蝨科、蚜蟲科、稻蝨科及浮塵子科之分類科中。

實施例96. 實施例92至95之任一方法，其中該昆蟲害蟲係為一刺吸式害蟲，(即藉由自植物葉子穿孔和吸取來進行餵養)。

本發明之實施例可以任何方式進行組合。該組合之實例係為描述於發明內容中包含按重量計算之(a)自約5%至約15%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺；(b)自約20%至約60%之於20°C下具有至少約5重量%水溶性、自約5至約17之HLB值及一自約2000道耳頓至約10000道耳頓之平均分子量非離子性EO/PO嵌段聚合物成分；(c)自約30%至約50%之水；視情況之(d)自約0.1%至約6%之額外的界面活性劑成分；視情況之(e)自約0.1%至約15%之一或多個除了3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺之生物活性劑；及視情況之(f)自約0.1%至約10%之一或多個額外的配方成份。

特別值得注意的是一殺蟲懸浮濃縮物組合物，其主要由根據本組合物總重量按重量計算之：



(a) 自約0.3%至約30%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡啶-5-甲醯胺；

(b) 自約5%至約70%之一於20°C下具有至少約5重量%之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物成分，親水性-親油性均衡值自約5至約18且平均分子量自約900道耳頓至約20000道耳頓；

(c) 自約20%至約95%之水；

(d) 自0%至約10重量%之一額外的界面活性劑成分；

(e) 自0%至約25%之一或多個除了3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡啶-5-甲醯胺之生物活性劑；且

(f) 自0%至約10%之一或多個額外的配方成分組成。

上述之實施例、其他於此描述之實施例及其組合亦關於以「主要由...組成」來描述所述成分之殺蟲懸浮濃縮物組合物。一更佳詳細描述使用上述實施例組合之本組合物實施例係為一主要由自約5%至約15重量%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡啶-5-甲醯胺(如成分(a))組成之殺蟲懸浮濃縮物組合物；自約20%至約60%之於20°C下具有至少約5重量%水溶性、自約5至約17之HLB值及一自約2000道耳頓至約10000道耳頓之平均分子量非離子性EO/PO嵌段聚合物成分；(如成分(b))；自約30%至約50%之水(如成分(c))；及自約0.1%至約6重量%之一額外的界面活性劑成分(如成分(d))；及自0%

至約10%之一或多個額外的配方成分(如成分(f))。

如同本發明摘要之描述於，本發明係關於一殺蟲懸浮濃縮物組合物，包含按重量計算之

(a) 自約0.3%至約30%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺；

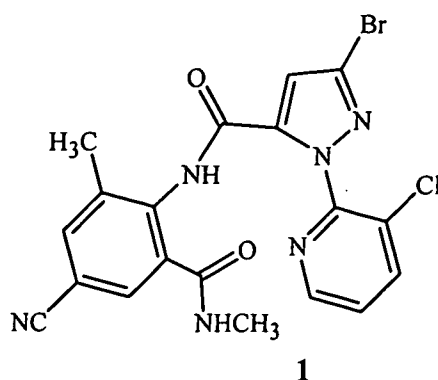
(b) 自約5%至約70%之一於20°C下具有至少約5重量%之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物成分，親水性-親油性均衡值自約5至約18且平均分子量自約900道耳頓至約20000道耳頓；且

(c) 自約20%至約95%之水。

成分(c)形成一提供一作為載體之連續液相，使本化合物中之其他成分(例如成分(a)及(b))溶解或分散於其中之含水介質。如同將進一步闡述之，該活性成分成分(a)在此組成中主要是懸浮的固體顆粒，本組成據此可視為一種含水懸浮濃縮物配方。

此組合物含有如成分(a)之化學化合物3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺，其係本組合物中之基本殺蟲活性成分。本組合物可選擇性的包含額外的生物活性成分。3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺也由於其暫時批准通用名稱稱為氰蟲醯胺(cyantraniliprole)及其商標名CyazypyrTM。氰蟲醯胺之分子結構顯示為式1。





製備式1化合物之方法係揭露於美國專利7247647及PCT發布 WO 2006/062978 及 WO 2008/069990。如同 WO 2006/062978 實施例15所揭露，3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺係固體形式融化於177-181或217-219°C，即兩種不同的晶型。兩種晶型皆適合目前之組合物。

最普遍的情況，成分(a)係為自約0.3%至約30%之本組成之重量。通常情況下成分(a)係為該組合物之至少約1重量%，更常見至少約2重量%，最常見至少5重量%。成分(a)通常不多於該組合物之約20重量%，更常見不多於約15重量%。由於3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺僅溶於水，成分(a)於此組成中主要以固體懸浮顆粒存在而不溶解於含水液相。通常約90%，更常見至少約95%，及最常見至少98%之成分(a)以固體存在經溶解。

於懸浮濃縮物配方中，活性成分係以小、細顆粒分佈形式存在以促進其懸浮。除了促進懸浮力，減少顆粒大小促進均勻覆蓋及增進該活性成分的生物可用性。於此組合物中，通常多於95重量%之成分(a)之顆粒經研磨至低於10微

米的顆粒大小，且該平均粒徑係介於約4微米及0.4微米之範圍內。該平均粒徑較佳係小於約3微米及更佳係小於約2微米。一其中成分(a)之平均粒徑約1微米之組合物可由描述於下列所揭露之研磨技術製備。

此組合物含有如成分(b)之一於20°C下具有至少約5%水溶性，範圍自約5至約18之親水性-親油性均衡(HLB)值及一自約900道耳頓至約20000道耳頓之平均分子量之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷(EO/PO)嵌段聚合物成分。該非離子性EO/PO嵌段聚合物成分主要由一或多個非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物組成。列入此組合物之具有上述之水溶性、HLB值及平均分子量之非離子性EO/PO嵌段聚合物經發現顯著促進成分(a)活性成分之葉面吸收以控制刺吸型害蟲同時最大限度地降低藥害風險。

非離子性環氧乙烷-環氧丙烷(EO/PO)嵌段聚合物係為包含一或多個主要由氧乙烯單元($-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$)單元之鏈及一或多個主要由氧丙烯單元($-\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$)單元之鏈組成之聚合物。更特別是在此揭露之內容及申請專利範圍中，該非離子性EO/PO嵌段聚合物分子被認為主要由聚氧乙烯及聚氧丙烯鏈組成，除了可被連結至及/或被其他非離子性分子單元終止之鏈，每鏈含有不多於4個之原子，氫原子不計算。當成分(b)之EO/PO嵌段聚合物為非離子性，其不包括一陰離子偶族或一通過解離作用可形成陰離子性之陰離子偶族(例如，羧酸、磺酸、硫酸、膦酸或磷酸官能基，或一該等酸性官能團之鹽類)。同時，成分(b)之非離



子性EO/PO嵌段聚合物不包括陽離子偶族(例如，四級銨鹽)，但該非離子性EO/PO嵌段聚合物可含有一級、二級或三級銨的功能，限制於除了不含有超過4個之原子，氫原子不計算之聚氧乙烯或聚氧丙烯單元之分子單元。然而，銨的功能對於成分(b)之非離子性EO/PO嵌段聚合物並非必要。因此，需注意成分(b)包含至少一不包括銨的功能之非離子性EO/PO嵌段聚合物。亦需注意，成分(b)不包括含有銨的功能之非離子性EO/PO嵌段聚合物。

聚氧丙烯鏈係為親油性的而聚氧乙烯鏈係為親水性的。聚氧乙烯鏈與聚氧丙烯鏈之組合造成一提供界面活性劑性能之兩性分子結構。在該等分子中之一或多個聚氧乙烯鏈可稱之為親水劑，在該等分子中之一或多個聚氧丙烯鏈可稱之為親油劑。可選擇聚氧乙烯及聚氧丙烯單元之數目以達到本成分所求之物理性質(例如水溶性、HLB、分子量)。

在本組合物中，成分(b)(即該非離子性EO/PO嵌段聚合物成分)必須於20°C時具有至少5重量%之水溶性。據此，成分(b)於20°C下溶於水的程度必須至至少約5%(重量)，也就是說，成分(b)之一飽和溶液或液晶相於水中20°C下含有至少約5重量%之成分(b)。(為簡單起見，在此揭露之內容中的水溶性於是定義為重量百分比，即使「按重量」沒有明文規定。)若成分(b)含有多種非離子性EO/PO嵌段聚合物成分，通常每個成分於20°C下具有至少約5%水溶性。大部分適合成分(b)之非離子性EO/PO嵌段聚合物具有顯著

較佳的水溶解度(例如，大於約10%)且其許多可與水混溶(例如，在所有比例下溶於水)。相較於可用來促進葉面吸收氫蟲鹽胺(即成分(a)之油類及其他不溶於水的液體，此成分(b)之水溶性被認為可降低藥害風險。在此揭露之內容及申請專利範圍內，「不溶於水的液體」及「水不互溶液態化合物」係指於20°C下具有少於約2重量%之水溶性的液體和液態化合物。

在本發明內容中，「水溶性」係指成分(b)能夠完全溶解在純水中(即只包括水和成分(b)之混合物)在以重量百分比表明下形成(1)一由獨立EO/PO嵌段聚合物分子(通常稱為unimers)分散在水相中組成之溶液，及/或由與分子之親水性成分聚集成團形成外部及與疏水性成分聚集成團形成內部(即微胞)之EO/PO嵌段聚合物分子隨機分散在水相中組成之溶液，及/或(2)一含有EO/PO嵌段聚合物分子聚集成團以使分子之親水性成分形成集群外部且疏水性成分形成集群內部之向液性液晶相，其中該集群在水存在下相對彼此之位置和/或方向係等向性次序或異向性次序。液晶相經常是粘質的或甚至似膠體的，但卻是清楚的。異向性液晶相一般係雙折射的，但等向性液晶相卻不然。某些EO/PO嵌段聚合物之液晶相係描述於P. Alexandridis et al., *Langmuir* 1996, 12, 2690-2700 及 P. Alexandridis, *Macromolecules* 1998, 31, 6935-6942。儘管於一含水介質中之微胞分散是水溶性的體現，缺乏微胞之外部次序及內部次序之分散劑和乳液液滴(例如油類及其他不溶於水的

液體)非為水溶性實例。不同於微胞之液滴態微乳液，除了具有疏水性成分之EO/PO嵌段聚合物分子其具有成分組成之內部，根據本發明定義，則非為溶液或水溶性實例。如需進一步參考EO/PO嵌段聚合物溶解度，可見於Drew Myers 中之 Section 4.1 「 Surfactant Solubility 」 , *Surfactant Science and Technology, Third Edition*, John Wiley, 2005。

在本懸浮濃縮物組合物中之非離子性EO/PO嵌段聚合物成分(即成分(b))聚集狀態取決於原料、濃度、溫度和離子強度等參數。本組合物包含相對於其體積有大的表面積之成分(a)之懸浮顆粒。非離子性EO/PO嵌段聚合物一般優先於溶液中其他物質吸附到這樣的界面(例如，單層、雙層或半微胞)，只有當該界面飽和時高濃度分子才會留在水相。因此成分(a)顆粒的存在，使得本組合物得以容納高於僅基於水溶性所得之預期的更多成分(b)，而不形成一分離之成分(b)相。倘若此懸浮濃縮物組合物含有之成分(b)超過其吸附到成分(a)粒子及其於含水載波相位中之溶解度兩者，一部分成分(b)會存在於離散相位，取決於成分(b)之物理性質(例如，熔點)呈現固體顆粒亦或是液滴。然而，由於成分(b)之水溶性於20°C下至少約5%，當懸浮濃縮物組成在使用前藉以水稀釋時過剩之成分(b)會溶解。

包含聚氧丙烯及聚氧丙烯鏈，提供非離子性EO/PO嵌段聚合物分子一定義良好的親水性和親油性區域之兩性組合，因此能夠作為一個表面活性劑。一界面活性劑之親水

性-親油性均衡值(HLB)係為親水性或親油性程度之一整體測量，並由界面活性劑分子中之極性與非極性基團比例決定之。一界面活性劑之HLB值(即數目)說明了在任意範圍為1至40之界活性劑分子之極性，其中該數字隨著與親水性增加而增加。一界面活性劑之HLB值可由Griffin之「乳劑比較法」(W. C. Griffin, *J. Cosmet. Chem.* **1949**, *1*, 311-326)決定。另外，HLB值可通過各種實驗技術於數字上估計或預測；參閱 X. Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* **2006**, *298*, 441-450；G. Ben-Et及D. Tatarsky, *Journal of the American Oil Chemists' Society* **1972**, *49*(8), 499-500；G. Trapani et al., *International Journal of Pharmaceutics* **1995**, *116*, 95-99；和其中提及的參考資料。所列出之界面活性劑及其各自的HLB值已廣泛公開於，例如在A. W. Adamson, *Physical Chemistry of Surfaces*, John Wiley and Sons, 1982。

本組合物之非離子性EO/PO嵌段聚合物成分(即成分(b)具有範圍約5至約18之HLB值。一HLB值高至約18之非離子性EO/PO嵌段聚合物成分現在經發現是促進葉面吸收成分(a)活性成份以控制刺吸型害蟲之關鍵。儘管具有小於約5之HLB值之非離子性EO/PO可促進葉面吸收的成分(a)活性成分，其水溶性通常是有限的且於20°C下少於約5%。具有至少約5之HLB值之非離子性EO/PO嵌段聚合物通常具有於20°C下至少5%溶解度，往往大於10%。另外，針對最佳害蟲防治效果，HLB值至少約6，較佳至少約7，最佳至



少約8。針對最佳害蟲防治效果，HLB值不多於約17，較佳不多於約16，最佳不多於約15。因此成分(b)之HLB值最佳為範圍約8至約15，提供對於刺吸型害蟲之顯著控制(例如，藉由促進葉面吸收成分(a)活性成份)。

非離子性EO/PO嵌段聚合物成分之理想的HLB值可藉由混合適當比例之或兩個或多個具有高於或低於所需的HLB值之非離子性EO/PO嵌段聚合物。一組合表面活性劑之HLB值，一般接近按照其重量百分比根據HLB對於表面活性劑的貢獻計算之值。一般來說，形成成分(b)之於非離子性EO/PO嵌段聚合物混合物中之每個非離子性EO/PO嵌段聚合物成分的HLB值介於自約5至約18的範圍中。較佳之每個非離子性EO/PO嵌段聚合物成分的HLB值為至少約6或7，更佳為至少約8。亦為較佳的情況下，每個非離子性EO/PO嵌段聚合物成分的HLB值不大於約17或16，且最佳不大於約15。

除了HLB值介於範圍自約5至約18，平均分子量介於900道耳頓至約20000道耳頓之非離子性EO/PO嵌段聚合物成分被認為對於促進葉面吸收成分(a)活性成份是重要的。在此揭露之內容及申請專利範圍內，非離子性EO/PO嵌段聚合物成分之平均分子量係為平均數字，其對應(對於一個給定的重量)至非離子性EO/PO嵌段聚合物分子之每個分子重量相乘，最後除以非離子性EO/PO嵌段聚合物分子總數以計算總和。然而，其他平均分子量定義一般提供近似數量級之值。非離子性EO/PO嵌段聚合物之平均分子量 s 可由

已知方法測量，例如引用 Nelson and Cosgrove, *Langmuir* 2005, 21, 9176-9182 之透膠層析術。另外，非離子性 EO/PO 嵌段聚合物製造業者產物一般揭露平均分子量資訊，其可用來選擇適當的本組合物之成分(b)的非離子性 EO/PO 嵌段聚合物。

成分(b)之平均分子量一般至少約 900 道耳頓，因為其為一具有一至少約 5 的 HLB 值之非離子性 EO/PO 嵌段聚合物作為一界面活性劑之最小分子大小。成分(b)之較佳平均分子量係為至少約 1000 道耳頓，最佳至少約 2000 道耳頓。成分(b)之平均分子量一般不多於 20000 道耳頓，因為較高之平均分子量會減少促進葉面吸收成分(a)活性成份，即使 HLB 值是適合的。為獲得最佳效率，平均分子量一般不大於約 15000 道耳頓或甚至 10000 道耳頓。較佳平均分子量不大於約 8000 道耳頓，最佳不大於約 7000 道耳頓。

一般來說，形成該非離子性 EO/PO 嵌段聚合物成分(即成分(b)之分子並不具有相同分子量，該等分子之分子量反而形成一分布(例如，正常高斯)。一般製備非離子性 EO/PO 嵌段聚合物之化學合成步驟提供單峰分布之分子量。然而，本組合物之成分(b)可包括從不同數量的環氧乙烷和環氧丙烷由不同批過程製備之非離子性 EO/PO 嵌段聚合物。因此成分(b)之分子量分佈可為雙峰或甚至多峰。一平均分子量約 20000 道耳頓之 EO/PO 嵌段聚合物能容納一些分子量相當高之分子。一般至少約 90%，較佳至少約 95% 且最佳至少約 98% 之形成成分(b)之非離子性 EO/PO 嵌段聚合物

分子具有不超過約40000道耳頓之分子量。

最常見的情況，成分(b)為該組成之自約5%至約70重量%。一般來說，成分(b)為該組成之至少約10重量%，較佳至少約15重量%，最佳至少約20重量%。成分(b)一般不超過該組成之約60重量%且較佳不超過約50重量%。

一般來說，增加成分(b)和成分(a)之重量比增加葉滲透且因此增加成分(a)控制刺吸型害蟲取食樹葉之效率。然而，增加成分(b)可減少本殺蟲懸浮濃縮物組合物所包括之成分(a)的量。一般來說，成分(b)和成分(a)之重量比至少約1:1，較佳至少約2:1，最佳至少約4:1或甚至約8:1。一般來說，成分(b)和成分(a)之重量比不大於約20:1，且較佳不大於約15:1。

非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物包括泊洛沙姆、反向泊洛沙姆、泊洛沙胺及反向泊洛沙胺。於泊洛沙姆及泊洛沙胺中，分子的中央部分包括一或多個聚氧丙烯鏈使其親油，且該中央部分連接至少兩個聚氧乙烯鏈以提供其親水性。於泊洛沙姆及泊洛沙胺中，該聚氧乙烯鏈係經一級羥基所終止。於反向泊洛沙姆及反向泊洛沙胺中，分子的中央部分包括一或多個聚氧乙烯鏈使其親水，且該中央部分連接至少兩個聚氧丙烯鏈以提供其親油性。於反向泊洛沙姆及反向泊洛沙胺中，該聚氧丙烯鏈係經二級羥基所終止。

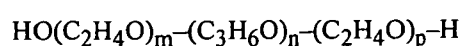
針對使用於成分(b)中之泊洛沙姆及泊洛沙胺，周邊親水劑(意即聚氧乙烯鏈之組合)之總分子量一般介於範圍約

10%至約50%分子重量。然而，只是在最低平均總分子量(意即接近1,000道耳頓)為親水劑之10重量%時足以確保於20℃下有至少約5%水溶性。因此，較佳之親水劑總分子量為至少約20%之分子重量。較佳之親水劑總分子量較佳亦為不多於40%之分子重量。

針對使用於成分(b)中之反向泊洛沙姆及反向泊洛沙胺，中央親水劑(意即聚氧乙烯鏈之組合)之總分子量一般介於範圍約20%至約80%分子重量。然而，只是在中高平均總分子量(意即接近2300道耳頓)為親水劑之30重量%時足以確保於20℃下有至少約5%水溶性。另外，當親水劑之平均分子量低(意即低於約1500道耳頓)，中央親水劑之總分子量一般不大於約60%分子重量且其HLB值不超過18。

特別值得注意的是泊洛沙姆(poloxamers)，因為泊洛沙姆具有介於範圍自約5至約18之HLB值，特別介於範圍自約8至約15，已經發現於本組合物中促進葉面吸收成分(a)活性成份以控制刺吸型害蟲非常有效。

所謂「泊洛沙姆」係指一由一連接至聚氧乙烯鏈之每端提供親水性之作為親油劑的聚氧丙烯鏈環組成之非離子性三嵌段聚合物。泊洛沙姆對應於如圖所示之式2。



2

其中m、n及p為與聚合物一致之數值變量。根據來自環氧乙烷或環氧丙烷之次單元分子量，可易於計算出所需的總

分子量及親水性百分比之m、n及p的合適值。

在其純的形態中，泊洛沙姆之物理一致性20℃下範圍於從液體到糊狀物到固體(通常稱為片)。具有至少約20(或22，當其分子量小於約3000道耳頓時)HLB值之泊洛沙姆於20℃下一般為固體，當泊洛沙姆具有較低HLB值時同時根據HLB值和分子量(較低HLB與較低分子量有利於液體與糊狀物)一般為液體或糊狀物。當本組合物之成分(b)經指定為具有不超過約18之HLB值，形成成分(b)之泊洛沙姆在其純的形態中一般為液體或糊狀物。

美國專利2,674,619描述依序加入環氧丙烷和環氧乙烷而後丙二醇製備泊洛沙姆。由於泊洛沙姆為該連續系列反應之產物，每個泊洛沙姆分子之分子量係為平均分子量之統計分佈。Nelson and Cosgove, *Langmuir* 2005, 21, 9176-9182報導一些商業泊洛沙姆產品係為雙峰且可能含有兩嵌段PEO-PPO(意即聚氧乙烯-聚氧丙烯)作為一種雜質。

泊洛沙姆可從商業供應商取得，如BASF，其以商標名「PLURONIC」將其命名，以及Croda，其以商標名「SYNPERONIC」將其命名。

如同Wikipedia所描述的「泊洛沙姆」文章(如July 8, 2009, <http://en.wikipedia.org/wiki/Poloxamer>)，根據商標名PLURONIC，產品編碼開頭字母描述其於室溫下之物理性質(「L」係指液體、「P」係指糊狀、「F」係指片狀(固體))，其後是二個或三個數字。第一個(左)數字(或在三位數中的兩個數字)在指定的數值乘以300表示聚氧丙烯鏈之

近似分子量，且最後一個數字乘以10提供聚氧乙烯內容之重量百分含量(例如，L64指一泊洛沙姆有一約1800道耳頓之聚氧丙烯分子質量及一40%聚氧乙烯含量)。曾經公佈一針對名詞「泊洛沙姆」之命名法對應體系統，由字母「P」(針對泊洛沙姆)，其次是三位數，前兩個數字乘以100所得提供聚氧丙烯核心之近似分子量，而最後一個數字乘以10給出聚氧乙烯含量百分比(例如，P184指一泊洛沙姆有一約1800道耳頓之聚氧丙烯分子質量及一40%聚氧乙烯含量，因此與PLURONIC L64相同)。正常分子量及聚氧乙烯與聚氧丙烯比例在製造批次和供應商之間可能有所不同。

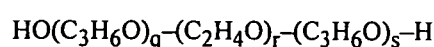
有用於本組合物成分(b)之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物的泊洛沙姆一般具有一平均分子量至少約800道耳頓之聚氧丙烯鏈環，其對應於式2之下標變量「n」之平均值至少約14。較佳聚氧丙烯鏈環之平均分子量至少約900道耳頓，其對應於式2之下標變量「n」之平均值至少約15。最佳聚氧丙烯鏈環之平均分子量至少約1200道耳頓。一般聚氧丙烯鏈環之平均分子量不超過約9000道耳頓(意即於式2中之「n」不超過約150)。較低分子量之泊洛沙姆促進包括更大比值之成分(b)與成分(c)(意即水)，同時保持本組合物之一自由流動的液體一致性。因此聚氧丙烯鏈環之較佳平均分子量不大於約4000道耳頓、約3000道耳頓或甚至約2000道耳頓。

在泊洛沙姆分子中，兩個聚氧丙烯鏈環(意即

$(C_2H_4O)_{m+p}$ ，參考式2)組合提供了親水性。一般來說式2之下標變量「m」與「p」之總和介於範圍約2至約110，在此範圍內對應較高下標變量「n」之值具有較高的總和值，因此該聚氧丙烯鏈環內容不超過50重量%，以及在此範圍內對應較低下標變量「n」之值具有較低的總和值，因此該聚氧丙烯鏈環內容至少約10重量%，較佳至少約20重量%。較佳之下標變量「m」與「p」之總和至少約6，更佳至少約10。

泊洛沙姆的物理性質是眾所周知的。Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* 2006, 298, 441-450列舉 PLURONIC 泊洛沙姆之平均分子量及HLB值，亦揭露一般計算泊洛沙姆之HLB值的方法。適合本組合物之成分(b)的泊洛沙姆實例包括 PLURONIC L31、L42、L43、L44、L62、L63、L64、P65、L72、P75、P84、P85、L92、P103、P104、P105及P123。特別值得注意的是 PLURONIC L64、P103及P104。

所謂「反向泊洛沙姆」係指一由一連接至聚氧丙烯鏈之每端提供親油性之作為親水劑的聚氧乙烷鏈環組組成之非離子性三嵌段聚合物。反向泊洛沙姆對應於如圖所示之式3。



3

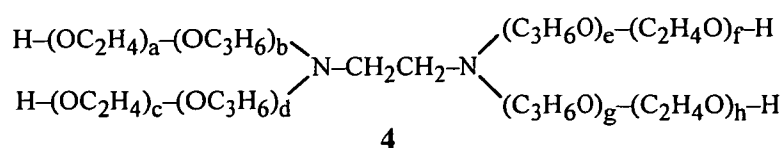
其中q、r及s為與聚合物一致之數值變量。根據來自環氧乙烷或環氧丙烷之次單元分子量，可易於計算出所需的總

分子量及親水性百分比之q、r及s的合適值。

Lundsted美國專利號2,674,619之製備泊洛沙姆的步驟可藉由以乙二醇而非丙二醇開始，並且轉換加入環氧乙烷和環氧丙烷的順序以適用於製備反向泊洛沙姆。反向泊洛沙姆從商業供應商取得，如BASF，其以商標名「PLURONIC」將其命名，以字母「R」插入左邊兩個數字之間說明(當乘以100)聚氧丙烯親油劑之分子量及在右邊數字之間說明(當乘以10)作為親水劑之聚氧乙烯之重量百分比含量。針對反向泊洛沙姆之PLURONIC產品代碼為省略左側「L」、「P」及「F」物理形式說明。

反向泊洛沙姆的物理性質是眾所周知的。Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* 2006, 298, 441-450列舉PLURONIC反向泊洛沙姆之平均分子量及HLB值，亦揭露一一般計算反向泊洛沙姆之HLB值的方法。適合本組合物之成分(b)的反向泊洛沙姆實例包括PLURONIC 10R5、12R3、17R2、17R4、17R8、22R4、25R4、25R5、25R8及31R4。

泊洛沙胺在結構上與泊洛沙姆相關，但如式4所示具有四鏈拴在1,2-乙二胺基。



其中a、b、c、d、e、f、g及h為與聚合物一致之數值變量。根據來自環氧乙烷或環氧丙烷之次單元分子量，可易於計算出所需的總分子量及親水性百分比之a、b、c、d、

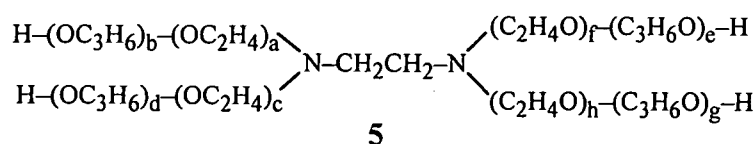


e、f、g及h的合適值。

泊洛沙姆係由依序加入環氧乙烷、環氧丙烷而後丙二醇製備而成，泊洛沙胺係由依序加入環氧乙烷、環氧丙烷然後乙二胺製備而成。泊洛沙胺從商業供應商BASF取得，其以商標名「TETRONIC」將其命名。TETRONIC右側的數字乘以10說明作為親水劑之聚氧乙烯的重量百分比含量。

泊洛沙胺的物理性質是眾所周知的。Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* 2006, 298, 441-450提供參數及一適用於計算泊洛沙胺之HLB值的方法。適合本組合物之成分(b)的泊洛沙胺實例包括TETRONIC 304及904。特別值得注意的是TETRONIC 304。美國專利申請公開號US 2003/0073583揭露TETRONIC 304具有1650道耳頓之平均分子量、40%之親水內容及16之HLB值。

反向泊洛沙胺在結構上與泊洛沙胺相關，但如式5所示具有聚氧丙烯和聚氧乙烯鏈對換拴在1,2-乙二胺基上。



其中a、b、c、d、e、f、g及h為與聚合物一致之數值變量。根據來自環氧乙烷或環氧丙烷之次單元分子量，可易於計算出所需的總分子量及親水性百分比之a、b、c、d、e、f、g及h的合適值。

泊洛沙胺係由依序加入環氧丙烷、環氧乙烷然後乙二胺製備而成，反向泊洛沙胺係由依序加入環氧乙烷、環氧丙

烷然後乙二胺製備而成。反向泊洛沙姆從商業供應商 BASF 取得，其以商標名「TETRONIC」將其命名，以字母「R」插入右邊數字之間說明(當乘以10)作為親水劑之聚氧乙烯之重量百分比含量。

反向泊洛沙胺的物理性質是眾所周知的。Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* 2006, 298, 441-450 供參數及一適用於計算反向泊洛沙胺之 HLB 值的方法。TETRONIC 90R4 係為一適合本組合物之成分(b)的泊洛沙胺實例。美國專利申請公開號 US 2003/0073583 揭露 TETRONIC 90R4 具有 7240 道耳頓之平均分子量、40% 之親水內容及 7 之 HLB 值。

在本懸浮濃縮物組合物中，成分(b)特別值得注意的是其促進葉面吸收及成分(a)活性成份的滲透以促進吸吮害蟲的控制。然而，形成成分(b)之非離子性 EO/PO 嵌段聚合物之潤濕和分散性能是眾所周知的，其一般包括在遠低於本組合物之指定濃度配方中，需要更大的量來促進葉面吸收成分(a)。因此，除了促進葉面吸收及滲透成分(a)，成分(b)在本懸浮濃縮物組合物及在使用(例如，噴灑)前由加入水所形成之稀釋的含水組合物中，亦作為分散劑使成分(a)避免凝聚以維持顆粒。

在本懸浮濃縮物組合物中，如成分(c)之水形成連續液相，其中之其他成份係為溶解或懸浮。一般來說，水量介於本組成之範圍約 20% 至約 95 重量%。特別當成分(b)含有一中高分子量(意即大於約 4000 道耳頓)之 EO/PO 嵌段聚合

物，水量一般至少約本成份之25重量%，較佳係至少約30重量%，最佳係至少約35重量%或甚至40重量%以降低粘度。儘管本發明之組合物於高濃度水中表現良好，為於懸浮濃縮物中容納大量的成分(a)及(b)，水量一般不多於該成份之約80重量%，較佳不多於約70%或60重量%，最佳不多於55%或甚至50重量%。

除了具有界面活性劑性能的非離子性EO/PO嵌段聚合物成分(b)，本組合物可視情況進一步包含高至10重量%之額外的界面活性劑成分(d)，其基本上係由一或多種除了非離子性EO/PO嵌段聚合物之界面活性劑組成。倘若存在，額外的界面活性劑成分(d)一般至少約該組成之0.01%或約0.1重量%，更佳至少約1重量%，最佳至少約2重量%。額外的界面活性劑成分(d)一般不多於約該組成之約8重量%，更佳不多於約6重量%，最佳不多於約4重量%。額外的界面活性劑成分(d)提供一個或更多有用的特性，例如促進潤濕、分散或乳化，或者於使用(例如，作為葉面噴灑)前藉由延長本組合物與水來減少本發明組成或稀釋之含水組合物的發泡。

如同本領域中人們普遍的理解，所謂「界面活性劑」之詞源來自「界面活化劑」，因為界面活性劑化合物調整(通常減少)界面自由能，例如，在水氣界面之水的表面張力或在水和不溶於水的液體之液體界面間的界面張力。界面活性劑通常是兩性有機化合物，也就是說其分子含有定義良好的疏水性(即親油性)和親水性成分。

界面活性劑根據其親水性成分的化學性質描述為非離子性、陰離子或陽離子界面活性劑。非離子性界面活性劑化合物之分子不含有離子性極性基團(即陰離子或陽離子)，儘管如此，分子中仍含有親水性和親油性部分。特別的是，倘若一界面活性劑含有一羧酸、磺酸、硫酸、膦酸或磷酸官能基，或一該等酸性官能團之鹽類，該界面活性劑一般被認為是一種陰離子表面活性劑，即使該分子亦含有一非離子性親水成分。儘管一級、二級及三級胺在與純水接觸後經質子化至一小範圍，含有胺功能但沒有陰離子基團分子之界面活性劑通常被視為非離子性界面活性劑而非陽離子性界面活性劑。在目前情況下，非離子性界面活性劑的定義於界面活性劑之分子結構中不排除胺的功能。然而，一含有一具有除了氫之原子四鍵結之氮原子及一正式正電荷的界面活性劑分子，例如四級銨鹽及其中一在環上連接至一除了氫之環外原子之 sp^2 -雜交氮原子(例如，*N*-取代吡啶或鎗(imidazolium))的雜芳環被認為是一種陽離子界面活性劑，即使在分子中含有一個非離子性親水性成分。

典型的界面活性劑描述於 *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, 以及 Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964。

另外如前所述，一非離子性界面活性劑含有不含有離子基團之界面活化分子，然而卻含有一定義良好的親水性成分以及一親油性成分。許多化學類的非離子性界面活性劑



具有至少一包含一或多個聚氧乙烯單位(-OCH₂CH₂-)以在其分子中提供親水性，因此該等非離子性界面活性劑稱為乙氧化之非離子性界面活性劑。本成分(b)之非離子性EO/PO嵌段聚合物係為一類乙氧化之非離子性界面活性劑，但許多其他類乙氧化之非離子性界面活性劑亦為合宜的且可用來形成成分(d)。其他類乙氧化之非離子性界面活性劑實例包括乙氧乙醇、乙氧烷基酚、乙氧山梨醇酐脂肪酸酯、乙氧山梨聚糖醇脂肪酸酯及乙氧脂肪酸酯。該等通常由環氧乙烷分別與乙醇、酚類、山梨醇酐、山梨聚糖醇或脂肪酸之羥基成分反應製備而成。乙氧山梨醇酐酯及乙氧山梨聚糖醇酯之分子中，一般至少存在一羥基，在經乙氧化後通常與一脂肪酸酯化。若每一界面活性劑分子上有超過一氧乙烯單元，「聚氧乙烯」可包括於所述界面活性劑之命名中，或者POE(聚氧乙烯)數量可包括於命名中以表示每分子的氧乙烯單元平均數量。

可使用其他化學類形成成分(d)之非離子性界面活性劑包括甘油酯與烷基聚葡，其中葡萄糖單位的數量稱為聚合度，範圍可以從1到3，且烷基單位的範圍可以從C₆至C₁₄(見K. Hill, *Pure and Applied Chemistry* 2000, 72, 1255-1264)。

成分(d)亦可包括陰離子界面活性劑。如前所述，一陰離子界面活性劑之兩性分子含有羧酸、磺酸、硫酸、膦酸或磷酸官能基，或一該等酸性官能團之鹽類。陰離子界面活性劑實例包括鈉烷基萘磺酸鹽、萘磺酸甲醛凝液、烷基

苯磺酸鹽、金屬磺酸鹽、烷硫酸鹽、烷基醚硫酸鹽、二烷基磺酸鈉、*N,N*-二甲基牛磺酸、多羧酸鹽、磷酸酯鹽、乙氧化三苯乙烯基苯酚磷酸鹽及脂肪酸鹼鹽。陰離子界面活性劑亦可於其分子結構中包括例如十二烷基醚硫酸鈉及 ATLOX 4912(一羥硬脂酸與聚氧乙烯鏈之嵌段聚合物)之聚氧乙烯鏈。

成分(d)亦可包括陽離子界面活性劑。如前所述，陽離子界面活性劑之兩性分子於一四級銨鹽(例如，苜三甲基四級銨鹽)或其他四級型功能(例如，*N*-取代吡啶基咪唑鹽)中含有一氮原子。

在一懸浮濃縮物組合物中，當在顆粒相之固體彼此相接近且其相互吸引克服了排斥力，可發生重組且該顆粒可藉由凝絮作用或黏聚作用黏在一起。分散劑(dispersing agent)，稱為分散劑(dispersant)可吸附在粒子表面以於顆粒之間創造靜電和/或空間位阻，從而減少粒子對粒子的相互作用並穩定懸浮液。

如前所述，成分(b)之非離子性EO/PO嵌段聚合物有分散性能。由於本組合物中包括大量成分(d)以促進葉面吸收和滲透成分(a)，成分(d)一般不需要包括一外的分散劑來預防成分(a)顆粒的黏聚作用。然而，成分(d)也可包括一或多個額外的分散劑。當一含有成分(a)之含水泥漿在加入成分(b)前經研磨以完成本懸浮濃縮物組合物，包含一分散劑之成分(d)特別有利。

使用於成分(d)之分散劑實例包括例如乙氧化三苯乙烯

基苯酚之磷酸酯(例如, SOPROPHOR 3D33)、烷芳磺酸及其鹽類例如, SUPRAGIL MNS90)、金屬磺酸鹽(例如, 鉍木質磺酸鹽或鈉木質磺酸鹽)、多酚磺酸鹽、聚丙烯酸、例如聚丙烯酸/甲基丙烯酸甲酯/聚氧乙烯接枝共聚合體之丙烯酸接枝共聚合體(例如, ATLOX 4913)及其他結合聚氧化烯基與例如 ATLOX 4912(一羥硬脂酸與聚氧乙烯鏈之嵌段聚合物)之酸功能的聚合體陰離子之界面活性劑。

成分(b)之非離子性EO/PO嵌段聚合物通常於成分(d)中排除包括一額外界面活性劑作為潤溼劑之需要, 但其亦可包括一或多個額外的潤溼劑。潤溼劑實例(其中一些與分散劑重疊)包括烷基硫酸鹽(例如, SIPON LC 98(十二烷基硫酸鈉))、烷醚硫酸鹽(例如, 十二烷基醚硫酸鈉)、例如鈉或鈣烷基苯磺酸鹽(例如, RHODACAL DS1)之烷芳基磺酸鹽(意即烷芳磺酸鹽類, 包括以多於一個烷基偶族置換之芳磺酸)及烷基萘磺酸鹽(例如, RHODACAL BX-78)、 α -烯烴磺酸鹽、二烷基磺酸鈉鹽及多羧酸鹽類。

成分(d)亦可包括一個或更多的反發泡劑。反發泡劑係為一可有效防止泡沫形成或一旦泡沫形成則減少或消除泡沫之界面活性劑。反發泡劑實例包括矽油、礦物油、例如聚二甲基矽氧烷、脂肪酸及其與例如鈣、鎂和鋁之多價陽離子之鹽類、炔二醇(例如, SURFYNOL 104)以及氟脂肪酸、全氟烷基膦酸及全氟烷基次磷酸及其鹽類。當成分(d)包含一或多個反發泡劑, 其量通常為該化合物之至少約0.01重量%且不多於3重量%。反發泡劑較佳不多於該化合

物約2重量%，最佳不多於約1重量%。

本發明之懸浮濃縮物組合物可視情況進一步包含高至約25重量%之一或多個除了3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(意即成分(a))之生物活性劑之成分(e)。成分(e)之生物活性成份不包括主要作用為保持目前組成而非保護與目前組成接觸之植物之殺蟲劑。倘若存在，成分(e)一般為本化合物之至少約0.1重量%且較佳為至少約1重量%。一般來說，成分(e)不超過化合物之20重量%，較佳不超過15重量%，最佳不超過10重量%。形成成分(e)之生物活性成份不同於成分(a)氰蟲醯胺殺蟲劑且可包括選自下列種類之化學物質或生物有機體：殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、如昆蟲蛻皮抑制劑及生根興奮劑(rooting stimulants)的生長調節素、化學滅菌劑、化學傳訊素(semiochemicals)、驅蟲劑(repellents)、引誘劑、費洛蒙、激食因子(feeding stimulants)(包括化學和生物製劑及選自上述類別之幾種化合物或有機體的混合物)。

包含不同生物活性劑之化合物較包含單一藥劑獨自具有更廣泛的活性。另外，該混合物可表現出增效效應。在本發明中，成分(e)存在於一個或兩個相位，意即溶解於水相(意即形成自成分(c)之相位，或一懸浮或分散在水相中之固體顆粒相或不連續液相。水溶性生物活性劑通常主要存在(溶解)於水相，然而低水溶性之生物活性劑通常會以一不同於含有成分(a)之固體顆粒相之固體顆粒相或在連續水



相中乳化液滴分散。值得注意的是本發明之組合物，其中成分(e)係以固體顆粒溶解或懸浮於連續液相中。

成分(e)(意即除了氰蟲醯胺外之一或多個生物活性劑)實例為：殺蟲劑如：例如阿巴汀(abamectin)、毆殺松(acephate)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、amidoflumer(S-1955)、阿佛菌素(avermectin)、印楝素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、bifenazate、布芬淨(buprofezin)、加保扶(carbofuran)、培丹(cartap)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、chlorfluazuron、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、可尼丁(clothianidin)、賽芬蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、拉姆達賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬諾克(diafenthiuron)、大利松(diazinon)、狄氏劑(dieldrin)、二福隆(di-flubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、殺力松(diofenolan)、因滅汀(emamectin)(包括 emamectin benzoate)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟尼胺(flonicamid)、氟蟲醯胺(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、氟胺氟菊

酯 (tau-fluvalinate)、嘧蟲胺 (flufenimer)(UR-50701)、氟芬隆 (flufenoxuron)、大福松 (fonophos)、合芬隆 (halofenozide)、六伏隆 (hexaflumuron)、愛美松 (hydramethylnon)、益達胺 (imidacloprid)、因得克 (indoxacarb)、亞芬松 (isofenphos)、祿芬隆 (lufenuron)、馬拉松 (malathion)、美氟綜 (metaflumizone)、松樹克螺 (metaldehyde)、達馬松 (methamidophos)、滅大松 (methidathion)、納乃得 (methomyl)、美賜平 (methoprene)、甲氧氯 (methoxychlor)、美特寧 (metofluthrin)、倍脈心 (milbemycin oxime)、亞素靈 (monocrotophos)、滅芬諾 (methoxyfenozide)、尼古丁 (nicotine)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、尼殺賽 (nithiazine)、諾伐隆 (novaluron)、諾伏隆 (noviflumuron)(XDE-007)、毆殺滅 (oxamyl)、巴拉松 (parathion)、甲基巴拉松 (parathion-methyl)、百滅寧 (permethrin)、福瑞松 (phorate)、裕必松 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福賜米松 (phosphamidon)、比加普 (pirimicarb)、佈飛松 (profenofos)、佈福靈 (profluthrin)、派滅淨 (pymetrozine)、派諾福羅 (pyrafluprole)、除蟲菊精 (pyrethrin)、啖蟲丙醚 (pyridalyl)、新喹啉 (pyrifluquinazon)、吡啶氟蟲腈 (pyriprole)、百利普芬 (pyriproxyfen)、魚藤精 (rotenone)、魚尼丁 (ryanodine)、賜托拉 (spinetoram)、賜諾殺 (spinosad)、賜派芬 (spirodiclofen)、螺甲蟎酯 (spiromesifen)(BSN 2060)、螺蟲乙酯 (spirotetramat)、甲丙硫磷 (sulprofos)、得芬諾 (tebufenozide)、伏蟲隆 (teflubenzuron)、七氟菊酯 (tefluthrin)、托福松 (terbufos)、

殺蟲威(tetrachlorvinphos)、噻蟲啉(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、thiosultap-sodium、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)及三福隆(triflumuron)；以及生物藥劑，包括蟲生細菌(entomopathogenic bacteria)，例如蘇力菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、蘇力菌庫斯塔基亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)及囊封的蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素(例如，Cellcap、MPV、MPVII)；蟲生真菌(entomopathogenic fungi)，例如青葙；以及蟲生病毒(entomopathogenic viruses)，包含桿狀病毒、核多角體病毒(nucleopolyhedro virus(NPV))，如：棉鈴蟲核多角體病毒(HzNPV)及芹菜夜蛾(AfNPV)，以及顆粒體病毒(GV)，如蘋果蠹蛾顆粒體病毒(CpGV)；殺真菌劑如：阿拉酸式苯(acibenzolar)、十二嗎啉(aldimorph)、ametoctradin、安美速(amisulbrom)、阿扎康唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、本達樂(benalaxyl)、免賴得(benomyl)、苯噻菌胺(benthiavalicarb)、苯噻菌胺-異丙基(benthiavalicarb-isopropyl)、雙諾邁(binomial)、聯苯(biphenyl)、比多農(bitertanol)、bixafen、保米黴素(blasticidin-S)、波多混合液(Bordeaux混合物)(三元硫酸銅(Tribasic copper sulfate))、白克列(boscalid/nicobifen)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、得滅寧(buthiobate)、萎銹靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、

四氯丹(captafol)、克菌丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、氯甲氧苯(chloroneb)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、克氯得(chlozolate)、克氯黴唑(clotrimazole)、鹼性氯氧化銅(copper oxychloride)、銅鹽(copper salts)例如：硫酸銅(copper sulfate)與氫氧化銅(copper hydroxide)、賽座滅(cyazofamid)、環氟菌胺(cyflunamid)、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、益發靈(dichlofluanid)、雙氯氟菌胺(diclocymet)、達滅淨(diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、乙霉威(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噻唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮、達滅芬(dimethomorph)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯唑醇(diniconazole)、達克利(diniconazole-M)、敵蟎普(dinocap)、敵克病(discostrobin)、腈硫醌(dithianon)、十二環嗎啉(dodemorph)、多果定(dodine)、氯氧甲苯咪唑(econazole)、乙環唑(etaconazole)、護粒松(edifenphos)、依普座(epoxiconazole)、噻唑菌胺(ethaboxam)、依瑞莫(ethirimol)、依得利(ethridiazole)、惡唑酮菌(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、芬瑞莫(fenarimol)、腈苯唑(fenbuconazole)、顯黴威(fencaramid)、酚菌氟來(fenfuram)、環醯菌胺(fenhexamide)、氟菌胺(fenoxanil)、拌種咯(fenpiclonil)、苯銹啉(fenpropidin)、芬普福(fenpropimorph)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、二甲胺甲硫羥羧酸鐵(ferbam)、



ferfurazoate、富米熱斯(ferimzone)、氟另南(fluzinam)、
護汰寧(fludioxonil)、氟鹽菌胺(flumetover)、氟吡菌胺
(fluopicolide)、fluopyram、氟嘧菌酯(fluoxastrobin)、氟
喹唑(fluquinconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護矽得
(flusilazole)、氟硫滅(flusulfamide)、福多寧(flutolanil)、
護汰芬(flutriafol)、滅菌丹(folpet)、三乙磷酸鋁(fosetyl-
aluminum)、麥穗寧(fuberidazole)、霜靈(furalaxyl)、福拉
比(furametpyr)、菲克利(hexaconazole)、殺紋寧
(hymexazole)、克熱淨(guazatine)、依滅列(imazalil)、易
胺座(imibenconazole)、烷苯磺酸鹽(iminoctadine)、依地
克(iodicarb)、依普克唑(ipconazole)、丙基喜樂松
(iprobenfos)、依普同(iprodione)、顯霉威(iprovalicarb)、
異康唑(isoconazole)、亞賜圃(isoprothiolane)、isopyrazam、
嘉賜黴素(kasugamycin)、克收欣(kresoxim-methyl)、鋅錳
乃浦(mancozeb)、曼普胺(mandipropamid)、錳乃浦
(maneb)、滅派林(mapanipyrin)、精甲霜靈(mefenoxam)、
滅普寧(mepronil)、滅達樂(metalaxyl)、滅特座(metconazole)、
滅速克(methasulfocarb)、免得爛(metiram)、苯氧菌胺
(metominostrobin/fenominostrobin)、滅派林(mepanipyrin)、滅
芬農(metrafenone)、咪可納唑(miconazole)、邁克尼
(myclobutanil)、鐵甲砷酸銨(neo-asozin)(甲基砷酸鐵
(ferric methanearsonate))、尼瑞莫(nuarimol)、辛噻酮
(octhilinone)、甲呋鹽胺(ofurace)、肱醚菌胺(orysastrobin)、毆
殺斯(oxadixyl)、歐索林酸(oxolinic acid)、惡咪唑

(oxpoconazole) 、 嘉 保 信 (oxycarboxin) 、 巴 克 素 (paclobutrazol) 、 平 克 座 (penconazole) 、 賓 得 克 利 (pencycuron) 、 賓 福 芬 (penflufen) 、 吡 噻 菌 胺 (penthioapyrad) 、 披 扶 座 (perfurazoate) 、 亞 磷 酸 (phosphonic acid) 、 熱 必 斯 (phthalide) 、 微 微 苳 醯 胺 (picobenzamid) 、 啖 氧 菌 酯 (picoxystrobin) 、 多 氧 菌 素 (polyoxin) 、 撲 殺 熱 (probenazole) 、 撲 克 拉 (prochloraz) 、 撲 滅 寧 (procymidone) 、 普 拔 克 (propamocarb) 、 普 拔 克 (propamocarb-hydrochloride) 、 普 克 利 (propiconazole) 、 甲 基 鋅 乃 浦 (propineb) 、 普 快 那 (proquinazid) 、 丙 硫 菌 唑 (prothioconazole) 、 百 克 敏 (pyraclostrobin) 、 必 瑞 滅 (pyrametostrobin) 、 嗜 菌 酯 (pyraoxystrobin) 、 白 粉 松 (pyrazophos) 、 比 芬 諾 (pyrifenoxy) 、 派 美 尼 (pyrimethanil) 、 比 芬 諾 (pyrifenoxy) 、 吡 咯 尼 林 (pyrolnitrine) 、 百 快 隆 (pyroquilon) 、 快 克 納 座 (quinconazole) 、 快 諾 芬 (quinoxifen) 、 五 氯 硝 基 苯 (quintozone) 、 sedaxane 、 席 塞 芬 (silthiofam) 、 硅 氟 唑 (simeconazole) 、 萆 孢 菌 素 (spiroxamine) 、 鏈 四 環 黴 素 (streptomycin) 、 硫 磺 (sulfur) 、 得 克 利 (tebuconazole) 、 tebufloquin techrazene 、 克 枯 爛 (tecloftalam) 、 四 氯 硝 基 苯 (tecnazene) 、 四 克 利 (tetraconazole) 、 松 腐 絕 精 (thiabendazole) 、 賽 氟 滅 (thifluzamide) 、 多 保 淨 (thiophanate) 、 甲 基 多 保 淨 (thiophanate-methyl) 、 得 恩 地 (thiram) 、 噻 噻 菌 胺 (tiadinil) 、 脫 克 松 (tolclofos-methyl) 、 基 益 發 靈 (tolyfluanid) 、 三 泰 芬 (triadimefon) 、 三 泰 隆 (triadimenol) 、 噻 菌 醇

(triarimol)、三挫磷(triazoxide)、三得芬(tridemorph)、垂嗎醯胺(trimorphamide)、三賽唑(tricyclazole)、三氟敏(trifloxystrobin)、賽福寧(triforine)、滅菌唑(triticonazole)、烯效唑(uniconazole)、維利黴素(validamycin)、維利芬那(valifenalate)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)、福美鋅(ziram)以及座賽胺(zoxamide)；殺線蟲劑，如得滅克(aldicarb)、新煙鹼類(imicyafos)、毆殺滅(oxamyl)及芬滅松(fenamiphos)；例如鏈黴素之殺菌劑；殺蟎劑，如三亞蹠(amitraz)、蟎離丹(chinomethionat)、克氯苯(chlorobenzilate)、錫蟎丹(cyhexatin)、大克蟎(dicofol)、得氯蟎(dienochlor)、依殺蟎(etoxazole)、芬殺蟎(fenazaquin)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、芬普寧(fenpropathrin)、芬普蟎(fenpyroximate)、合賽多(hexythiazox)、毆蟎多(propargite)、畢達本(pyridaben)及得芬瑞(tebufenpyrad)。

農業保護劑(意即殺蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑及生物藥劑)的一般參考文獻包括 *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., 英國作物保護會, Farnham, Surrey, 英國, 2003年以及生物殺蟲劑手冊(*The BioPesticide Manual*), 第2版, L. G. Copping, Ed., 英國作物保護會, Farnham, Surrey, 英國, 2001年。

特別值得注意的是選自阿巴汀(abamectin)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、阿佛菌素(avermectin)、印棟素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-

methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、布芬淨(buprofezin)、培丹(cartap)、克凡派(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、可尼丁(clothianidin)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、拉姆達賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬諾克(diafenthiuron)、狄氏劑(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、因滅汀苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟尼胺(flonicamid)、氟蟲醯胺(flubendiamide)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、祿芬隆(lufenuron)、美氟綜(metaflumizone)、納乃得(methomyl)、滅芬諾(methoxyfenozide)、倍脈心(milbemycin oxime)、尼古丁(nicotine)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、尼殺賽(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、毆殺滅(oxamyl)、派滅淨(pymetrozine)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、啖蟲丙醚(pyridalyl)、新喹啉(pyrifluquinazon)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚尼丁(ryanodine)、賜托拉(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、得芬諾(tebufenozide)、噻蟲啉



(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲單(thiosultap-sodium)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三福隆(triflumuron)、蘇力菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、蘇力菌庫斯塔基亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)、核多角體病毒(nucleopolyhedro virus)及一囊封蘇力菌 δ -內毒素之成分(e)。

特別值得注意的是選自除了生物有機體(意即不包括例如病毒、細菌和真菌)之生物活性劑之成分(e)。

本發明之懸浮濃縮物組合物可視情況進一步包含高至約15重量%之如成分(f)之一或多個額外的配方成分。可能的額外配方成分，或者說是輔助劑之實例為例如化學穩定劑或殺蟲劑及肥料之防凍劑、增稠劑、防腐劑。倘若成分(f)存在，其一般量為本組合物之至少0.01重量%，較佳為至少約0.1重量%。

當成分(f)包含一主要由一或多個防凍劑成分組成之防凍劑，防凍劑成分之量一般高至本化合物之約7重量%。當一防凍劑成分存在時，其一般量約為本組合物之至少約0.1重量%。防凍劑成分一般不超過本化合物之約5重量%且較佳約4重量%。值得注意的是本發明之組合物，其中該防凍劑成分與成分(c)之比例範圍自1：5至1：20。

防凍劑實例包括乙二醇類例如乙二醇、二甘醇、丙二醇、二丙二醇、甘油、1,3-丙二醇、1,2-丙二醇或分子量介於範圍自約200道耳頓至約1000道耳頓之聚乙二醇。特

別適合本組合物之防凍劑包括乙二醇、丙二醇、甘油、1,3-丙二醇及1,2-丙二醇。

考量商業來源和成本之原因，特別值得注意的是本組合物中成分(f)包含一選自乙二醇、丙二醇、1,3-丙二醇及1,2-丙二醇之防凍劑。特別值得注意的是本組合物中成分(f)包含乙二醇或丙二醇。

增稠劑(意即增稠劑)增加連續液相介質之黏度，固體顆粒(例如，成分(a)係懸浮於其中並因此減少其沉澱傾向。因為成分(b)亦增加黏度，一般不需要於成分(f)中包括一或多個增稠劑，且當本化合物之黏度已經達所需時確實無益。於成分(f)中包括一或多個增稠劑，對於在含有相對於成分(b)之大量成分(c)之化合物中減緩成分(a)之沉澱是有利的，特別當成分(b)主要包含具有相對低分子量(意即小於約3500道耳頓)之非離子性EO/PO嵌段聚合物時。有用於本組合物之增稠劑實例包括例如甘油之多元醇、多醣，包括例如三仙膠之異原元多醣以及具有非常小顆粒大小(例如2奈米)之水合粘土，例如水合鎂鋁矽酸鈣ACTI-GEL 208(Active Minerals)。值得注意的是甘油具有防凍劑和增稠劑兩者之特性。增稠劑種類及其應用可見於2005年*McCutcheon*，第2卷：機能性原料，製造者出版公司。倘若成分(f)包含一增稠劑成分，該增稠劑成分一般為本化合物之至少約0.1重量%且不多於約5重量%。

當成分(f)包含一主要由一或多個穩定劑或殺蟲劑組成之防腐劑成分，防腐劑成分之量一般高至本組合物之約1重



量%。當一防腐劑成分存在時，其一般量為本組合物之至少約0.01重量%。防腐劑成分一般不超過本組合物總重量之1%，較佳不超過0.5%且最佳不超果約0.3%。

穩定劑可預防活性成分(意即成分(a)及/或成分(e))在儲存時分解，例如，抗氧化劑(例如丁基羥基甲苯)或pH調節劑(例如檸檬酸或醋酸)。殺蟲劑可預防或降低在配方組合物中之微生物污染。特別適合之殺蟲劑係為例如LEGEND MK(5-氯-2-甲基-3(2H)-異唑酮與2-甲基-3(2H)-異唑酮之混合物)、EDTA(乙二胺四乙酸)、甲醛、安息香酸或1,2-苯并異噻唑-3(2H)-酮或其鹽類，例如PROXEL BD或PROXEL GXL(Arch)之殺菌劑。值得注意的是在本組合物中，成分(f)包含一殺蟲劑，特別是一例如1,2-苯并異噻唑-3(2H)-酮或其鹽類之殺菌劑。

成分(f)亦可包含一或多種肥料(意即植物營養)。包括於成分(f)之肥料可提供例如氮、磷、鉀及或微量元素，如錳、鐵、鋅及鉬之植物營養。特別值得注意的是成分(f)包括微量元素，如錳、鐵、鋅及鉬肥料較方便於以混合品製備在噴灑罐中，因此本組合物一般不包括大量肥料。若成分(f)包含一或多種肥料，儘管可包括更大量，其一般量為本組合物之至少約0.1重量%且不多於約10重量%。

本組合物中作為成分(f)之其他配方成分可包括例如流變調控劑及染料等。該等成分為熟習該領域之技藝人士所習知且經描述於，例如 *McCutcheon's, Volume 2: Functional Materials* published by MC Publishing Company annually。

本發明懸浮濃縮物組合物之製備一般包含研磨氰蟲醯胺活性成分(即成分(a))及水(即成分(c))之混合物直到氰蟲醯胺之顆粒經研磨至所需的顆粒大小，通常小於10微米。製造懸浮或分散顆粒之方法為眾所周知，包括球磨、珠磨、沙磨、膠體研磨、氣磨與高速混合結合，通常需要高剪切。特別值得注意的是球磨或珠磨這一步。於研磨或稍後與研磨混合物混合時，該混合物中可包括該懸浮濃縮物中之其他成分，例如成分(b)。然而，其他包含具有一大於10微米之顆粒大小及低水溶性之固體顆粒的成分通常包括於此混合物中研磨。儘管非離子性EO/PO嵌段聚合物成分(b)及額外的界面活性劑成分(d)可在研磨後加入成分(a)及成分(c)之混合物中，一般來說，一部分之成分(b)及/或成分(d)會包括至該混合物中研磨以促進成分(a)經研磨至小粒徑(意即小於10微米)。

當本發明懸浮濃縮物組合物包含相對高濃度的成分(b)，在研磨成分(a)及成分(c)後加入大部份或全部成分(b)特別有利。通常一振盪機適合用來混合成分(b)及成分(a)及成分(c)之研磨混合物。然而，取決於成分(b)物理性質及其於本組合物中之濃度，液晶相可形成粘性甚至是凝膠體狀。為混合此粘性甚至是凝膠體狀，可使用雙螺桿揉合機或三輥壓機。

採用本發明之稀釋組合物之理想方法例如：噴灑、噴霧、分散或傾鑄，取決於預期標的及給定之情況，其可由熟悉該領域之技藝人士可輕易決定。雖然本發明殺蟲懸浮



濃縮物(懸浮濃縮物)組合物可直接應用於昆蟲害蟲或其環境，本懸浮濃縮物組合物通常先以水稀釋以形成一稀釋組合物，然後使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸以控制該昆蟲害蟲。與水混合後，自本發明懸浮濃縮物組成形成之所得稀釋組合物一般包含成分(a)之懸浮固體顆粒。該稀釋組合物可通過各種方法，包括噴灑，應用於一蟲害或其環境。本發明殺蟲懸浮濃縮物組合物在以水稀釋、噴灑至植物葉面及乾燥後，經發現提供對於取食樹葉的同翅目刺吸型害蟲顯著有效的控制。該控制係包括殺死害蟲、干擾其生長、發展或複製、及/或抑制其攝食。另外，促進葉子吸收氰蟲醃胺亦隨後增加後續清洗之堅牢度(例如，暴露於雨)。

上述稀釋組合物對於植物葉子之有效殺蟲量的應用亦可控制其他植食性害蟲。因此本發明方法一方面係為一保護植物樹葉免於植食性害蟲之方法，該方法包括使該樹葉與一有效殺蟲量之上述稀釋組合物接觸。該方法可保護種類繁多的植物物種之樹葉。該植物物種實例包括十字花科(油菜)作物例如青花菜、球芽甘藍、甘藍、花椰菜及油菜子(例如芥花籽油)；其他葉菜類蔬菜，如芹菜、水芹、菊苣、茴香、萵苣、香芹、大黃、菠菜及瑞士甜菜；瓜類，如黃瓜、冬瓜、哈密瓜及其他洋香瓜、南瓜、美國南瓜、西瓜及印度南瓜；茄科作物，如茄子、辣椒、馬鈴薯和番茄；甘藷和薯芋屬植物；豆類如豌豆、大豆、豆粕；樹上的水果，如梨果(如蘋果、梨)，核(例如、桃、杏油桃、梅

紅、梅杏雜種、櫻桃)和柑橘(例如甜橙、檸檬、萊母、紅橘、橘柚、葡萄柚、柚子)；小型水果、如草莓、藍莓、覆盆莓、黑莓和波伊森莓；穀物，如小麥、燕麥、大麥、黑麥、水稻和玉米；其他作物，如向日葵、棉花和葡萄；牧草和草坪草；和其他植物景觀、園藝和花卉生產。

此用途包括保護含有以遺傳工程導入之遺傳物質(即基因轉殖)或以基因突變改良以提供有利性狀的農作物和其他植物。該特徵之實例包括除草劑耐受性、食植物的害蟲抵抗性(例如，昆蟲、壁蟲、蚜蟲、蜘蛛、線蟲、蝸牛、植物病原性真菌、細菌及病毒)、改善植物生長、增加對有害生長條件之耐受性，如高或低溫、低或高土壤濕度，以及高鹽分、增加開花與果實、提高產量、更快成熟、提高收成產品之品質及/或營養值或改善收成產物之儲存或處理性質。基因轉殖植物可經改良以表現多種特徵。植物之實例含有以遺傳工程或基因突變方式提供之特徵，包括許多種表現殺蘇力菌毒素之玉米、棉、黃豆及馬鈴薯，如 YIELD GARD®、KNOCKOUT®、STARLINK®、BOLLGARD®、NuCOTN®及NEWLEAF®、許多種耐除草劑之玉米玉米、棉、黃豆及油菜子，如 ROUNDUP READY®、LIBERTY LINK®、IMI®、STS®及CLEARFIELD®、以及表現 *N*-乙醯基轉換酶(GAT)之作物，其提供草甘膦除草劑之抵抗性或含有HRA基因之作物，該基因提供除草劑之抵抗性，透或抑制乙醯乳酸合成酶(ALS)。本組合物可能與經由遺傳工程導入或基因突變改良方式獲得之特徵產生增效交互作用，



因此增加表現型表現或特徵之有效性或增加本組合物控制無脊椎動物害蟲之效果。尤其，本發明組合物可能與對無脊椎動物害蟲具有毒性的蛋白質表現型表現或其他天然產物產生增效作用，以提供大於相加效果的害蟲控制。

在本揭露文件中，術語「昆蟲害蟲」及「植食性昆蟲害蟲」包括鱗翅目(order Lepidoptera)的幼蟲，例如夜盜蛾(*armyworms*)、切根蟲(*cutworms*)、尺蠖(*loopers*)與夜蛾科(*Noctuidae*)中的夜蛾亞種(*heliathines*)(例如秋夜盜蛾(*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith))、甜菜黏蟲(甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner)))、黑切根蟲(球莖夜蛾(*Agrotis ipsilon* Hufnagel))、擬尺蠖(粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner))、菸草夜蛾(菸芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius)))；蟲(*borers*)、鞘蛾(*casebearers*)、網蛾類(*webworms*)、鱗翅目蛾類(*coneworms*)、甘藍菜蟲(*cabbageworms*)及螟蛾科(*Pyrallidae*)中的雕葉蟲(*skeletonizers*)(例如：歐洲玉米螟(歐洲玉米螟蟲(*Ostrinia nubilalis* Hübner))、薊橙蟲(薊橙螟(*Amyelois transitella* Walker))、玉米根網蛾(蒙草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens))、草地網蛾(切葉野螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker)))；捲葉蟲、苞芽蟲、種蟲(*seed worms*)與捲葉蛾科(*Tortricidae*)中的蛀果蟲(例如：蘋果蠹蛾(蘋果小捲蛾(*Cydia pomonella* L(L.係指 Linnaeus))、葡萄螟蛾(葡萄果實蛀蟲(*Endopiza viteana* Clemens))、折心蟲(桃折心蟲(*Grapholita molesta* Busck)))；以及許多其他

經濟上重要的鱗翅類(例如：鑽紋蛾(葉蛾科之小菜蛾(*Plutella xylostella* L.))、棉紅鈴蟲(麥蛾科之紅鈴麥蛾(*Pectinophora gossypiella*))、舞毒蛾(毒蛾科之吉普賽舞蛾(*Lymantria dispar* L.))；鞘翅目(order Coleoptera)的食葉性幼蟲以及成體包括長角象鼻蟲科、豆象科與象鼻蟲科的象鼻蟲(例如：棉子象鼻蟲(棉鈴象鼻蟲(*Anthonomus grandis* Boheman))、水稻水象鼻蟲(稻水象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel))、穀象(小紅鰐節蟲(*Sitophilus oryzae* L.))；金花蟲科的跳甲蟲、黃瓜甲蟲、根蟲、葉甲蟲、馬鈴薯甲蟲和潛葉蠅(例如：科羅拉多馬鈴薯甲蟲(科羅拉多金花蟲(*Leptinotarsa decemlineata* Say))、西方玉米根蟲(玉米根螢葉甲(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)))；金龜子科的金龜子與其他甲蟲(例如：日本麗金龜(日本豆金龜(*Popillia japonica* Newman))以及歐洲金龜子(歐洲切根鰓金龜(*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)))；叩頭蟲科的鐵線蟲與小蠹科的小蠹蟲；革翅目(order Dermaptera)的卵、成體與幼蟲包括蠹蠅科的蠹蠅(例如：地蜈蚣(歐洲球蠹蠅(*Forficula auricularia* L.))、黑蠹蠅(墊跗蠹(*Chelisoches morio* Fabricius)))；半翅目的成體與若蟲以及同翅目，例如：盲蝽科中的盲蝽、蟬科中的蟬、葉蟬科中的葉蟬(例如：茶小綠葉蟬(*Empoasca* spp.))、浮塵子科中的浮塵子、蠟蟬總科與稻蝨科中的蠟蟬、角蟬科中的角蟬、木蝨科中的木蝨、粉蝨科中的粉蝨、常蚜科中的蚜蟲、根瘤蚜科中的根瘤蚜、粉介殼蟲科中的粉介殼蟲、軟



介殼蟲科中介殼蟲、盾介殼蟲科與碩介殼蟲科、軍配蟲科中的網蝽、蝽科中的臭蟲、麥長蝽(例如：毛長蝽(美洲谷長蝽(*Blissus* spp.))以及其他長蝽科中的長蝽象、沫蟬科中的尖胸沫蟬、緣蝽科中的南瓜蟲以及紅蝽科中的紅椿與木棉蟲；直翅目(order Orthoptera)的卵、成體與未成熟個體包括蚱蜢、蝗蟲與蟋蟀(例如：遷徙蝗蟲(例如：血黑蝗(*Melanoplus sanguinipes* Fabricius、*M. differentialis* Thomas))、美洲蚱蜢(例如：南美沙漠蝗*Schistocerca americana* Drury))、沙漠蝗蟲(非洲沙漠飛蝗(*Schistocerca gregaria* Forskal))、遷徙蝗蟲(東亞飛蝗(*Locusta migratoria* L.))、螻蛄(*Gryllotalpa* spp.))；雙翅目的卵、成體與未成熟個體包括潛葉蠅蠓、果蠅(果實蠅科)、果蠅(例如：瑞典稈蠅(*Oscinella frit* L.))、土壤蛆和其他長角亞目(Nematocera)；纓翅目(order Thysanoptera)的成體與未成熟個體包括洋蔥薊馬(薊馬(*Thrips tabaci* Lindeman)))與其他食葉性薊馬特別值得注意的是本方法控制一選自半翅目(特別是粉蝨科、蚜蟲科、浮塵子科、稻蝨科)及鱗翅目(特別是麥蛾科、毒蛾科、夜蛾科、葉蛾科、螟蛾科及卷蛾科)之分類目之植食性害蟲。特別值得注意的是本方法控制一選自粉蝨科、蚜蟲科、稻蝨科及浮塵子科之分類之植食性害蟲。

儘管藉由水稀釋有效濃度之本懸浮濃縮物組合物所形成之一噴灑組成可以提供足夠效能控制害蟲，亦可加入另外配製佐劑產物到噴灑槽混合物中。此等額外佐劑通常稱為

「噴灑佐劑」或「槽混佐劑」，並包括混合於噴灑槽之任何物質，以改善殺蟲劑處理效能，如提升效益(如生物可利用性、黏附性、滲透性、覆蓋均勻性及防護持久性)，或最小化或消除不相容、發泡、飄移、蒸發、揮發以及劣化等噴灑應用問題。因為無法以單一佐劑提供所有功效，通常係組合相容佐劑以展現多重機能。為了獲得最佳性能，依據活性成份、配方及標的(例如，作物、害蟲)之特性選擇佐劑。

在噴灑佐劑中，最常使用包括作物油、濃縮作物油、濃縮植物油及濃縮甲基籽油之油類，可能通過促進更均勻一致之噴灑沈澱以提高農藥療效。當考量藥害可能由油或其他不溶於水的液體引起的情況下，自本組合物製備噴灑化合物一般不會含有石油為基礎的噴灑佐劑。然而，當由油基噴灑佐劑引起之藥害在商業上微不足道的情況下，自本組合物製備噴灑化合物亦可含有以石油為基礎的噴灑佐劑，其有可能進一步增加控制特別是葉面刺吸式害蟲之昆蟲害蟲，以及增進耐雨堅牢度。

所謂「作物油」通常含有95%至98%石蠟或石腦油基石油，以及1至2%之一或多種乳化劑功能界面活性劑。定義為「濃縮作物油」之產品一般由80%至85%以乳化石油為基礎之油類及15至20%非離子性界面活性劑組成。目前定義為「濃縮植物油」之產品一般由80%至85%植物油(即種子或果實油，最常見來自棉、亞麻籽、大豆或向日葵)以及15%至20%非離子性界面活性劑組成。將植物油置換為

植物油來源之脂肪酸甲酯可改良佐劑效能。濃縮甲基籽油實例包括MSO[®] Concentrate(UAP-Loveland Products, Inc.)及Premium MSO Methylated Spray Oil(Helena Chemical Company)。油基佐劑添加至噴灑混合物之量以體積計通常不超過約2.5%，更常為約0.1%至約1%體積比。油基佐劑添加噴灑混合物之施用率通常約每公頃1至約5 L，而甲基籽油佐劑使用率通常為每公頃約1至約2.5 L。

含有油類、有或沒有乳化劑、特別是甲基籽油之噴灑佐劑，在混合槽中可與本發明之殺蟲懸浮濃縮物組合物兼容。因此本發明之一實施例係關於一控制一昆蟲害蟲之方法，包含以水稀釋本發明之殺蟲懸浮濃縮物組合物以形成稀釋組合物，並視情況加入一例如甲基籽油(以任何順序增補或混合)之佐劑，並使該昆蟲害蟲或其環境與一有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。

殺蟲懸浮濃縮物組合物之量與用來稀釋之水量的比例一般介於範圍自約1：100至約1：1000，較佳自約1：200至約1：800，最佳自約1：300至約1：600。進行害蟲有效控制(意即殺蟲有效量)所需之稀釋化合物的量取決於多個因素，包括氰蟲醯胺(例如成分(a))之濃度及任何其他該殺蟲懸浮濃縮物組合物中之殺蟲劑、在水中稀釋的程度、昆蟲害蟲對於氰蟲醯胺及任何其他殺蟲劑之易感性，環境條件以及其他佐劑之濃度，但熟悉該領域之技藝人士皆可藉由計算和簡單的實驗輕易決定之。

即使沒有進一步的闡述，相信使用上述說明的熟習該領

域之技藝人士仍能夠最大程度地利用本發明。因此，下面的實例應理解為僅僅是說明性的，而且不管是以任何方式，都不作為此處揭露內容的限制。

表1描述使用於實施例及比較實施例中之非離子性EO/PO嵌段聚合物。所有該等EO/PO嵌段聚合物皆為BASF Corporation產品。該等EO/PO嵌段聚合物之分子量及HLB值係自Guo et al., *Journal of Colloid and Interface Science* 2006, 298, 441-450。TETRONIC 904及90R4之數據係分別自美國專利7 534324及7 541 386。

表1. 非離子性EO/PO嵌段聚合物之特性

商標名	類型	分子量(道耳頓)	HLB
PLURONIC L31	泊洛沙姆	1100	5
PLURONIC L44	泊洛沙姆	2200	16
PLURONIC L64	泊洛沙姆	2900	15
PLURONIC P103	泊洛沙姆	4950	9
PLURONIC P104	泊洛沙姆	5900	13
PLURONIC F108	泊洛沙姆	14600	27
PLURONIC 25R4	反向泊洛沙姆	3600	8
TETRONIC 904	泊洛沙胺	6700	15
TETRONIC 90R4	反向泊洛沙胺	7240	7

表2描述使用於實施例及比較實施例中之其他成分。



表 2. 其他成分之特性

名稱	特性
化合物1	3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺
ATLOX 4913 (Croda)	甲基丙烯酸/甲基丙烯酸甲酯/聚氧丙烯接枝共聚物
ATLOX 4894 (Croda)	M聚氧乙烯烷基醚及聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段聚合物混合物
AGNIQUE DFM111S (Cognis Corp)	聚二甲矽氧
PROXEL GXL (Arch)	鈉1,2-苯并異噻唑-3(2H)-酮
RHODOPOL 23 (Rhodia)	三仙膠(異原元多醣)
ACTI-GEL 208 (Active Minerals)	水合鎂鋁矽酸鈣

PCT專利發表 WO 2006/062978揭露一製備3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺(意即化合物1)之方法。該案實施例15揭露以177-181°C(表觀分解)粉末熔點製備化合物1,其為一種易於脫水的多形晶體形式。實施例15亦揭露自1-丙醇再結晶以提供晶體熔化於217-219°C,其為一種可抗水化之無水多晶體形式。使用於本發明實施例及比較實施例中之化合物1樣本經檢測含有化合物1之約94-96%重量,其被認為係兩種多晶體形式之混合物。

揭露於下之實施例中所報導的化合物1之量及重量百分比係指技術材料之重量(含有約94-96%之化合物1),非指實際化合物1之重量。相同的,所報導之EO/PO共聚物和化合物1之比例係根據含有化合物1之技術材料的重量計算而來,非根據化合物1本身實重。

實施例1-8及比較實施例B

製備實施例1-8及比較實施例B之常用方法

於一配備有開銷攪拌器之250毫升的不銹鋼燒杯中,混

合攪拌列於表3及4中之成分以得到100克混合物。使用轉子定子混合器(Polytron PT 3000, Kinematica AG, Switzerland)均質該混合物，然後使用一50毫升Eiger Motormill(一由Eiger Machinery Inc., Chicago, Illinois製造的臥式砂磨機)研磨至約1微米中等顆粒大小以各自製造懸浮濃縮物實施例化合物。

表3. 實施例1-8之組成物成分

成分	功能	重量%
化合物1	活性成分	4.29
ATLOX 4913	分散劑	0.64
ATLOX 4894	分散劑	0.43
ACTI-GEL 208	增稠劑	0.50
AGNIQUE DFM111S	反發泡劑	0.11
PROXEL GXL	殺菌劑	0.05
丙二醇	防凍劑	4.00
RHODOPOL 23	增稠劑	0.10
水	稀釋劑	40.00
EO/PO嵌段聚合物 (見表4)	佐劑	49.88

表4. 實施例1-8之EO/PO嵌段聚合物

實施例	商標名
1	PLURONIC L31
2	PLURONIC L44
3	PLURONIC L64
4	PLURONIC P103
5	PLURONIC P104
6	PLURONIC 25R4
7	TETRONIC 904
8	TETRONIC 90R4
比較實施例 B	PLURONIC F108

粉蟲控制試驗



為評估對於銀葉粉蝨(*Bemisia tabaci* Gennadius)之控制，每個測試單元由一14-21日齡至少有二片真葉之棉花植物，種在Redi-earth®培養基(Scotts Co.)。該等植物被放在網籠中，允許導入粉蝨成蟲於其中並產卵約二十四小時。僅有可觀察出具產卵之植物用來進行測試噴灑待測溶液前，再次檢查植物上之卵孵化及履帶沈陷(crawler settlement)。每株植物中一單株葉片被認為是一個複製；每一處理使用四次複製。

以水稀釋所有配方材料以製造含有200 ppm氰蟲醯胺之待測混合物。噴灑之待測混合物係與外觀混濁的水均勻分散。使用TeeJet扇形噴嘴並於最高的植物上7.5英寸(19厘米)處噴灑植物。調整噴灑流率為5.5毫升/秒，相當於468升/ha。

噴灑後，允許植物在一通風圍牆內乾燥並於在50%相對濕度下進行六天，於28°C光照(如白天)16小時及24°C下黑暗(如夜間)8小時。在移除測試植物之所有樹葉後，計算葉子底部死亡及活著的若蟲以作為評估。使用所得數據計算死亡率百分比作為控制測量。

實施例1-8化合物經發現提供超過50%控制。相反地，根據比較PCT發表WO 2008/069990之實施例A(此處確認為目前比較實施例A)製備而成之化合物，包含少於2% EO/PO嵌段聚合物之氰蟲醯胺含水懸浮濃縮物經發現提供少於10%控制。另外，於本發明比較實施例B之化合物中，係為PLURONIC F108之EO/PO嵌段聚合物經發現提供少於

10%控制。

實施例9-11及比較實施例C

實施例9-11之組成係由混合一氰蟲醯胺(之後定義為「研磨基」)之研磨含水懸浮液與非離子性EO/PO嵌段聚合物製備而成。

實施例9-11及比較實施例C之研磨基的製備

在一擋板500毫升燒杯金屬中混合ATLOX 4913(9.135克)和ATLOX 4894(6.105克)與水(74.775克)。將化合物1(60.000克)加入所得之溶液中。仔細混合所得混合物至所有化合物1於溶液中浸濕。當燒杯經水冷卻至10°C，使用120公分³ 0.6至0.8毫米ER120S珠(SEPR, Paris, France)和一以3000 rpm旋轉之購自Firestone Associates(Philadelphia, PA)標準1.75英寸(4.44厘米)之聚胺酯製成的高速分散瓣片研磨該混合物210分鐘。含有化合物1之40重量%之準備研磨基係為一分散良好、不具粘性之白色懸浮。使用Malvern Mastersizer® 2000(Malvern Instruments, Malvern, Worcestershire, UK)之光散射分析顯示平均粒徑為1.0微米。

製備實施例9A-11D及比較實施例C之化合物

於一上限20公分³玻璃管中稱重表5各實施例指定之水量。藉振盪混合兩成分，之後加入含有化合物1(0.70克)之上述研磨基(1.75克)。搖勻所得混合物，接著將含有該混合物之試管置於一滾軸(US Stoneware, Mahwah, NJ)上之塗料罐內並於約60 rpm繞軸滾動一個晚上。大部分所得分散



係為白色自由流動的液體，然而一部分含有較高量EO/PO嵌段聚合物之化合物(實施例10C、10D、11C、11D)為黏性糊狀。

比較實施例C化合物亦經製備，其忽略了包括超過用來製備研磨基之ATLOX 4894界面活性劑所包括之兩個成分之一的小量EO/PO嵌段聚合物。本發明人並不清楚ATLOX 4894中之EO/PO嵌段聚合物特性是否符合本發明成分(b)之要求。由於ATLOX 4894中EO/PO嵌段聚合物成分特性無從得知，且相較於PLURONIC EO/PO嵌段聚合物，其量很極小，因此在實施例9A至11D之化合物1中計算EO/PO嵌段聚合物比例時不包括ATLOX 4894 EO/PO嵌段聚合物。

表5. 實施例9A-11D及比較實施例C之化合物選擇成分

實例	水	EO/PO嵌段聚合物		化合物1	EO/PO共聚物與 化合物1之比例
	量(克)	特性	量(克)	量(克)	
9A	7.55	PLURONIC L64	0.70	0.70	1 : 1
9B	6.75	PLURONIC L64	1.50	0.70	2.1 : 1
9C	5.25	PLURONIC L64	3.00	0.70	4.3 : 1
9D	2.15	PLURONIC L64	6.10	0.70	8.7 : 1
10A	7.55	PLURONIC P103	0.70	0.70	1 : 1
10B	6.75	PLURONIC P103	1.50	0.70	2.1 : 1
10C	5.25	PLURONIC P103	3.00	0.70	4.3 : 1
10D	2.15	PLURONIC P103	6.10	0.70	8.7 : 1
11A	7.55	PLURONIC P104	0.70	0.70	1 : 1
11B	6.75	PLURONIC P104	1.50	0.70	2.1 : 1
11C	5.25	PLURONIC P104	3.00	0.70	4.3 : 1
11D	2.15	PLURONIC P104	6.10	0.70	8.7 : 1
比較 實例C	8.25	-	<0.07	0.70	<0.1 : 1

粉蟲之控制試驗

將實施例 9A-9D、10A-10B 及 11A-11D 化合物及比較實施例 C 與水混合以形成一含有 200 ppm 化合物 1 之噴灑混合物，並使用描述於用於測試實施例 1-8 化合物之步驟測試之。實施例 10C 及 10D 未經測試，由於在通常採用此測試之使用設備中其粘度成分會阻止與水之快速混合。試驗結果列於表 6。

表 6. 200 ppm 的化合物 1 對於粉蟲之控制

實例	EO/PO 嵌段聚合物	EO/PO 共聚物與 化合物 1 之比例	百分比控制
9A	PLURONIC L64	1 : 1	14
9B	PLURONIC L64	2.1 : 1	36
9C	PLURONIC L64	4.3 : 1	78
9D	PLURONIC L64	8.7 : 1	92
10A	PLURONIC P103	1 : 1	4
10B	PLURONIC P103	2.1 : 1	73
11A	PLURONIC P104	1 : 1	27
11B	PLURONIC P104	2.1 : 1	54
11C	PLURONIC P104	4.3 : 1	89
11D	PLURONIC P104	8.7 : 1	89
比較 實施例 C	-	<0.1 : 1	5

為決定由一些實施例化合物製備之噴灑混合物中之氰蟲醯胺控制粉蟲之 LC_{50} 及 LC_{90} 值，使用用於實施例 1-8 中之上述常用測試步驟，除了本測試使用四種不同量之組成（因而於噴灑混合物中提供四種濃度之化合物 1）。使用機率單位分析，計算可殺死 50% 和 90%（意即 LC_{50} 及 LC_{90} ）粉蟲群體之該劑量，並將結果列於表 7。由於在應用率測試記錄中



有可忽略控制(negligible control)，因此無法計算自比較實施例A(PCT發佈WO2008/069990之比較實施例A)化合物製備之噴灑混合物中氰蟲醯胺控制粉蝨之有意義的 LC_{50} 及 LC_{90} 值。

表 7. 化合物1控制粉蝨的 LC_{50} 及 LC_{90} 值

實施例	EO/PO嵌段聚合物	EO/PO共聚物及化合物1之比例	LC_{50}	LC_{90}
9A	PLURONIC L64	1 : 1	342	679
9B	PLURONIC L64	2.1 : 1	175	379
9C	PLURONIC L64	4.3 : 1	157	311
9D	PLURONIC L64	8.7 : 1	95	216
10B	PLURONIC P103	2.1 : 1	154	268
11A	PLURONIC P104	1 : 1	226	492
11B	PLURONIC P104	2.1 : 1	137	465
比較 實施例A	-	<0.1 : 1(*)	(**)	(**)

(*) 比較實施例A之化合物含有一比較小量之EO/PO嵌段聚合物，作為ATLOX 4894界面活性劑2重量%成分之中兩種成分之其中一種。本發明人並不清楚ATLOX 4894中之EO/PO嵌段聚合物特性是否符合本發明成分(b)之要求。

(**) 由於所測試比率中之可忽略控制，無法計算 LC_{50} 及 LC_{90} 。

七、申請專利範圍：

1. 一種殺蟲懸浮濃縮物(suspension concentrate)組合物，包含根據本組合物總重量按重量計算之：
 - (a) 自約0.3%至約30%之3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺；
 - (b) 自約5%至約70%之一於20℃下具有至少約5重量%之水溶性之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物化合物，其親水性-親油性均衡值係為自約5至約18且平均分子量係為自約900道耳頓至約20000道耳頓(daltons)；且
 - (c) 自約20%至約95%之水；其中該組合物包含不多於該組合物5重量%之水不互溶液態化合物。
2. 如申請專利範圍第1項之組合物，其中成分(b)係為該組合物之自約20至約70重量%。
3. 如申請專利範圍第1項及第2項之任一組合物，其中成分(b)與成分(a)之重量比例至少係為約1：1。
4. 如申請專利範圍第1項及第2項之任一組合物，其中成分(b)之親水性-親油性均衡值係為自約8至約15。
5. 如申請專利範圍第1項及第2項之任一組合物，其中成分(b)之平均分子量係為自約2000道耳頓至約8000道耳頓。
6. 如申請專利範圍第1項及第2項之任一組合物，其中成分(b)包含一或多個選自由泊洛沙姆(poloxamers)、反向泊

洛沙姆、泊洛沙胺(poloxamines)及反向泊洛沙胺組成之群組之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物。

7. 如申請專利範圍第6項之組合物，其中成分(b)包含一或多個選自泊洛沙姆之非離子性環氧乙烷-環氧丙烷嵌段聚合物。
8. 如申請專利範圍第1項及第2項之任一組合物進一步包含自約0.1至約15重量%之一或多個除3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-甲醯胺以外之生物活性劑。
9. 如申請專利範圍第8項之組合物，其中一或多個生物活性劑係選自阿巴汀(abamectin)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、阿佛菌素(avermectin)、印楝素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、布芬淨(buprofezin)、培丹(cartap)、克凡派(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、可尼丁(clothianidin)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、拉姆達賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬諾克(diafenthiuron)、狄氏劑(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、因滅汀苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟

尼 胺 (flonicamid)、 氟 蟲 醯 胺 (flubendiamide)、 氟 芬 隆 (flufenoxuron)、 六 伏 隆 (hexaflumuron)、 愛 美 松 (hydramethylnon)、 益 達 胺 (imidacloprid)、 因 得 克 (indoxacarb)、 祿 芬 隆 (lufenuron) 美 氟 綜 (metaflumizone)、 納 乃 得 (methomyl)、 滅 芬 諾 (methoxyfenozide)、 倍 脈 心 (milbemycin oxime)、 尼 古 丁 (nicotine)、 烯 啉 蟲 胺 (nitenpyram)、 尼 殺 賽 (nithiazine)、 諾 伐 隆 (novaluron)、 毆 殺 滅 (oxamyl)、 派 滅 淨 (pymetrozine)、 除 蟲 菊 精 (pyrethrin)、 畢 達 本 (pyridaben)、 啉 蟲 丙 醚 (pyridalyl)、 新 喹 啉 啉 (pyrifluquinazon)、 百 利 普 芬 (pyriproxyfen)、 魚 尼 丁 (ryanodine)、 賜 托 拉 (spinetoram)、 賜 諾 殺 (spinosad)、 賜 派 芬 (spirotetramat)、 螺 甲 蟎 酯 (spiromesifen)、 螺 蟲 乙 酯 (spirotetramat)、 得 芬 諾 (tebufenozide)、 賽 果 培 (thiacloprid)、 賽 速 安 (thiamethoxam)、 硫 敵 克 (thiodicarb)、 殺 蟲 單 (thiosultap-sodium)、 脫 芬 瑞 (tolfenpyrad)、 泰 滅 寧 (tralomethrin)、 啉 蚜 威 (triazamate)、 三 福 隆 (triflumuron)、 蘇 力 菌 鮎 澤 亞 種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、 蘇 力 菌 庫 斯 塔 基 亞 種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)、 核 多 角 體 病 毒 (nucleopolyhedro virus) 及 一 囊 封 蘇 力 菌 δ -內 毒 素。

10. 一 控 制 一 昆 蟲 害 蟲 之 方 法， 包 含 以 水 稀 釋 申 請 專 利 範 圍 第 1 項 至 第 9 項 之 任 一 組 合 物 以 形 成 稀 釋 組 合 物， 並 使 該 昆 蟲 害 蟲 或 其 環 境 與 一 有 效 殺 蟲 量 之 該 稀 釋 組 合 物 接 觸。

11. 如申請專利範圍第10項之方法，其中該昆蟲害蟲之環境中的葉群係與有效殺蟲量之該稀釋組合物接觸。
12. 如申請專利範圍第10項或第11項之方法，其中該昆蟲害蟲係為一分類科中選自粉蝨科、蚜蟲科、稻蝨科及浮塵子科。