



(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 I711379 B

(45) 公告日：中華民國 109 (2020) 年 12 月 01 日

(21) 申請案號：105111591

(22) 申請日：中華民國 105 (2016) 年 04 月 14 日

(51) Int. Cl. : *A01N51/00 (2006.01)**A01N43/90 (2006.01)**A01N25/04 (2006.01)**A01P7/04 (2006.01)*

(30) 優先權：2015/04/16 歐洲專利局

15163823.6

(71) 申請人：香港商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：布里斯托 詹姆士 BRISTOW, JAMES TIMOTHY (GB)

(74) 代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

(56) 參考文獻：

CN 1307802A

審查人員：方冠岳

申請專利範圍項數：8 項 圖式數：0 共 21 頁

(54) 名稱

亞微米益達胺及阿巴汀組合物

(57) 摘要

本發明涉及包含益達胺和阿巴汀的新型水懸劑和濃懸乳劑製劑，其具有小於 1 微米的平均粒徑。

The present invention relates to novel suspension concentrate and suspoemulsion for formulations comprising imidacloprid and abamectin, having an average particle size of less than 1 micron.

I711379

## 發明摘要

※ 申請案號：

※ 申請日：

※IPC 分類：

### 【發明名稱】(中文/英文)

亞微米益達胺及阿巴汀組合物

SUBMICRON IMIDACLOPRID AND ABAMECTIN COMPOSITIONS

### 【中文】

本發明涉及包含益達胺和阿巴汀的新型水懸劑和濃懸乳劑製劑，其具有小於1微米的平均粒徑。

### 【英文】

The present invention relates to novel suspension concentrate and suspoemulsion for formulations comprising imidacloprid and abamectin, having an average particle size of less than 1 micron.

**【代表圖】**

**【本案指定代表圖】：**無

**【本代表圖之符號簡單說明】：**

無

**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：**

無

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

## 【發明名稱】(中文/英文)

亞微米益達胺及阿巴汀組合物

SUBMICRON IMIDACLOPRID AND ABAMECTIN COMPOSITIONS

## 【技術領域】

本發明涉及包含益達胺和阿巴汀的水懸劑 (SC) 和濃懸乳劑 (SE) 製劑，其具有小於 1 微米的平均粒徑。

## 【先前技術】

益達胺的 IUPAC 名稱是(E)-1-(6-氯-3-吡啶基-甲基)-N-硝基-咪唑烷-2-亞基胺。益達胺控制吸啜昆蟲，包括稻飛蝨、葉飛虱和植物飛虱，蚜蟲，薊馬和粉虱。其也有效對抗土壤昆蟲、白蟻和一些叮咬昆蟲，如稻水象蟲和科羅拉多甲蟲。益達胺可在不同作物，例如，水稻、棉花、穀類、玉米、甜菜、馬鈴薯、蔬菜、柑橘類水果、梨果和核果中用作拌種製劑、用作土壤處理劑和葉部處理劑。其一般以乳劑 (EC)、水懸劑 (SC)、溶液 (SL) 和可潤性粉劑 (WP) 製劑市售。

阿巴汀分離自鏈黴菌 (*Streptomyces avermitilis*) (一種天然存在的土壤放線菌) 的發酵物。阿巴汀通過刺激  $\gamma$ -胺基丁酸 (一種抑制性神經遞質) 的釋放來起作用，從而最終啟動氯化物通道。阿巴汀控制觀賞植物、棉花、柑橘類水果、梨果、堅果作物、蔬菜、馬鈴薯和其他作物上蟎蟲、潛葉蟲、吸蟲、科羅拉多甲蟲等的能動階段。阿巴汀也用於通過種子處理控制線蟲並控制火蟻。阿巴汀一般以 EC 製劑形式購買。

近年來，已經存在一種通過在施用中合併兩種或更多種活性成分以增加功效、拓展活性譜、並且延遲對殺蟲劑的抗性的趨勢。

CN1115964A 描述了益達胺和阿巴汀的預混合物。其提出益達胺和阿巴



汀的預混合物可配製成 EC 和 WP。

US6,444,690B 也描述了益達胺和阿巴汀的預混合物。其提出可將活性成分的混合物配製成常規製劑，如溶液、乳液、懸浮液、粉末、泡沫、糊料、顆粒、氣溶膠、活性化合物-浸漬的中性和合成材料、聚合物質中非常細的包封物，和用於種子的包被製劑、煙薰制劑如熏筒、薰蒸罐、薰蒸線圈等，和 ULV 冷暖霧製劑。通過已知方式，例如通過將活性成分與增量劑（例如，液體溶劑、加壓液化氣體和/或固體載體）、任選的表面活性劑（例如，乳化劑和/或分散劑和/或泡沫形成劑）混合來製備這些製劑。

通常，清澈(clear)稀釋的益達胺 SL 和阿巴汀 EC 有非常良好的功效。然而，需要大量的極性和非極性有機溶劑來提供 SL 和 EC 製劑的高功效。但是，已知這些有機溶劑具有毒理學和生態毒理學性質，使用有機溶劑將導致相應的問題。因此，農業部農藥檢定所 (ICAMA) 已經禁止了 EC 製劑的登記。此外，雖然 EC 製劑在一些國家中還未被禁止，但是已經從根本上提高了乳劑獲得登記的標準。除此以外，在不使用含有極性和/或非極性有機溶劑的現有溶劑系統的情況下難以配製益達胺 SL 和阿巴汀 EC。因此，將益達胺和阿巴汀的預混合物開發成 SL 或 EC 同時面臨製劑和監管的問題。

通常以水性系統的形式給予活性成分。通過將活性成分在水中溶解、乳化和/或懸浮來獲得水基製劑。對於具有低水溶性的活性成分，它們將難以配製成水性系統的形式。含有固體活性成分的水性系統可配製為水懸劑 (SC) 或濃懸乳劑 (SE) 製劑。然而，這些製劑已知存在多種問題，如固體活性成分的團聚、不可逆的增稠、漿液(serum)形成或沉降為硬的堆積沉澱物。在 SE 製劑的情況中，由於水基乳劑的固有不穩定性，乳化的油層的存在增加了配製失敗的風險。長期的儲存、在極端溫度變化下的儲存、高剪切和振盪增加了失敗的可能性。

現有的益達胺和阿巴汀 SE 或 SC 製劑的穩定性和功效不好。已知，SE 和 SC 製劑的功效一般比 EC 和 SL 製劑的功效差。

因此，存在改善益達胺和阿巴汀 SE 或 SC 製劑的穩定性和功效的需求。

本發明提供了一種解決益達胺和阿巴汀 SE 或 SC 製劑的穩定性和功效問題的方法。

### 【發明內容】

本發明提供了一種製備包含益達胺和阿巴汀的 SE 或 SC 製劑的水性系統的方法，與平均粒徑超過 1 微米的類似製劑相比，其顯示改善的物理儲存穩定性、分散性、功效。

本發明還涉及包含益達胺和阿巴汀的水懸劑（SC）和濃懸乳劑（SE）製劑，其中兩者或其一具有小於 1 微米的平均粒徑。

本發明還涉及通過使用水懸劑和/或濃懸乳劑製劑用於控制作物，尤其是棉花、柑橘、番茄、馬鈴薯、青椒、西瓜、咖啡和大豆中的昆蟲的殺蟲劑組合物，並且涉及所述製劑在控制作物中有害昆蟲中的用途。

根據本發明，提供了包含益達胺和阿巴汀以及至少一種分散劑的水懸劑（SC）製劑，所述益達胺和阿巴汀中兩者或其一具有小於 1 微米的平均粒徑。

本發明還提供了濃懸乳劑製劑，其包含：

（A）連續水相；

（B）（i）包含至少一種液體和阿巴汀的分散的乳液相；

（ii）足量的乳化劑，以乳化所述液體和阿巴汀；以及

（C）（i）包含平均粒徑小於 1 微米的益達胺的分散的固相；

（ii）足量的至少一種分散劑，以使所述製劑中存在的益達胺和任何其它固體技術材料分散；其中該固相在水相和/或乳液



相中分散。

本發明還涉及濃懸乳劑製劑，其包含：

- (A) 連續水相；
- (B) (i) 包含至少一種液體和益達胺的分散的乳液相；  
(ii) 足量的乳化劑，以乳化所述液體和益達胺；以及
- (C) (i) 包含平均粒徑小於 1 微米的阿巴汀的分散的固相；以及  
(ii) 足量的分散劑，以使所述製劑中存在的阿巴汀和任何其它固體技術材料分散；其中該固相在水相和/或乳液相中分散。

#### 【圖式簡單說明】

無

#### 【實施方式】

市售的益達胺配製成溶液 (SL)；並且市售的阿巴汀通常配製成乳劑 (EC)。已知益達胺 SL 和阿巴汀 EC 均顯示出更好的生物功效。然而，使用有機溶劑來製備益達胺 SL 和阿巴汀 EC 對於環境和使用者的不利。水性系統/懸液液，如濃懸乳劑 (SE) 和水懸劑 (SC) 沒有在 EC 或 SL 製劑中出現的問題。最近，已經開發了多種 SC。然而，水性系統/懸液液在生物效果上不可避免地不如乳劑。具體地，當使用不溶於水的活性成分時，水性系統/懸液液在生物效果上遠遠不如乳劑。

SC 製劑需要以超過 EC 製劑 4-8 倍的劑量施用，因為常規 SC 製劑的生物作用低於 EC 製劑。

因此，本發明通過包含細顆粒形式的活性成分提供具有改善的生物作用的水性系統/懸液液。出於該原因，本發明提供了製備包含益達胺和阿巴汀的殺蟲劑製劑的方法，其中活性成分兩者或之一具有低於 1  $\mu\text{m}$  的小粒徑，以與具有超過 1 微米的平均粒徑的類似製劑相比獲得更好的生物作用。

通過提供本文所述的組合物，已經發現不再出現與該組合物相關的其他問題，如固體顆粒的團聚、不可逆的增稠、漿液形成或沉降為硬堆積沉澱物，使得與具有超過 1 微米的平均粒徑的類似製劑相比，本發明的殺蟲劑製劑顯示出改善的物理儲存穩定性、可分散性和功效。

可按照本領域已知的任何技術測量活性成分的粒徑，如，光分析、沉降技術、鐳射衍射法、聲光譜或超聲衰減光譜等。具體地，可通過兩種不同的技術，即  $Dv50$  和  $Z$ -平均技術來測量活性成分的粒徑。通過使用本領域技術人員溶液確定的設備如瑪律文奈米篩選儀 (Malvern Nanosizer) 的光子相關光譜測量本文定義的活性成分的  $Z$ -平均直徑。活性成分的  $Dv50$  粒徑是使用市售的分析裝置如瑪律文鐳射粒徑儀 (Malvern Mastersizer) 確定的中位數粒徑。

優選地，術語「具有小於 1 微米的平均粒徑」是指由  $Dv50$  和  $Z$ -平均技術確定低於 1 微米的平均粒徑的活性成分。當粒徑分佈狹窄並且低於 1 微米時， $Dv50$  和  $Z$ -平均技術的結果相似。當顯著分數的大於 1 微米的顆粒存在時，結果並不相似。

本發明還涉及包含益達胺和阿巴汀以及至少一種分散劑的水性水懸劑，其中益達胺和阿巴汀中兩者或其一具有小於 1 微米的平均粒徑。

本發明還涉及濃懸乳劑製劑，其包含：

- (A) 連續水相；
- (B) (i) 包含至少一種液體和阿巴汀的分散的乳液相；  
(ii) 足量的乳化劑，以乳化阿巴汀；以及
- (C) (i) 包含平均粒徑小於 1 微米的益達胺的分散的固相；  
(ii) 足量的分散劑，以使所述製劑中存在的益達胺和任何其它固體技術材料分散；其中該固相在水相和/或乳液相中分散。



此外，本發明涉及濃懸乳劑製劑，其包含：

- (A) 連續水相；
- (B) (i) 包含至少一種液體和益達胺的分散的乳液相；  
(ii) 足量的乳化劑，以乳化所述液體和非水溶性成分；以及
- (C) (i) 包含平均粒徑小於 1 微米的阿巴汀的分散的固相；  
(ii) 足量的分散劑，以使所述製劑中存在的阿巴汀和任何其它固體技術材料分散；其中該固相在水相和/或乳液相中分散。

在一些實施方式中，作為濃懸乳劑製劑中分散的固相，益達胺的平均粒徑小於 1 微米。在某些實施方式中，作為濃懸乳劑製劑中分散的固相，阿巴汀的平均粒徑小於 1 微米。

製劑中益達胺的量可在以下範圍內：約 1% 至約 80%，優選約 5% 至約 70%，更優選約 10% 至約 60%，更優選約 10% 至約 50% 或者約 15% 至約 40%，更優選約 30%。製劑中阿巴汀的量可在以下範圍內：約 0.5% 至約 80%，優選約 0.5% 至約 70%，更優選約 1% 至約 60% 或者約 1% 至約 50%，或者約 1% 至約 40%，甚至約 1% 至約 30%，更優選約 1% 至約 20% 或者約 1% 至約 10%。

在懸浮液中，尤其是濃懸乳劑中，表面活性劑的功能為乳化劑，用於乳化油相和一種非水溶性技術材料，以及分散劑，以分散另一種固體非水溶性技術材料。這些表面活性劑應該在一種製劑中相容。表面活性劑可同時用作乳化劑和分散劑。

根據活性成分的性質，合適的表面活性化合物是具有良好的乳化、分散和可濕特性的非離子、陽離子和/或陰離子表面活性劑和表面活性劑的混合物。

合適的陰離子表面活性劑是本領域已知的。例如，聚-芳基苯酚聚烷氧

基醚硫酸酯/鹽和/或磷酸酯/鹽；C<sub>8-18</sub> 醇聚烷氧基醚磷酸酯/鹽、碳酸酯/鹽和/或檸檬酸酯/鹽；烷基苯磺酸；C<sub>8-20</sub> 烷基羧酸酯/鹽，包括脂肪酸；C<sub>8-20</sub> 醇硫酸酯/鹽；C<sub>8-20</sub> 醇磷酸單酯和二酯；C<sub>8-20</sub> 醇和(C<sub>8-20</sub> 烷基)苯酚聚氧乙烯醚羧酸酯/鹽、硫酸酯/鹽和磺酸酯/鹽；C<sub>8-20</sub> 醇和(C<sub>8-20</sub> 烷基)苯酚聚氧乙烯醚磷酸單酯和二酯；C<sub>8-20</sub> 烷基苯磺酸鹽，萘磺酸鹽及其甲醛縮合物；木質素磺酸鹽；C<sub>8-20</sub>-烷基磺基琥珀酸酯/鹽和磺基琥珀醯胺酸酯/鹽；C<sub>8-20</sub> 丙烯醯基谷胺酸鹽、肌胺酸鹽、羥乙基磺酸鹽和胺基乙磺酸鹽；水溶性皂及其混合物。市售的聚芳基苯酚聚烷氧基醚硫酸鹽和磷酸鹽包括，例如，SOPROPHOR<sup>®</sup>4D384（三苯乙炔基苯酚(EO)<sub>16</sub> 硫酸銨鹽，羅迪亞公司（Rhodia Corporation））、SOPROPHOR<sup>®</sup>3D33（三苯乙炔基苯酚(EO)<sub>16</sub> 磷酸游離酸，羅迪亞公司）、SOPROPHOR<sup>®</sup>FLK（三苯乙炔基苯酚(EO)<sub>16</sub> 磷酸鉀鹽，羅迪亞公司）、SOPROPHOR<sup>®</sup>RAM/384（聚乙氧基化油胺中和的三苯乙炔基苯酚聚乙氧基化醚硫酸鹽，羅迪亞公司）。市售 C<sub>8-18</sub> 醇聚乙氧基醚磷酸酯、羧酸酯和檸檬酸酯包括 STEPFAC<sup>®</sup> 8180（十三烷基醇(EO)<sub>3</sub> 磷酸酯，斯特磐公司（Stean Corporation））、STEPFAC<sup>®</sup>8181（十三烷基醇(EO)<sub>6</sub> 磷酸酯，斯特磐公司）、STEPFAC<sup>®</sup>8182（十三烷基醇(EO)<sub>12</sub> 磷酸酯，斯特磐公司）。示例性的烷基苯磺酸及其鹽包括十二烷基苯磺酸，和烷基苯磺酸的金屬（例如，鈉或鈣）、胺或胺鹽，包括十二烷基苯磺酸。胺中和的版本包括伯胺、二胺、三胺和烷醇胺。

示例性的非離子表面活性劑包括環氧乙烷-環氧丙烷嵌段共聚物；環氧乙烷-環氧丁烷嵌段共聚物；環氧乙烷-環氧丙烷嵌段共聚物的 C<sub>2-6</sub> 烷基加合物；環氧乙烷-環氧丁烷嵌段共聚物的 C<sub>2-6</sub> 烷基加合物；聚丙二醇；聚乙二醇；聚芳基苯酚聚乙氧基醚；聚烷基苯酚聚乙氧基醚；飽和或不飽和脂肪酸和烷基苯酚或者脂族或環脂族醇的聚乙二醇醚衍生物。市售非離子表面活性劑包括，例如，TOXIMUL<sup>®</sup>8320（EO/PO 嵌段共聚物的丁基醚衍生物，



斯特磐公司)、WITCONOL<sup>®</sup>NS-500LQ (EO/PO 嵌段共聚物的丁基醚衍生物, CK Witco 公司)。

合適的非離子表面活性劑是壬基苯酚聚乙氧基乙醇、植物油聚乙二醇醚、環氧乙烷和環氧丙烷的聚加合物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

陽離子表面活性劑優選四級銨鹽帶有, 如 N-取代的, 至少為 C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub> 烷基, 以及進一步的取代基, 非取代或鹵代的低級烷基、苄基或羥基-低級烷基。這些鹽優選是鹵化物、甲基硫酸鹽或乙基硫酸鹽的形式, 例如, 硬脂基三甲基氯化銨或苄基雙(2-氯乙基)-乙基-溴化銨。

表面活性劑的量取決於對於組合物所選的特定活性成分及其所需的絕對量和相對量。可通過常規實驗確定選自本文提供的類別或具體示例的表面活性劑的合適的量, 該測試如下: 在 20 - 25°C 下儲存 24 小時之後或者, 對於優選的實施方式, 在上文指示的更寬的溫度範圍內更長的儲存時間之後, 組合物基本沒有顯示出相分離、沉積或絮凝。一般而言, 組合物/製劑中表面活性劑的總量範圍是組合物/製劑的重量的約 1% 至約 30%。表面活性劑可同時用作乳化劑和分散劑。乳化劑的量的範圍是組合物/製劑的重量的約 1% 至約 30%。分散劑的量的範圍是組合物/製劑的重量的約 1% 至約 30%。

這些組合物也可包含其他助劑, 如潤濕劑、化學穩定劑、粘度控制劑、增稠劑、粘合劑、增粘劑、肥料和消泡劑。

可用於本發明的合適的聚合物穩定劑的示例的分子量為 10000 至 1000000 道爾頓(daltons)並且包括但不限於, 聚丙烯、聚異丁烯、聚異戊二烯、單烯烴和二烯烴的共聚物、聚丙烯酸酯、聚苯乙烯、聚乙酸乙烯酯、聚胺酯或聚醯胺。

代表性的消泡劑是二氧化矽, 聚二烷基矽氧烷, 尤其是聚二甲基矽氧



烷，氟脂族酯或全氟烷基膦酸或其鹽，及其混合物。優選聚二甲基矽氧烷。

製劑一般占組合物重量的 0.1 % 至 95 %，優選 0.5 % 至 90 %。

益達胺和阿巴汀的混合物適用於對抗農業、林業、保護儲存產品和材料以及衛生領域中遇到的動物蟲害，尤其是昆蟲、蛛形綱和線蟲，並且具有良好的植物耐受性和對溫血動物的有利毒性。它們對抗常規敏感和抗性物種以及對抗所有或部分發展階段有活性。蟲害包括蚜蟲、柑桔鏽蟎、粉虱、蛛蟎、鏽蟎和紅斑蟥象等。

本發明的組合物的施用率可廣泛變化。組合物的施用率將取決於待控制的昆蟲的特定類型、所需要的控制程度，以及施用的時間和方法。一般而言，組合物可以一定量施用，使得益達胺和阿巴汀的施用率為 0 - 400 g 活性成分/公頃，優選 20 - 300 g 活性成分/公頃。

通過說明的方式，而非限制性方式提供本發明的以下實施例。除非特別說明，本說明書和申請專利範圍中，百分比以重量計。

## 實施例

### 實施例 1

	% wt
益達胺	30
阿巴汀	2.8
PLURONIC <sup>®</sup> PE 6800 (巴斯夫)	3.5
TERSPERSE <sup>®</sup> 2500 (亨斯曼公司)	1.5
矽酮消泡劑	0.1
黃原膠	0.2
丙二醇	5.0
防腐劑	0.15

水

補充至 100

### 1.1 益達胺和阿巴汀研磨基料的製備

將合適量的水、非離子和離子表面活性劑以及益達胺和阿巴汀混合在一起。加入消泡劑和合適量的黃原膠並混合至均勻。如果需要，將研磨基料研磨至所需的粒徑。

### 1.2 最終產物的製備

按照上述組成，向益達胺和阿巴汀研磨基料中加入丙二醇、黃原膠和防腐劑以及水並且摻混至均勻。

## 實施例 2

### 2.1 阿巴汀 EW 的製備

	Wt%
阿巴汀	10
N-甲基吡咯烷酮	20
TWEEN <sup>®</sup> 80 (柯洛達公司)	5
RHODACAL <sup>®</sup> 70B (羅地亞公司)	2
水	22

將阿巴汀溶解在 N-甲基吡咯烷酮中，然後加入 TWEEN<sup>®</sup>80 和 RHODACAL<sup>®</sup>70B 並混合至均勻以形成油相。然後向水中加入油相以形成粒徑為 1-40 微米的乳化的油相。

### 2.2 益達胺研磨基料的製備

Wt %

益達胺	60
PLURONIC <sup>®</sup> PE 6800 (巴斯夫)	3.5
TERSPERSE <sup>®</sup> 2500 (亨斯曼公司)	1.5
矽酮消泡劑	0.1
黃原膠	0.2
水	54.7

將水、PLURONIC<sup>®</sup>PE 6800、TERSPERSE<sup>®</sup>2500 和益達胺混合在一起。加入消泡劑和黃原膠並混合至均勻。如果需要，將研磨基料研磨至所需的粒徑。

### 2.3 最終產物的製備

	Wt%
阿巴汀 EW	14
益達胺研磨基料	50
丙二醇	5
TOXIMUL <sup>®</sup> 8320 (斯特磐公司)	6
黃原膠	0.15
防腐劑	0.15
水	補充至 100

將阿巴汀 EW、丙二醇、TOXIMUL<sup>®</sup>8320 和一些水摻混在一起。加入益達胺研磨基料並摻混。接著，加入黃原膠和防腐劑並摻混至均勻。

### 實施例 3 樣品製備



### 3.1 益達胺 EW 的製備

	Wt%
益達胺	60
N-甲基吡咯烷酮	20
TWEEN <sup>®</sup> 80 (柯洛達公司)	5
RHODACAL <sup>®</sup> 70B	2
水	補充至 100

將益達胺溶解在 N-甲基吡咯烷酮中，然後加入 TWEEN<sup>®</sup>80 和 RHODACAL<sup>®</sup>70B 並混合至均勻以形成油相。然後向水中加入油相以形成粒徑為 1-40 微米的乳化的油相。

### 3.2 阿巴汀研磨基料的製備

	Wt%
阿巴汀	10
PLURONIC <sup>®</sup> PE 6800 (巴斯夫)	3.5
TERSPERSE <sup>®</sup> 2500 (亨斯曼公司)	1.5
矽酮消泡劑	0.1
黃原膠	0.2
水	34.7

將水、PLURONIC<sup>®</sup>PE 6800、TERSPERSE<sup>®</sup>2500 和阿巴汀混合在一起。加入消泡劑和黃原膠並混合至均勻。如果需要，將研磨基料研磨至所需的粒徑。

### 2.3 最終產物的製備

	Wt%
益達胺 EW	50
阿巴汀研磨基料	14
丙二醇	5
TOXIMUL <sup>®</sup> 8320 (斯特磐公司)	6
黃原膠	0.15
防腐劑	0.15
水	補充至 100

將益達胺 EW、丙二醇、TOXIMUL<sup>®</sup>8320 和水摻混在一起。加入阿巴汀研磨基料並摻混。接著，加入黃原膠和防腐劑並摻混至均勻。

#### 實施例 4

##### 益達胺和/或阿巴汀研磨基料的再分散

穩定性方案：將來自 1.1、2.2、3.2 部分的研磨基料樣品在 38 °C 下於 2 盎司瓶中持續儲存 6 周。再分散沉降物的能力與通過中等速度搖晃樣品勻化所需時長相關。希望更短的再分散沉降物的時間。罐在 1 秒內水準搖晃 2 次完整搖晃(1 次完整搖晃 = 完整的前後運動)。沉降物必須被完全再分散，所有沉降物來自罐底部並且在樣品的本體中沒有團塊或團聚體。

樣品 1-1 代表 1.1 部分中所示的亞微米研磨基料。樣品 2-1 代表 2.2 部分中所示的亞微米研磨基料。樣品 3-1 代表 3.2 部分中所示的亞微米研磨基料。樣品 1-2、2-2 和 3-2 具有相似的組成，但是含有具有較大顆粒的研磨基料。

表 1

樣品	粒徑瑪律文奈米篩選儀* (Z-平均, $\mu\text{m}$ )	粒徑瑪律文鐳射粒徑儀* (中值, DV50, $\mu\text{m}$ )	勻化時間 (秒)
1-1	0.621	0.58	25
1-2*	0.964	1.32	56
2-1	0.568	0.573	15
2-2*	1.212	1.523	80
3-1	0.854	0.892	10
3-2*	0.987	1.432	70

\*本發明範圍以外的研磨基料

從表 1 中可見，具有本發明範圍內的平均粒徑的益達胺和/或阿巴汀(實施例 1-1、實施例 2-1 和實施例 3-1) 明顯更易於再分散。

### 實施例 5

具有亞微米研磨基料的最終產物的改善的稀釋性能

稀釋方案：使用硬度為 50 ppm 和 1000 ppm 的水在 100 mL 量筒中將來自 1.2、2.3 和 3.3 部分的最終產物製劑稀釋至 100 mL。對量筒進行 10 次完整翻轉。量筒在室溫下不受干擾地放置 24 小時。在 24 小時後，記錄需要完全再分散沉降物所需的翻轉次數。完全在分散沉降物所需的翻轉次數越低，表明再分散最終產物的能力提高。

樣品 2-1 代表 1.2 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 3-1 代表 2.3 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 4-1 代表 3.3 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 2-2、樣品 3-2 和樣品 4-2 具有類似的組成，但含有具有較大平均粒徑的研磨基料。



表 2

樣品	最終產物/研磨基料	50ppm	1000ppm
2-1	亞微米研磨基料的最終產物	10 次翻轉	10 次翻轉
2-2*	非亞微米研磨基料的最終產物	50 次翻轉	50 次翻轉
3-1	亞微米研磨基料的最終產物	6 次翻轉	6 次翻轉
3-2*	非亞微米研磨基料的最終產物	30 次翻轉	30 次翻轉
4-1	亞微米研磨基料的最終產物	7 次翻轉	7 次翻轉
4-2*	非亞微米研磨基料的最終產物	40 次翻轉	40 次翻轉

\*本發明範圍以外的最終產物

從表 2 所列資料中明顯看出，從益達胺和/或阿巴汀研磨基料製備的具有本發明範圍的平均粒徑的最終產物製劑比含有本發明範圍外的益達胺和/或阿巴汀研磨基料的製劑明顯易於再分散，如勻化最終產物所需更少的翻轉次數所示。

#### 實施例 6-功效測試

功效測試方案：製備如樣品 1.2、2.3 和 3.3 中所示的最終產物製劑。通過浸入所需濃度的活性化合物的製備物中處理大豆葉片並且在葉片仍然濕潤時將蛛蟎放在它們之上。在 6 天後，確定以%表示的殺傷。100%表示所有的蛛蟎已被殺死；0%表示沒有蛛蟎被殺死。

樣品 2-1 代表 1.2 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 3-1 代表 2.3 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 4-1 代表 3.3 部分中所述的亞微米研磨基料。樣品 2-2、樣品 3-2 和樣品 4-2 具有類似的組成，但含有具有較大平均粒徑的研磨基料。

表 3

樣品	最終產物/研磨基料	6 天後的殺死% (50 ppm)	6 天後的殺死% (1000 ppm)
2-1	亞微米研磨基料的 最終產物	80	100
2-2*	非亞微米研磨基料的 最終產物	10	50
3-1	亞微米研磨基料的 最終產物	90	100
3-2*	非亞微米研磨基料的 最終產物	30	60
4-1	亞微米研磨基料的 最終產物	90	100
4-2*	非亞微米研磨基料的 最終產物	40	70
益達胺 200SL	Confidor, 拜耳公司	70	80
阿巴汀 1.8EC	Agrimec, 先正達公司	70	80
益達胺 200SL + 阿巴汀 1.8EC	罐混合物	90	90

從表 3 所列資料中明顯看出，從益達胺和/或阿巴汀研磨基料製備的具有本發明範圍的平均粒徑的最終產物製劑比含有本發明範圍外的益達胺和/或阿巴汀研磨基料的製劑（相關乳劑製劑）顯示出明顯更高的功效，如明顯高的昆蟲殺傷率所示。

雖然上文已經詳細描述了本發明的少量示例性實施方式，但是本領域技術人員將容易認識到在示例性實施方式中許多修飾是可能的，而沒有實

質上偏離本發明的新的啟示和優勢。因此，所有這類修飾旨在包括於以下申請專利範圍中限定的本發明的範圍內。

**【符號說明】**

無

**【生物材料寄存】**

無

**【序列表】** (請換頁單獨記載)

無



## 申請專利範圍

1. 一種濃懸乳劑製劑，包含
  - (A) 連續水相；
  - (B) (i) 包含至少一種液體和阿巴汀(abamectin)的分散的乳液相；  
(ii) 足量的乳化劑以乳化所述液體和阿巴汀；以及
  - (C) (i) 包含平均粒徑小於 1 微米的益達胺(imidacloprid)的分散的固相；  
(ii) 足量的至少一種分散劑，以使所述製劑中存在的益達胺和任何其它固體技術材料分散；其中所述固相在水相和/或乳液相中分散。
2. 一種濃懸乳劑製劑，包含
  - (A) 連續水相；
  - (B) (i) 包含至少一種液體和益達胺的分散的乳液相；  
(ii) 足量的乳化劑以乳化所述液體和益達胺；以及
  - (C) (i) 包含平均粒徑小於 1 微米的阿巴汀分散的固相；以及  
(ii) 足量的分散劑，以使所述製劑中存在的阿巴汀和任何其它固體技術材料分散；其中所述固相在水相和/或乳液相中分散。
3. 如請求項 1 或 2 所述的濃懸乳劑製劑，所述製劑進一步包含一或多種分散劑和乳化劑。
4. 如請求項 1 或 2 所述的濃懸乳劑製劑，其中所述製劑中益達胺含量範圍為約 1%至約 80%，並且阿巴汀含量範圍為約 0.5%至約 80%。
5. 如請求項 3 所述的濃懸乳劑製劑，其中所述製劑中益達胺含量範圍為約 1%至約 80%，並且阿巴汀含量範圍為約 0.5%至約 80%。

6. 一種如請求項 1 至 5 中任一項所述的濃懸乳劑製劑在控制作物中的昆蟲的用途。
7. 如請求項 6 所述的用途，其中所述作物選自棉花、柑橘、番茄、馬鈴薯、青椒、西瓜、咖啡和大豆。
8. 如請求項 6 所述的用途，其中所述昆蟲選自稻飛蝨、葉飛虱和植物飛虱、蚜蟲、薊馬和粉虱、土壤昆蟲、白蟻、稻水象蟲和科羅拉多甲蟲、蟎、潛葉蟲、吸蟲、線蟲和火蟻。