



〔12〕发明专利申请公开说明书

〔21〕 申请号 89108601.3

〔51〕 Int.Cl⁵

A01N 25/28

〔43〕 公开日 1990年6月6日

〔22〕申请日 89.11.18

〔30〕优先权

〔32〕88.11.18 〔33〕GB 〔31〕8827029.3

〔71〕申请人 帝国化学工业公司

地址 英国英格兰伦敦

〔72〕发明人 戴维·约瑟夫·布朗

戈登·詹姆斯·马斯

〔74〕专利代理机构 中国专利代理有限公司

代理人 姜建成 罗 宏

说明书页数: 8

附图页数:

〔54〕发明名称 杀虫剂组合物

〔57〕摘要

本发明提供一种适于作为浓缩物而用于制备叶片喷雾剂的杀蚜剂组合物,其特征在于,该组合物是一种缓释微囊悬浮剂,其中含有作为活性成分而微囊包封在悬浮的聚脲或聚硅氧烷颗粒中的一种杀蚜剂。本发明还提供制备这些组合物的方法和它们在防治植物的蚜虫侵染中的使用方法。

权 利 要 求 书

1. 一种适于用来制备叶片喷雾剂的浓缩物形式的杀蚜剂组合物，其特征在于，该组合物是一种缓释微囊悬浮剂，其中含有作为活性成分而微囊包封在悬浮的聚脲或聚硅氧烷颗粒中的抗蚜威。

2. 一种适于用来制备叶片喷雾剂的浓缩物形式的杀蚜剂组合物，其特征在于，该组合物是一种缓释微囊悬浮剂，其中含有作为活性成分而微囊包封在悬浮的聚脲或聚硅氧烷颗粒中的一种杀蚜剂，所述杀蚜剂选自乐果、甲基—〇五九、庚烯磷、1—(二甲基氨基甲酰基)—3—叔丁基—5—乙氧羰基甲硫基—1H—1, 2, 4—三唑、高灭磷、tefluthrin、chlorpyrifos、久效磷、杀螟松、灭多虫、砒吸磷、氧化乐果、甲基磷、乙基磷、三唑磷、profenofos、二氯苯醚菊酯、腈二氯苯醚菊酯、 λ -cyhalothrin、灭蚜松和伏杀磷。

3. 一种如权利要求 1 或 2 所述的杀蚜剂组合物，其特征在于，活性成分的含量为 5—85 %。

4. 一种制备缓释微囊悬浮剂形式的杀蚜剂组合物的方法，该方法包括，在含有一种杀蚜剂的乳液中，使一种或多种单体界面聚合，形成悬浮的聚合物颗粒，颗粒中微囊包封有该杀蚜剂；所述杀蚜剂选自抗蚜威、乐果、甲基—〇五九、庚烯磷、1—(二甲基氨基甲酰基)—3—叔丁基—5—乙氧羰基甲硫基—1H—1, 2, 4—三唑、高灭磷、tefluthrin、chlorpyrifos、久效磷、杀螟松、灭多虫、砒吸磷、

氧化乐果、甲基磷、乙基磷、三唑磷、profenofos、二氯苯醚菊酯、腈二氯苯醚菊酯、 λ -cyhalothrin、灭蚜松和伏杀磷。

5. 一种如权利要求4所述的方法，其特征在于，单体的聚合反应形成微囊包封有杀蚜剂的聚脲颗粒。

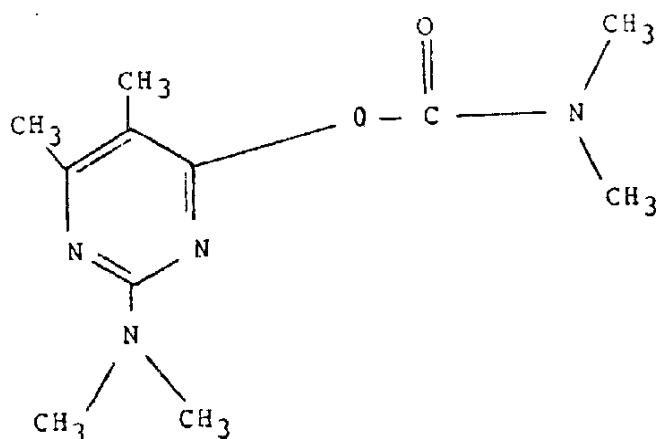
6. 一种如权利要求4所述的方法，其特征在于，单体的聚合反应形成微囊包封有杀蚜剂的聚硅氧烷颗粒。

7. 一种防治植物的蚜虫侵染的方法，该方法包括，向植物的叶簇或植物生长介质中施用杀虫有效量的一种含水组合物，该组合物是由如权利要求1至3中任一项所述的杀蚜剂组合物经水稀释而制得的。

杀虫剂组合物

本申请涉及某些含有抗蚜威的杀虫剂组合物，这些组合物适于作为浓缩物而用于制备供叶片施用的含水喷雾剂，并能提高抗蚜威在目标作物上的持久性。

英国专利说明书 1,181,657 叙述了某些具有选择性杀蚜活性的嘧啶衍生物。英国专利 1,181,657 所公开的一种特殊化合物具有如下的化学结构，俗名叫做抗蚜威。



抗蚜威是一种作用迅速的氨基甲酸酯类杀蚜剂，它能够通过熏蒸作用而呈现出迅速的初始击倒效应，因而被广泛用来对谷类和蔬菜作物、甜菜和果树树冠中的蚜虫进行有效的控制。抗蚜威能迅速控

制蚜类害虫，使虫害迅速清除，并防止目标作物上由蚜虫携带的病毒性病害的传播。传统供应的抗蚜威的形态，是适于以水稀释而作为叶片喷雾剂施用的浓缩物。在《GIFAP杀虫剂剂型和国际编号系统目录》中，在“适于以水稀释的浓缩物”标题下列的任一种剂型，都适于以上述方式叶片施用抗蚜威。已证明有效的组合物的例子有：固体组合物，如可湿性粉剂（WP）和水分散性颗粒（WG）；以及液体组合物，如乳油（EC）、悬浮浓缩剂（SC）和微囊悬浮剂（CS）。

在多数情况下，这些传统组合物都能够令人满意地对蚜类害虫产生迅速的控制作用，但传统剂型造成化合物在目标作物上的持久性很低，因而有可能导致再侵染，从而需要进一步施药以产生持续的控制作用。

我们现已研究出抗蚜威的悬浮剂组合物，这些组合物适于作为浓缩物而用于制备叶片施用的水喷雾剂，组合物中含有能提高化合物在目标作物上的持久性的添加剂，从而防止蚜类害虫的再侵染，但这些组合物意外地保持了传统组合物所具有的快速初始击倒和控制作用。

因此，本发明提供了一种适于作为浓缩物而用于制备叶片喷雾剂的杀蚜剂组合物，其特征在于，该组合物是一种缓释型微囊悬浮剂，其中含有作为活性成分而被微囊包封在悬浮的聚脲或聚硅氧烷颗粒中的抗蚜威。

本发明的缓释组合物对与农业或园艺有关的蚜类害虫有毒，因而可用于控制这些害虫。它们特别可用于控制棉花、谷类作物、蔬菜作物、甜菜和果树树冠的蚜类害虫，例如棉蚜、麦长管蚜、桃蚜、

豆卫矛蚜和苹果绵蚜。它们还特别可用于防止蚜虫携带的病毒的传播，例如甜菜的黄化病毒、谷类的大麦黄矮病病毒、马铃薯的马铃薯卷叶病毒。使用时，把这些组合物用水稀释，形成含水制剂，这些制剂能在足够长的时间内保持均相，使它们能够用常规喷雾器施用于害虫、害虫场所、害虫栖息地、或已被害虫侵染或易受害虫侵染的种植植物、或种植植物的介质。这些组合物中抗蚜威的含量可以为 5% 至 85% (重量)，最好为 10% 至 20%。在稀释成含水制剂后，这些制剂的活性成分含量可以不同，取决于它们的使用目的。对农业和园艺目的来说，特别适用的是含 0.0001% 至 0.1% 抗蚜威的含水制剂。

本发明的组合物还适于在制备供叶片施用的含水喷雾剂时，与一种或多种含其他活性成分的组合物进行混合或桶混。适于进行这种混合的活性成分包括另一些杀虫剂、杀虫剂增效剂、除草剂、杀真菌剂和植物生长调节剂。

本发明的缓释悬浮剂组合物，可以利用《Interfacial Synthesis》第二卷“聚合物应用和技术”(F. Millich 和 C. E. Carraher Jr 编，Marcel Dekker Inc. 出版)中所述的界面缩聚法，制成聚脲微囊的水悬浮剂。利用此方法，以水来乳化抗蚜威在含有油溶性的活性单体(如甲苯二异氰酸酯)的与水不互溶的极性溶剂(如对氯甲苯或甲基环己酮)中的溶液。然后加入第二种水溶性活性单体(例如乙二胺)，从而通过与油溶性单体反应而形成微囊壁。加入常规抗沉降剂稳定所得到的聚脲颗粒悬浮液(微囊悬浮剂)，此悬浮液中抗蚜威已被微囊包封。实例1给出了一种典型组合物。

缓释微囊悬浮剂

成 分	重量百分比
抗蚜威	10
甲基环己酮	25
甲苯二异氰酸酯	3
乙二胺	1
二亚乙基三胺	2
聚乙烯醇	2
羧甲基纤维素钠	0.5
水	加至100 %

本发明缓释微囊悬浮剂组合物的另一实例是由英国专利申请 1, 371, 179所述的界面缩聚法制备的聚脲微囊水悬浮剂。利用该方法, 以含油溶性单体(例如甲苯二异氰酸酯和二苯基甲烷—4, 4'—二异氰酸酯)的水乳化抗蚜威在与水不互溶的溶剂(例如重芳香石脑油)中的溶液。将该中间混合物加热至约50℃, 在油溶性单体和水相之间发生界面反应而形成微囊壁。加入常规抗沉降剂稳定所得到的聚脲颗粒悬浮剂(微囊悬浮剂), 此悬浮剂中抗蚜威已被微囊包封。实例2给出了一种典型的组合物。

实例 2

缓释微囊悬浮剂

成 分	重量百分比
抗蚜威	14
Waxoline black 5BP ⁺ (紫外吸收剂)	1

Topanol 0 ⁺ (抗氧化剂)	!
甲苯二异氰酸酯	3.2
二苯基甲烷—4, 4'—二异氰酸酯	6.3
Pluronic L64 ⁺ (乳化剂)	0.25
聚乙烯醇	2.0
Daxad 23 ⁺ (保护胶体)	1.5
合成生物聚合胶	0.1
Proxel GXL ⁺ (杀生剂)	0.1
Attagel 50 ⁺ (粘土)	0.8
Solvesso 200 ⁺ (烷基苯溶剂)	21.0
水	加至100 %

= 注册商标。

抗蚜威被微囊包封在聚硅氧烷聚合物颗粒中而形成的微囊悬浮剂，也落在本发明的范围内。Grüning等人叙述了一种适用于制备这类组合物的通用方法(Proceed Int. Symp. Control. Rel. Bioact. Mater. 15, 1988)。利用该方法，通过在含有欲微囊包封的活性成分的乳液中对烷氧硅烷进行水解而后进行缩合，制得聚硅氧烷聚合物。一种改进制剂的制备方法是，将抗蚜威和以商品名V7280或V7353出售的有机硅化合物(Goldschmidt AG, West Germany)溶于烷基苯溶剂如Solvesso 200中。将该溶液用含十二烷基苯磺酸钠的水乳化，向该乳化混合物中加入十二烷基苯磺酸。然后在室温下将此混合物剪切混合约3小时。

以本方法用有机硅化合物制备的微囊悬浮剂的一个实例说明于实例3。

实例 3

成 分	重量百分比
抗蚜威	13.0
烷基苯	19.0
有机硅化合物V7280或V7353	5.0
十二烷基苯磺酸钠	2.3
十二烷基苯磺酸	6.5
水	加至100%

利用上述任意一种通用方法制得的微囊悬浮剂组合物，视需要可含有制剂领域常用的其他添加剂，例如稳定剂、紫外吸收剂、抗沉降剂、抗氧化剂、杀生剂等。这些添加剂的选择，取决于所用的材料的性质和组合物的应用，这属于配制人员的一般技术。

现已证明，本发明的微囊悬浮剂组合物在以叶片喷雾剂形式施用，其持久性比用传统组合物达到的持久性有所提高。

这将在实例4和5中说明。

实例 4

通过加速化学持久性测量

测定抗蚜威制剂的半寿期

利用实验室加速技术，通过测定半寿期来测量以本发明组合物和标准组合物形式施用的抗蚜威的大田持久性。把组合物用水稀释，用轨迹喷雾器喷到若干玻璃载片上。使载片风干，取样分析以测定初始抗蚜威附着水平。把其余的载片放在装在Hereaus Suntest装置上的冷却盘上，对其施加风道效应和持续的人工日光(氙弧灯)。以3天的间隔取载片分析抗蚜威残留。用这些结果确定半寿期的值。

用此方法测得实例 2 所述组合物的半寿期为12小时，相比之下，以商品名‘Aphox’出售的50 %水分散性抗蚜威标准颗粒组合物的半寿期为 4 小时。

实例 5

生物活性和持久性的评定

在温室试验中，用稀释的本发明组合物和稀释的标准组合物喷白菜植株，然后用桃蚜侵染，以评价所附着的抗蚜威的初始毒性和经过一段时间后的毒性。表 I 所示的结果证明，实例 2 的缓释微囊悬浮剂组合物不仅比标准可湿性粉剂组合物给出较长的持久性和控制作用，而且意外地给出了等效的初始控制作用。

表 I

组合物	施用率（喷雾剂 中抗蚜威的ppm数）	桃蚜成虫死亡率（%）		
		初始	处理4天后	处理5天后
实例2组合物	156	70	88	87
标准组合物*	156	99	29	21

*以商品名‘Aphox’出售的标准50 %WG组合物。

这里所述的用以改进抗蚜威持久性的组合物，也适于改进本领域已知的其他杀蚜剂的持久性，并且同样能提高杀蚜剂的持久性，从而防止蚜类害虫的再侵染，但却意外地保持传统组合物所具有的快速初始击倒作用和控制作用。因此，本发明的另一方面还提供一种适于用来制备叶片喷雾剂的浓缩物形式的杀蚜剂组合物，其特征在于，该组合物是一种缓释微囊悬浮剂，其中含有一种作为活性成分而微囊包封在悬浮的聚脲或聚硅氧烷颗粒中的杀蚜剂，所述杀蚜剂选自乐果、甲基—〇五九、庚烯磷、1—（二甲基氨基甲酰基）

—3—叔丁基—5—乙氧羰基甲硫基—1H—1, 2, 4—三唑、高灭磷、tefluthrin、chlorpyrifos、久效磷、杀螟松、灭多虫、砒吸磷、氧化乐果、甲基磷磷、乙基磷磷、三唑磷、profenofos、二氯苯醚菊酯、腈二氯苯醚菊酯、 λ -cyhalothrin、灭蚜松和伏杀磷。