



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 201945371 A

(43) 公開日：中華民國 108 (2019) 年 12 月 01 日

(21) 申請案號：108112904

(22) 申請日：中華民國 108 (2019) 年 04 月 12 日

(51) Int. Cl. :

*C07D491/113 (2006.01)**A01N25/12 (2006.01)**A01N43/90 (2006.01)**A01N59/00 (2006.01)**A01N41/04 (2006.01)**B01F17/50 (2006.01)**A01P7/04 (2006.01)**A01G7/06 (2006.01)**A01G13/10 (2006.01)*

(30) 優先權：2018/04/13

歐洲專利局

18167264.3

(71) 申請人：德商拜耳廠股份有限公司 (德國) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72) 發明人：伊格 霍爾格 EGGER, HOLGER (AT)；費薛爾 瑞納 FISCHER, REINER (DE)；

薩山德 蘿拉 ZUMSANDE, LAURA (DE)

(74) 代理人：何愛文；王仁君

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：2 共 38 頁

(54) 名稱

殺昆蟲混合物之固體調配物 (一)

(57) 摘要

本發明關於具殺昆蟲劑活性的帖啞咪酸(tetramic acid)衍生物的固體調配物(尤其是水溶性粒劑(SG))、關於其製造方法且關於其用於施用存在的活性成分之用途，尤其用於滴注及澆灌(drench)施用。

The invention relates to solid formulations (especially water-soluble granules (SG)) of insecticide active tetramic acid derivatives, to a process for production thereof and to the use thereof for application of the active ingredients present, especially for drip & drench applications.

【發明說明書】

【中文發明名稱】 殺昆蟲混合物之固體調配物(一)
【英文發明名稱】 SOLID FORMULATION OF INSECTICIDAL
MIXTURES

【技術領域】

【0001】 本發明關於具殺昆蟲劑活性的帖啞咪酸(tetramic acid)衍生物的固體調配物(尤其是水溶性粒劑(SG))、關於其製造方法且關於其用於施用存在的活性成分之用途，尤其用於滴注及澆灌施用。

【先前技術】

【0002】 帖啞咪酸衍生物的SL調配物(可溶性濃縮物)是先前技術習知的，舉例來說，習知自WO 2009/115262，但是這些具有的缺點是濃縮物中的活性成分的濃度通常很低，因此需要大體積來運輸、加工和儲存。此外，在高度濃縮溶液的情況下，存在過飽和的風險，使得成分可能沉澱並因此影響產品的儲存穩定性。

【0003】 而且，這些化合物的SC調配物(懸浮液濃縮物)是習知的，但這些通常具有較差的溶解度或只有很慢的溶解度的活性成分(ai)與成分，WG調配物(水分散性粒劑)也同樣如此，其另含不溶的填充劑。

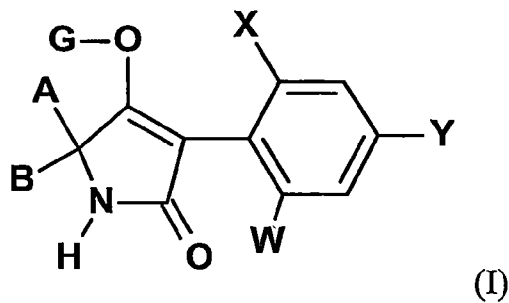
【0004】 當用於一般包括小直徑軟管與噴嘴的噴霧設備與灌溉系統時，尤其是在WG的情況下，亦在包括不溶於水物質的其他調配物類型的情況下，這些軟管與噴嘴經常被未溶解或沉澱的材料(無論是活性成分或輔劑)堵塞。

【發明內容】

【0005】本發明的一個目的因此是提供根據本發明之帖啞咪酸衍生物的速溶、高度濃縮調配物，由此可以無殘餘物的方式生產即用型調配物。而且，減少了土壤的鹽分負荷，視情況地，調配物的另外構分用作為肥料/營養物。

【0006】本發明因此提供呈水溶性粒劑(SG)形式的殺昆蟲組成物，包含：

- a. 作為組分a的式(I)帖啞咪酸衍生物



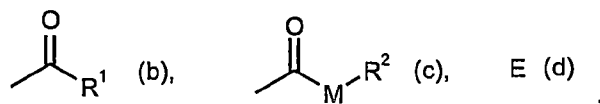
其中

W與Y獨立地為氫、C₁-C₄-烷基、氯、溴、碘或氟，

X 為C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、氯、溴或碘，

A、B 與其所鍵結的碳原子為被視情況經C₁-C₄-烷基-或C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基-取代之伸烷基二氧基取代的C₃-C₆-環烷基，其與其所鍵結的碳原子共同形成5-員或6-員縮酮，

G 為氫(a)或下列群組之一者



其中

E 為金屬離子或銨離子，

M 為氧或硫，

R¹ 為直鏈或支鏈的C₁-C₆-烷基，

R² 為直鏈或支鏈的C₁-C₆-烷基，

- b. 至少一鹼，較佳為無機鹼，更佳為鹼金屬氫氧化物(組分b)，
- c. 至少一分散劑，較佳選自木質素磺酸鹽及其鹽之群組，

- d. 視情況的至少一潤濕劑，
- e. 視情況的至少一水溶性填充劑，以及
- f. 視情況的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

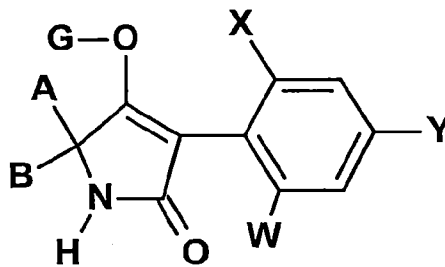
【0007】該分散劑較佳為鹼性分散劑，亦即在水溶液中較佳具有 $\text{pH} \geq 8$ ，進一步較佳 ≥ 10 (於 25°C ，在15%溶液中藉由玻璃電極測量)。

【0008】特別偏好用於上述組成物的是具有上文提及式(I)且 $G=\text{氫(a)}$ 的帖啞咪酸衍生物。

【0009】同樣地，最佳使用的上文提到的式(I)帖啞咪酸衍生物，其中 $G=E$ (d)。

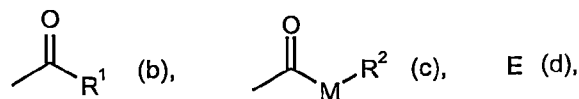
【0010】在較佳的具體例中，本發明提供一種呈水溶性粒劑(SG)形式的殺昆蟲組成物，包含：

- a. 式(I)化合物



其中式(I)化合物具有下列定義：

- W 為甲基，
- X 為氯或甲基，
- Y 為氯、溴或甲基，
- A、B 與其所鍵結的碳原子為經伸烷基二氧基取代的飽和 C_6 -環烷基，其與其所鍵結的碳原子共同形成5-員或6-員縮酮，
- G 為氫(a)或下列群組之一者

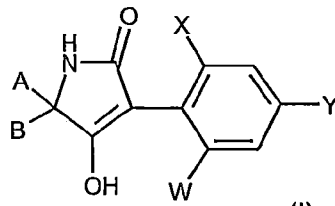


其中

- M 為氧，
- E 為一金屬離子等效物或銨離子，
- R¹ 為直鏈或支鏈的C₁-C₄-烷基，
- R² 為直鏈或支鏈的C₁-C₄-烷基，
- b. 至少一鹼(組分b)，其係選自包含LiOH、KOH與NaOH之群組，
- c. 至少一分散劑，其係選自由下列所組成的木質素磺酸鹽及其鹽之群組：得自Borregaard之Borresperse NA、Borresperse 3A、Ultrazine NA、Ufoxane 3A、Vanisperse CB、Marasperse AG、MARASPERSE N 22、MARASPERSE C 21、MARASPERSE CBOS-4、WAFEX CA122與Borresperse CA；得自Ingevity之KRAFTSPERSE EDF-350、KRAFTSPERSE 25M、KRAFTSPERSE EDF-450、REAX 100M、REAX 83A、REAX 85A、REAX 88A、REAX 88B、REAX 907、REAX 910、POLYFON H、POLYFON O與POLYFON T；得自Tembec之AGRINOL DN 19與Agrinol C12，
- d. 至少一潤濕劑，其係選自由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，舉例來說，®Morwet EFW；以及二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽，舉例來說，®Aerosol OTB；以及環氧丙烷與環氧乙烷在乙二胺上的嵌段聚合物，舉例來說，®Synperonic T 905，
- e. 視情況的至少一水溶性填充劑，以及
- f. 視情況的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【0011】在進一步較佳的具體例中，本發明提供一種呈水溶性粒劑(SG)形式的殺昆蟲組成物，包含：

- a. 式(I)化合物，其係選自下列化合物：



(I)

W	X	Y	A	B
CH ₃	CH ₃	CH ₃	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}$	
CH ₃	CH ₃	Cl	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}$	
CH ₃	CH ₃	Br	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}$	
CH ₃	CH ₃	CH ₃	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_3-\text{O}$	
CH ₃	CH ₃	Cl	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_3-\text{O}$	
CH ₃	CH ₃	Br	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}-(\text{CH}_2)_2-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_3-\text{O}$	

(I)

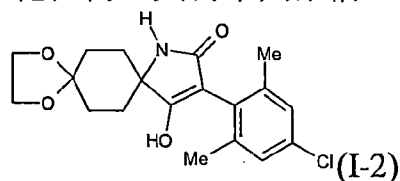
- b. 至少一鹼(組分b)，其係選自包含KOH與NaOH之群組，
- c. 至少一分散劑，其係選自由REAX 88B、Reax 100M所組成的木質素磺酸鹽及其鹽之群組，
- d. 至少一潤濕劑，其係選自由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，舉例來說，®Morwet EFW，以及二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽，舉例來說，®Aerosol OTB，
- e. 至少一水溶性填充劑，其係選自包含下列之群組：易溶的無機鹽類、糖類與脲衍生物，較佳選自包含下列之群組：硫酸鉀、

M_3PO_4 形式的磷酸鹽，其中M較佳為銨或鹼金屬陽離子，更佳為銨、Na或K；乳糖、麥芽糊精和脲，

f. 視情況的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【0012】在尤其較佳的具體例中，本發明提供一種呈水溶性粒劑(SG)形式的殺昆蟲組成物，包含：

a. 具有式(I-2)之化合物，具有下列結構：



(I)

b. KOH，作為鹼(組分b)，

c. REAX 88B (CAS No. 68512-34-5)，作為鹼性分散劑，來自木質素磺酸鹽群組，

d. 潤濕劑，其係選自於由烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽所組成之群組，較佳為®Morwet EFW (CAS No. 26264-58-4)，

e. 至少一水溶性填充劑，其係選自包含下列之群組：糖類與易溶有機鹽類，較佳為硫酸鉀、磷酸鉀、乳糖與麥芽糊精，更佳為乳糖，

f. 視情況的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【0013】特別偏好用於上述組成物的是具有上述式(I)且G = 氫(a)的帖啞咪酸衍生物。

【0014】同樣地，最佳使用上文提到的式(I)帖啞咪酸衍生物，其中G = E (d)。

【0015】化合物I-2較佳以其熱力學最穩定的多晶型結構的形式使用。此晶體結構與進一步的物理數據如下列測定：

樣本製備：

【0016】 化合物I-2 ($C_{19}H_{22}ClNO_4$ / MW = 363.84 g/mol)從甲醇結晶並於室溫乾燥，得到變體A。

【0017】 I-2的變體A可藉由基於以Cu-K α 1輻射(1.5406 Å)於25°C記錄的對應繞射圖的x-射線粉末繞射儀來定徵(圖1)。

【0018】 根據本發明的變體A顯示如圖1所示的至少3個、較佳至少5個、進一步較佳至少7個、甚至進一步較佳至少10個且最佳所有反射。

【0019】 根據本發明的變體A進一步藉由圖I所示的x射線繞射圖定徵。

【0020】 對變體A單晶的晶體學研究顯示，晶體結構為單斜晶系。單位晶格具有P2₁/c晶格群。

表2：變體A的晶體學特性

參數	變體 A
晶體系統	單斜晶系
晶格群	P2 ₁ /c
a, 單位 Å	11.66544(14)
b, 單位 Å	9.50603(10)
c, 單位 Å	16.66907(19)
α	90
β	110.2045(13)
γ	90
Z	4
密度(計算值)	1.393 g/cm ³

a、b、c = 單位晶格的各側長度

α 、 β 、 γ = 單位晶格的角度

Z = 單位晶格中的分子數

表2a/b：變體A的晶體學資料/反射[°2 θ]

2a	2b

[°2 θ]	反射[°2 θ]
變體 A	變體 A
11.3	8.0
14.6	10.8
16.0	11.3
20.1	12.2
21.7	14.6
22.7	16.0
23.1	17.6
24.5	18.4
28.2	19.4
29.0	20.1
	21.7
	22.7
	23.1
	23.8
	24.5
	25.9
	26.4
	28.2
	29.0
	29.4
	30.1
	30.6
	32.2
	36.2
	37.4
	38.2
	39.1

【0021】 I-1的變體A的多晶形式可使用鑽石ATR儀器藉由於4 cm^{-1} 解析度在25°C記錄的對應光譜的IR光譜來測定(圖2)。本發明的變體A顯示可由圖2所見且如表2c所述的至少3個、較佳至少5個、進一步較佳至少7個且更佳為所有譜帶。

表2c) IR譜帶[cm^{-1}]

譜帶最大值 [cm^{-1}]	譜帶最大值 [cm^{-1}]
變體 A	

3378	1133
2969	1109
2955	1088
2943	1045
2924	1036
2876	1027
2858	1015
2326	997
1637	980
1592	965
1575	946
1564	936
1470	903
1444	869
1438	856
1428	821
1394	783
1372	769
1344	748
1325	704
1317	691
1297	659
1272	639
1247	625
1194	573
1157	563
	553

【0022】除了上述變體A外，化合物I-2可呈現為另外的多晶形式，還有偽多晶形式(水合物、溶劑合物等等)。

【0023】在較佳的具體例中，活性成分對鹼(組分(a)對(b))的當量比例較佳在0.7：1.0至1.0：0.7範圍內，進一步較佳在1.0：1.0至1.0：0.8範圍內且更佳在1.0：1.0至1.0：0.9範圍內。

【0024】在本發明中，在化學式，譬如式(I)中，除另有述明外，視情況經取代之基團可為經單-或多取代，其中在多取代的情況下，取代基可相同或不同。

【0025】而且，在本發明所述的較佳範圍內，應該理解不同的較佳程度，使得彼等可彼此排列組合，但在任何情況下，相同的較佳程度準，尤其是在各情況下的最佳具體實例/較佳程度為組合彼此且確實以如此的組合揭示。

【0026】僅由必要組分(非視情況的組分)所組成的如上所述的組成物應該同樣被視為已揭露。

【0027】至於組分a，當然可能製備具有低於50重量%的活性成分含量的組成物，儘管較佳的是用於施用(運輸量、操作、經濟性)的高活性成分含量。本領域技術人員亦熟知的是，以重量百分比計的鹼比率可根據所用鹼的類型而取決於其分子量來變化。

【0028】固體含量—除非另有指明—應視為重量百分比，其中組成物的固體含量應相加為100。而且，在添加溶液(譬如鹼)的情況下的比率指的是該溶液的比率，所以，舉例來說，在50%溶液的情況下的純KOH的比率相當於給定百分比的一半。

【0029】在根據本發明的組成物中的活性成分(組分a/式I/I-2化合物)的比率

較佳為50-90重量%，

進一步較佳為55-85重量%，以及

更佳為60-80重量%。

【0030】 在根據本發明的組成物中的鹼(組分b，在水中的50%懸浮液)的比率

較佳為2-40重量% (相當於1-20重量%的純鹼)

進一步較佳為10-30重量% (相當於5-15重量%的純鹼)，以及

更佳為15-25重量% (相當於7.5 – 12.5重量%的純鹼)。

【0031】 在根據本發明的組成物中的分散劑(組分c)的比率

較佳為1-40重量%，

進一步較佳為3-15重量%，以及

更佳為8-12重量%。

【0032】 在根據本發明的組成物中的潤濕劑(組分d)的比率

較佳為0-5重量%，

進一步較佳為1-3重量%，以及

更佳為1.5-2.5重量%。

【0033】 在該組成物中的水溶性填充劑(組分e)的比率

較佳為0-25重量%，

進一步較佳為0-20重量%，以及

更佳為0-18重量%。

【0034】 在替代的具體實例中，在組成物中的水溶性填充劑(組分e)的比率，其中其餘構分係以所述量存在於本案例中，較佳為1-25重量%，

進一步較佳為5-18重量%以及

更佳為12-18重量%。

【0035】 在根據本發明的組成物中的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑(組分f)–倘若存在–的比率(消泡劑與作為pH調整劑的硫酸)

較佳為0-10重量%，

進一步較佳為0.1-8重量%，以及

更佳為0.1-5重量%。

【0036】 在下文說明的具體實例中，鹼的比率總是基於50%的在水中的漿料，意思是純鹼的比率是一半大(參見上文)。此外，本發明中給出的組成物總是指涉水溶性粒劑(SG)形式的組成物，除非另有明確說明。

【0037】 本發明的較佳具體實例為包含下列組分的組成物

- a) 55-85重量%
- b) 10-30重量%
- c) 3-15重量%
- d) 1-3重量%
- e) 0-25重量%
- f) 0-10重量%。

【0038】 本發明的進一步較佳具體實例為包含下列組分的組成物

- a) 55-80重量%
- b) 10-30重量%
- c) 3-15重量%
- d) 1-3重量%
- e) 0-20重量%
- f) 0.1-8重量%。

【0039】 本發明的甚至進一步較佳具體實例為包含下列組分的組成物

- a) 60-80重量%
- b) 15-25重量%
- c) 8-12重量%
- d) 1.5-2.5重量%
- e) 0-18重量%
- f) 0.1-5重量%。

【0040】 本發明的較佳的替代具體實例為包含下列組分的組成物

- a) 60-80重量%
- b) 15-25重量%
- c) 8-12重量%
- d) 1.5-2.5重量%
- e) 1-25重量%
- f) 0.1-8重量%。

【0041】本發明的進一步特定具體實例是REAX 88b®用作分散劑且乳糖作為組分e)的該些組成物。

【0042】本發明的進一步特定具體實例是REAX 88b®用作分散劑且硫酸鉀作為組分e)的該些組成物。

【0043】本發明的進一步特定具體實例是REAX 88b®用作分散劑且磷酸鉀作為組分e)的該些組成物。

【0044】本發明的進一步特定具體實例是REAX 88b®用作分散劑且Morwet EFW作為組分d)的該些組成物。

【0045】本發明的進一步特定具體實例是REAX 88b®用作分散劑且磷酸鉀和乳糖一起作為組分e)的該些組成物。

【0046】欲強調的本發明進一步具體實例是REAX 88b®用作分散劑且Silcolapse 726R ®作為抗起泡劑的該些組成物。

【0047】欲強調的本發明進一步具體實例是REAX 88b®用作分散劑且硫酸用於調整pH的該些組成物。

【0048】欲強調的本發明進一步具體實例是Silcolapse 726R ®用作抗起泡劑且硫酸用於調整pH的該些組成物。

【0049】欲強調的本發明進一步具體實例是REAX 88b®用作分散劑且Silcolapse 726R ®作為抗起泡劑、以及硫酸用於調整pH的該些組成物。

【0050】根據組分a)的適宜活性成分是上述的式1的具體實例中所示者。

【0051】組分a)的適宜活性成分是上述的式1的具體實例中所示者。

【0052】在本發明上下文中的適宜鹼(b)是無機鹼，較佳為金屬氫氧化物鹼，進一步較佳為鹼金屬氫氧化物，甚至進一步較佳選自包含下列之群組的鹼金屬氫氧化物：LiOH、NaOH與KOH且更佳為KOH。

【0053】在本發明上下文中的適宜分散劑(c)為選自木質素磺酸鹽及其鹽之群組的分散劑，較佳選自由下列所組成之木質素磺酸鹽及其鹽之群組：得自Borregaard之Borresperse NA、Borresperse 3A、Ultrazine NA、Ufoxane 3A、Vanisperse CB、Marasperse AG、MARASPERSE N 22、MARASPERSE C 21、MARASPERSE CBOS-4、WAFEX CA122與Borresperse CA；得自Ingevity之KRAFTSPERSE EDF-350、KRAFTSPERSE 25M、KRAFTSPERSE EDF-450、REAX 100M、REAX 83A、REAX 85A、REAX 88A、REAX 88B、REAX 907、REAX 910、POLYFON H、POLYFON O與POLYFON T；得自Tembec之AGRINOL DN 19與Agrinol C12，進一步較佳選自包含REAX 88A與REAX 88B的群組，更佳為REAX 88B。

【0054】在本發明上下文中的適宜潤濕劑(d)為選自於由下列所組成之群組的潤濕劑：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，舉例來說，®Morwet EFW，以及二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽，舉例來說，®Aerosol OTB，以及環氧丙烷與環氧乙烷在乙二胺上的嵌段聚合物，舉例來說，®Synperonic T 905，較佳選自於由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，舉例來說，®Morwet EFW，以及二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽，舉例來說，®Aerosol OTB，更佳由烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽所組成，較佳為®Morwet EFW。

【0055】在本發明上下文中的適宜水溶性填充劑(e)為選自包含下列之群組的填充劑：易溶的無機鹽、糖類與脲衍生物，舉例來說，乳糖、麥芽糊精、硫酸鉀、 M_3PO_4 形式的磷酸鹽，其中M較佳為銨或鹼金屬陽離子，進一步較佳為銨、Na或K；和脲。又較佳地，該填充劑選自包含下列之群組：糖類與 M_3PO_4 形式的磷酸鹽，其中M較佳為銨或鹼金屬陽離子，進一步較佳為銨、Na或K，較佳為硫酸鉀、乳糖與麥芽糊精，更佳為硫酸鉀與乳糖。

【0056】本發明的組成物視情況地包含另外的調配物輔劑(f)，舉例來說，來自下列群組的任擇物質：乳化劑、陰離子型或非離子型潤濕劑、泡沫抑制劑，舉例來說，以矽氧烷為基底的泡沫抑制劑、防腐劑、抗氧化劑、染料、用以調整pH的酸或鹼及/或惰性填充材料。

【0057】所用的另外的適宜潤濕劑(組分e-3)可為固體潤濕劑、陰離子型及/或兩性離子型潤濕劑、磺酸鹽(磺基琥珀酸鹽)、硫酸鹽、磷酸鹽、磷酸鹽與羧酸鹽，亦可為鹼性潤濕劑(譬如®Synperonic T產品)。彼等可選自固體潤濕劑的群組，亦即在室溫下不是液體而具有，舉例來說，蠟質、無定形或結晶質特性的那些，舉例來說，選自環氧烷類與仲烷基聚胺的反應產物的群組、萘磺酸以及磺基琥珀酸衍生物的群組、以及首先可包括磺基琥珀酸的單酯和二酯及其鹽(磺基琥珀酸鹽)且其次可包括烷基化萘磺酸鹽及其鹽的該些群組的鹽類。

【0058】適宜潤濕劑的典型代表包括®Synperonic T產品(環氧丙烷和環氧乙烷在乙二胺上的嵌段聚合物)、®Nekal BX (烷基化萘磺酸鹽)、®Galoryl MT 804 (烷基化萘磺酸鹽)。

【0059】有用的泡沫抑制劑是在農化組成物中通常可用於此目的的所有物質。偏好的是矽油與硬脂酸鎂。尤其偏好的是非離子型水性聚二甲基矽氧烷系乳液。有用的防腐劑包括在此類型農化組成物中通常可用於此目的的所有物質。實例包括Preventol® (得自Lanxess)與Proxel®。

【0060】有用的抗氧化劑是在農化組成物中通常可用於此目的的所有物質。偏好的是丁基羥基甲苯。

【0061】有用的染料是在農化組成物中通常可用於此目的的所有物質。實例包括二氧化鈦、顏料黑、氧化鋅與藍色顏料，還有永固紅(Permanent Red) FGR。

【0062】所用的pH調整劑可為任何標準的酸與鹼，例如，舉例來說，氫氯酸、硫酸、檸檬酸或氫氧化鈉與氫氧化鉀。

【0063】 特佳的pH調整劑是硫酸。

【0064】 根據本發明的調配物的施用比率可以在相對寬廣的範圍內變化。該比率係藉由個別活性成分及其於組成物中的含量來指引。

【0065】 藉助於根據本發明的組成物，殺昆蟲活性成分混合物可以特別有利的方式用於植物及/或其生境。

【0066】 根據本發明的組成物可用來處理所有植物與植物的部分。植物在此背景下應理解為包括所有植物與植物族群，例如所欲與非所欲野生植物或作物植物(包括自然發生的作物植物)。作物植物可為可藉由傳統育種和優化方法或藉由生物技術和基因工程方法或該等方法之組合獲得的植物，包括基因轉殖植物並包括能夠或不能受到植物育種者權利保護的植物品種。植物的部分應理解為意指植物在地上和地下的所有部分和器官，例如芽、葉、花與根，所提供的實例為葉、針葉、秸稈、莖、花、子實體、果實與種子；亦有塊莖、根與根莖。植物部分亦包括經採收材料和無性與有性繁殖材料，舉例來說，剪枝、塊莖、根莖、芽和種子。

【0067】 較佳地，式(I)化合物是用於在澆灌或滴注施用後對抗來自下列害蟲科的動物害蟲：

【0068】 偏好的是來自綿蚜(woolly aphids)的科(綿癭蚜科，Pemphigidae)：在作物，例如，舉例來說，柑橘類水果、梨果、核果、葉菜類蔬菜、根莖類蔬菜以及觀賞植物的綿蚜屬(*Eriosoma* spp.)、癭棉蚜屬(*Pemphigus* spp.)。

【0069】 偏好的是來自葡萄蚜(grape lice)的科(根瘤蚜科，Phylloxeridae)：在葡萄藤、堅果、柑橘類水果的根瘤蚜屬(*Phylloxera* spp.)。

【0070】 偏好的是來自木蝨(jumping plant lice)的科(木蝨科，Psyllidae)：在作物，例如，舉例來說，梨果、核果、柑橘類水果、蔬菜、馬鈴薯，在熱帶作物的木蝨屬(*Psylla* spp.)、帕拉木蝨屬(*Paratrioza* spp.)、田納菲木蝨屬(*Tenalaphara* spp.)、透木蝨屬(*Diaphorina* spp.)、叉木蝨屬(*Triozia* spp.)。

【0071】 偏好的是來自介殼蟲(soft scales)的科(介殼蟲科, Coccidae)：在多年生作物，例如，舉例來說，柑橘類水果、梨果、核果、橄欖、葡萄藤、咖啡、茶、熱帶作物、觀賞植物、蔬菜的蠟蚧屬(*Ceroplastes* spp.)、草履介殼蟲屬(*Drosicha* spp.)、棉蚧屬(*Pulvinaria* spp.)、原棉介殼蟲屬(*Protopulvinaria* spp.)、硬介殼蟲屬(*Saissetia* spp.)、介殼蟲屬(*Coccus* spp.)。

【0072】 偏好的是來自盾介殼蟲(armoured scale insects)的科(盾介殼蟲科, Diaspididae)：在作物，例如，舉例來說，柑橘類水果、梨果、核果、杏仁、開心果、堅果、橄欖、茶、觀賞植物、葡萄藤、熱帶作物的圓盾介殼蟲屬(*Quadraspidotus* spp.)、腎圓盾介殼蟲屬(*Aonidiella* spp.)、蠣盾介殼蟲屬(*Lepidosaphes* spp.)、薄圓盾介殼蟲屬(*Aspidiotus* spp.)、蛇狀介殼蟲屬(*Aspis* spp.)、盾介殼蟲屬(*Diaspis* spp.)、片盾介殼蟲屬(*Parlatoria* spp.)、擬白輪盾介殼蟲屬(*Pseudaulacaspis* spp.)、矢盾介殼蟲屬(*Unaspis* spp.)、並盾介殼蟲屬(*Pinnaspis* spp.)、刺圓盾介殼蟲屬(*Selenaspis* spp.)。

【0073】 偏好的是來自旌介殼蟲(ensign scales)的科(旌介殼蟲科, Ortheziidae)：在柑橘類水果、梨果、核果的旌介殼蟲屬(*Orthezia* spp.)。

【0074】 偏好的是來自粉介殼蟲(mealy bugs)的科(粉介殼蟲科, Pseudococcidae)：在柑橘類水果、核果與梨果、茶、葡萄藤、蔬菜、觀賞植物與熱帶作物的介殼蟲(*Pericera*)、粉介殼蟲屬(*Pseudococcus* spp.)、臀紋粉介殼蟲屬(*Planococcus* spp.)、嫡粉介殼蟲屬(*Dysmicoccus* spp.)。

【0075】 更偏好的是來自粉蝨(whiteflies)的科(粉蝨科, Aleyrodidae)：在作物，例如，舉例來說，蔬菜、甜瓜類、馬鈴薯、煙草、軟果、柑橘類水果、觀賞植物、棉花、大豆和熱帶作物的煙草粉蝨(*Bemisia tabaci*)、銀葉粉蝨(*Bemisia argentifolii*)、溫室粉蝨(*Trialeurodes vaporariorum*)、棉絮粉蝨(*Aleurothrixus floccosus*)、粉蝨屬(*Aleurodes* spp.)、透粉蝨屬(*Dialeurodes* spp.)、楊梅粉蝨(*Parabemisia myricae*)。

【0076】 再者，偏好的是來自下列的蚜蟲的科(蚜科, Aphidae)：

瘤蚜屬(*Myzus* spp.)，在煙草、核果、軟果、果實類蔬菜、葉菜類蔬菜、根莖類蔬菜、甜瓜類、馬鈴薯、觀賞植物、香料中，

碗豆蚜(*Acyrtosiphon onobrychis*)，在蔬菜中，

蚜屬(*Aphis* spp.)，在煙草、柑橘類水果、梨果、核果、甜瓜類、草莓、軟果、果實類蔬菜、葉菜類蔬菜、根莖類蔬菜、觀賞植物、馬鈴薯、南瓜、香料中，

玫瑰蚜(*Rhodobium porosum*)，在草莓中，

萵苣蚜(*Nasonovia ribisnigri*)，在葉菜類蔬菜中，

長管蚜屬(*Macrosiphum* spp.)，在觀賞植物、馬鈴薯、葉菜類蔬菜與果實類蔬菜、草莓中，

忽布疣額蚜(*Phorodon humuli*)，在啤酒花中，

菜蚜(*Brevicoryne brassicae*)，在葉菜類蔬菜中，

橘蚜屬(*Toxoptera* spp.)，在柑橘類水果、核果、杏仁、堅果、香料中，

粗額蚜屬(*Aulacorthum* spp.)，在柑橘類水果、馬鈴薯、果實類蔬菜與葉菜類蔬菜中，

飛蠊短尾蚜(*Anuraphis cardui*)，在蔬菜中，

李短尾蚜(*Brachycaudus helycrisii*)，在向日葵中，

驢食豆額蚜(*Acyrtosiphon onobrychis*)，在蔬菜中。

【0077】同樣地，偏好的是來自薊馬(thrips)的科(薊馬科，Thripidae)：在作物，例如，舉例來說，水果、棉花、葡萄藤、茶、堅果、熱帶作物、觀賞植物、針葉樹、煙草、香料、蔬菜、軟果、甜瓜類、柑橘類水果與馬鈴薯的呆薊馬屬(*Anaphothrips* spp.)、稻薊馬屬(*Baliothrips* spp.)、巢薊馬屬(*Caliothrips* spp.)、花薊馬屬(*Frankliniella* spp.)、微毛薊馬屬(*Heliothrips* spp.)、溫室薊馬(*Hercinothrips* spp.)、鉤薊馬屬(*Rhipiphorothrips* spp.)、跳薊馬屬(*Scirtothrips* spp.)、卡薊馬屬(*Kakothrips* spp.)、帶薊馬屬(*Selenothrips* spp.)、薊馬屬(*Thrips* spp.)。

【0078】再者，偏好的是來自潛葉蠅(leaf-miner flies)的科(潛蠅科，Agromyzidae)與高麗菜蠅(root-maggot flies)的科(花蠅科，Anthomyiidae)：在作物，例如，舉例來說，蔬菜、甜瓜類、馬鈴薯、堅果、觀賞植物的潛蠅屬(*Agromyza* spp.)、暗潛葉蠅屬(*Amauromyza* spp.)、芒蠅屬(*Atherigona* spp.)、克羅蠅屬(*Chlorops* spp.)、斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)、稗蠅屬(*Oscinella* spp.)、泉蠅屬(*Pegomyia* spp.)。

【0079】偏好的是來自葉蟬(leafhoppers)的科(葉蟬科，Cicadellidae)與飛蝨(plantoppers)的科(稻蝨科，Delphacidae)：在作物，例如，舉例來說，柑橘類水果、水果、葡萄藤、馬鈴薯、蔬菜、觀賞植物、針葉樹、甜瓜類、軟果、茶、堅果、稻米與熱帶作物的環莖葉蟬屬(*Circulifer* spp.)、角頂葉蟬屬(*Dalbus* spp.)、小綠葉蟬屬(*Empoasca* spp.)、紅斑葉蟬屬(*Erythroneura* spp.)、大葉蟬屬(*Homalodisca* spp.)、扁葉蟬屬(*Iodioscopus* spp.)、斑飛蝨屬(*Laodelphax* spp.)、黑尾葉蟬屬(*Nephotettix* spp.)、褐飛蝨屬(*Nilaparvata* spp.)、昂康托蟲屬(*Oncometopia* spp.)、飛蝨屬(*Sogatella* spp.)。

【0080】偏好的是來自潛葉蛾(leaf-miner moths)的科(細蛾科，Gracillariidae)：

小捲葉蛾屬(*Caloptilia* spp.)、細蛾屬(*Gracillaria* spp.)、細潛葉蛾屬(*Lithocolletis* spp.)、潛葉蛾屬(*Leucoptera* spp.)、蠹蛾屬(*Phtorimaea* spp.)、潛葉蛾屬(*Phyllocnistis* spp.)，在作物，例如，梨果、核果、葡萄藤、堅果、柑橘類水果、針葉樹、馬鈴薯、咖啡中。

【0081】偏好的是來自下列的瘿蚧(gall midges)的科(瘿蚧科，Cecidomyiidae)：

康瘿蚊屬(*Contarinia* spp.)、葉瘿蚊屬(*Dasineura* spp.)、瘿蚊屬(*Diplosis* spp.)、普蠅屬(*Prodiplosis* spp.)、鞘瘿蚊屬(*Thecodiplosis* spp.)、吸漿蟲屬(*Sitodiplosis* spp.)、哈洛蟲屬(*Haplodiplosis* spp.)，在作物，例如，柑橘類水果、梨果、核果、蔬菜、馬鈴薯、香料、軟果、針葉樹、啤酒花中。

【0082】 同樣地，偏好的是來自果蠅的科(實蠅科，Tephritidae)：

實蠅屬(*Anastrepha* spp.)、小條實蠅屬(*Ceratitis* spp.)、寡毛實蠅屬(*Dacus* spp.)、繞實蠅屬(*Rhagoletis* spp.)，在作物，例如，蔬菜、軟果、甜瓜類、梨果與核果、觀賞植物、馬鈴薯、葡萄藤、熱帶作物、柑橘類水果、橄欖中。

【0083】 再者，偏好的是來自葉蟎(spider mites)的科(葉蟎科，Tetranychidae)與來自瘿蟎(gall mites)的科(瘿蟎科，Eriophyidae)的蟎類：

葉蟎屬(*Tetranychus* spp.)、全爪蟎屬(*Panonychus* spp.)、刺皮節蟎屬(*Aculops* spp.)，在作物，例如，蔬菜、馬鈴薯、觀賞植物、柑橘類水果、葡萄藤、針葉樹中。

【0084】 本發明之以根據本發明的組成物處理植物與植物的部分係直接致效或藉由慣常處理方法作用在其周邊、環境或儲存空間，舉例來說，藉由澆灌、浸漬、噴灑、霧化、噴霧、散播、灑上以及在繁殖材料的情況中，尤其是種子的情況中，亦藉由以一或多層包衣施用。

【0085】 活性成分較佳藉由水施用至土壤上。或者，活性成分是藉由滴注施用。

【0086】 較佳地，欲處理的植物係選自於由下列所組成之群組：棉花、大豆、煙草、蔬菜、香料、觀賞植物、針葉樹、柑橘類植物、水果、熱帶作物、堅果與葡萄藤。

【0087】 較佳地，根據本發明的組成物對抗來自下列科的害蟲：綿蚜、葡萄蚜、木蝨、介殼蟲、盾介殼蟲、旌介殼蟲、粉介殼蟲、粉蝨、蚜蟲、薊馬、葉蟬、飛蝨、潛葉蠅、瘿蚧、果蠅、潛葉蛾、葉蟎、瘿蟎。

【0088】 亦發現到，根據本發明的組成物可藉由具有下列步驟的方法製造：

1) 將活性成分(a)和鹼(b)與分散劑(c)及視情況的另外的構分d-e，或在替代具體實例中，d-f，在水中混合；

2) 將混合物噴霧乾燥。

【0089】 或者，混合物也可藉由流化床方法或藉由本領域技術人員已知的其他方法乾燥。

【0090】 用於混合與噴霧乾燥的相關設備是本領域技術人員已知的。

【0091】 此製程亦形成本發明標的之一部分。

【0092】 最後，已發現根據本發明的組成物非常適合用於將存在之活性農化成分施用至植物及其生境。此方法亦形成本發明標的之一部分。

【圖式簡單說明】

【0093】 圖1：I-2 (變體A)的X光繞射圖

【0094】 圖2：IR光譜

【實施方式】

【0095】 以下實施例例示本發明之標的，而非設限。

製造：

【0096】 藉由將活性成分連同鹼性水溶液一起溶解以及適宜的乾燥方法，有可能製造具有極高活性成分含量(> 50%)的固體調配物。

【0097】 將化合物I-2連同氫氧化鉀、結合劑與視情況的另外的添加劑以表1指定的份量一起在水中混合，同時攪拌，隨後藉由噴霧乾燥的方式乾燥(LabPlant Model SprayDryer SD-05，空氣進料溫度190°C，空氣出口溫度50-60°C，空氣流通量48 m³/h)。

表1

實驗編號	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	12a	13	14	15
註解															比較例	
I-2 /g	135	311	311	10	186.6	186.6	140	135.4	138.2	57.4	57.4	56	66.5	10	72.2	66
KOH(50%)/g	41.6	95.8	94.1	2.5	57.5	57.5	32	37.5	34.2	15.5	16.4	15.5	20.8	-	13.4	18.3
Reax 88B /g	27	62.2	-	2	31.3	17	10	9.7	9.9	10.1	10	11.5	9	2	5.2	-
Reax 88A /g	-	-	61.1	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
K ₃ PO ₄ /g	-	31.1	31.1	1	18.7	37.3	14	13.5	13.8	-	-	-	-	5.8	7.2	-
乳糖/g	-	-	-	-	-	-	-	-	-	15	14.7	-	-	-	-	-
K ₂ SO ₄ /g	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	15	-	-	-	14.2
Morwet EFW /g	-	-	-	-	6	-	4	3.9	3.9	2	1.5	2	2	-	2.1	1.5
Silcolapse 426 R													0.2			
硫酸 25%													1.5			
水/g	250	632	632	20.1	380	380	260	253	257	131	130	130	108.1	71.3	-	-
莫耳比例 A.I./KOH	1:1	1:1	1:0.9	1:0.8	1:1	1:1	1:0.75	1:0.9	1:0.8	1:0.9	1:0.95	1:0.9	1:1	1:0	1:0.6	1:0.9
溶解程度(5% w/v 溶液) / %							99.9	100	99.9	99.7	99.2	99.9	99.9		96.1	96.6
結果	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	-	-	-

【0098】 比較例13-15顯示，當鹼含量太低並且無分散劑時，不可能達到足夠的溶解度。

測定溶解度與溶解率：

測定溶解程度：

【0099】 於25°C將調配物與水引入可封閉的250 ml量筒中，將封閉的量筒倒置15次進行混合，並在靜置5分鐘後，傾倒通過40 μm 篩子。確定殘餘物份量以測定溶解程度。

【0100】 殘餘物百分比使用以下公式計算：

$$\text{殘餘物} = \frac{w_1 \cdot 100}{w_0} [\%]$$

其中：

w_1 = 篩子上殘餘物的量[g]

w_0 = 起始重量[g]

100 = 百分比因子[%]

【0101】 測定5分鐘後的殘餘物百分比(殘留物[5分鐘])。

溶解程度 = 100 - 殘餘物[5 min] [%]。

溶解度：

【0102】 在室溫下攪拌的同時，將20 g的根據實施例3的組成物完全溶於50 g的水中。結果是深色的澄清溶液。

溶解率：

【0103】 將11.4 mg的根據本發明的調配物在各種條件下(水硬度和pH)在200 ml的水中攪拌溶解，並在24 h內目測評估混合物。「溶解」意指溶液澄清且不再存在未溶解的固體。

【0104】 結果示於表2。

	實施例	介質	溶液的 pH	300 l H ₂ O 中的目標 a.i.[g]	調配物的起始重量 [mg]	在下列時間之後評估溶解特性						
						0 min	30 sec	5 min	30 min	1 h	24 h	
A	3	500 ppm H ₂ O	6.8	12	11.4	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
B		緩衝液 1	6.0	12	11.4	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
C		緩衝液 2	7.9	12	11.4	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
D	2	500 ppm H ₂ O	7.5	12	11.4	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
E		緩衝液 1	6.0	12	11.4	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
F		緩衝液 2	7.9	12	11.4	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
G	2	500 ppm H ₂ O	7.6	24	22.9	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
H		緩衝液 1	6.0	24	22.9	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
I		緩衝液 2	8.0	24	22.9	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
J	2	500 ppm H ₂ O	8.4	48	45.7	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
K		緩衝液 1	6.0	48	45.7	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
L		緩衝液 2	8.0	48	45.7	未溶	未溶	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解

	實施例	介質	pH	溶解程度(5% w/v 溶液) [%]	5 min 後目測評估 溶解特性
M	12a	水 Cipac A	-	99.9	溶解
N		水 Cipac C	-	99.8	溶解
O		水 Cipac D	-	99.7	溶解
P		緩衝液 3	4.7	99.6	溶解
Q		緩衝液 4	10	99.8	溶解

比較

編號	調配物種類	溶液的 pH	300 l H ₂ O 的目標 a.i.[g]	調配物的起始重量[g]	在下列之後評估溶解特性						
					0 min	30 sec	5 min	30 min	1 h	24 h	
A	SL050	500 ppm H ₂ O	12	0.08	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
B		緩衝液	12	0.08	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
C		緩衝液	12	0.08	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
D	SC050	500 ppm H ₂ O	12	0.08	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶
E		緩衝液	12	0.08	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶
F		緩衝液	12	0.08	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶
G	SL050	500 ppm H ₂ O	6	0.04	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
H		緩衝液	6	0.04	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
I		緩衝液	6	0.04	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解	溶解
J	SC050	500 ppm H ₂ O	6	0.04	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶
K		緩衝液	6	0.04	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶
L		緩衝液	6	0.04	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶	未溶

【0105】由SL與SC 050調配物的比較實驗中可以明顯看出，在較低的pH (6)，根據本發明的調配物比具相同活性成分含量的SC調配物在水中溶解得更好。而且，獲得具更高活性成分含量(達48 g/300 l)的真溶液。

SC調配物如下製造：

SC調配物：

【0106】為了製備懸浮液濃縮物，首先將所有液體組分彼此混合。在下一步驟中，加入固體並攪拌直至獲得均勻的懸浮液。先將均勻的懸浮液投至粗研磨操作，隨後投至細研磨操作，以獲得懸浮液，其中90%的固體顆粒具有低於10 μm 的粒徑。然後，在室溫下攪拌的同時加入Kelzan® S與水，以達到預定黏度。獲得均勻的懸浮液濃縮物。另外的SC調配物的典型組成是：

49 g的式I-2化合物(活性成分)

15 g的Soprophor® TS 54

45 g的Atlox® 4913

100 g的甘油(99%)

1 g的檸檬酸

1 g的Silfoam® SRE

1.2 g的Proxel® GXL

0.8 g的Preventol® D7

1.2 g的Kelzan® S

785.8 g的水

SL調配物：

【0107】先加水、活性成分(I-2)與脲來製造SL調配物。添加2莫耳氫氧化鈉溶液，直到每樣皆溶入溶液中，隨後以1莫耳氫氯酸將pH調成10，加水將混合物補至1 l。

【0108】 SL調配物的典型組成是：

50 g的該式化合物(活性成分)

51.35 g的氫氧化鈉溶液 (2 m)

51.35 g的氫氟酸(1 m)

102.7 g的脲

0.82 g的Preventol® D 7

1.23 g的Proxel® GXL 20%

1.03 g的Silfoam® SRE

768.5 g的水

生物活性：

【0109】 在溫室中，在甜椒上針對桃蚜(*Myzus persicae*)的澆灌施用後(drench)，藉由與SC 225的比較來比較兩種SG調配物(實施例2、3、12a)的生物活性：

施用： 澆灌體積50 ml，種植後7日土壤施用

比率： 0.5；1；2 mg a.i./土壤l

土壤： 標準BI土壤 (pH 6.8)

土壤水分含量： ~10% w/w

土壤體積：每株植物0.5 l盆

侵染： 施用後1週

【0110】 在所用施用比率及指定測試條件下，根據本發明的調配物與SC顯示完全控制了桃蚜。

【發明摘要】

【中文發明名稱】 殺昆蟲混合物之固體調配物(一)
【英文發明名稱】 SOLID FORMULATION OF INSECTICIDAL
MIXTURES

【中文】

本發明關於具殺昆蟲劑活性的帖啞咪酸(tetramic acid)衍生物的固體調配物(尤其是水溶性粒劑(SG))、關於其製造方法且關於其用於施用存在的活性成分之用途，尤其用於滴注及澆灌(drench)施用。

【英文】

The invention relates to solid formulations (especially water-soluble granules (SG)) of insecticide active tetramic acid derivatives, to a process for production thereof and to the use thereof for application of the active ingredients present, especially for drip & drench applications.

【指定代表圖】 無

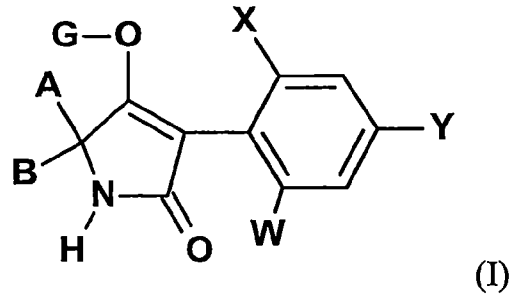
【代表圖之符號簡單說明】

無

【發明申請專利範圍】

【第1項】一種呈水溶性粒劑(SG)形式的固體組成物，包含：

a. 式(I)帖唑咪酸(tetramic acid)衍生物



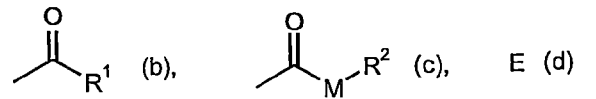
其中

W與Y獨立地為氫、C₁-C₄-烷基、氯、溴、碘或氟，

X 為C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、氯、溴或碘，

A、B 與其所鍵結的碳原子為被視情況經C₁-C₄-烷基-或C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基-取代之伸烷基二氧基取代的C₃-C₆-環烷基，其與其所鍵結的碳原子共同形成5-員或6-員縮酮，

G 為氫(a)或下列群組之一者



其中

E 為金屬離子或銨離子，

M 為氧或硫，

R¹ 為直鏈或支鏈的C₁-C₆-烷基，

R² 為直鏈或支鏈的C₁-C₆-烷基，

- b. 至少一鹼，
- c. 至少一分散劑，
- d. 視情況的至少一潤濕劑，
- e. 視情況的至少一水溶性填充劑，以及

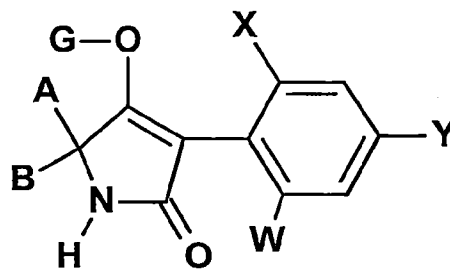
f. 另外的水溶性或液體活性成分與佐劑。

【第2項】如請求項1之組成物，其特徵在於組分b)係選自包含下列之群組：金屬氫氧化物鹼，進一步較佳為鹼金屬氫氧化物，甚至進一步較佳為選自包含下列之群組的鹼金屬氫氧化物：LiOH、NaOH與KOH且更佳為KOH，其中在根據本發明的組成物中的鹼(組分b)的比率較佳為2-40重量%，進一步較佳為10-30重量%，較佳為15-25重量%。

【第3項】如請求項1之組成物，其特徵在於組分c)係選自包含木質素磺酸鹽及其鹽之群組；較佳由下列所組成：得自Borregaard之Borrespere NA、Borrespere 3A、Ultrazine NA、Ufoxane 3A、Vanisperse CB、Maraspere AG、MARASPERSE N 22、MARASPERSE C 21、MARASPERSE CBOS-4、WAFEX CA122與Borrespere CA；得自Ingevity之KRAFTSPERSE EDF-350、KRAFTSPERSE 25M、KRAFTSPERSE EDF-450、REAX 100M、REAX 83A、REAX 85A、REAX 88A、REAX 88B、REAX 907、REAX 910、POLYFON H、POLYFON O與POLYFON T；得自Tembec之AGRINOL DN 19與Agrinol C12；更佳為REAX 88B，其中在根據本發明的組成物中的組分c)的比率較佳為1-40重量%，進一步較佳為3-15重量%，更佳為8-12重量%。

【第4項】如前述請求項中任一項之組成物，包含

a. 式(I)化合物

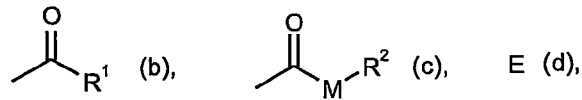


其中式(I)化合物具有下列定義：

W 為甲基，

X 為氯或甲基，

- Y 為氯、溴或甲基，
 A、B 與其所鍵結的碳原子為經伸烷基二氧基取代的飽和C₆-環烷基，其與其所鍵結的碳原子共同形成5-員或6-員縮酮，
 G 為氫(a)或下列群組之一者

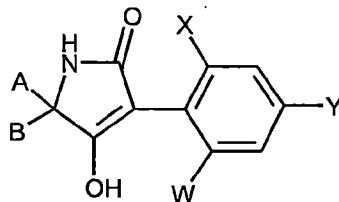


其中

- M 為氧，
 E 為一金屬離子等效物或銨離子，
 R¹ 為直鏈或支鏈的C₁-C₄-烷基，
 R² 為直鏈或支鏈的C₁-C₄-烷基，
- b. 至少一鹼(組分b)，其係選自包含LiOH、KOH與NaOH之群組，
 c. 至少一分散劑，其係選自木質素磺酸鹽及其鹽之群組，較佳由下列所組成：得自Borregaard之Borresperse NA、Borresperse 3A、Ultrazine NA、Ufoxane 3A、Vanisperse CB、Marasperse AG、MARASPERSE N 22、MARASPERSE C 21、MARASPERSE CBOS-4、WAFEX CA122 與 Borresperse CA；得自Ingevity之KRAFTSPERSE EDF-350、KRAFTSPERSE 25M、KRAFTSPERSE EDF-450、REAX 100M、REAX 83A、REAX 85A、REAX 88A、REAX 88B、REAX 907、REAX 910、POLYFON H、POLYFON O與POLYFON T；得自Tembec之AGRINOL DN 19與Agrinol C12，
 d. 至少一潤濕劑，其係選自於由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，例如，較佳選自於由下列所組成之群組：®Morwet EFW、二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽、®Aerosol OTB、與環氧丙烷與環氧乙烷在乙二胺上的嵌段聚合物、®Synperonic T 905，
 e. 視情況的至少一水溶性填充劑，以及

f. 另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【第5項】如前述請求項中任一項之組成物，包含選自下列化合物的式(I)化合物作為a)：



(I)

W	X	Y	A	B
CH ₃	CH ₃	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_2\text{-O} \end{array}$	
CH ₃	CH ₃	Cl	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_2\text{-O} \end{array}$	
CH ₃	CH ₃	Br	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_2\text{-O} \end{array}$	
CH ₃	CH ₃	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_3\text{-O} \end{array}$	
CH ₃	CH ₃	Cl	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_3\text{-O} \end{array}$	
CH ₃	CH ₃	Br	$\begin{array}{c} \text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-C-(CH}_2\text{)}_2\text{-} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{O-(CH}_2\text{)}_3\text{-O} \end{array}$	

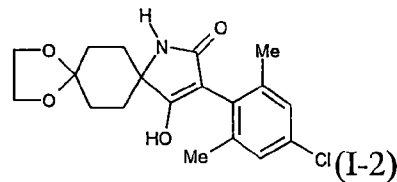
(I)

- b. 至少一鹼(組分b)，其係選自包含KOH與NaOH之群組，
- c. 至少一分散劑，其係選自由REAX 88B所組成的木質素磺酸鹽及其鹽之群組，
- d. 至少一潤濕劑，其係選自由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽與二辛基磺基琥珀酸的鈉鹽，

- e. 視情況的至少一水溶性填充劑，其係選自包含下列之群組：易溶的無機鹽、糖類與脲衍生物，以及
- f. 另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【第6項】如前述請求項中一或多項之組成物，包含

- a. 具有式(I-2)之化合物，具有下列結構：

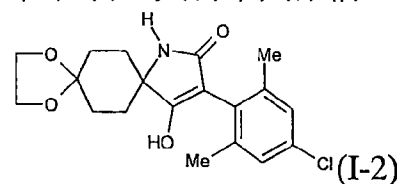


(I)

- b. KOH作為鹼(組分b)，
- c. 來自木質素磺酸鹽群組的REAX 88B (CAS No. 68512-34-5)作為鹼性分散劑，
- d. 潤濕劑，其係選自於由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，較佳為®Morwet EFW，
- e. 視情況的水溶性填充劑，其係選自包含糖類的群組，較佳為乳糖與麥芽糊精，更佳為乳糖，
- f. 另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【第7項】如前述請求項中一或多項之組成物，包含

- a. 具有式(I-2)之化合物，具有下列結構：



(I)

- b. KOH作為鹼(組分b)，
- c. 來自木質素磺酸鹽群組的REAX 88B (CAS No. 68512-34-5)作為鹼性分散劑，

- d. 潤濕劑，其係選自於由下列所組成之群組：烷基化萘磺酸鹽的鈉鹽，較佳為®Morwet EFW，
- e. 水溶性填充劑，其係選自包含糖類的群組，較佳為乳糖與麥芽糊精，更佳為乳糖，
- f. 視情況的另外的水溶性或液體活性成分和佐劑。

【第8項】如前述請求項中一或多項之組成物，其特徵在於活性成分對鹼(組分(a)對(b))的莫耳比例在0.7：1.0至1.0：0.7範圍內。

【第9項】如前述請求項中一或多項之組成物，其特徵在於活性成分對鹼(組分(a)對(b))的莫耳比例在1.0：1.0至1.0：0.9範圍內。

【第10項】如前述請求項中一或多項之組成物，其特徵在於組分a-f係以下列存在：

- a) 55-85重量%
- b) 10-30重量%
- c) 3-15重量%
- d) 1-3重量%
- e) 0-25重量%
- f) 0-10重量%。

【第11項】如前述請求項中一或多項之組成物，其特徵在於組分a-f係以下列存在：

- a) 55-80重量%
- b) 10-30重量%
- c) 3-15重量%
- d) 1-3重量%
- e) 0-20重量%
- f) 0.1-8重量%。

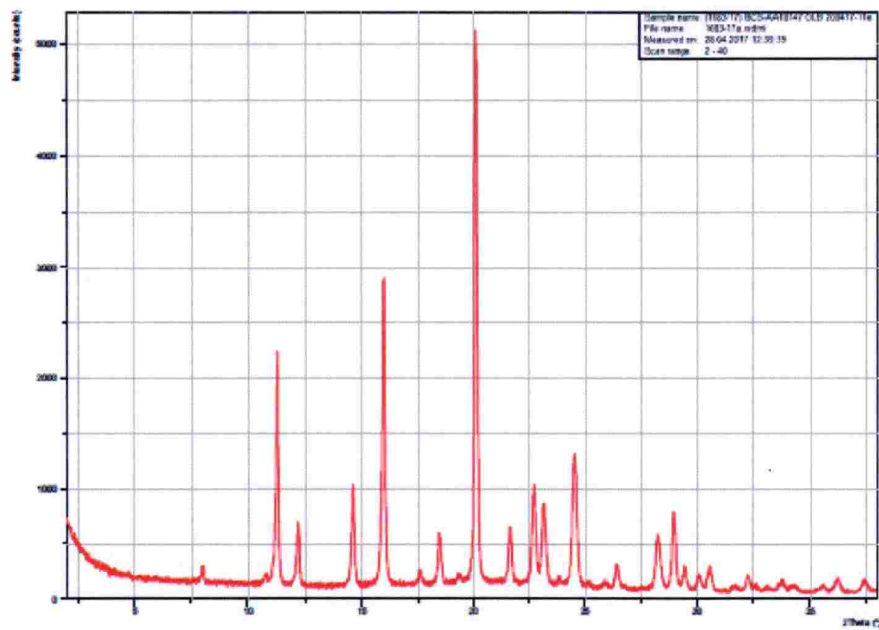
【第12項】一種用於製造如前述請求項中一或多項之組成物的方法，其特徵在於該調配是藉由將組分混合且隨後噴霧乾燥來進行。

【第13項】一種如請求項1至11中一或多項之組成物的用途，其係用於施用存在之活性農化成分至植物及/或其生境。

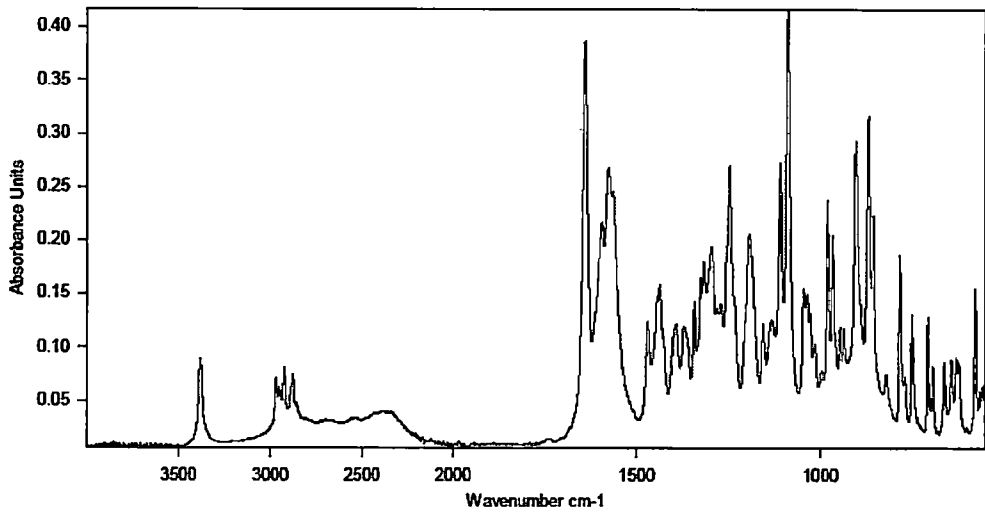
【第14項】一種產品，其特徵在於如請求項1至11中一或多項之組成物的含量。

【第15項】一種如請求項1至11中一或多項之組成物的用途，其係用於控制昆蟲。

【發明圖式】



【圖1】



【圖2】