

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A01N 25/00

A01N 57/28

[12] 发明专利申请公开说明书 // (A01N57/28, 25: 04, 25: 00)

[21] 申请号 00813242.9

[43] 公开日 2002 年 10 月 23 日

[11] 公开号 CN 1376028A

[22] 申请日 2000.8.2 [21] 申请号 00813242.9

[30] 优先权

[32] 1999.9.22 [33] US [31] 09/404,985

[86] 国际申请 PCT/US00/21086 2000.8.2

[87] 国际公布 WO01/20983 英 2001.3.29

[85] 进入国家阶段日期 2002.3.22

[71] 申请人 埃科莱布有限公司

地址 美国明尼苏达

[72] 发明人 S·J·巴凯 D·G·安德森

T·D·奈尔森

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所

代理人 李华英

权利要求书 2 页 说明书 9 页 附图页数 1 页

[54] 发明名称 含水敏性杀虫剂的水基害虫毒饵

[57] 摘要

本发明涉及一种制备快速作用毒饵组合物的方法，该组合物是水基的并含有水敏性杀虫剂作为活性成分。该组合物易于施加至裂缝和裂隙和空隙或其它害虫躲藏区，以快速杀死昆虫害虫，尤其是蟑螂。一种用于制备该组合物的试剂盒。

ISSN 1008-4274

权利要求书

1. 杀虫毒饵组合物的一种制备方法，该方法包括下列步骤：
 - (a) 在规定量的水中溶解水敏性杀虫剂；
 - (b) 将含取食刺激剂和任选的一种或多种胶凝剂的毒饵基质，与所得的杀虫剂溶液混合；
 - (c) 搅拌所得的组合物直至完全混合；和，如果需要，
 - (d) 使这种混合的组合物形成凝胶或糊剂。
2. 权利要求 1 的方法，其中在步骤(a)，将水加入到水敏性杀虫剂并在密闭的不能渗透的容器内摇动。
3. 权利要求 1 的方法，其中在步骤(b)，在密闭盒中将杀虫剂溶液与毒饵基质混合并摇动或捏合。
4. 权利要求 3 的方法，其中将杀虫剂溶液与毒饵基质的混合物倾入分散药筒中，盖紧并使其凝结以形成凝胶或糊剂。
5. 权利要求 1 的方法，其中该组合物含约 0.1 至约 5 wt-% 的杀虫剂。
6. 权利要求 1 的方法，其中杀虫剂是高灭磷或甲胺磷。
7. 权利要求 1 的方法，其中该组合物包含约 1 wt-% 的高灭磷。
8. 一种杀虫剂毒饵组合物，包括：
 - (a) 约 0.1 至 5.0 wt-% 的水溶性、可水降解的杀虫剂；
 - (b) 约 3 至 40 wt-% 的水；和
 - (c) 余量的毒饵基质；其中所述的组合物具有约 50000 至 1500000 厘泊的粘度。
9. 权利要求 8 的组合物，其中毒饵基质包括取食刺激剂。
10. 权利要求 9 的组合物，其中毒饵基质进一步包括一种或多种胶凝剂。
11. 权利要求 10 的组合物，其中胶凝剂包括约 0.1 至 5 wt-% 的毒饵基质。
12. 权利要求 8 的组合物，其中杀虫剂是高灭磷或甲胺磷。

13. 权利要求 8 的组合物，其中毒饵基质包括高达 50 wt-%的硼砂或硼酸。
14. 权利要求 8 的组合物，包括：
 - (a) 约 1 wt-%的高灭磷；
 - (b) 约 30 wt-%的水；和
 - (c) 余量的毒饵基质，它含有取食刺激剂和胶凝剂。
15. 权利要求 14 的组合物，其中胶凝剂是占毒饵基质总重约 1 wt-%的改性淀粉。
16. 权利要求 15 的组合物，具有约 180,000 厘泊的粘度。
17. 一种控制昆虫害虫的方法，包括向待控制区域施加有效量的权利要求 8 的组合物。
18. 权利要求 17 的方法，其中昆虫害虫是蟑螂。
19. 权利要求 16 的方法，其中该组合物应用至商业公司的裂缝和裂隙中。
20. 一种控制蟑螂的方法，包括向待控制区域施加有效量的按照权利要求 14 的组合物。
21. 适于杀虫剂毒饵组合物的制备和应用的试剂盒，包括：
 - (a) 密闭的不能渗透的容器，在其中的小丸或粉剂中含水敏性杀虫剂；和
 - (b) 含毒饵基质的密闭盒。
22. 权利要求 21 的试剂盒，它进一步包括分散容器。
23. 按照权利要求 22 的试剂盒，其中分散容器是注射器、药筒或圆筒。
24. 按照权利要求 22 的试剂盒，其中分散容器用于连接毒饵敷料器。
25. 按照权利要求 21 的试剂盒，其中密闭不能渗透的容器是玻璃小瓶。
26. 按照权利要求 21 的试剂盒，其中密闭盒是可再封口的塑料包。

说 明 书

含水敏性杀虫剂的水基害虫毒饵

发明领域

本发明涉及到水基、快速作用的含水敏性杀虫剂作为控制昆虫(尤其是蟑螂)的活性成分的害虫毒饵。

发明背景

历史上，控制爬行昆虫例如蟑螂的毒饵是水基的。尤其对于蟑螂，推测水对于良好的毒饵性能是必需的。不幸的是，由于水分损失、酸败、活性成分的分解和其它因素，水基毒饵产品迅速失去效力。水基糊剂毒饵的研究已经证实水分损失、活性成分的驱除性能和杀虫剂抗药性是影响毒饵性能的最重要的因子。Appel, A. G., *J. Econ Entomol.* 85 (4):1176-1183 (1992), Robinson, W. H., 《城市昆虫学国家协会学报》(*Proceedings of the National Conference on Urban Entomology*) 77-91 (1992)，和 Rust, N. K., “控制居室害虫” (“Managing Household Pests”), 《控制城市害虫的报道》(in *Advances in Urban Pest Management*), G. W. Bennett and M. Owens (eds), Van Norstrand Reinhold, N. Y. 335-368 (1986).

一种改善水基杀虫剂产品的方法已使用包括和杀虫剂在一起的所谓水粉剂的粉剂或糊剂组合物。这种水粉剂是以氢化大豆油包封水分。美国专利 No. 5,820,855 介绍了这样的产品。不幸地是，粉剂组合物使用时具有如物质漂移的缺点。

美国专利 Nos 5,464,613 和 5,464,613 介绍了无水脂肪基害虫毒饵产品。这些组合物是糊剂剂型并且包含作为主要成分的脂肪基载体。尽管糊剂产品并不漂移，它们难于应用，并且在应用糊剂至裂缝和裂隙或空隙中时需要敷料器。糊剂、无水产品另外的缺陷是它们不能像水基产品一样快速作用，尤其是抗蟑螂时。

高灭磷是非常理想的杀虫剂，特别在杀蟑螂方面。高灭磷的可用性

基于这样的事实，已知它无杀虫剂抗药性，而且它具有极低的哺乳动物毒性。然而，高灭磷在水基基质在整个时间内是不稳定的。尽管在以上无水、脂肪基专利中已经介绍了高灭磷，目前它未在任何市售蟑螂毒饵中用作活性成分。因此，需要一种采用水敏性杀虫剂的改良快速作用、水基毒饵。

发明概述

在本发明中我们已经发现使水敏性杀虫剂(例如，高灭磷)成功地用于水基基质的方法。本发明是这样的组合物，如果需要，它可以在应用位置制备并且施加至裂缝、裂隙和空隙中。配制和应用时该组合物是有活性的，导致昆虫害虫，特别是蟑螂快速死亡。优选的快速作用组合物是凝胶形式。

因此，本发明的第一方面是即可使用的杀虫毒饵组合物的制备方法，它包括如下步骤：(a)在规定量的水中溶解水敏性杀虫剂，(b)将所得的杀虫溶液和毒饵基质混合，毒饵基质中含有取食刺激剂和任选含有一种或多种胶凝剂的混合物，(c)搅拌所得的组合物，直到彻底地混合，和，如果需要，(d)使混合组合物形成凝胶或糊剂。

本发明的第二方面提供具有约50000至约1500000厘泊之间粘度的即可使用的杀虫毒饵组合物，它含有(a)约0.1至5.0wt-%水敏性杀虫剂、(b)约3至40wt-%水，和(c)余量的毒饵基质。

本发明的第三方面是通过向待控制区施加有效量的上述组合物，来控制昆虫害虫，特别是蟑螂的方法。

最后，本发明的第四方面是可由最终消费者在应用位置使用的试剂盒，它包括上述任选地以凝胶形式的组合物的制备和应用工具，并且含有(a)闭合的不能渗透的容器，其中具有水敏性杀虫丸或粉末，和(b)包含基质毒饵的闭合盒，饵中含有取食刺激剂，和任选地，一种或多种胶凝剂。这种试剂盒可进一步包括分散即可使用的毒饵的工具。另外，混合盒可用于敷施组合物。

附图简要说明

该图是比较有关对蟑螂应用高灭磷凝胶与锐劲特凝胶的平均杀灭

(knockdown) 时间的图。

发明的详细介绍

本发明包括水基杀虫毒饵组合物，它包括水敏性杀虫剂、水和含取食刺激剂以及任选地至少一种或多种胶凝剂的毒饵基质。这种组合物优选是凝胶，并且可以在应用位置通过以下详细介绍的方法，如果需要，采用试剂盒按下述方法制备。本发明的组合物具有快速作用抗昆虫害虫，尤其是蟑螂的优点，并且易于应用至裂缝、裂隙和空隙或者其它的昆虫栖居地。

杀虫剂

水敏性杀虫剂是溶于水的，但亦是水可降解的。高灭磷是适于本发明快速作用、水基组合物的优选杀虫剂。高灭磷是水溶性的细结晶粉末。它是理想的活性组分，由于它无已知的杀虫剂抗药性并且具有极低的哺乳动物毒性。高灭磷分子式为 $C_4H_{10}NO_3PS$ ，化学上称为 O, S-二甲基乙酰磷酰胺锍盐 (phosphoramidothioate)。一般地，高灭磷和其它水敏性杀虫剂可以约 0.1 wt-% 的最小含量用于这种组合物。优选的范围是约 0.1 至约 5 wt-% 的浓度。凝胶组合物中最优选的，高灭磷的量大约是 1 wt-%。其它水敏性杀虫剂包括，例如，甲胺磷，化学上称为 O, S-二甲基磷酰胺锍盐 (phosphoramidothioate)，它是高灭磷的去乙酰基类似物。

水

作为水基组合物，水是本发明的基本成分，用于溶解毒饵基质内杀虫剂和可溶成分。水的用量可以根据杀虫剂的数量和毒饵基质的数量改变。因此，水的数量占总组合物的 3 至 40 wt-% 的范围内。优选地，水的用量是约 22-32 wt-%。在优选的实施方案中，在含 1.0 wt-% 高灭磷的组合物中使用 30 wt-% 的水。

毒饵基质

毒饵基质包括取食刺激剂和诱引剂的固体混合物，它优选含有至少一种胶凝剂。取食刺激剂包含于组合物中以吸引昆虫至毒饵，并且引诱昆虫食用毒饵。优选的取食刺激剂包括碳水化合物和蛋白质的混合物。碳水化合物的例子是麦芽糖糊精等等；碳水化合物复合物，玉米糖浆固

体，例如蔗糖、葡萄糖、果糖的糖类，例如玉米、马铃薯等等的淀粉。蛋白质的例子包括酵母提取物和牛奶固体，例如全部奶粉。

如果需要，取食刺激剂可包括具有双功能的胶凝剂，例如，淀粉。这些淀粉优选改性的，例如，改性的玉米淀粉。其它的可用作毒饵基质部分的胶凝剂包括，例如，树胶，如黄原胶；琼脂；琼脂糖；鹿角菜胶；膨润土；藻酸盐；胶原；明胶；聚丙烯酸酯；纤维素，纤维素衍生物；聚乙二醇；聚环氧乙烷；聚乙烯醇；葡聚糖；聚丙烯酰胺；多糖，或者任何其它常规胶凝剂，或者粘度增强剂。本发明的优选胶凝剂是改性淀粉。

除了取食刺激剂和胶凝剂之外，毒饵基质也可含有额外的诱引剂。诱引剂的例子是增香剂和食用香料，例如，如甲基环戊烯醇酮等等，如葫芦巴等等的植物提取物，如乙醇的醇类，或者协同乙醇的挥发性酯。所述挥发性酯由 C₁-C₆ 支链或无支链醇与 C₁-C₃ 羧酸的组合制备。用于制备本发明的挥发性酯共诱引剂的低级醇包括甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、叔丁醇、正戊醇、异戊醇、叔戊醇、正己醇，和它们的混合物。用于制备本发明的酯诱引剂的羧酸包括醋酸、丙酸、丁酸，它们的混合物，以及其他等等。可以采用的各个羧酸的相关的反应类似物，例如，酰基氯或酸酐。适用的优选的挥发性酯是低级醇醋酸酯，例如醋酸正戊酯、醋酸异戊酯、醋酸异丁酯、醋酸正丙酯，醋酸乙酯或它们的混合物。如胶凝剂和取食刺激剂一样，这些成分中的一些在种类上重叠，由于它们既可以是诱引剂又可以是取食刺激剂，例如，上述的蛋白质、增香剂和食用香料。

毒饵基质可进一步包括作为部分固体混合物的高达 50 wt-%(总毒饵基质的)的硼砂或硼酸，它可用于延长组合物的杀虫活性。

取食刺激剂、诱引剂和任选地胶凝剂是毒饵基质的成分，毒饵基质含有取决于用于该组合物的杀虫剂和水的数量的余量组成。毒饵基质含有取食刺激剂的同时，任选的胶凝剂和其它诱引剂含有余量成分，使用时毒饵基质中胶凝剂的含量可以由总固体混合物的 0.1 变至 5wt-%。胶凝剂的优选含量大约是固体毒饵基质混合物的 1wt-%。

制备方法

如果需要，设计昆虫害虫毒饵组合物在使用位置制备，可以采用是本发明的一部分的试剂盒。如下最佳介绍这种方法：

1. 使用之前在玻璃或另外的不能渗透容器中，以其专门形式(95.0%-100%纯度)容纳并贮藏活性成分。水敏性杀虫剂优选包含于小丸或粉剂形式，容器优选具有可移动的盖，优选是玻璃瓶。

2. 通过将杀虫剂和规定量的水稀释剂混合来制备毒饵。搅拌溶液直至杀虫剂完全溶解。

3. 配好的杀虫剂溶液接着与毒饵基质混合，毒饵基质是取食刺激剂、任选的胶凝剂，以及，如果需要，其它诱引剂的固体混合物。完全搅拌这种混合物，如果需要，令其成凝胶。

毒饵基质优选包含于盒内，例如，通常是可再封口的塑料包，当杀虫剂溶液加入后，将塑料包再封口，并且该内容物优选通过彻底地捏和物料来混合。混合物料可倾入分散工具，例如注射器或分散药筒，或者选择性地留在原来的混合盒内，直至备用。通常地，对于含有胶凝剂的1%的高灭磷组合物，胶凝时间大约是20分钟。

根据活性成分、取食刺激剂和水的数量，该组合物可具有约50000至约1500000厘泊的粘度。通常地，对于1wt-%高灭磷凝胶组合物，以及采用30%水和余量的毒饵基质，所制备的凝胶的粘度大约是180000厘泊。

使用方法

组合物一旦形成，它可直接施用于裂缝和裂隙，以控制昆虫害虫，尤其是蟑螂。

该组合物的用途适用于食物和饲料加工公司，例如餐馆；牛奶场；包装、装瓶和罐头制造厂；面包店；磨坊或贮藏、制备、加工和包装食物和饲料的任何地方。

该组合物亦用于食物区内的点、裂缝和裂隙的处理。这些包括，例如，在密闭体系内接收、贮藏、制备、供应、包装、处理食物或饲料的场所以及贮藏可食垃圾的场所。这种毒饵组合物可以直接施用至裂缝和

裂隙，这里设备吻合地板和墙壁；设备和柜台腿；基部、马达和导管；通向昆虫隐藏的墙空隙的空穴和孔口。

该组合物也可用于饲料和食品加工厂的非食物区，例如，包括垃圾房、休息室、实验室、办公室、库房、锅炉和设备间、车库、盥洗室、储藏间。该组合物还可用于护壁板周围的裂缝或裂隙处、水管和排水管周围、最底层和后部凹陷、库房、餐桌以及可能藏匿昆虫的地方。

最后，在饮食服务公司的服务区内可采用该组合物，它包括，例如饭厅、食堂和其它准备食品的区域。该组合物以豌豆大小或更小的部位施加至选择的表面，例如护壁板、货摊下面和裂缝和裂隙内。

试剂盒

同样本发明的一部分是试剂盒，它供给最终用户必要的物质、容器和装置以制备毒饵组合物，并且施加至必需的包括裂缝和裂隙的区域。这种试剂盒包含在作为提供给毒饵组合物的最终用户的一种包装选项内。

作为试剂盒的部分，不能渗透的和具封盖的容器用来严密容纳在小丸内或粉剂剂型内含有的水敏性杀虫剂。这种容器优选是玻璃瓶。

这种试剂盒亦包括含基质毒饵固体混合物的密闭盒。这种密闭盒优选是可再封口的塑料包，其中在加入杀虫剂水溶液之后完全混合和/或捏合物料。

任选地，试剂盒的第三部分包括可密闭的分散容器。这种容器优选是药筒、注射器或圆筒，它容纳杀虫剂水溶液与毒饵基质材料完全混合的组合物。如果需要的话，分散容器可以用于让混合物凝结并形成凝胶。例如，分散药筒接着放入毒饵敷料器或者与毒饵敷料器相连，以便将组合物敷用于裂缝和裂隙处。

可得到用于在现场使用的组装在盒中作为单元系统的整个试剂盒。

下列实施例意图举例说明本发明，但并不是限制性的解释。

实施例

实施例 1

制备以下的高灭磷组合物：

7. 0% 面包酵母提取物(全球香料公司(Universal Flavor Inc.) CAS# 8013-01-2)

19. 0% 蔗糖(联合糖果公司(United Sugar Company.) CAS# 57-50-01)

9. 0% ProMax 70L 大豆蛋白浓缩物(Central Soya, Code 4510.)

39. 0% Calf 代乳品(Cargill, Inc. CAS# N/A)

24. 0% 水

1. 0% 甘油

1. 0% 高灭磷(Valent Corp. 0, S-二甲基乙酰磷酰胺锍盐)

高灭磷溶于水，在密闭容器中摇晃，然后加入以上确定的固体组分的混合物。接着让这些组分凝结。

实施例 2

采用实施例 1 的配方进行以下实验，以测量高灭磷的降解。用以下介绍的罐/涂方法，比较实施例 1 的 1. 0% 高灭磷制剂杀蟑螂成虫和幼虫的效力。下表中以 KT50 报道了 4 周龄(室内)数据，其中 KT50 是以小时计杀死蟑螂总数的 50% 的时间。

<u>成年雄性:</u>	<u>开始</u>	<u>1wk</u>	<u>2wk</u>	<u>4wk</u>
FB#10	0. 685	1. 035	1. 157	1. 532

成年雌性:

FB#10	4. 780	5. 995	1. 677	5. 082
-------	--------	--------	--------	--------

大幼虫(Lrg Nmphs):

FB#10	1. 217	6. 325	1. 187	4. 587
-------	--------	--------	--------	--------

小幼虫(Sm Nmphs):

FB#10	0. 298	2. 134	1. 622	4. 998
-------	--------	--------	--------	--------

所有生物学数据表明在应用之后，这种制剂在应用 4. 0 周之后具有抗所有生命期蟑螂的效力。

这里介绍罐/涂方法：

材料

1. 筛选毒饵配方。
2. 以凡士林涂抹在泥瓦罐的上沿，防止逃脱。
3. 平衡测量的毒饵。
4. 德国蟑螂；每罐 10 只。
5. 停止观察。

方法

1. 给予蟑螂 4 小时，以适应罐内的食物和水。试验期间允许提供交替的食物和水。
2. 施加 0.3g 的毒饵至倒置的塑料称量舟皿的唇沿（模拟裂缝&裂隙处理）。
3. 适应之后，约 4 小时，将施加有毒饵的称量舟皿（且倒置的）水平置入罐内。按顺序重复所有蟑螂罐。
4. 测量整个时间内蟑螂死亡率，并确定每个生命期蟑螂的 KT50。

实施例 3

以下列成分制备下列配方：

下列组合物为 1.0 wt-%高灭磷，30 wt-%水，和 69 wt-%毒饵基质：

毒饵基质组合物

<u>组成</u>	<u>供应商</u>	<u>Wt%</u>
Calf 代乳品	Minneapolis, Minnesota 55440	71.31
CAS # N/A	Cargill 公司	
6X 糖粉	United Sugar Company	5.40
CAS # 57-50-1	Moorhead, Minnesota 56561	
面包酵母提取物	Universal Flavor Inc.	8.80
CAS # 8013-01-2	Indianapolis, Indiana 46241	
食用淀粉-改性	National Starch and Chemical	0.94
CAS # 113894-92-1	Bridgewater, New Jersey 08807	
山梨醇	Archer Daniels Midland	3.70
CAS # 50-70-4	Decatur, Illinois 62526	
果糖	A. E. Staley Manufacturing Co.	6.90

CAS # 57-48-7	Decatur, Illinois 62526	
氯化钠	Cargill, Inc.	1.25
CAS # 7647-14-5	Minneapolis, Minnesota 55440	
山梨酸钾	Archer Daniels Midland	0.38
CAS # 24634-61-5	Decatur, Illionis 62526	
柠檬酸, 无水	Archer Daniels Midland	1.32
CAS # 77-92-9	Decatur, Illionis 62526	
		总计 100%

1. 打开高灭磷-贮运器(小瓶), 将 30ml 的水加入到 1.04g 高灭磷中)。盖上瓶盖, 摆动小瓶直至完全溶解高灭磷。
2. 接着将小瓶成分加入拉链锁包内的 68.9 g 毒饵糊盒中(以上介绍的)。盖上盒并通过摇动和捏合进行完全混合。
3. 毒饵混合物倾入分散药筒, 盖紧并使其凝结 20 分钟以使毒饵成凝胶。所得的凝胶具有约 180,000 厘泊的粘度。

实施例 4

关于受毒饵组合物的给药时间影响的蟑螂平均杀灭时间, 比较实施例 3 的凝胶组合物与市售的含 0.01% 锐劲特作为活性成分的凝胶组合物。这种市售的锐劲特凝胶组合物以与本发明的组合物同样的方法使用, 并且它宣称是快速作用的。试验结果如图 1 所示。观察到的本发明的最长平均杀灭时间是 60 秒给药时间内为 1.62 小时。相反, 最短的锐劲特平均杀灭时间在同样的 60 秒给药时间内是 4.42 小时。显著地, 在 5-秒给药时间内, 本发明的凝胶组合物具有 1.18 小时的平均杀灭时间, 而锐劲特凝胶对于同样的 5 秒给药时间是 20.28 小时。

以上说明书、实施例和数据提供本发明组合物的制备和使用的完全说明。由于在不背离本发明的精神和范围内可得出本发明的许多实施方案, 本发明属于下文附加的权利要求。

说 明 书 封 面

图 1

