



(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 I479993 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 04 月 11 日

(21)申請案號：100106786

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 03 月 02 日

(51)Int. Cl. : A01N25/24 (2006.01)

A01N25/26 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P13/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/03/02 英國

1003503.8

(71)申請人：龍燈農業化工國際有限公司 (香港地區) ROTAM AGROCHEM INTERNATIONAL CO. LTD. (HK)

香港

(72)發明人：布里斯拖 詹姆士 T BRISTOW, JAMES T. (GB)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希

(56)參考文獻：

US 2003224031A1

WO 2009/135492A2

審查人員：魏鳳鳳

申請專利範圍項數：24 項 圖式數：0 共 18 頁

(54)名稱

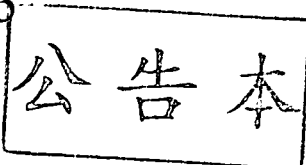
除草組合物及其應用方法

(57)摘要

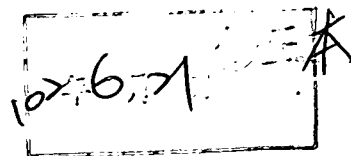
本發明公開了一種製備包含可滅蹤的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體和粘合劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(iv)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明提供了製備包含可滅蹤的製劑的另一種方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含、固體載體和分散劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(iv)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明還提供了製備包含可滅蹤的製劑的又一種方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體、粘合劑和分散劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；(iv)應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(v)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明還公開了通過所述方法製備的顆粒以及其在控制植物生長中的用途。

A method for preparing a formulation comprising clomazone is disclosed, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier and a binder to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a binder to coat the granules; and (iv) drying the thus coated granules. A further method for preparing a formulation comprising clomazone is provided, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier and a dispersant to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a dispersant to coat the granules; and (iv) drying the thus coated granules. A still further method for preparing a formulation comprising clomazone is provided, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier, a binder and a

dispersant to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a dispersant to coat the granules; (iv) applying a composition comprising a binder to coat the granules; and (v) drying the thus coated granules. Granules prepared by the methods and their use in controlling plant growth are also disclosed.



發明專利說明書



(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：100106186

※ 申請日：100.3.2

※ IPC 分類：A01N 25/24, 25/26, 43/80

一、發明名稱：(中文/英文)

A01P 13/00

除草組合物及其應用方法

二、中文發明摘要：

本發明公開了一種製備包含可滅蹤的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體和粘合劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(iv)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明提供了製備包含可滅蹤的製劑的另一種方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含、固體載體和分散劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(iv)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明還提供了製備包含可滅蹤的製劑的又一種方法，所述方法包括以下步驟：(i)將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體、粘合劑和分散劑的核心合併形成混合物；(ii)由所得混合物形成顆粒；(iii)應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；(iv)應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；以及(v)乾燥由此得到的經包裹的顆粒。本發明還公開了通過所述方法製備的顆粒以及其在控制植物生長中的用途。

三、英文發明摘要：

A method for preparing a formulation comprising clomazone is disclosed, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier and a binder to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a binder to coat the granules; and (iv) drying the thus coated granules. A further method for preparing a formulation comprising clomazone is provided, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier and a dispersant to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a dispersant to coat the granules; and (iv) drying the thus coated granules. A still further method for preparing a formulation comprising clomazone is provided, the method comprising the steps of (i) combining microcapsules having a polymer shell and a core comprising clomazone, a solid carrier, a binder and a dispersant to form a mixture; (ii) forming granules from the resulting mixture; (iii) applying a composition comprising a dispersant to coat the granules; (iv) applying a composition comprising a binder to coat the granules; and (v) drying the thus coated granules. Granules prepared by the methods and their use in controlling plant growth are also disclosed.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。

(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】

本發明涉及包含除草劑的組合物以及所述組合物的用途。具體而言，本發明涉及包含除草活性組分的擠出顆粒組合物，所述活性組分（尤其是某些異噁唑烷酮）。

【先前技術】

[01] 已知某些異噁唑烷酮有除草劑作用，並可用於控制不需要的植物生長。本領域已知的具有商業重要性的一種特定異噁唑烷酮是 2-(2-氯苯基)甲基-4,4-二甲基-3-異噁唑烷酮，下文中用其通用名可滅蹤（clomazone）表示。

[02] 某些異噁唑烷酮除草劑（尤其是可滅蹤）的問題來自於所述化合物相對高的揮發性。在這些活性成分的常規製劑中，所述化合物傾向於從施用所述製劑的表面快速氣化。氣化的活性成分易於從目標區域或位置漂移，導致所述目標區域外的植物可能受所述化合物帶來的不利影響。因此，需要避免揮發性活性化合物（如可滅蹤）的這種次級效應。

[03] 為了減少所述活性化合物的快速氣化，已知可以將可滅蹤包囊，尤其是將化合物的液體製劑包囊在聚合物中。在例如 US 4,405,357 中教導了這種可滅蹤的微膠囊化。微膠囊的使用允許活性成分保存在相對大的液滴中，並降低了施用後活性成分氣化的速率。這進而降低了所述活性成分對目標區域或位置外的植物的次級效應。

[04] 已經發現某些已知的微膠囊化形式的可滅蹤存在問題。具體而言，已經發現目標位置存在的顯著量的水分（例如在施用時由所存在的肥料吸收的水）可提高活性成分的揮發性，即使是在如上所述的微膠囊化時。

[05] 在 US 6,797,277 中論述了這個問題，其提出了用於遞送相對高揮發性的活性化合物（尤其是可滅蹤）的擠出顆粒製劑。具體而言，US 6,797,277 提出了一種用於將農業化合物（尤其是可滅蹤）遞送到作物的製備擠出顆粒的方法，其中將可滅蹤與固體載體混合形成混合組合物，將其通過沖模擠出而形成顆粒。可滅蹤可以微膠囊化或可以不微膠囊化。公開的合適固體載體是矽酸鋁、高嶺土（kaolin）、蒙脫石（montmorillinite）、矽鎂土、黑陶土（Black Charm clay）、膨潤土、玉米芯、沙、造紙殘渣吸附微粒（biodac）、澱粉基質（starch matrix）、流體土碳（fluid earth carbon）、

活性碳或其他固體稀釋劑。矽酸鋁是優選的固體載體。所述顆粒可以包含粘合劑。所述粘合劑可以在擠出前包含在含有可滅蹤和載體的組合物中。或者，可以在擠出後將所述粘合劑施用至顆粒，例如通過噴塗（spray coating）的方式。所述粘合劑可以是木質素磺酸鹽、糖漿、多糖、甲基纖維素、丙烯酸類聚合物、膨潤土、煉脂油或水溶膠。而且，所述顆粒還可以包含分散劑。所述分散劑（如果存在）可以在擠出前包含在所述組合物中。或者，所述分散劑可以在擠出後施加於所述顆粒，例如通過噴塗。所述分散劑可以是木質素磺酸鹽、冷凝的萘磺酸鹽、膨脹的膨潤土和酸/堿泡騰系統。US 6, 797, 277 似乎傾向於使用木質素磺酸鹽作為粘合劑和分散劑。

[06] US 6, 797, 277 公開的實際組合物的唯一實例包含矽酸鋁粘土固體載體、微膠囊化的可滅蹤、木質素磺酸鹽粘合劑、木質素磺酸鹽分散劑和水。所述顆粒組合物描述為通過將微膠囊化的可滅蹤噴灑到粘土上并混合而形成均一混合物來製備。將得到的混合物擠出以形成顆粒。將所得顆粒用粘合劑和分散劑的溶液包裹。最後，將顆粒乾燥至水分含量為 5% 至 6%。

【發明內容】

[07] 需要一種改進的異噁唑烷酮（尤其是可滅蹤）製劑來應對活性成分高揮發性的問題，同時避免與顆粒製劑相關的問題，比如在製造、運輸和使用期間由於顆粒磨擦而造成的細粉或粉末形成。

[08] 根據本發明的第一方面，提供了一種製備包含可滅蹤的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：

將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體和粘合劑的核心合併形成混合物；

由所得混合物形成顆粒；

應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；以及

乾燥由此得到的經包裹的顆粒。

[09] 本發明該方面的方法提供了改進的可滅蹤顆粒製劑，其特別穩定，更耐磨損，同時在製劑施用到某位置後可有效遞送活性成分至目標植物，且活性成分到施用位置外植物的漂移最少。

[10] 所述方法包括形成微膠囊化的可滅蹤（在下文中詳述）、固體載體和粘合劑的混合物。所述固體載體可以是易形成顆粒（尤其是通過擠出形成）

的任何合適材料，並且施用製成的製劑時，其可以施用於某位置處的植物。所述固體載體通常是惰性的，即不對可滅蹤的活性或製成顆粒中的其他組分的作用產生不利影響。合適的固體載體包括含有一種或更多種金屬鹽的組合物，所述金屬鹽尤其是指元素週期表中 IA、IIA 和 IIIA 族的金屬的鹽。所述載體還可以包含過渡金屬鹽。優選的金屬鹽包括鈣、鎂和鋁的金屬鹽。可以使用任何適合的鹽，尤其是氧化物、碳酸鹽、硫酸鹽和矽酸鹽。合適的載體材料包括粘土，如高嶺石、綠土 (smectite)、蒙脫石、膨潤土、綠泥石、海泡石和凹凸棒石 (atapulgitite)。這些和其他合適的固體載體是本領域已知的並且通常可購得。

[11] 所述固體載體可以以任何合適的量存在，尤其是占終產物重量的 20% 至 98%，優選按重量計占製成顆粒的 40% 至 95%，更優選 50% 至 90%。

[12] 所述混合物還包含一種或更多種粘合劑。所述粘合劑用於粘附或結合終產物中存在的固體微粒，並為顆粒提供整合性，防止它們破裂等。粘合劑可以是任何適合物質，並且適合的粘合劑材料為本領域已知而且可購得。適合的粘合劑包括麵粉、澱粉、樹膠、醇、脂質、纖維素衍生物、藻酸鹽和木材提取物，如木質素和木質素衍生物（如木質素磺酸鹽）。

[13] 粘合劑以足夠的量存在於混合物中以便為擠出顆粒提供整合性，並且所述量根據所用粘合劑的性質而不同。通常，最終顆粒產物中存在的粘合劑的量為按重量計 0.2 至 15%，優選按重量計 0.5 至 10%，更優選按重量計 1 至 5%。

[14] 根據待制入顆粒的混合物的其他組分的組成和特性以及造粒方法，所述混合物還可包含溶劑。合適的溶劑包括有機和無機液體。水是特別方便的溶劑。其他合適的溶劑包括有機液體（例如醇）、芳族溶劑等。同樣，合適的溶劑是本領域中已知的並且可以購得。

[15] 混合物中存在的溶劑的量取決於其他組分的特性和組成。例如，可滅蹤的某些微膠囊化製劑包含微膠囊在溶劑中的懸液，尤其是水懸液。因此，溶劑通過所用的可滅蹤製劑提供給所述混合物。溶劑應當以合適的量存在以允許混合物形成顆粒（例如通過擠出），尤其是占混合物重量的 1% 至 20%，優選按重量計 2% 至 10%，更優選按重量計 2% 至 5%。

[16] 待擠出的混合物可以由微膠囊化的可滅蹤、一種或更多種固體載體以及一種或更多種粘合劑組成。然而，混合物可以包含其他組分。具體而言，待擠出的混合物可以包含一種或更多種分散劑。提供分散劑以當其被遞送

至所處理位置并與水接觸以釋放活性成分時，提高顆粒崩解的速率。分散劑可以包含陰離子分散劑材料、非離子性分散劑材料、或此二者的混合物。用於摻入到顆粒中的合適分散劑是本領域中已知的並且可以購得。合適分散劑的實例包括磺化和非磺化的木質素聚合物、磺化萘化合物和丙烯酸鹽。磺化木質素分散劑是首選的陰離子分散劑材料。首選的非離子性分散劑是磺化萘。

[17] 如存在分散劑，混合物可以包含任何合適量的分散劑以保證施用時顆粒的充分崩解，尤其是占製成顆粒重量的 0.5%至 20%，首選按重量計 1%至 15%，更首選按重量計 2%至 10%。

[18] 混合物的組分可以按任何順序組合並混合。用於混合組分的合適技術和用於進行所述混合的設備是本領域中已知的，合適的儀器可以購得。此外，或作為替換方案，組分可以作為將混合物製成顆粒之過程的作用結果而被混合。在一個實施方案中，如下所述，通過擠出使混合物形成顆粒，在此情況下可以將組分直接加至擠出器的入口或進料斗，在擠出過程中進行混合。

[19] 在本發明方法的以下步驟中，將上述混合物製成顆粒。所述顆粒可以通過任何合適的技術形成。合適的技術是本領域中已知的並包括造粒、壓制、噴霧乾燥、流化床附聚和擠出。擠出是使混合物形成顆粒的特別首選的方式。合適的擠出技術和設備是本領域中眾所周知的，並且所述儀器可以購得。

[20] 一旦形成顆粒，通過向顆粒外部施加另外的粘合劑來處理顆粒。所述粘合劑可以含有與起始混合物所含的粘合劑相同或不同的物質。合適的粘合劑材料如上所述。可以通過任何合適的方式將粘合劑施加到顆粒上。首選地，所述粘合劑作為所述粘合劑材料在溶劑中的溶液、懸液或漿的形式形成。所述溶劑最首選為水。顆粒可以通過任何合適的方式與粘合劑的溶液、懸液或漿相接觸。向顆粒外表面施加另外的粘合劑材料的特別首選的方式是噴灑。

[21] 在本步驟中施加到顆粒上的粘合劑材料的量取決於以下因素，即存在於用於製備顆粒的起始混合物中的粘合劑的量，以及存在於製成顆粒中的粘合劑的最終量。在本步驟中使用的顆粒總粘合劑含量的比例可以是按重量計的 5%至 75%，首選 10%至 60%，更首選 20%至 50%。

[22] 作為在用於形成顆粒的混合物中加入分散劑或另外加入分散劑的替換

方案，可以在顆粒的外表面另外施加分散劑。所述另外的分散劑可以與粘合劑一起或作為單獨步驟施加。合適的分散劑材料如上所述。在本步驟中施加於顆粒的分散劑可以與用於形成顆粒的混合物中存在的任何分散劑相同或不同。可以通過任何合適的方式將分散劑施加到顆粒上。優選地，所述分散劑作為所述分散劑材料在合適溶劑中的溶液、懸液或漿的形式而形成。所述溶劑最優選為水。可以通過任何合適的方式將所述顆粒與分散劑的溶液、懸液或漿接觸。噴灑是對顆粒外表面施加額外分散劑材料的特別優選的方式。

[23] 在本步驟中施加於顆粒的分散劑材料的量取決於以下因素，即存在於用於製備顆粒的起始混合物中的分散劑的量，以及分散劑在製成顆粒中所存在的最終量。在本步驟中使用的總分散劑含量占顆粒的比例可以是按重量計的 0% 至 100%，尤其是 5% 至 75%，優選 10% 至 60%，更優選 20% 至 50%。

[24] 在用另外的粘合劑和任何分散劑（如果採用）包裹後，將所得顆粒乾燥（如果需要），以將顆粒中存在的任何溶劑去除至合適的水平。用於乾燥顆粒的合適技術和乾燥設備是本領域中已知的，並且合適的乾燥儀器可以購得。可以將顆粒乾燥以將溶劑去除到合適的量，尤其是提供溶劑含量按重量計為 0.5% 至 15%、更優選按重量計為 1% 至 10% 的所述製成顆粒。

[25] 如以上指出的，通過本發明方法製備的顆粒最優選包含分散劑。還如以上指出的，分散劑可以包含在用於製備顆粒的起始混合物中。然而，已經發現將分散劑加至起始混合物和顆粒（一旦它們已經形成）的做法尤其有利。

【實施方式】

[26] 因此，在又一方面，本發明提供了製備包含可滅蹤的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：

將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體和分散劑的核心合併形成混合物；

由所得混合物形成顆粒；

應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；以及

乾燥由此得到的經包裹的顆粒。

[27] 本發明該方面的方法提供了可滅蹤的改進的顆粒製劑，即特別穩定，並且在將所述製劑施用於位置或可更有效遞送活性成分至目標植物，同時

活性成分到施用位置外植物的漂移最少。

[28] 所述方法包括形成微膠囊化的可滅蹤（在下文中更詳細的描述）、固體載體和分散劑的混合物。所述固體載體可以是如上所述的易形成顆粒（尤其是通過擠出形成）的任何合適材料。

[29] 所述固體載體可以以任何合適的量存在，尤其是占終產物重量的 20% 至 98%，優選按重量計占製成顆粒的 40%至 95%，更優選 50%至 90%。

[30] 混合物還可以包含分散劑。提供分散劑以當其被遞送至所處理位置並與水接觸以釋放活性成分時，提高顆粒崩解的速率。分散劑可以包含陰離子分散劑材料、非離子性分散劑材料或此二者的混合物。用於加入到顆粒中的合適的分散劑是本領域中已知的並如上描述。

[31] 混合物包含任何合適量的分散劑以保證施用時顆粒的充分崩解，尤其是占製成顆粒重量的 0.5%至 20%，優選按重量計 1%至 15%，更優選按重量計 2%至 10%。

[32] 待擠出的混合物可以由微膠囊化的可滅蹤、一種或更多種固體載體、以及一種或更多種分散劑組成。然而，所述混合物可以包含其他組分。具體而言，待擠出的混合物可以包含一種或更多種粘合劑。粘合劑用於粘附或結合存在於終產物中的固體微粒並提供顆粒的整合性，防止它們破碎等。粘合劑可以是任何合適的物質，合適的粘合劑材料如上所述。

[33] 如果存在粘合劑，則混合物中粘合劑的量足以為擠出顆粒提供整合性，並且所述量根據所用粘合劑的性質而不同。通常，存在於最終顆粒產物中的粘合劑的量為按重量計的 0.2 至 15%，優選按重量計 0.5 至 10%，更優選按重量計 1 至 5%。

[34] 根據要製成顆粒的混合物的其他組分的組成和特性以及造粒方法，所述混合物還可包含溶劑。合適的溶劑如上所述。

[35] 溶劑應以合適的量存在以允許混合物形成顆粒（例如通過擠出），尤其是占混合物重量的 1%至 20%，優選按重量計 2%至 10%，更優選按重量計 2%至 5%。

[36] 混合物的組分可以按任何順序組合併混合。混合組分的合適的技術和進行所述混合的設備是本領域中已知的，並且合適的儀器可以購得。此外，或者作為替換方案，所述組分可以作為將混合物製成顆粒之過程的作用結果而被混合。在一個實施方案中，如下所述，通過擠出將混合物製成顆粒，在此情況下可以將組分直接加至擠出器的入口或進料斗，在擠出過程中進

行混合。

[37] 在本發明該方面方法的以下步驟中，將上述混合物製成顆粒。顆粒可以通過任何合適的技術形成。合適的技術是本領域中已知的并包括造粒、壓制、噴霧乾燥、流化床附聚和擠出。擠出是使混合物形成顆粒的特別優選的方式。合適的擠出技術和設備是本領域已知的，並且所述設備可以購得。

[38] 顆粒形成後，通過向顆粒外部施加另外的分散劑來處理顆粒。所述分散劑可以含有與起始混合物中所含分散劑相同或不同的物質。合適的分散劑材料如上所述。可以通過任何合適的方式將分散劑施加到顆粒上。優選地，分散劑作為所述分散劑材料在合適溶劑中的溶液、懸液或漿的形式形成。所述溶劑最優選水。顆粒可以通過任何合適的方式與分散劑的溶液、懸液或漿接觸。噴灑是向顆粒外表面施加額外粘合劑材料的特別優選的方式。

[39] 在本步驟中施加於顆粒的分散劑材料的量取決於諸如以下的因素：存在於用於製備顆粒的起始混合物中分散劑的量，以及存在於製成顆粒中的分散劑的總量。在本步驟中使用的顆粒的總分散劑含量的比例可以是按重量計的 5%至 75%，優選 10%至 60%，更優選 20%至 50%。

[40] 作為在用於形成顆粒的混合物中所包含的粘合劑或在另外向所述混合物中加入粘合劑的替換方案，可以在顆粒的外表面另外施加粘合劑。所述另外的粘合劑可以與分散劑一起或作為單獨的步驟施加。合適的粘合劑材料如上所述。在本步驟中施加到顆粒的粘合劑可以與用於形成顆粒的混合物中存在的任何粘合劑相同或不同。可以通過任何適合方式將粘合劑施加到顆粒上。優選地，粘合劑作為所述粘合劑材料在合適溶劑中的溶液、懸液或漿的形式形成。所述溶劑最優選為水。可以通過任何合適方式將顆粒與粘合劑的溶液、懸液或漿接觸。噴灑是向顆粒外表面施加額外粘合劑材料的特別優選的方式。

[41] 在本步驟中施加於顆粒的粘合劑材料的量取決於諸如以下的因素：存在於用於製備顆粒的起始混合物中粘合劑的量，以及存在於製成顆粒中的粘合劑的總量。在本步驟中使用的顆粒的總粘合劑含量的比例可以是按重量計的 0%至 100%，尤其是 5%至 75%，優選 10%至 60%，更優選 20%至 50%。

[42] 在用另外的分散劑（以及任選地另外的粘合劑材料）包裹後，將所得顆粒乾燥（如果需要），以將顆粒中存在的任何溶劑去除到合適的水平。乾

燥顆粒的合適技術和乾燥設備是本領域中已知的，並且合適的乾燥設備可以購得。可以將顆粒乾燥以將溶劑去除到合適的量，尤其是提供溶劑含量按重量計為 0.5%至 15%、更優選按重量計為 1%至 10%的所述製成顆粒。

[43] 如上所述，在兩步中向顆粒提供粘合劑和分散劑可以是有利的，即首先在形成顆粒前在混合物中包含所述物質，然後對顆粒的外表面施加另外的物質。

[44] 因此，在另一個方面，本發明提供了一種製備包含可滅蹤的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：

將具有聚合物殼的微膠囊與包含可滅蹤、固體載體、粘合劑和分散劑的核心合併形成混合物；

由所得混合物形成顆粒；

應用包含分散劑的組合物以包裹所述顆粒；

應用包含粘合劑的組合物以包裹所述顆粒；並且

乾燥由此得到的經包裹的顆粒。

[45] 本發明該方面的方法提供了一種改進的可滅蹤顆粒製劑，其特別穩定，耐磨損且對粉塵和細粉形成有抗性，將製劑到位置後可更有效遞送活性成分至目標植物，並且活性成分到施用位置外植物的漂移最少。

[46] 關於顆粒構成組分和製備顆粒的方法的詳細情況如上文所述。如所指出的，顆粒製成後就在其外表面施加另外的粘合劑材料和另外的分散劑材料。所述另外的粘合劑和分散劑可以在一個步驟中施加或者在分別的顆粒處理中施加。

[47] 按照本發明方法製備的顆粒包含可滅蹤作為活性成分，尤其是微膠囊形式的可滅蹤。包含微膠囊化活性農業化學物組分（尤其是可滅蹤）的製劑是本領域中已知並且可以購得。微膠囊化的可滅蹤包含具有聚合物殼的微膠囊和核心，核心包含可滅蹤，以及任選地一種或更多種其他組分，如在農業化學物製劑中通常採用的溶劑和其他輔助劑（adjuvant）或賦形劑。聚合物殼可以是任何合適的聚合物物質，並且通過任何合適的方法形成微膠囊。優選地，用介面聚合技術形成聚合物殼。聚合物的合適實例包括聚酰胺、聚酯、聚氨酯和聚脲。聚合物優選為聚脲，尤其是一種或更多種異氰酸酯化合物與一種或更多種胺化合物反應形成的聚脲。這些反應是本領域已知的，並且所述反應物是已知的并可以購得。

[48] 適用於製備用於包含在本發明顆粒中的可滅蹤的微膠囊化的實例公開於 EP 0 719 087、EP 0 792 100、EP 0 854 675、EP 1 104 991、EP 1 164 849、EP 1 404 176、EP 1 928 593、EP 2 133 140、WO 01/24631、WO 03/099005、WO 96/22159、WO 2007/072046、WO 2007/101019、WO 2009/00545 和 WO 2009/086914。

[49] 除以上討論的那些外，通過本發明方法製備的顆粒還可以包含其他組分。這些組分的實例包括那些通常包含在農業化學物製劑（尤其是顆粒農業化學物製劑）中的組分，並包含一種或更多種選自以下的組分：殺蟲劑、輔劑和活性改良劑，包括活性成分的安全劑（safener）和協同劑（synergising agent）。這些組分可以購得並且它們的用途是本領域中已知的。另外的組分可以在製備方法中的任何步驟加入到顆粒中。具體而言，可將上述另外的組分在單獨或分別的處理中加入起始混合物中和/或在顆粒形成後施加於顆粒，如上所述。

[50] 如所指出的，可滅蹤是通過本發明方法製備的製劑中的一種活性成分。製成的顆粒可以包含可滅蹤作為唯一的活性組分。或者，所述製成顆粒可以包含一種或更多種另外的殺蟲活性組分，包括一種或更多種殺菌劑、殺蟲劑和/或除草劑。所述另外的活性組分（如果存在）可以包含在用於製備顆粒的起始混合物中和/或在製備後施加於顆粒。所述另外的活性組分可以在微膠囊中和可滅蹤一起存在，和/或存在於顆粒的體相（bulk phase）或連續相中。

[51] 本發明還提供了一種顆粒組合物，其包含通過上述方法可獲得的農業化學活性組分，尤其是可滅蹤。

[52] 此外，本發明還提供了通過本發明方法製備的顆粒在處理不需要的植物生長中的用途。

[53] 此外，本發明還提供了一種在某位置處理植物生長的方法，所述方法包括向所述位置施用通過本發明方法製備的顆粒。

[54] 通過以下實施例進一步舉例說明本發明。除非另外指明，否則在實施例中指出的百分比均基於製成顆粒的重量。

實施例 1

[55] 製劑 A 的顆粒具有以下組成：

矽酸鋁（載體）	82%
---------	-----

微膠囊化可滅蹤（活性成分）	14%
磺化木質素（粘合劑）	1.5%
萘磺酸鈉（分散劑）	2%
水	0.5%

[56] 所述微膠囊化異可滅蹤是包含具有聚脲殼（通過聚異氰酸酯與聚胺的介面縮合聚合制得）的微膠囊的製劑並且含有按重量計 25%的可滅蹤，按重量計 7%的聚合物，餘下的部分是惰性有機溶劑。

[57] 製備製劑 A 的顆粒的方法如下：

將矽酸鋁、微膠囊化可滅蹤和 50%的粘合劑材料合併形成混合物。在混合物中加入足夠的水以使混合物能夠被擠出。將混合物加入螺旋擠出機的進料口并通過板擠出以形成標稱粒徑為 3mm 的顆粒。通過噴霧將剩餘粘合劑材料和分散劑的水懸液施加於顆粒，以均勻包裹顆粒的外表面。此後，在烘箱中乾燥所得顆粒以除去多餘的水。

[58] 所述顆粒耐摩擦性高並且粉塵和細粉形成少。當施用於某位置的植物時，所述顆粒在與水接觸後釋放可滅蹤，而漂移到目標位置外的可滅蹤最少。

實施例 2

[59] 製劑 B 的顆粒具有以下組成：

矽酸鋁（載體）	81%
微膠囊化可滅蹤（活性成分）	14%
磺化木質素（粘合劑）	1.5%
萘磺酸鈉（分散劑）	2%
水	1.5%

[60] 所述微膠囊化可滅蹤是包含具有聚脲殼（通過聚異氰酸酯與聚胺的介面縮合聚合而制得）的微膠囊的製劑並且含有按重量計 25%的可滅蹤，按重量計 7%的聚合物，餘下的部分是惰性有機溶劑。

[61] 製備製劑 B 的顆粒的方法如下：

將矽酸鋁、微膠囊化可滅蹤和 50%的分散劑材料合併形成混合物。在混合物中加入足夠的水以使混合物能夠被擠出。將混合物加入螺旋擠出機的進料口并通過板擠出以形成標稱粒徑為 3mm 的顆粒。通過噴霧將剩餘分散劑材料和粘合劑的水懸液施加於顆粒，以均勻包裹顆粒的外表面。此後，在烘箱中乾燥所得顆粒以除去多餘的水。

[62] 所述顆粒耐摩擦性高並且粉塵和細粉形成少。當施用於某位置的植物時，所述顆粒在與水接觸後釋放可滅蹤，而漂移到目標位置外的可滅蹤最少。

實施例 3

[63] 製劑 C 的顆粒具有以下組成：

矽酸鋁（載體）	79.5%
微膠囊化可滅蹤（活性成分）	16%
磺化木質素（粘合劑）	2%
萘磺酸鈉（分散劑）	2%
水	0.5%

[64] 所述微膠囊化可滅蹤是包含具有聚脲殼（通過聚異氰酸酯與聚胺的介面縮合聚合而制得）的微膠囊的製劑並且含有按重量計 25%的可滅蹤，按重量計 7%的聚合物，餘下的部分是惰性有機溶劑。

[65] 製備製劑 C 的顆粒的方法如下：

將矽酸鋁、微膠囊化可滅蹤、50%的粘合劑材料以及 50%的分散劑材料合併形成混合物。在混合物中加入足夠的水以使混合物能夠被擠出。將混合物加入螺旋擠出機的進料口并通過板擠出以形成標稱粒徑為 3mm 的顆粒。通過噴霧將剩餘粘合劑材料和剩餘的分散劑的水懸液施加於顆粒，以均勻包裹顆粒的外表面。此後，在烘箱中乾燥所得顆粒以除去多餘的水。

[66] 所述顆粒耐摩擦性高並且粉塵和細粉形成少。當施用於某位置的植物時，所述顆粒在與水接觸後釋放可滅蹤，而漂移到目標位置外的可滅蹤最少。

【圖式簡單說明】

【主要元件符號說明】

七、申請專利範圍：

1. 一種製備包含可滅蹤(clomazone)的製劑的方法，所述方法包括以下步驟：
 - (i) 將具有聚合物殼和包含可滅蹤之核心的微膠囊、固體載體、以及粘合劑和/或分散劑合併形成混合物；
 - (ii) 由所得混合物形成顆粒；
 - (iii) 應用包含粘合劑和/或分散劑的組合物以包裹(ii)之形成顆粒；以及
 - (iv) 乾燥由(iii)得到的經包裹的顆粒。
2. 如申請專利範圍第 1 項所述的方法，其中所述載體包括金屬鹽。
3. 如申請專利範圍第 2 項所述的方法，其中所述金屬鹽是元素週期表中 IA、IIA 或 IIIA 族的金屬的鹽。
4. 如申請專利範圍第 3 項所述的方法，其中所述金屬鹽是鈣、鎂或鋁的鹽。
5. 如申請專利範圍第 2 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述金屬鹽是氧化物、碳酸鹽、硫酸鹽或矽酸鹽。
6. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述載體是粘土。
7. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述載體在步驟(i)中提供，其量占所完成顆粒重量的 20%至 98%。
8. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述分散劑選自磺化和非磺化的木質素聚合物、磺化萘化合物和聚丙烯酸鹽。

9. 如申請專利範圍第 8 項所述的方法，其中所述分散劑是磺化木質素或萘磺酸鹽。
10. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述完成顆粒包含按重量計 0.5% 至 20% 的分散劑。
11. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述粘合劑包含選自以下的材料：麵粉、澱粉、樹膠、醇、脂質、纖維素衍生物、藻酸鹽、木材提取物、木質素和木質素衍生物。
12. 如申請專利範圍第 11 項所述的方法，其中所述粘合劑是木質素磺酸鹽。
13. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述粘合劑以所述完成顆粒重量的 0.2% 至 15% 的量存在。
14. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中在步驟(i)中形成的所述混合物還包含溶劑。
15. 如申請專利範圍第 14 項所述的方法，其中所述溶劑是水。
16. 如申請專利範圍第 1 至 4 項所述之任一項的方法，其中所述顆粒通過包括造粒、壓制、噴霧乾燥、流化床附聚或擠出的方法在步驟(ii)中形成。
17. 如申請專利範圍第 16 項所述的方法，其中所述顆粒通過擠出所述混合物而形成。
18. 如申請專利範圍第 1 至 4 項任一項的方法，其中在步驟(iii)中將所述顆粒用在溶劑中包含所述粘合劑和/或分散劑材料的溶液、漿或懸

液進行處理。

19. 如申請專利範圍第 18 項的方法，其中所述溶劑是水。
20. 如申請專利範圍第 1 至 4 任一項的方法，其中在步驟(iii)中施加於所述顆粒的所述分散劑與步驟(i)中所述混合物中包含的所述分散劑相同。
21. 如申請專利範圍第 1 至 4 項任一項的方法，其中在步驟(iii)中應用所述完成顆粒的總分散劑含量的 5%至 75%。
22. 如申請專利範圍第 1 至 4 項任一項的方法，其中在步驟(iii)中施加於所述顆粒的所述粘合劑與步驟(i)中所述混合物中包含的所述粘合劑相同。
23. 如申請專利範圍第 1 至 4 項任一項的方法，其中在步驟(iii)中提供存於所述完成顆粒中的以重量計為 5%至 75%的粘合劑。
24. 如申請專利範圍第 1 至 4 項任一項的方法，其中將所述顆粒在步驟(iv)中乾燥以提供按重量計溶劑含量 0.5%至 15%的所述完成顆粒。