



(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 202321234 A

(43)公開日：中華民國 112 (2023) 年 06 月 01 日

(21)申請案號：111128177

(22)申請日：中華民國 111 (2022) 年 07 月 27 日

(51)Int. Cl. : C07D417/04 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01P7/04 (2006.01)

(30)優先權：2021/08/03 美國

63/228,910

2022/07/15 美國

63/368,548

(71)申請人：美商科迪華農業科技有限責任公司 (美國) CORTEVA AGRISCIENCE LLC (US)
美國(72)發明人：貝托里 里克 BETORI, RICK (US)；加里茲 尼加 GARIZI, NEGAR (US)；拉森
保羅 LARSEN, PAUL (US)；劉 婧琳 LIU, JINGLIN (US)；特魯林格 湯尼
TRULLINGER, TONY (US)；韋伯 尼古拉 WEBB, NICOLA (US)；維索斯 法蘭
克 WESSELS, FRANK (US)；薩內 尼拉傑 SANE, NEERAJ (US)；斯凱爾頓 珍
妮佛 SKELTON, JENNIFER (US)

(74)代理人：劉法正；尹重君

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：33 項 圖式數：14 共 120 頁

(54)名稱

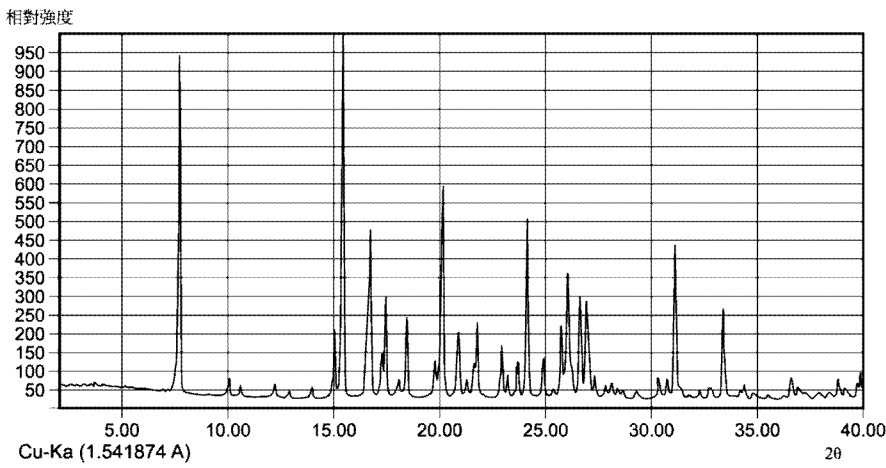
具有殺有害生物活性之多晶型物

(57)摘要

本揭露關於 N-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-N-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式，其可用於防治半翅目、繖翅目、鱗翅目等的有害生物；生產此類多晶型形式之方法；在此類方法中使用的中間體；含有此類多晶型形式的殺有害生物組成物；以及使用此類殺有害生物組成物對抗此類有害生物之方法。

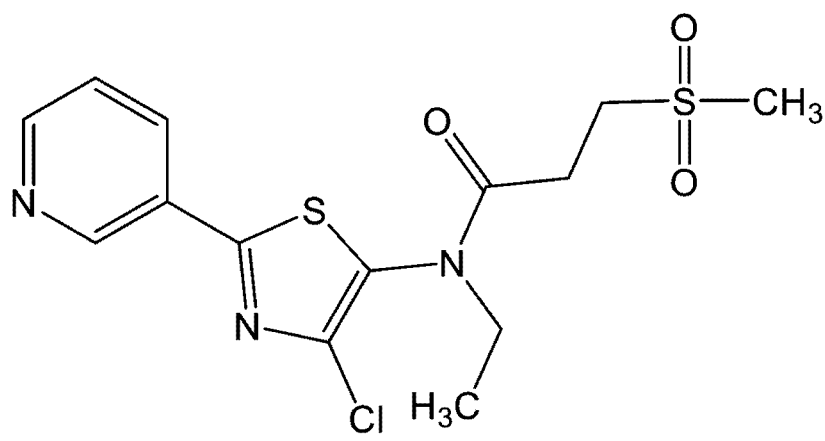
This disclosure relates to polymorphic forms of N-[4-chloro-2-(pyridin-3-yl)-1,3-thiazol-5-yl]-N-ethyl-3-(methylsulfonyl)propanamide, that are useful in the control of pests in the Order Hemiptera, Thysanoptera, Lepidoptera, and the like, processes to produce such polymorphic forms, intermediates used in such processes, pesticidal compositions containing such polymorphic forms, and processes of using such pesticidal compositions against such pests.

指定代表圖：



【圖3】

特徵化學式：



式1

【發明摘要】

【中文發明名稱】 具有殺有害生物活性之多晶型物

【英文發明名稱】 POLYMORPHS HAVING PESTICIDAL ACTIVITY

【中文】

本揭露關於*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式，其可用於防治半翅目、縷翅目、鱗翅目等的有害生物；生產此類多晶型形式之方法；在此類方法中使用的中間體；含有此類多晶型形式的殺有害生物組成物；以及使用此類殺有害生物組成物對抗此類有害生物之方法。

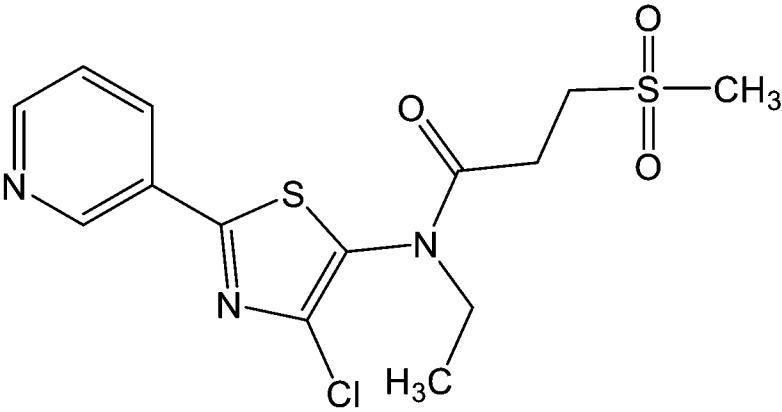
【英文】

This disclosure relates to polymorphic forms of *N*-[4-chloro-2-(pyridin-3-yl)-1,3-thiazol-5-yl]-*N*-ethyl-3-(methylsulfonyl)propanamide, that are useful in the control of pests in the Order Hemiptera, Thysanoptera, Lepidoptera, and the like, processes to produce such polymorphic forms, intermediates used in such processes, pesticidal compositions containing such polymorphic forms, and processes of using such pesticidal compositions against such pests.

【指定代表圖】 圖3

【代表圖之符號簡單說明】 無

【特徵化學式】



式1

【發明說明書】

【中文發明名稱】 具有殺有害生物活性之多晶型物

【英文發明名稱】 POLYMORPHS HAVING PESTICIDAL ACTIVITY

【技術領域】

相關申請的交叉引用

【0001】 本申請根據35 U.S.C. § 119(e)要求2021年8月3日提交的美國臨時申請案序號63/228,910和2022年7月15日提交的美國臨時申請案序號63/368,548的優先權，該等申請之全部揭露內容藉由援引併入本文。

【0002】 本揭露關於*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式，其可用於防治半翅目、縷翅目、鱗翅目等之有害生物；生產此類多晶型形式之方法；在此類方法中使用的中間體；含有此類多晶型形式的殺有害生物組成物；以及使用此類殺有害生物組成物對抗此類有害生物之方法。

【先前技術】

【0003】 「許多最危險的人類疾病皆為藉由昆蟲介體傳播」(Rivero等人)。「在歷史上，瘧疾、登革熱、黃熱病、鼠疫、絲蟲病、虱傳斑疹傷寒、錐蟲病、利什曼病、和其他介體傳播的疾病在17世紀至20世紀初造成的人類疾病和死亡超過所有其他原因的總和」(Gubler)。介體傳播的疾病占全球寄生蟲和感染性疾病的約17%。僅瘧疾每年就造成超過800,000人死亡，其中85%發生於五歲以下的兒童。每年有約5千萬至約1億例登革熱病例。每年還發生250,000至500,000例

登革出血熱（Matthews）。介體防治在感染性疾病的預防和防治中起著至關重要的作用。然而，在作為人類疾病的主要介體的所有昆蟲物種中都出現了對殺昆蟲劑的抗性，包括對多種殺昆蟲劑的抗性（Rivero等人）。最近，超過550種節肢動物物種已產生了對至少一種殺有害生物劑的抗性（Whalon等人）。此外，昆蟲抗性的案例到目前為止繼續在超過除草劑和殺真菌劑抗性的案例的數目（Sparks等人）。

【0004】 每年，昆蟲、植物病原體、和雜草破壞了所有食品生產中的多於40%。儘管應用了殺有害生物劑並且使用了多種多樣的非化學防治措施（諸如輪作）和生物防治措施，這種損失仍然發生。如果可以僅挽救此食物中的一部分，則可以將其用來養活世界上多於三十億營養不良的人（Pimental）。

【0005】 植物寄生線蟲係最普遍的有害生物之一，並且通常是最隱蔽且最昂貴的有害生物之一。據估計，可歸因於線蟲的損失為從發達國家的約9%至不發達國家的約15%。然而，在美國對35個州關於各種作物的調查指示，由線蟲引起的損失高達25%（Nicol等人）。

【0006】 值得注意的是，腹足類（蛞蝓和蝸牛）係比其他節肢動物或線蟲經濟重要性低的有害生物，但在某些地方，它們可能大幅降低產率，嚴重影響收穫產品的品質，並且傳播人類、動物、和植物疾病。儘管僅幾十種腹足類物種係嚴重的區域性有害生物，而少數物種係在全球範圍上的重要有害生物。特別地，腹足類會影響多種多樣的農業和園藝作物，諸如可耕地、牧場（pastoral）、和纖維作物；蔬菜；灌木和樹木果實；藥草；以及觀賞植物（Speiser）。

【0007】 白蟻對各種私人和公共建築都造成了損害。每年，全球範圍的白蟻損害損失量達數十億美元。2005年，據估計，白蟻每年在全球範圍內造成超過500億美元的損失（Korb）。

【0008】 因此，出於許多原因（包括上述那些），對昂貴（2010年估計每種殺有害生物劑約2.56億美元）、耗時（每種殺有害生物劑平均約10年）並且困難地開發新殺有害生物劑的需求持續存在（美國植保協會（CropLife America））。

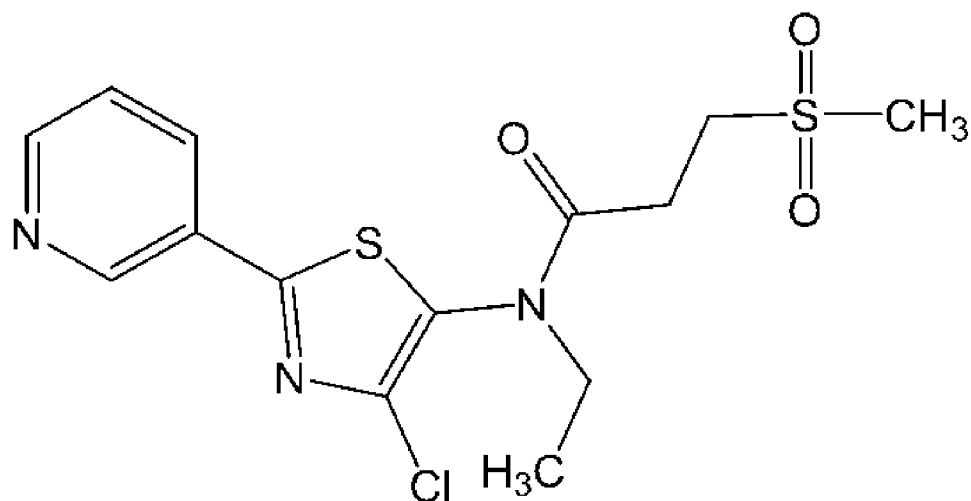
【0009】 急需新的殺有害生物劑。某些有害生物不斷發展對當前使用的殺有害生物劑的抗性。數百種有害生物物種對於一種或多種殺有害生物劑存在抗性。對一些更老的殺有害生物劑，諸如DDT、胺基甲酸酯類、和有機磷酸酯類的抗性發展係眾所周知的。但是甚至對一些較新的殺有害生物劑也已經發展了抗性。

【0010】 某些殺有害生物劑，諸如殺昆蟲劑，已被證明藉由干擾對目標有害生物的發育、繁殖或生存至關重要的生理過程來消滅昆蟲有害生物。該等生理干擾可以以各種方式發生，這導致了發現和開發藉由許多不同作用方式發揮作用的化合物。屬於殺昆蟲劑類別的殺有害生物劑具有各種作用方式，基於該等殺有害生物劑干擾的生理過程，該等作用方式可以大體上分為不同的組。示例性的作用方式包括神經和肌肉、生長和發育、呼吸、中腸靶標、以及具有未知或非特定作用的殺昆蟲劑（IRAC 2022）。儘管該等係廣義上的分類，但目標有害生物死亡的原因並不總是與殺昆蟲劑的特定作用方式一致（Matsumura 1985）。

【0011】 一個實例係殺昆蟲劑影響弦音器官。此類殺昆蟲劑的實例係可商購的，並且包括諸如吡蚜酮、氟蟲吡啶（pyrifluquinazon）和氟啶蟲醯胺等化合物，以及最近引入市場的較新成員，諸如雙丙環蟲酯（afidopyropen）。雖然廣

義上被分類為目標係神經和肌肉組織，但弦音調節劑在目標有害生物物種中會誘發各種行為症狀，包括干擾協調和進食能力，最終導致因饑餓和脫水而死亡（Kandasamy等人2017，Morita等人2007，Maienfisch 2019，Wang等人2011，Zhou等人2021）。行為學研究已經研究了弦音調節劑的行為效果。例如，Lee和同事（Lee等人2013）評價了pyrifluquinazon對煙粉虱（*Bemisia tabaci*）和白粉虱（*Trialeurodes vaporariorum*）成蟲的影響並注意到快速敲低效果和強烈的中毒症狀，包括抽搐和麻痺。在黑腹果蠅（*Drosophila melanogaster*）中報告了類似的行為效果，其中暴露於弦音調節劑強烈抑制了處理過的蒼蠅的攀爬行為（Nesterov等人2015，Wang等人2019）。由於弦音調節劑殺昆蟲劑影響活動性和進食，因饑餓和脫水導致的死亡的發生比其他殺昆蟲劑諸如新菸鹼更慢（He等人2010，Maienfisch 2019）。然而，中毒症狀在暴露後不久可見並且可以診斷其作用（Lee等人2013，Morita等人2007）。因此，已經證明，弦音調節劑的行為效果，諸如敲低效果，係導致死亡率增加的變化並且可以作為死亡率的指標提供。

【0012】因此，由於包括上述原因在內的許多原因，對新殺有害生物劑存在著需求。一種這樣的化合物，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺，或其溶劑化物或水合物（本文中也被稱為「化合物1」，也被稱為*N*-(4-氯-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-基)-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺），其由式1表示



N-(4-氯-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-基)-*N*-乙基-3-(甲基磺酰基)丙酰胺

1

係表現出對抗多種有害生物的活性的有效小分子。研究了化合物1的殺昆蟲效用。與化合物1相關的化合物揭露於國際專利公佈案號WO 2010/139497 A1和美國專利號8,350,044中，該等專利以其全文藉由援引併入本文。

【0013】雖然化合物1已被用作殺有害生物劑，但具有以下多晶型形式係有利的，該等多晶型形式具有改進的特性，諸如改進的結晶度、溶解特性、降低的吸濕性和/或易於在商業上可行的組成物中配製以用於現場應用；同時保持化學穩定性特性。

本揭露中引用的某些參考文獻

【0014】 Busvine, J. R. (1971). Contact poisons in solid form: residual films of contact insecticides [呈固體形式的接觸性毒劑：接觸性殺昆蟲劑的殘留膜]. In *A Critical Review of the Techniques for Testing Insecticides* [在測試殺昆蟲劑的技術的批判性評論中] (第二版編輯, 第102-128頁). Commonwealth Agricultural Bureaux [聯邦農業局]。

【0015】 CropLife America [美國植保協會], The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future [新農用化學品發現、開發和註冊以及未來研究與開發預測的成本], 2010。

【0016】 Drewes, M., Tietjen, K., Sparks, T.C., High-Throughput Screening in Agrochemical Research, *Modern Methods in Crop Protection Research, Part I, Methods for the Design and Optimization of New Active Ingredients* [農業化學研究中的高通量篩選，作物保護研究中的現代方法，第I部分，用於設計和優化新活性成分之方法], 由Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., 和Matthias W.編輯, 第1-20頁, 2012。

【0017】 Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, *Emerging Infectious Diseases* [作為全球健康問題的複現的介體傳播的疾病，新出現的感染性疾病], 第4卷, 第3期, 第442-450頁, 1998。

【0018】 He, Y., Chen, L., Chen, J., Zhang, J., Chen, L., Shen, J., & Cheng Zhu, Y. (2011). Electrical penetration graph evidence that pymetrozine toxicity to the rice brown planthopper is by inhibition of phloem feeding [電穿透圖證明吡蚜酮對水稻褐飛虱的毒性係藉由抑制韌皮部攝食]. *Pest Management Science* [害蟲管理科學], 67(4), 483-491。

【0019】 IRAC Insecticide Resistance Action Committee [IRAC 殺蟲劑抗性行動委員會] (2022). IRAC Mode of Action Classification Scheme [IRAC 作用方式分類表], 版本 10.2. 39. 2022 年 3 月檢索, 從 <https://irac-online.org/mode-of-action/>

【0020】 Kandasamy, R., London, D., Stam, L., von Deyn, W., Zhao, X., Salgado, V. L., & Nesterov, A. (2017). Afidopyropen: New and potent modulator of insect transient receptor potential channels [雙丙環蟲酯：昆蟲瞬時受體電位通道的新型且有效的調節劑]. *Insect Biochemistry and Molecular Biology* [昆蟲生物化學和分子生物學], 84, 32-39。

【0021】 Korb, J., Termites, *Current Biology* [白蟻類，現代生物學], 第17卷, 第23號, 2007。

【0022】 Lee, S.-W., Song, M.-K., Ahn, Y. J., Kim, Y.-J., Moon, Y.-S., Koo, H. N., & Kim, G. H. (2013). Insecticidal Activity and Behavioral Disorders by Pyriproxyfen to *Trialeurodes vaporariorum* and *Bemisia tabaci* [Pyriproxyfen對白粉虱和煙粉虱的殺昆蟲活性和行為紊亂]. *The Korean Journal of Pesticide Science* [韓國農藥科學雜誌], 17(1), 33-40

【0023】 Maienfisch, P. (2019). Selective feeding blockers: pymetrozine, flonicamid, and pyriproxyfen [選擇性進食阻斷劑：吡蚜酮、氟啶蟲醯胺和pyriproxyfen]. 在P. Jeschke, M. Witschel, W. Krämer, & U. Schirmer (編輯), *Modern Crop Protection Compounds* [現代作物保護化合物] (第三版編輯, 第3卷: Insecticides [殺昆蟲劑], 第1501-1526頁). 威利-VCH出版社 (Wiley-VCH) 中。

【0024】 Matsumura, F. (1985). Modes of action of insecticides [殺昆蟲劑的作用方式]. 在*Toxicology of Insecticides* [殺昆蟲劑的毒理學]: 第二版 (第111-202頁). 普萊紐姆出版社 (Plenum Press) 中。

【0025】 Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases [綜合的介體管理：防治瘧疾介體和其他昆蟲介體傳播的疾病], 第1章, 第1頁, 2011。

【0026】 Morita, M., Ueda, T., Yoneda, T., Koyanagi, T., & Haga, T. (2007). Flonicamid, a novel insecticide with a rapid inhibitory effect on aphid feeding [氟啶蟲醯胺，一種對蚜蟲攝食有快速抑制作用的新型殺昆蟲劑]. *Pest Management Science* [害蟲管理科學], 63, 969-973。

【0027】 Nesterov, A., Spalthoff, C., Kandasamy, R., Katana, R., Rankl, Nancy B., Andrés, M., Jähde, P., Dorsch, John A., Stam, Lynn F., Braun, F.-J., Warren, B., Salgado, Vincent L., & Göpfert, Martin C. (2015). TRP Channels in Insect Stretch Receptors as Insecticide Targets [作為殺昆蟲劑靶標的昆蟲牽張感受器中的TRP通道]. *Neuron* [神經元], 86(3), 665-671。

【0028】 Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, Genomic and Molecular Genetics of Plant - Nematode Interactions [當前對世界農業的線蟲威脅，植物的基因組和分子遺傳學 - 線蟲相互作用], 第21-43頁, 2011。

【0029】 Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, Agricultural Sciences [世界農業中的有害生物防治，農業科學] - 第II卷, 2009。

【0030】 Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector- Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem? [介體傳播的疾病的昆蟲防治：何時昆蟲抗性成為問題？]Public Library of Science Pathogens [公共科學圖書館病原體], 第6卷, 第8期, 第1-9頁, 2010。

【0031】 Sparks T.C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management [IRAC：作用方式分類和殺昆蟲劑抗性管理], Pesticide Biochemistry and Physiology [農藥生物化學和生理學] (2014)，可線上接入，2014年12月4日。

【0032】 Speiser, B., Molluscicides, Encyclopedia of Pest Management [殺軟體動物劑，有害生物管理百科全書], 第219章, 第506-508頁, 2002。

【0033】 Stroup, W.W. (2012). Generalized Linear Mixed Models: Modern Concepts, Methods and Applications [廣義線性混合模型：現代概念、方法和應用]. CRC出版社. 第555頁。

【0034】 Wang, H., Lei, Z., Mei, Y., Shuo, L., & YunLiang, J. (2011). Effect of pymetrozine interferes with feeding behavior of *Bemisia tabaci* (Homoptera, Aleyrodidae) [吡蚜酮干擾煙粉虱（同翅目，粉虱科）的攝食行為的影響]. *Chinese Journal of Applied Entomology* [中國應用昆蟲學雜誌], 48(1), 54-59。

【0035】 Wang, L.-X., Niu, C.-D., Salgado, V. L., Lelito, K., Stam, L., Jia, Y.-L., Zhang, Y., Gao, C.-F., & Wu, S.-F. (2019). Pymetrozine activates TRPV channels of brown planthopper *Nilaparvata lugens* [吡蚜酮活化褐飛虱*Nilaparvata lugens*的TRPV通道]. *Pesticide Biochemistry and Physiology* [農藥生物化學和生理學], 153, 77-86。

【0036】 Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, Global Pesticide Resistance in Arthropods [全球節肢動物的殺有害生物劑抗性的分析，節肢動物的全球殺有害生物劑抗性], 第1章, 第5-33頁, 2008。

【0037】 Zhou, X., Zhang, Z., Zheng, H., Zhang, Q., Gong, J., Li, C., & Wang, R. (2021). Physiological and Biochemical Responses to Sublethal Concentrations of the Novel Pyropene Insecticide, Afidopyropen, in Whitefly *Bemisia tabaci* MED (Q Biotype) [粉虱煙粉虱MED (Q生物型) 對亞致死濃度的新型Pyropene殺昆蟲劑雙丙環蟲酯的生理和生物化學反應]. *Agronomy [農藝學]*, 11(11)。

本揭露之定義

【0038】 該等定義中給出的實例通常是非詳盡的，並且不得解釋為限制本揭露。可以理解的是，取代基應相對於與其附接的特定分子遵從化學鍵合規則和空間相容性約束。該等定義僅用於本揭露之目的。

【0039】 短語「活性成分」意指具有可用於防治有害生物的活性的材料和/或可用於幫助使其他材料具有較好的防治有害生物的活性的材料；此類材料的實例包括但不限於殺蜚蠊亞綱動物劑、殺藻劑、拒食劑、殺鳥劑、殺細菌劑、驅鳥劑、化學不育劑、殺真菌劑、除草劑安全劑、除草劑、昆蟲引誘劑、驅昆蟲劑、殺昆蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、植物活化劑、植物生長調節劑、殺齧齒動物劑、增效劑、和殺病毒劑（參見bcpc.org）。

【0040】 短語「活性成分組α」（在下文中為「AIGA」）共同意指以下材料：阿維菌素、阿維菌素胺甲基、脫落酸、ACC、乙醯甲胺磷、滅蟎醃、啖蟲脒、家蠅磷、乙草胺、三氯殺蟲酯、乙酯磷、乙醯蟲脒、阿拉酸式苯、三氟羧草醚、苯草醚、ACN、阿萊普、氟丙菊酯、丙烯醛、丙烯腈、阿西非那比（acynonapyr）、阿普泰克、雙丙環蟲酯（afidopyropen）、阿福拉納、(S)-阿福拉納、AITC、甲草胺、抑草生、棉鈴威、阿苯達唑、涕滅威、涕滅威砒、阿迪味啉、涕滅威砒、艾氏劑、丙烯菊酯、右旋反式丙烯菊酯、蒜素、草毒死、阿洛胺菌素、禾草滅、烯

丙醇、異硫氰酸烯丙酯、除害威、五氯戊酮酸、 α -溴敵隆、 α -氯氰菊酯、 α -硫丹、
 甲體氯氰菊酯、六甲蜜胺、磷化鋁（aluminium phosphide）、磷化鋁（aluminum
 phosphide）、辛啞啞菌胺、胺吡啶、莠滅淨（ametryn）、莠滅淨（ametryne）、
 特草吡啶、胺啞草酮、拌種靈、賽果、先甲草胺（amidochlor）、磷胺磷酯、噻
 啞磷隆、滅害威、環丙啞啞啞酸、氯胺吡啞啞酸、4-胺基吡啞啞、胺基吡芬、胺基三啞、
 甲基胺草磷、胺草磷、甲基-胺草磷、吡啞啞菌胺、胺吸磷、雙甲脒、殺草強、
 胺基磷酸銨、代森銨、氣相二氧化矽、無定形二氧化矽、胺丙膦酸、AMS、新菸
 鹼、啞啞醇、敵菌靈、莎稗磷、anisiflupurin、疏草隆、蔥醌、酒石酸銻鉀、安妥、
 啞磷吡、殺蟎特、殘殺威、三氧化二砷、福美砷、黃草靈、乙基殺撲磷、阿特拉
 通、阿特拉津、金色製酶素、阿維菌素B₁、AVG、艾維激素、阿紫康啞、印苦楝
 子素、草芬定、甲基吡啞啞、滅蚜松、四啞啞磷隆、益棉磷（azinphos-ethyl）、
 益棉磷（azinphosethyl）、保棉磷（azinphos-methyl）、保棉磷（azinphosmethyl）、
 疊氮津（aziprotryn）、疊氮津、氧化福美雙、偶氮苯、三啞錫、偶氮磷、啞菌酯、
 菊乙胺酯、燕麥靈（barban）、燕麥靈（barbanate）、六氟矽酸鋇、多硫化鋇、
 氟矽酸鋇、熏菊酯、鹼式碳酸銅、鹼式氯化銅、鹼式硫酸銅、BCPC、氟丁噻草
 胺、氟丁噻草胺-M、苯霜靈、精苯霜靈、草除靈、苯卡巴肼、苯氯噻、苯啞吡丙
 酯（bendaqingbingzhi）、啞蟲威、苯達松、倍尼芬（benefin）、氟草胺、丙硫克
 百威、呋草黃、苯啞磷草胺、麥鏽靈、苯菌靈、解草酮、苯啞磷、敵菌肼、啞草
 酮、苄啞磷隆、地散磷、殺蟲磷、苯它隆、噻草平、滅草松、苯噻菌胺、苯噻硫
 氰、禾草滅、苯草滅、胺酸殺、苯紫氯銨、苄烯酸、異惡草胺、抑菌啞、六氯化
 苯、雙苯啞草酮、苯甲亞胺、苄草胺、苯并雙環酮、硫丹、吡草酮、氟磷胺草、
 基異脛肼酸、苯蟎特（benzomate）、苯并磷酸鹽（Benzophosphate）、苯并噻二

唑、苯丙烯氟菌唑、苯蟊特(benzoximate)、新燕靈、苯并嘧啶烷(benzpyrimoxan)、
苯噻隆、苯唑草酮(benzuocaotong)、苄腺嘌呤、苯甲酸苄酯、小蘗鹼、 β -氟氯
氰菊酯、 β -氯氰菊酯、苯噻吡、BHC、 γ -BHC、雙丙胺磷、雙環哌喃酮、聯苯肼
酯、必芬諾、聯苯菊酯、 κ -聯苯菊酯、吡氟菌酯、畢拉草、樂殺蟊、丙環唑、病
氰硝、生物丙烯菊酯、S-生物丙烯菊酯、戊環苄呋菊酯、生物氯菊酯、生物苄呋
菊酯、聯苯、雙唑草酮、吡殺茲、噻枯唑、噻枯唑銅、亞甲基二(x-萘-y-磺酸)二
苯汞(bisphenylmercury methylenedi(x-naphthalene-y-sulphonate))、雙草醚、雙三
氟蟲脲、殺蟲雙、比多農、硫雙二氯酚、必殺吩、比克羅宗、殺稻瘟菌素S、硼
砂、波爾多混合液、硼酸、白可列、BPCMS、BPMC、BPPS、芸薹素內酯、乙
基芸薹素內酯、小蠹性資訊素、溴鼠靈、溴氟醚菊酯(brofenprox)、溴滅菊酯、
溴氟鹽胺、溴氟菊酯、除草定、溴敵隆、 α -溴敵隆、二溴磷(bromchlophos)、
溴鼠胺、溴苄呋菊酯、溴苯烯磷、溴乙鹽胺、糠草腈、溴丁鹽草胺、溴西克林、
溴烯殺、溴-DDT、殺草全、溴硫磷(bromofos)、溴甲烷、溴硫磷(bromophos)、
乙基溴硫磷、溴蟊酯、溴菌腈、溴苯腈、溴莠敏、溴唑草酮(brompyrazone)、
糠菌唑、溴硝醇、bropropdifacoum、BRP、BTH、增效特、合殺威、特克草、布
瑞莫、噻吡酮、伯更狄混合液、白消安(busulfan)、白消安(busulphan)、畜
蟲威、丁草胺、氟丙嘧草酯、牧草胺、抑草磷、丁烷氟蟲腈、特嘧硫磷、丁烯草
胺、丁烯氟蟲腈、苄烯菊酯、特咪唑草、丁硫啶、丁噻隆、脫葉亞磷(butifos)、
丁酮威、丁酯磷、避蚊酮、丁酮虱威、地樂胺、葉鏽特、丁苯草酮、炔草隆、丁
胺、丁草敵、丁酯磷(butylchlorophos)、丁烯氟蟲腈、二甲胂酸、硫線磷、唑
草胺、鈣化醇、砷酸鈣、氯酸鈣、氰胺鈣、氰化鈣、多硫化鈣、敵敵鈣、克草胺
酯、毒殺芬、樟腦、*d*-樟腦、硝硫氰醚(cantrodifene)、敵菌丹、克菌丹、威百

畝、嗎菌威、氯滅殺威、卡巴立 (carbaril)、西維因、卡巴草靈、硫威鈉、卡巴
 松、貝芬替、多菌靈、長殺草、卡波硫磷、克百威、二硫化碳、四氯化碳、硫化
 羰、三硫磷、馬拉硫磷 (carbophos)、丁硫克百威、甲草威、環二混劑、菱鏽靈、
 唑草酮、環丙噻菌胺、殺螟丹、香芹酚、香芹酮、CAVP、CDAA、CDEA、CDEC、
 葉枯炔、CEPC、賽拉羅、敵菌脲、cetocaelat、沙巴草、切欣特混合液、奎硫磷
 (chinalphos)、甲基愛奎硫磷 (chinalphos-méthyl)、滅蟊猛 (chinomethionat)、
 滅蟊猛 (chinomethionate)、赤拉靈、殼聚糖、滅瘟唑、甲氧除草醚、氯-IPC、
 氯醛糖、草滅平、氯胺磷、抑黴唑、氯黴素、雙胺靈、四氯化苯醌、丁噻草胺、
 氯蟲苯甲噻胺、炔禾靈、可樂津、氯殺蟊、滅幼脲、冰片丹、氯溴隆、氯炔靈、
 氯丹、十氯酮、殺蟲脒、氯烯炔菊酯、玉雄殺、乙烯利、蟲脒、鹽酸殺蟲脒、伐
 草克、蟲蟊脒、苯咪唑菌、殺蟊醇、滅草隆、燕麥酯、殺蟊酯、敵蟊特、毒蟲畏、
 甲基毒蟲畏、定蟲隆、氟啶殺、氯甲丹、氯茆羧酸、氯茆素、氯草敏、氯嘧磺隆、
 氯化物、氯甲磷、矮壯素、磺草酮、甲氧除草醚、氯乙靈、草枯醚、氯乙酸、乙
 酯殺蟊醇、氯二硝萘、殺蟊酯、氯仿、 α -氯代醇、氯吡啶噻肼、伊托明、滅蟲脲、
 地茂散、氯敵鼠、敵百蟲、氯肽亞胺 (chlorophthalim)、氯化苦、三氯丙酸、氯
 炔丙菊酯、丙酯殺蟊醇、百菌清、氯麥隆、氯醚隆 (chloroxifenidim)、枯草隆
 (chloroxuron)、羥敵草脒、三丁氯苄脒、氯辛硫磷、氯噻亞胺 (chlorphthalim)、
 氯吡啶磷、草敗死、氯苯胺靈、毒死蜱、甲基毒死蜱、四氯喹啉、氯磺隆、敵
 草索、草克樂、蟲蟊磷、綠麥隆、克氯得、殼聚糖、膽鈣化醇、氯化膽鹼、環蟲
 噻肼、環己米特、抗倒酯 (cimectacarb)、抗倒酯 (cimetacarb)、瓜菊酯I、瓜
 菊酯II、瓜菊酯、吡啶酮草酯、環庚草醚、醚磺隆、津奧琳、氯苯噻胺、咯草隆、
 順式苄炔菊酯、氯噻草脒、環苯草酮、克侖吡林、氯苯氫吡咯 (clenpyrin)、克

草同、氯咪巴唑、碘氯啉酯、炔草酸、地蟲威、苯嗒吡啶、滴滴涕、四蟎吡、氯
 芬磷、降固醇酸、草氯丙酸、廣滅靈、稗草胺、貝螺殺、氯羥吡啶、坐果安、氯
 丙氧定、畢克草、解毒啞、氯酯磺草胺酸、氯氰碘柳胺、噻蟲胺、克黴唑、坐果
 酸、克拉壘 (cloxylacon)、克紫壘 (clozylacon)、CMA、CMMP、CMP、CMU、
 科得引誘劑、膽骨化醇、噻唑硫磷、醋酸銅、亞砷酸銅、砷酸銅、碳酸銅、鹼式、
 氫氧化銅、環烷酸銅、油酸銅、氧氯化銅、8-羥基喹啉銅、矽酸銅、硫酸銅、鹼
 式硫酸銅、鉻酸鋅銅、氯殺鼠靈、殺鼠靈、庫馬磷 (coumafós)、克滅鼠、蠅毒
 磷、殺鼠迷、甲香菌酯、畜蟲磷、丁香菌酯、4-CPA、4-CPB、CPMC、CPMF、
 4-CPP、CPPC、醚草敏、甲酚、甲苯基酸、鼠立死、氯康唑、克羅米通、巴毒磷
 (crotoxyfos)、丁烯磷 (crotoxyphos)、育畜磷、冰晶石、誘蠅酮、硫雜靈、枯
 草酮 (cumyleron)、芞草隆、福美銅氯、氧化亞銅、莠術醇、CVMP、胺腈、氰
 草淨、氰草津、苯腈磷、氰、殺螟腈、果蟲磷、氰蟲醯胺、三聚氰酸、氰霜唑、
 灑布淨、環菌胺、環丙酸醯胺、環溴蟲醯胺、環蟲菊酯、環草敵、cyclobutrifluram、
 環己醯亞胺、環蟎酯、乙氰菊酯、環吡喃 (cyclopyranil)、環噠草特、環磺隆、
 環氧蟲啉、環殺草、環莠隆、腈吡蟎酯、乙唑蟎腈、環氟菌胺、丁氟蟎酯、氟氯
 氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、環鹵二醯胺 (cyhalodiamide)、氟氯草酯、氯氟氰菊酯、
 γ -氯氟氰菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、三環錫、cymergan、蟎婢胺、霜脲氰、解草胺腈、
 氰菌靈、氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 β -氯氰菊酯、 θ -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、牧草
 快、苯醚氰菊酯、環草津、三環塞草胺、環克座、啞菌環胺、環丙氟蟲胺、酯菌
 胺、環丙草胺、可普磺醯胺、環吡氟草酮、環丙馬秦、畜婢磷、多果定、1,3-D、
 2,4-D、3,4-DA、殺草隆、茅草枯、丁醯肼、噠幼酮、棉隆、2,4-DB、3,4-DB、
 DBCP、d-樟腦、DCB、DCD、DCIP、DCPA (美國)、DCPA (日本)、DCPTA、

DCU、DDD、DDPP、DDT、pp'-DDT、DDVP、2,4-DEB、咪菌威、癸磷錫、溴
氰菊酯（decamethrin）、一甲呋喃丹、避蚊胺、去氧乙酸、敵草快（deiquat）、
異丁草胺、環氧硫磷、溴氰菊酯（deltamethrin）、田樂磷、田樂磷-O、田樂磷-
S、內吸磷、甲基內吸磷、內吸磷-O、甲基內吸磷-O、內吸磷-S、甲基內吸磷-S、
內吸磷-S-甲磺酸、甲基內吸磷-S磺、DEP、2,4-DEP、生物丙烯菊酯、魚藤酮、
2,4-DES、甜菜安、敵草淨（desmetryn）、敵草淨（desmetryne）、d-反式鹵炔丙
菊酯、DFDT、丁醚脲、氯亞磷、氯亞胺硫磷、燕麥敵（di-allate）、燕麥敵（diallate）、
二胺磷、diamiphenethide、麥草畏（dianat）、矽藻土（diatomaceous earth）、矽
藻土（diatomite）、二吡農、二溴磷、1,2-二溴乙烷、鄰苯二甲酸二丁酯、驅蟲
特、麥草畏（dicamba）、異氯磷、dicarbasulf、dicarbosulf、敵草腈、二氯苯噻唑
（dichlobentiazox）、dichlobenz-methyl、除線磷、益發靈、二氯萘醌、氯全隆、
二滅幼脲、敵草隆、羧酸萆、二氯萆醇（dichlorflurenol）、苄胺靈、二氯丙烯胺、
鄰二氯苯（o-dichlorobenzene）、鄰二氯苯（ortho-dichlorobenzene）、對二氯苯
（p-dichlorobenzene）、對二氯苯（para-dichlorobenzene）、2,5-二氯苯甲酸、1,2-
二氯乙烷、二氯甲烷、二氯酚、3,6-二氯吡啶酸、1,2-二氯丙烷、1,3-二氯丙烯、
滴丙酸、滴丙酸-P、敵敵畏、菌核利（dichlozolin）、菌核利（dichlozoline）、苄
氯三唑醇、二氯西莫、二草氯丙酸、達滅淨、氯硝胺、敵克美施、雙氯磺草胺、
三氯殺蟎醇、滴滴涕、雙殺鼠靈、敵來死、百治磷、地快樂、雙香豆素、地昔尼
爾、迪賽隆、狄氏劑、除蟎靈、二乙除草雙、甘草鎖、二愛殺松、乙硫磷（diéthion）、
乙黴威、增效磷、乙硫磷（diéthion）、焦碳酸二乙酯、待乙妥、鼠得克、待克利、
戊味禾草靈、枯莠隆、苯敵快、噻鼠靈、氟蟎吡、二福隆、吡氯草胺、吡氯醯草
胺、二氟吡隆、二氟林、敵草克、雙羥丙茶鹼、敵瑪替夫、dimefluazole、四氟甲

醚菊酯、甲氟磷、噁唑隆、殺蟲雙、dimenoxypyrin、吡草丹、dimesulfazet、菌核
 淨、地麥威、混滅威、菌核淨、二甲草胺、異戊淨、二甲噻草胺、二甲噻草胺-
 P、噻節因、二甲嘧啶、樂果、達滅芬、苄菌酯、驅蚊靈、二甲基二硫醚、二甲
 基鄰苯二甲酸酯、二甲基亞硝胺、敵蠅威、草滅散、草噻酮、地莫菌胺、滅草靈
 (dimpropyridaz)、二吡農、殺草隆、消螨酚、啞菌噁唑、烯唑醇、烯唑醇-M、
 R-烯唑醇、敵樂胺、二硝基酚、大脫螨、消螨普、消螨普-4、消螨普-6、鄰敵螨
 消、迪樂芬諾、硝戊酯、丙硝酚、戊硝酚、地樂酚、硝辛酯、呋蟲胺、特樂酚、
 硝丁酯、苯蟲醚、蔬果磷、二氧威、敵殺磷、敵惡磷、dioxopyritrione、敵鼠
 (diphacin)、敵鼠(diphacinone)、二苯茛酮、草乃敵(diphenamid)、草乃敵
 (diphenamide)、二苯胺、二苯砒、二苯硫醚、調味酸、地樂靈、異丙淨、敵百
 蟲、敵派美創、雙硫氧吡啶、敵草快、殺蟲雙、雌舞毒蛾引誘劑、麥草畏甲酯、
 賽松、雙硫命、乙拌磷、滅菌磷、腈硫醯、噻喃磷、二甲基二硫醚、甲基乙拌磷、
 氟硫草定、dithiuron、達有龍、雙黃藥、*d*-檸檬烯、DMDS、DMPA、DNOC、嗎
 菌靈、多地辛、多寧、苯氧炔螨、十二烷基胍醋酸鹽、穀蠹引誘劑、朵拉克汀、
 2,4-DP、3,4-DP、DPC、敵菌酮、DSMA、右旋七氟甲醚菊酯、右旋反式丙烯菊
 酯、右旋反式苄呋菊酯、毒氟磷、莎撲隆、EBEP、EBP、硫線磷、 α -蛻皮激素、
 β -蛻皮激素、蛻皮甾酮、氯唑靈、EDB、EDC、EDDP、克瘟散、甘草津、甲胺
 基阿維菌素、EMPC、烯炔菊酯、烯腺嘌呤、硫丹、 α -硫丹、草多索、草藻滅、
 因毒磷、安特靈、烯肱菌酯(enestroburin)、恩康唑、烯肱菌酯(enoxastrobin)、
 螨淨、24-表藝薹素內酯、EPN、丙醯藝薹素內酯、保幼醚、依普座、依立諾克
 丁、磺唑草、 ϵ -甲氧苄氟菊酯、 ϵ -莫氟殺林、EPTC、epyrifenacil、抑草蓬、麥角
 鈣化醇、二氯己醯草胺、esafoxolaner、生物烯丙菊酯、高氰戊菊酯、ESP、戊草

丹、乙烯矽、乙環唑、依他伏殺、代森硫、噻唑菌胺、克草胺、乙丁烯氟靈、胺
苯磺隆、殺草胺、乙烯利、噻二唑隆、殺蟲丹、抑草威、愛殺松、乙吡草酮、乙
蟲腈、依瑞莫、益硫、乙氧本草胺、乙呋草黃、驅蚊醇、滅克磷、普伏松、氯氟
草醚、(3-乙氧基丙基)溴化汞、促長啉、乙氧嘧磺隆、吲熟酯、乙滴滴、乙基-DDD、
乙烯、二溴乙烯、二氯乙烯、氧化乙烯、甲酸乙酯、乙蒜素、乙酸乙基汞、溴化
乙基汞、氯化乙基汞、2,3-二羥基丙基硫醇化乙基汞、磷酸乙基汞、N-(乙基汞)-
對甲苯磺醯苯胺(sulfonanilide)、N-(乙基汞)-對甲苯磺醯苯胺(sulphonanilide)、
焦磷酸乙酯、乙拌磷、戊唑醇(ethyltrianol)、戊唑醇(etiltrianol)、硝草酚、
ETM、乙胺草醚、乙氧苯草胺、依芬普司、乙蟎唑、依得利、乙嘧硫磷(etrifos)、
丁香酚、EXD、famoxacarb、凡殺同、胺磺磷、右旋反式氯丙炔菊酯、伐草克、
咪唑菌酮、敵克松、烯肟菌胺、芬滅松、咪菌腈、芬瑞莫、醯苯磺威(fenasulam)、
抗蟎唑、啞蟎醚、芬克座、苯丁錫、解草唑、皮蠅硫磷、芬氯磷、解草啞、乙苯
威、fenetrazole、五氟苯菊酯、甲呋醯胺、環醯菌胺、非草隆、種衣酯、撲滅松、
除蟎酯、酚菌酮、fenmezoditiaz、仲丁威、毒菌錫、涕丙酸、苯硫威、非諾克林、
氰菌胺、啞唑禾草靈、啞唑禾草靈-P、異啞苯砒、芬諾克、拌種咯、芬哌沙米
(fempicoxamid)、吡氯氰菊酯、甲氰菊酯、苯鏽啞、芬普福、胺苯吡菌酮、苯
唑氟草酮、唑蟎酯、芬奎三酮、嗒吡抑雄素、除蟎酯、豐索磷、氯苯氧乙醇、噻
唑禾草靈、芬殺松、乙基芬殺松、噻唑禾草靈、三苯錫、四唑醯草胺、芳氟胺、
非草隆、非草隆-TCA、氰戊菊酯、福美鐵、富米綜、磷酸鐵、硫酸亞鐵、氟蟲
腈、氟燕靈、氟燕靈-M、嘧啶磺隆、氟鼠靈、氟美托奎、氟啞蟲醯胺、雙氟磺草
胺、氯氟吡啞酯、氟吡草胺(florylpicoxamid)、嘧蟎酯、三氟咪啞醯胺
(fluazaindolizine)、吡氟禾草靈、吡氟禾草靈-P、扶吉胺、異丙吡草酯、氟佐

隆、氟蟲雙醯胺、氟苯醚醯胺、氟蟊嗪、溴氟菊酯、氟酮磺隆、氟吡磺隆、氟消
 草、fluchloraminopyr、氟氯蟲雙醯胺 (fluchlordiniliprole)、伏康脲、氟環脲、氟
 氰菊酯、護汰寧、聯氟蟊 (fluénéthyl)、聯氟蟊 (fluenetil)、氟噻蟲砒、氟噻
 草胺、氟芬內林、吡氟草胺、flufenoxadiazam、氟蟲脲、氟菌蟊酯、三氟醚、氟
 嗒吡草酯、氟蟊吡、丁烯氟蟲腈、氟己芬、氟茚啉菌胺 (fluindapyr)、氟氯苯菊
 酯、氟噻菌胺、氟節胺、啞啞磺草胺、flumetylsulforim、氟默吡、氟烯草酸、丙
 炔氟草胺、氟米丙平、氟味啉、伏草隆、氟吡菌胺、氟吡胺 (fluopimomide)、
 氟吡菌醯胺、氟殺蟊、增糖胺、氟乙醯胺、氟乙酸、氟咯草酮、氟-DDT、消草
 醚、氟滴滴涕、乙羧氟草醚、啞啞草、氟氯菌核利 (fluoromide)、啞啞草、氟
 除草醚、氯氟吡氧乙酸、氟硫隆、三氟苯啞、氟氧雜吡乙酮 (fluoxapiprolin)、
 氟啞菌酯、fluoxytioconazole、flupentiofenox、氟胺草啞、氟丙啞草、氟鼠啞、四
 氟丙酸、氟吡啞喃酮、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、氟啞啞 (flupyrimin)、氟啞
 啞磺隆、氟啞啞、氟拉藍那、解草安、抑草丁、羧萆素、氟啞草酮、氟咯草酮、
 氟定咪、氟草定、調啞醇、氟磺醯胺、啞草酮、護矽得、氟硫滅、氟蟊吡、吡草
 酸、氟噻草胺、氟替尼、福多果定、護汰芬、氟胺氰菊酯、 τ -氟胺氰菊酯、氟甲
 醯胺 (fluxametamide)、氟啞菌醯胺、肱草安、福爾培 (folpel)、滅菌丹 (folpet)、
 氟磺胺草醚、地蟲磷、甲醯啞磺隆、氟吡脲、甲醛、伐蟲脛、安果、胺甲威、殺
 木磷、福賽得、丁苯硫磷、福司吡酯、噻啞磷、丁硫環磷、弗羅塔林、四氯苯酞、
 麥穗靈、氟草淨、氟草醚、啞喃蟲醯肼、氟菌蟊酯 (fujunmanzhi)、氟氯醚 (fulumi)、
 氟乙醯胺、氟蔡禾草靈、啞苯硫脲、乙二醇縮糖醛、啞霜靈、炔啞菊酯、福拉比、
 啞喃蟲醯肼、啞線威、二甲啞醯胺、氟康啞、順式氟康啞、抗蟲菊、糠醛、啞喃
 解草啞、拌種胺、啞菌隆、啞氧草醚、 γ -BHC、 γ -氯氟氰菊酯、 γ -HCH、格蟊酯、

赤黴酸、赤黴素A3、激勃素、鼠甘伏（gliftor）、鼠甘伏（glitor）、氯醛糖、草
銨磷、草銨磷-P、L-草銨磷、果綠定、乙二肼、草甘磷、草甘二磷、棉紅鈴蟲性
誘劑、誘殺烯混劑、灰黃黴素、胍諾克汀、雙胍鹽、丙烯酸喹啉酯、氟氯吡啶酯、
苄蟊醚、氯蟲醯肼、氟硝磺醯胺、氯吡嘧磺隆、氟啶草、吡氟氯禾靈、吡氟氯禾
靈-P、吡氟氯禾靈-R、HCA、HCB、HCH、 γ -HCH、六甲密胺、六甲磷、HEOD、
七氯、禾他氟林、heptamaloxyloglucan、庚烯磷、增產肼、除莠黴素、除莠黴素
A、速殺硫磷、六氯、六氯環己烷、六氯丙酮、六氯苯（hexachlorobenzene）、
六氯丁二烯、六氯苯（hexachlorophene）、菲克利、氟鈴脲、六氟拉敏、六氟砷
酸鉀、己誘劑、己醯胺、六吡同、己硫磷、噻蟊酮、HHDN、霍洛硫、高油菜素
內酯、環吡氟草酮、環草肼、環蟲腈（huanchongjing）、磺草靈、環菌唑、氟蟻
肼、汞加芬、水合石灰、胺腈化氫、氰化氫、烯蟲乙酯、S-烯蟲乙酯、土菌消、
4-羥基苯乙醇、8-羥基喹啉硫酸鹽、惡黴靈、奮淋威、IAA、IBA、IBP、埃卡瑞
丁、伊米薩利、咪草酸、imazamethapyr、甲氧咪草煙、甲咪唑菸酸、滅草煙、滅
草喹、咪草煙、唑吡嘧磺隆、亞胺唑、新煙磷、吡蟲啉、氯噻啉、克熱淨、炔咪
菊酯、依納素、茚草酮、indazapyroxamet、茚吡氟草胺、茚蟲威、枯瘟淨、纖毛
蟲土（infusorial earth）、茚吡氟西姆（inpyrfluxam）、碘草腈、碘克威、碘硫磷、
碘甲烷、碘甲磺隆、優芬磺隆、碘苯腈、抑草津、IPBC、IPC、種菌唑、艾分卡
巴肼、艾分氟康唑、伊匹芬喹（ipflufenquin）、丙基喜樂松、依普同、顯黴威、
丙草定、齒小蠹二烯醇、小蠹烯醇、IPSP、IPX、氯唑磷、依殺松、碳氯靈、丁
咪胺、丁咪胺、水胺硫磷、異草定、異環斯蘭（isocycloseram）、異艾氏劑、異
柳磷、甲基異柳磷、艾索非他米、異氟普蘭（isoflucypram）、異索威、丁吡草
酮、異草完隆、異派磷、氮草草、葉蟬散、異草定、異樂靈、異丙吡草酯、稻瘟

靈、異丙隆、異吡瑞沙、異噻醇、異拌磷、異噻菌胺、異惡隆、異噻菌酮、異噻
 噻草胺、isoxacarbole、異惡氯草酮、雙苯噻唑酸、異噻唑草酮、異惡草醚、異噻
 唑磷、異惡隆、伊維菌素、異惡草胺、浸種磷(izopamfos)、浸種磷(izopamphos)、
 日本麗金龜引誘劑、喃烯菊酯、茉莉菊酯I、茉莉菊酯II、茉莉酸、甲磺蟲脒、甲
 基增效磷、甲香菌酯、解草烷、解草烯、井崗黴素A、碘硫磷、保幼激素I、保幼
 激素II、保幼激素III、噻嗪菊酯、κ-聯苯菊酯、κ-七氟菊酯、卡草靈、卡日塔贊、
 春日黴素、克菌靈、氯戊環、克螺多、矽藻土(kieselguhr)、活動素、烯蟲炔酯、
 S-烯蟲炔酯、精苯霜靈、克收欣、啞草烯、乳氟禾草靈、λ-氯氟氰菊酯、蘭考三
 酮(lancotriene)、拉替魯爾、砒酸鉛、環草定、雷皮菌素、溴苯磷、L-草銨膦、
 聯苯腈酯(lianbenjingzhi)、石硫合劑、右旋檸檬烯、靈丹、三甲基二氧三環壬
 烷、利穀隆、啞蟲磷、夜蛾性誘劑、粉紋夜蛾性誘劑、洛替拉納(lotilaner)、
 氯芬奴隆、氯氟氰蟲噻胺(lüfuqingchongxianan)、氯噻草磷(lüxiancaolin)、
 氯啞菌酯、氯氟醚菊酯(lvfumijvzhi)、氯噻草膦、噻唑磷、M-74、M-81、MAA、
 磷化鎂、馬拉硫磷(malathion)、馬拉硫磷(maldison)、馬來噻肼、丙蟎氰、
 麥芽糊精、MAMA、manam、代森錳銅、代森錳鋅、曼得羅賓、雙炔噻菌胺、錳
 乃浦、苦參鹼、疊氮磷、MCA、MCC、MCP、1-MCP、MCPA、2,4-MCPA、MCPA-
 硫代乙基、MCPB、2,4-MCPB、MCPB、滅鏽胺、滅蚜磷、甲威苯咪、甲基滅蚜
 磷、甲氯丙酸、甲氯丙酸-P、殺蟎脒、地樂施、誘殺酯、苯噻噻草胺、精甲霜靈、
 吡啶解草酸、甲芬氟康唑(mefentrifluconazole)、氟噻噻草胺、美加特酸、蜂花
 醇、雙殺鼠靈、MEMC、滅蚜松、MEP、噻菌胺、氯氟醚菊酯、滅芬酯、地安磷、
 壯棉素、mepitriflufenpyr、滅普寧、消蟎多、滅蟲威、倍硫磷、倍硫磷硫醇
 (mercaptophos thiol)、馬拉硫磷(mercaptothion)、氯化汞、氧化汞、氯化亞

汞、脫葉亞磷、氧化脫葉亞磷、滅莠津、甲基二磺隆、甲基磺草酮、甲硫芬（mesulfen）、甲亞砷磷（mesulfenfos）、甲硫芬（mesulphen）、間甲酚、氰氟蟲胺、甲霜靈、甲霜靈-M、R-甲霜靈、蝸牛敵、威百畝、惡唑醯草胺、苯吡草酮、甲基對硫磷、metarylpicoxamid、滅他熏、吡草胺、雙醚氯吡嘧磺隆、間氯敵菌酮、美卡芬（metcamifen）、滅特座、甲基涕巴、二甲達草伏、噻嗪隆、蟲蟎畏、美索丙鉑林、威百畝、甲胺磷、滅速克、滅草啞、呋菌胺、甲草苯隆、殺撲磷、甲硫苯威、滅賜克、甲硫嘧磺隆、甲硫涕巴、甲硫啞啞、滅草恒、殺蟲乙烯磷、速滅威、醚草通、滅多威、甲氧普林、S-甲氧普林、格草淨、蓋草津、丁基奎納克林、甲醚菊酯、甲氧滴滴涕、2-甲氧基乙基氯化汞、甲氧蟲醯肼、去草酮、甲基啞磷吡、甲基溴、甲基丁香酚、甲基碘、甲基異柳磷、異硫氰酸甲酯、甲基對硫磷、甲基乙酯磷、甲基氯仿、1-甲基環丙烯、二硫代胺基甲酸甲酯、甲基殺草隆、二氯甲烷、甲基倍硫磷、氧化甲基倍硫磷、甲基倍硫磷硫醇、甲基汞苯甲酸鹽、氰胍甲汞、甲基汞五氯酚鹽、甲基新癸胺、殺螟硫磷、保棉磷、甲硫啞啞、代森聯、代森聯鋅、吡喃隆、溴穀隆、甲氧苄氟菊酯、ε-甲氧苄氟菊酯、異丙甲草胺、S-異丙甲草胺、速滅威、氯苯咯菌胺、苯磺隆、苯氧菌胺、磺草啞啞、惡蟲酮、甲氧隆、滅芬農、代森聯、賽克津、美曲磷酯、敵百蟲、噻菌胺、甲磺隆、metyltetraprole、速滅磷、茲克威、滅除威（miechuwei）、滅鼠安、滅蚊菊酯（miewenjuzhi）、米爾蟎素、米爾貝肼、代森環、醚蟎胺（mimanan）、丙胺氟磷、MIPC、滅蟻靈、MITC、mivorilaner、MNAF、modoflaner、蘑菇醇、草達滅、殺蟲單、莫氟殺林、ε-莫氟殺林、庚醯草胺、monisouron、特啞啞隆（monisuron）、單甲脒、單氯乙酸、久效磷、綠穀隆、殺蟲單（monomehypo）、舒非侖、嘧磺隆、單嘧磺酯、殺蟲單（monosultap）、滅草隆、滅草隆-TCA、伐草快、咪啞脒

胍、茂果、莫茲得、莫昔克丁、MPMC、MSMA、MTMC、 α -multistriatin、家蠅
引誘劑、腈菌唑、米克啞、蜂花基醇、NAA、NAAm、鈉乃浦、萘酞磷、二溴磷、
萘、萘乙醯胺、 α -萘乙酸、萘酸酐、萘肽磷、1-萘酚、萘氧基乙酸、萘乙酸、萘
基二氫茚-1,3-二酮、萘氧基乙酸、萘丙胺、敵草胺、敵草胺-M、萘草胺、游黴素、
NBPOS、草不隆（neburea）、草不隆（neburon）、異狄氏劑、毒藜鹼、對氯硫
磷（nichlorfos）、除草醚、氯硝柳胺、啶鹽菌胺、nicofluprole、煙嘧磺隆、菸鹼、
氟蟻靈、尼克黴素、ningnamycin、寧南黴素、NIP、氟氯草胺、吡氯草胺
（nipyralofen）、烯啶蟲胺、硝乙脲噻唑、磺樂靈、氯啶、戊氰威、除草醚、三
氟甲草醚、硝基苯乙烯、異丙消、NNM、滅鼠寧、王醇、鼠特靈、草完隆、達
草滅、降菸鹼、草完隆、氟鹽脲、多氟脲、NPA、尼瑞莫、奴南酮（nuranone）、
OCH、八氯二丙醚、辛噻酮、2-(辛硫基)乙醇、鄰二氯苯、呋鹽胺、氧樂果、鄰
苯基苯酚、坪草丹、歐福綠、旱草丹、鄰二氯苯、苯腈素、噻苯胺磺隆、奧克綠、
肟醚菌胺、胺磺樂靈、蛇床子素（osthol）、蛇床子素（osthole）、歐斯摧蒙
（ostramone）、歐威壯（ovatron）、殺蟎酯、解草腈、丙炔啶草酮、啶草酮、歐
殺斯、草胺酸鹽、歐殺滅、草噻松（oxapyrazon）、草噻松（oxapyrazone）、環
氧嘧磺隆、奧賽普林、啶啞草酮、啶唑硫（oxazosulfonyl）、喹啉銅（oxine-copper）、
喹啉銅（oxine-Cu）、歐索林酸、啶咪唑、氧化萎鏽靈、甲基磺吸磷、異亞磺磷、
磺拌磷、羥烯腺嘌呤、oxyfenthiin、oxyfenthin、乙氧氟草醚、氧化苦參鹼、土黴
素、氧化克殺蟎、PAC、巴克素、啞蟲啶、丙烯除蟲菊、PAP、對二氯苯、對氟
隆、百草枯、對硫磷、甲基對硫磷、苯吡醇、巴黎綠、PCNB、PCP、PCP-Na、
對二氯苯、PDJ、克草猛、消蟎酚、披扶座、天竺葵酸、平克座、賓克隆、二甲
戊樂靈、三氯殺蟲酯、噴福芬、氟幼脲、二甲戊樂靈、平速爛、五氯苯酚、五氯

苯基月桂酸鹽、戊醯苯草胺、吡嗪菌胺、戊烯氰氯菊酯、環戊嘧草酮、perbutin、
 滅蟻靈、氟草磺胺、苧氯菊酯、乙滴涕、烯草胺、PHC、氰烯菌酯、乙基氰烯菌
 酯、敵磺鈉（phénaminosulf）、葉枯淨、雙乙威（phénétacarbe）、棉胺寧、芬硫
 磷、甜菜寧、乙基甜菜寧、稀草隆、酚硫殺、苯醚菊酯、苯蟎醚、稻豐散、8-苯
 基汞氧基喹啉（8-phenylmercurioxyquinoline）、苯汞脲、乙酸苯基汞、氯化苯基
 汞、鄰苯二酚的苯基汞衍生物、硝酸苯基汞、水楊酸苯基汞、2-苯基苯酚、甲拌
 磷、毒鼠磷（phosazetim）、伏殺磷、磷滅丁（phosametine）、毒鼠磷（phosazetim）、
 毒鼠磷（phosazetin）、三磷錫、氯瘟磷、黴疫淨（phosethyl）、硫環磷、甲基硫
 環磷、甘胺硫磷、亞胺硫磷、對氯硫磷、磷醯胺、磷胺、磷烷、草丁膦、磷蟲威、
 磷、丁基嘧啶磷、三磷錫、辛硫磷、甲基辛硫磷、四氯苯酞、萘酞磷（phthalophos）、
 似蟲菊、皮卡布西、派卡瑞丁、毒莠定、氟吡草胺、啉氧菌酯、匹馬菌素、殺鼠
 酮、唑啉草酯、粉病靈、吡啉、胡椒基丁醚、胡椒基環己烯酮、吡草磷、吡壯素
 （piroctanly）、吡壯素、增效醛、甲胺嘧磷（pirimetaphos）、比加普、滅鼠優、
 嘧啶氧磷、乙基蟲蟎磷、甲基蟲蟎磷、鼠完（pival）、殺鼠酮、三氯殺蟲酯、PMA、
 PMP、聚丁烯、聚胺基甲酸酯、毒殺芬、聚乙氧基喹啉、多氧菌素D、多氧菌素
 （polyoxins）、保粒黴素、代森聯、多噻吡、亞砷酸鉀、疊氮化鉀、氰酸鉀、乙
 基黃原酸鉀、環烷酸鉀、多硫化鉀、硫氰酸鉀、pp'-DDT、丙炔菊酯、早熟素I、
 早熟素II、早熟素III、丙草胺、乙醯嘧啶磷、氟嘧磺隆、撲殺熱、咪醯胺、丙氯
 醇、環丙腈津、撲滅寧、胺氟樂靈、丙溴磷、氟唑草胺、環丙氟靈、丙氟菊酯、
 環苯草酮、殺蟲胺、甘撲津、調環酸、茉莉酮、蟬虱威、猛殺威、撲滅通、撲草
 淨（prometryn）、撲草淨（prometryne）、捕滅鼠、前尼替丁（pronitridine）、
 拿草特、撲草胺、丙蟲磷、普羅帕脒、霜黴威、敵稗、丙蟲磷、啉草酯、克蟎特、

撲蟲菊、撲滅津、巴胺磷、苯胺靈、普克利、丙匹定（propidine）、甲基鋅乃浦、異丙草胺、安丹、丙苯磺隆、增效酯、丙嘧磺隆、戊炔草胺、丙氧喹啉、補骨內酯、甲硫磺樂靈、苜草丹、氟磺隆、乙噻唑磷、硫菌威、丙硫菌唑、普硫松、發硫磷、丙苯炔菊酯、撲滅生、派密多磷（prymidophos）、廣草胺、補骨脂素（psoralen）、補骨脂素（psoralene）、比達農、氟唑菌醯胺（pydiflumetofen）、派氟丁胺、派滅淨、比鏽靈、吡唑硫磷、雙唑草腈、百克敏、吡草醚、氟蟲腈、嘧啶威、唑胺菌酯、唑菌酯、吡丙炔（pyrapropoyne）、磺醯草吡唑、派拉氟胺、吡唑特（pyrazolate）、吡唑特（pyrazolynate）、殺草敏、白粉松、吡嘧磺隆、硫吡唑磷、苜草唑、反滅蟲菊、必列寧I、必列寧II、除蟲菊精、異丙酯草醚、丙酯草醚、吡菌苯威、嘧啶肟草醚、稗草丹、氯草定、噻蟎靈、吡啶氯甲基（pyridachlometyl）、吡啶達醇、啶蟲丙醚、嗒吡硫磷（pyridaphenthion）、嗒吡硫磷（pyridaphenthione）、噻草特、啶菌腈、比芬諾、氟蟲吡啶、環酯草醚、派滅他磷（pyrimétaphos）、嘧黴胺、抗蚜威、嘧蟎醚、嘧草醚、嘧蟎胺、乙基嘧啶磷、甲基嘧啶磷、嘧啶硫蕃、嘧硫磷、滅鼠優、派瑞芬酮、派瑞樂、吡啶醇、吡丙醚、啶菌噁唑、嘧硫草醚、吡唑威、百快隆、嘧氧磺、甲氧磺草胺、吡氯靈、吡氧呋、吡草酸（qincaosuan）、氰枯靈（qingkuling）、苦木素、羥基喹啉基乙酮、喹硫磷、甲基喹硫磷、醌菌脒、二氯喹啉酸、喹克唑、喹草酸、滅藻醌、奎諾夫林（quinofumelin）、滅蟎猛、氯藻胺、畜寧磷、喹草酮、快諾芬、喹硫磷、五氯硝基苯、二氯喹啉草酮、喹禾靈、喹禾靈-P、驅蚊酯、驅蠅定、吡咪唑、碘醚柳胺、R-烯唑醇、熱必得、敵草快、氯氟醚菊酯、雷度隆（renriduron）、紅圓介殼蟲引誘劑、滅蟲菊、右旋反式苜呋菊酯、硫氰苯乙胺、鬧羊花毒素III、病毒唑、rimisoxafen、嘧嘧磺隆、丁烯氟蟲腈（rizazole）、R-甲霜靈、硫氰苯胺

(rodéthanil)、皮蠅磷、魚藤酮、魚尼丁、藜蘆鹼、苯嘧磺草胺、噻菌茂、噻森銅、水楊醯苯胺、氟矽菊酯、血根鹼、散道萆、沙羅拉納(sarolaner)、S-生物丙烯菊酯、八甲磷、海蔥糖苷、辛菌胺、另丁津、密草通、氟唑環菌胺、司拉克丁、單甲脒、增效菊、芝麻林素、賽松、西殺草、西維因、S-烯蟲乙酯、雙甲胺草磷、雙鹼胺草磷(shuangjianancaolin)、環草隆、四氟醚菊酯(sifumijvzhi)、誘蟲環、矽護芬、毒鼠矽、二氧化矽氣凝膠、矽膠、矽噻菌胺(silthiofam)、矽噻菌胺(silthiopham)、矽噻菌胺(silthiophan)、三氯苯氧丙酸、西瑪津、矽氟唑、西瑪通、西草淨(simetryn)、西草淨(simetryne)、殺雄啉、S-烯蟲炔酯、消石灰、SMA、S-甲氧普林、S-異丙甲草胺、亞砷酸鈉、疊氮化鈉、氯酸鈉、氯乙酸鈉、氰化鈉、氟化鈉、氟乙酸鈉、六氟矽酸鈉、環烷酸鈉、鄰苯基酚鈉(sodium orthophenylphenoxide)、五氯酚鈉(sodium pentachlorophenate)、五氯酚鈉(sodium pentachlorophenoxide)、鄰苯基酚鈉(sodium o-phenylphenoxide)、多硫化鈉、氟矽酸鈉、四硼酸二鈉、四硫代碳酸鈉、硫氰酸鈉、蔬草滅、蘇硫磷、spidoxamat、乙基多殺菌素、賜諾殺、螺螨雙酯(spirobudifen)、螺螨酯、螺甲螨酯、螺環啉(spiropidion)、螺蟲乙酯、螺環菌胺、司替羅磷、鏈黴素、番木鱉鹼、食菌甲誘醇、磺苯醚隆、磺草酮、草克死、sulfathiadiazuron、sulfathiazuron、甲磺草胺、舒非侖、氟蟲胺、磺噻隆(sulfodiazole)、甲嘧磺隆、草硫膦、磺醯磺隆、治螟磷(sulfotep)、硫特普(sulfotepp)、氟啉蟲胺脒、亞砷、硫脲醚、硫、硫酸、氟化硫醯、吡啶磺酯、草硫膦、硫丙磷、戊苯砷、suthiazuron、苄氯菊酯、滅草靈、2,4,5-T、吐酒石、 τ -氟胺氰菊酯、稗草烯、噻蟎威、2,4,5-TB、2,3,6-TBA、TBTO、TBZ、TCA、TCBA、TCMTB、TCNB、TDE、得克利、蟲醯肼、吡蟎胺、特普弗洛奎(tebufloquin)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、丁基嘧啶磷

(tebupirimphos)、牧草胺、丁噁隆、克枯爛、四氯硝基苯、福美雙聯、三氯殺蟎虱、得福隆、七氟菊酯、κ-七氟菊酯、右旋七氟甲醚菊酯、特呋喃隆、環磷酮、替美福司、雙硫磷、涕巴、TEPP、哌喃草酮 (tepraloxym)、哌喃草酮 (teproloxydim)、環戊烯菊酯、特草定、特草靈、猛殺草、terbuconazole、特丁硫磷、甲氧去草淨、特丁津、芽根靈、terbutrazole、去草淨 (terbutryn)、去草淨 (terbutryne)、五氯硝基苯、土黴素 (terramycin)、土黴素 (terramycin)、特效烯、四氟吡咯啉 (tetflupyrolimet)、四氯蟲醯胺、四氯乙烷、司替羅磷、四克利、三氯殺蟎虱、殺蟎好 (tetradisul)、四氟隆、胺菊酯、四氟醚菊酯、四胺、殺蟎素、氟氰蟲醯胺、四氟丙酸鈉、殺蟎好、硫酸鉈、硫酸亞鉈、甲氧噁草胺、θ-氯氰菊酯、腐絕、噁蟲啉、噁二吡、噁二氟、噁蟲吡、噁磺隆、噁丙腈、噁氟隆 (thiazafluron)、噁氟隆 (thiazfluron)、噁酮、噁草定、苯噁硫磷、噁菌腈、噁二唑胺、噁苯隆、噁酮磺隆、噁吩磺隆、賽氟滅、硫柳汞、甲拌磷、禾草丹、抗蟲威、硫氯苯亞胺、硫氰基二硝基苯 (thiocyanatodinitrobenzenes)、殺蟲環、硫丹、乙拌磷、噁菌銅、硫敵克、久效威 (thiofanocarb)、久效威 (thiofanox)、硫氟肟醚、噁赫派 (thiohempa)、硫柳汞、甲基乙拌磷、硫磷吡、多保淨、乙基多保淨、甲基多保淨、對硫磷、克殺蟎、胺基硫脲、殺蟲雙、噁替派、殺線威 (thioxamyl)、福美雙、秋蘭姆、蘇雲金素、噁苯達唑、汰敵寧、汰芬那、調節安、TIBA、蟎蟬胺、替戈拉納 (tigolaner)、仲草丹、替可裡姆 (tioclorim)、硫蟲醯胺、替噁殺芬 (tioazafen)、硫氰苯甲醯胺、TMTD、威線肟、甲基脫克松、噁蟲醯胺、甲磺菌胺、托普洛卡 (tolprocarb)、托吡拉特 (tolpyralate)、甲苯氟磺胺、甲基益發靈、乙酸甲苯汞、托瑪琳 (tomarin)、苯吡唑草酮、毒殺芬、2,4,5-TP、2,3,3-TPA、TPN、肟草酮、溴氯氰菊酯、四溴菊酯、吡咯腈、右

旋反式丙烯菊酯、右旋反式苄呋菊酯、拜富寧、反式苄氯菊酯、不孕津、野麥畏 (tri-allate)、三十烷醇、三泰芬、三泰隆、氟酮磺草胺、野麥畏 (triallate)、威菌磷、抑芽唑、苯蟊嗪、嘧菌醇、醚苯磺隆、唑蚜威、葉鏽特、三吡氟草胺、triazofenamide、三唑硫磷、三唑磷 (triazothion)、咪唑吡啶、三元氯化銅、三元硫酸銅、苯磺隆、脫葉磷、三丁基氧化錫、殺草畏、水楊菌胺、trichlophenidine、三氯吡氧乙酸 (trichlopyr)、敵百蟲、異皮蠅磷-3、毒壤磷 (trichloronat)、毒壤磷 (trichloronate)、三氯三硝基苯 (Trichlorotrinitrobenzenes)、敵百蟲 (trichlorphon)、綠草定、氯啶菌酯、三甲酚、三環唑、三環己基氫氧化錫、三得芬、滅草環、草達津、蝸螺淨、三氯丙氧磷、三氟敏、三氟啶磺隆、三氟地殺吡、三氟殺線酯、三氟苯嘧啶、賽福座、三福隆、氟樂靈、氟胺磺隆、翠福、三氟禾草肟 (trifopsime)、賽福寧、三羥基三吡、2,3,5-三-碘苯甲酸、2,3,5-三碘苯甲酸、特誘酮、trimefluor、混滅威、三甲隆、三氯咪啶乙基甲醯胺 (trimorfamid)、三氯咪啶乙基甲醯胺 (trimorphamide)、抗倒酯、三苯基錫、烯蟲硫酯、弗草酮、雷公藤內酯、三唑磺草酮、草達克、殺蟲釘、滅菌唑、三氟甲磺隆、增效醛、創克考、脫葉磷 (tuoyelin)、泰勒吡氟 (tyclopirazoflor)、umifoxolaner、烯效唑、烯效唑-P、福美甲肟、烏瑞替派、戊酸酯、維利微素、維利微素A、霜黴滅、異殺鼠酮、蚜滅多、抑黴胺、凡尼普羅、增效炔醚、滅草猛、免克寧、烯霜苄唑 (viniconazole)、維生素D3、華法林、硝蟲硫磷、辛菌胺、烯肟菌胺、烯肟菌酯、XMC、二甲苯草胺、二甲苯酚、xyloxadine、滅殺威、殺滅唑 (xymiazole)、抑食肟、氰菌胺、玉米素、增效胺、增效磷 (zengxiaolin)、ζ-氯氰菊酯、環烷酸鋅、磷化鋅、噻唑鋅 (zinc thiazole)、噻唑鋅 (zinc thiozole)、三氯酚鋅、三氯酚鋅 (zinc trichlorophenoxide)、鋅乃浦、福美鋅、左拉普磷、殺鼠靈、苯醯

菌胺、唑胺菌酯（zuoanjunzhi）、唑草胺（zuocaoan）、唑菌酯（zuojunzhi）、唑嘧磺隆、1-MCP、1-甲基環丙烯、1-萘酚、1,2-二氯丙烷、1,3-D、1,3-二氯丙烯、2iP、2M-4C、2M-4CM、2-甲氧基乙基氯化汞、2-(辛硫基)乙醇、2-苯基苯酚、2,2,3-TPA、2,3,5-三碘苯甲酸、2,3,6-TBA、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、2,4-DES、2,4-DP、2,4-MCPA、2,4-MCPB、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4,5-TP、2,5-二氯苯甲酸、(3-乙氧基丙基)溴化汞、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、3,6-二氯吡啶酸、4-胺基吡啶、4-CPA、4-CPB、4-CPP、4-羥基苯乙醇、8-羥基喹啉硫酸鹽、8-苯基汞氧基喹啉和24-表薹素內酯。

【0041】 如本揭露中所使用的，以上每一個均是活性成分。關於更多資訊查閱「Compendium of Pesticide Common Names [農藥通用名綱要]」中列出的材料，網址係<https://pesticidecompendium.bcpc.org>。

【0042】 活性成分的特別較佳的選擇係氯蟲苯甲醯胺、氰蟲醯胺、氟鈴脲、滅多威、甲氧蟲醯肼、多氟脲、草胺醯、乙基多殺菌素、多殺菌素、氟啶蟲胺脒和三氟苯嘧啶（在下文中為「AIGA-2」）。

【0043】 另外，活性成分的另外的特別較佳的選擇係滅蟎醯、啶蟲脒、乙醯蟲脒、阿維菌素、穀硫磷-甲基、聯苯肼酯、聯苯菊酯、西維因、克百威、蟲蟎脒、定蟲隆、環蟲醯肼、噻蟲胺、氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、丁醚脲、甲胺基阿維菌素苯甲酸鹽、硫丹、高氰戊菊酯、乙蟲脒、乙蟎唑、氟蟲脒、氟啶蟲醯胺、啞蟎酯、 γ -氯氟氰菊酯、氯蟲醯肼、茚蟲威、 λ -氯氟氰菊酯、虱蟎脲、馬拉硫磷、滅多威、氟醯脲、苄氯菊酯、啶蟲丙醚、啞蟎醚、螺蟎酯、蟲醯肼、噻蟲啉、噻蟲吡、硫雙威、啞蟲醯胺、和 ζ -氯氰菊酯（在下文中為「AIGA-3」）。

【0044】種子處理劑單獨使用或組合使用，以解決或預防多種有害生物，疾病，營養缺乏症，並促進植物生長。該等種子處理劑可以包括殺真菌劑、殺昆蟲劑、接種劑、植物生長調節劑、肥料和肥料增強劑。目前，以下殺真菌劑可以與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用：*(R)*-粉唑醇、*(R)*-己唑醇、*(S)*-粉唑醇、*(S)*-己唑醇、10,10'-氧基雙吩啉砒、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、2,2-二溴-3-次氨基丙醯胺、2,4,5-三氯苯酚、2,4-二甲苯酚、2,5-二氯苯甲酸甲酯、2,6-二氯-*N*-((4-(三氟甲基)苯基)甲基-苯甲醯胺、24-表油菜素內酯、2-烯丙基苯酚、2-胺基丁烷、乙酸2-甲氧基乙基汞、氯化2-甲氧基乙基汞、2-苯基苯酚、8-羥基喹啉、阿拉酸式苯-*S*-甲基、阿迪味啉、噻啉菌胺、安美速、乙酸鋁，碳酸鋁、胺丙膦酸、敵菌靈、蔥油、福美砒、阿紫康唑、氧化福美雙、噻菌酯、多硫化鋁、精苯霜靈、精苯霜靈-M、麥鏽靈、苯菌靈、敵菌脒、苯它隆、苯噻菌胺酯、異丙基苯噻菌胺酯、苯紫氯鋁、苧烯酸、異丁基苧烯酸、抑菌啉、苯甲酸、苯丙烯氟菌唑、Bethoxazin、樂殺蟎、聯苯、硫酸(雙甲基汞)、噻枯唑、雙三氯甲基砒、聯苯三唑醇、硫雙二氯酚、聯苯吡菌胺、波爾多混合物、硼酸、啞醯菌胺、糠菌唑、溴硝醇、乙噻酚磺酸酯、丁硫啞、碳酸鈣、氯化鈣、氰胺鈣、氫氧化鈣、磷酸鈣、敵菌丹、克菌丹、嗎菌威、貝芬替、萎鏽靈、環丙噻菌胺、滅蟎猛、滅瘟唑、雙胺靈、四氯化苯醌、十氯酮、苯咪唑菌、地茂散、百菌清、氯二甲苯酚、四氯喹啉、乙菌利、順式-丙環唑、氯咪巴唑、氧化銅(1)、松脂酸銅、雙(3-苯基水楊酸)銅、乙酸銅II、碳酸銅II、氯化銅II、氫氧化銅II、環烷酸銅、氯氧化銅、硫酸銅、COS-OGA、甲香菌酯、丁香菌酯、硫雜靈、福美銅氯、氰霜唑、環己醯亞胺、環氟菌胺、霜脲氰、氰菌靈、環丙唑醇、噻菌環胺、酯菌胺、棉隆、D-D、咪菌威、癸磷錫、脫氫乙酸、仲乙基雙(二硫代胺基甲酸)二胺、二溴氯丙烷、

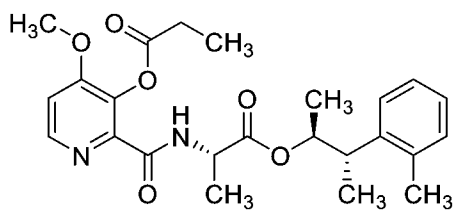
Dichlobentiazox、抑菌靈、二氯萘醌、二氯芬、苄氯三唑醇、二氯氰菌胺、達滅淨、氯硝胺、二癸基二甲基氯化銨、乙黴威、苯醚甲環唑、燕麥枯、野燕枯、二氟林、菌核淨、二甲嘧酚、烯醯味啉、二甲基二硫醚、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇-M、消蟎通、消蟎普、鄰敵蟎消、硝戊酯、硝辛酯、二苯胺、敵派美創、雙硫氧吡啶、四水八硼酸二鈉、磷酸二鈉、滅菌磷、二腈蔥醌、DNOC、嗎菌靈、嗎菌靈乙酸酯、多寧、敵菌酮、克瘟散、烯肱菌酯、依普座、乙環唑、代森硫、噻唑菌胺、依瑞莫、促長啉、仲乙基雙異硫氰酸酯硫化物、乙蒜素、氯化乙基汞、土菌靈、啉唑菌酮、咪唑菌酮、敵克松、烯肱菌胺、咪菌腈、芬瑞莫、芬克座、甲呋醯胺、環醯菌胺、種衣酯、氰菌胺、拌種咯、芬吡沙米、苯鏽啶、芬普福、胺苯吡菌酮、薯瘟錫、三苯錫氯、毒菌錫、福美鐵、氟吡草胺、氟啶胺、氟苯醚醯胺、氟蟎噻、咯菌腈、氟菌蟎酯、氟味啉、氟吡菌胺、氟吡胺、氟吡菌醯胺、唑呋草、三氟苯唑、氟氧雜吡乙酮、氟嘧菌酯、氟喹唑、護矽得、氟硫滅、氟噻唑菌腈、氟醯胺、粉唑醇、氟唑菌醯胺、福爾培、甲醛、福賽得、三乙膦酸鋁、麥穗寧、呋霜靈、呋霜靈-M、福拉比、氟康唑、順式氟康唑、糠醛、拌種胺、呋氧草醚、膠黴素、戊二醛、果綠定、灰黃黴素、雙胍鹽、丙烯酸喹啉酯、六氯苯、六氯酚、己唑醇、己硫磷、環菌唑、過氧化氫、惡黴靈、伊米薩利、亞胺唑、克熱淨、雙胍辛胺三乙酸酯、雙胍三辛烷基(苯基磺酸鹽)、枯瘟淨、種菌唑、艾分氟康唑、伊匹芬喹、異稻瘟淨、依普同、顯黴威、異丁酸、艾索非他米、異氟普蘭、氯草草、稻瘟靈、吡唑萘菌胺、異噻菌胺、浸種磷、克收欣、石硫合劑、代森錳銅、代森錳鋅、曼得羅賓、雙炔醯菌胺、錳乃浦、滅鏽胺、甲威苯咪、氯氟醚菌唑、嘧菌胺、滅普寧、消蟎多、氧化汞、氯化亞汞、甲霜靈、甲霜靈-M、威百畝-鉀、威百畝-鈉、間氯敵菌酮、滅特座、滅速克、呋菌胺、異硫氰酸甲酯、

甲基硫化肼、二硫氰基甲烷、代森聯、苯氧菌胺、滅芬農、噻菌胺、Metyltetraprole、黏氯酸酐、腈菌唑、米克啉、N-(3-氯-2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氫-2-側氧基-3-呋喃基)乙醯胺、鈉乃浦、雙(二甲基二硫代胺基甲酸酯)鎳、氯硝柳胺、異丙消、尼瑞莫、辛噻酮、呋醯胺、呋醯菌胺、歐殺斯、氟噻唑吡乙酮、噁唑硫、噻啉銅、富馬酸噁咪唑、氧化萎鏽靈、巴克素、石蠟油(C11-C25)(4a)、石蠟油(C11-C30)(4c)、石蠟油(C15-C30)(4b)、苯吡醇、平克座、賓克隆、氟唑菌苯胺、五氯苯酚、吡噻菌胺、過氧乙酸、乙酸苯基汞、氯化苯基汞、硝酸苯基汞、氯瘟磷、四氯苯酞、皮卡布西、啉氧菌酯、粉病靈、碳酸氫鉀、碘化鉀、磷酸鉀、硫氰酸鉀、撲殺熱、咪鮮胺、撲滅寧、普羅帕脒、霜黴威、霜黴威鹽酸鹽、普克利、甲基鋅乃浦、丙酸、丙氧喹啉、硫菌威、丙硫菌唑、氟唑菌醯脲胺、比鏽靈、唑菌胺酯、唑菌酯、吡丙炔、派拉氟胺、吡唑特、吡菌苯威、吡啉氯甲基、啉菌脒、比芬諾、嘧黴胺、丁吡咪啉、派瑞芬酮、啉菌噁唑、咯噻酮、奎諾夫林、噻氧靈、五氯硝基苯、噻森銅、氟唑環菌胺、矽噻菌胺、矽氟唑、亞砷酸鈉、碳酸鈉、碳酸氫鈉、次氯酸鈉、四硼酸鈉、甲氧吡啶乙酯、螺環菌胺、磺醯氟、硫、戊唑醇、特普弗洛奎、克枯爛、四氯硝基苯、四克利、噻苯咪唑、噻菌脒、噻呋醯胺、硫柳汞、多保淨、甲基托布津、克殺蟎、福美雙、汰敵寧、甲基脫克松、唑蟲醯胺、托普洛卡、甲苯氟磺胺、反式丙環唑、三唑酮、三唑醇、威菌磷、咪唑吡、三丁基氧化錫、水楊菌胺、氯啉菌酯、三環唑、克啉菌、呋菌酯、賽福座、賽福寧、三聚甲醛、滅菌唑、脲、霜黴滅、乙烯菌核利、氰菌胺、硼酸鋅、氧化鋅、鋅乃浦、福美鋅和苯醯菌胺，此殺真菌劑組在下文中是「FGK-I」。

【0045】在種子處理劑中與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用的另一組較佳的殺真菌劑係嘧菌酯、苯菌靈、苯丙烯氟菌唑、聯苯吡菌胺、

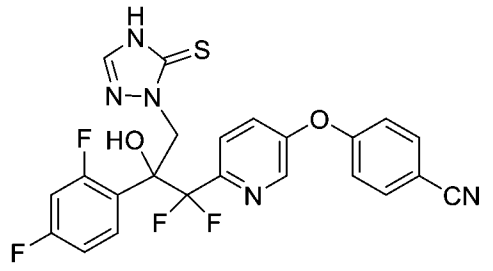
貝芬替、百菌清、霜脲氰、環丙唑醇、Dichlobentiazox、苯醚甲環唑、噻唑菌胺、噁唑菌酮、芬克座、氟吡菌醯胺、氟節唑菌胺、咯菌腈、福爾培、節吡氟西姆、種菌唑、艾分氟康唑、異氟普蘭、代森錳鋅、錳乃浦、氯氟醚菌唑、消蟲多、甲霜靈和甲霜靈-M（精甲霜靈）、氟噻唑吡乙酮、氟唑菌苯胺、氧菌酯、咪鮮胺、丙氧喹啉、丙硫菌唑、唑菌胺酯、啞氧靈、氟唑環菌胺、噻苯咪唑、福美雙、三環唑和肟菌酯，此殺菌劑組在下文中是「FGK-2」。

【0046】 以下兩種殺真菌劑分子也較佳的是與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用；



(2*S*,3*S*)-3-(鄰甲苯基)丁-2-基 (4-甲氧基-3-(丙醯氧基)吡啶甲醯基)-*L*-丙胺酸酯

下文中是「FGK-3」；以及



4-((6-(2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4,5-二氫-1*H*-1,2,4-三唑-1-基)丙基)吡啶-3-基)氧基)苯甲腈

下文中是「FGK-4」。

【0047】 在WO 2019173665中以化合物編號278描述了FGK-3，並且在WO 2016187201實例2中描述了FGK-4。

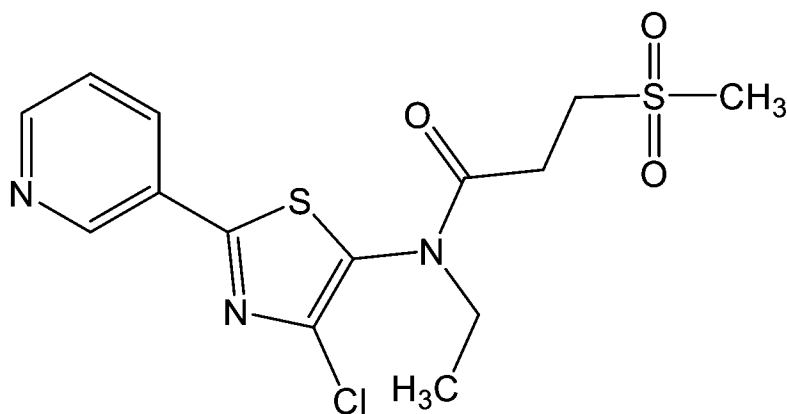
【0048】術語「場所」意指有害生物正在生長、可能生長、或可能經過的棲息地、育種地、植物、種子、土壤、材料、或環境。例如，場所包括但不限於作物、樹木、果實、穀物、飼料物種、藤蔓、草坪和/或觀賞植物生長的區域；家畜居住的地方；建築物的內部或外部表面（諸如儲存穀物的地方）；建築物中使用的裡面和周圍建築材料（諸如浸漬木材）；和建築物周圍的土壤。

【0049】短語「MoA材料」意指具有如在IRAC MoA分類v. 10.3（位於irac-online.org.）中指示的作用方式（「MoA」）的活性成分。

【0050】短語「殺有害生物有效量」意指對有害生物實現可觀測的作用所需的殺有害生物劑的量，該作用例如壞死、死亡、阻滯、預防、消除、摧毀、或在其他方面減少有害生物在場所中的出現和/或活性的作用。當有害生物群體從場所被驅逐、有害生物在場所中或周圍喪失能力、和/或有害生物在場所中或周圍被根除時，這種作用可以出現。當然，可出現該等作用的組合。通常，有害生物群體、活性或兩者都希望降低多於50百分比，較佳的是多於90百分比，並且最較佳的是多於99百分比。通常，用於農業目的的殺有害生物有效量為約0.0001克/公頃至約5000克/公頃，較佳的是約0.0001克/公頃至約500克/公頃，並且甚至更較佳的是約0.0001克/公頃至約50克/公頃。

【發明內容】

【0051】在一個方面，本揭露提供了由下式表示的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的一種或多種結晶形式



【0052】 在一個實施方式中，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的一種或多種結晶形式。

【0053】 在另一個實施方式中，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的一種或多種結晶形式係無水和無溶劑結晶多晶型形式。

【0054】 在另一個實施方式中，一種或多種結晶形式係化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）。

【0055】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 $19.9 \pm$

0.2、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0056】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 20.3 ± 0.2 和 24.7 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式

中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、和 24.7 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2

± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。

【0057】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 $16.0 \pm$

0.2、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。

【0058】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在與圖1或圖2所示基本相同的繞射角（ 2θ ）處的峰。

【0059】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰和 $= 75.707 \text{ J/g}$ 或與圖4基本相同的熔化熱。

【0060】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖6所示基本相同的波數處的峰。

【0061】 在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式A之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式A還包含（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰；和/或低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含

在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式A之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式A還包含與圖4基本相同的DSC熱譜圖和/或包含與圖6所示基本相同的波數處的峰的低頻拉曼光譜。

【0062】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具

有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0063】在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、和 24.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、和 24.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在

繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、

17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、21.8 ± 0.2、24.1 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、21.8 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。

【0064】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、21.8 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.8 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.8 ± 0.2、22.9 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.3 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.8 ± 0.2、22.9 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、

27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.3 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、19.8 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.8 ± 0.2、22.9 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。

【0065】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在與圖3所示基本相同的繞射角（2θ）處的峰。

【0066】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約105.24°C的峰值溫度的吸熱峰和 = 92.879 J/g或與圖5基本相同的熔化熱。

【0067】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約266 cm⁻¹、約446 cm⁻¹、約546 cm⁻¹、約763 cm⁻¹、約987 cm⁻¹、約1044 cm⁻¹、約1137 cm⁻¹、約1187 cm⁻¹和約1308 cm⁻¹、約1518 cm⁻¹、約1573 cm⁻¹、約1592 cm⁻¹、約1673 cm⁻¹、約2919 cm⁻¹、和約2937 cm⁻¹處的一個或多個峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖7所示基本相同的波數處的峰。

【0068】 在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式B之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式B還包含（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約105.24°C的峰值溫度的吸熱峰；和/或低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約266 cm⁻¹、約446 cm⁻¹、約546 cm⁻¹、約763 cm⁻¹、約987 cm⁻¹、約

1044 cm^{-1} 、約1137 cm^{-1} 、約1187 cm^{-1} 和約1308 cm^{-1} 、約1518 cm^{-1} 、約1573 cm^{-1} 、約1592 cm^{-1} 、約1673 cm^{-1} 、約2919 cm^{-1} 、和約2937 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式B之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式B還包含與圖5基本相同的DSC熱譜圖和/或包含與圖7所示基本相同的波數處的峰的低頻拉曼光譜。

【0069】 本揭露進一步提供了一種包含化合物1的多晶型形式A和B中的一種或多種的組成物。

【0070】 在另一方面，本揭露提供了一種防治有害生物之方法，所述方法包括向場所應用殺有害生物有效量的如本文所述之*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式A和B中的一種或多種、或包含如本文所述之*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式A和B中的一種或多種的組成物。

【0071】 在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：螞蟻、蚜蟲、臭蟲（bed bug）、甲蟲、蛀蟲、毛毛蟲、蟑螂、蟋蟀、蠼螋、跳蚤、蒼蠅、草蜢、蛆、葉跳蟲（leafhoppers）、虱、蝗蟲、蛆蟲、蟎、線蟲、飛虱（planthopper）、木虱、葉蜂、介殼蟲、蠹蟲、蛞蝓、蝸牛、蜘蛛、跳蟲、椿象、綜合綱、白蟻、薊馬、扁虱、黃蜂、粉虱和鐵線蟲。在一些實施方式中，所述有害生物係取食汁液的有害生物或咀嚼有害生物。

【0072】 在一些實施方式中，所述有害生物來自半翅目、縷翅目、鱗翅目等。

【0073】 在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：球蚜屬物種（*Adelges spp.*）、白輪盾介殼蟲屬物種（*Aulacaspis spp.*）、沫

蟬屬物種 (*Aphrophora* spp.)、蚜屬物種 (*Aphis* spp.)、小粉虱屬物種 (*Bemisia* spp.)、蠟介殼蟲屬物種 (*Ceroplastes* spp.)、雪盾介殼蟲屬物種 (*Chionaspis* spp.)、褐圓盾介殼蟲屬物種 (*Chrysomphalus* spp.)、軟介殼蟲屬物種 (*Coccus* spp.)、小綠葉蟬屬物種 (*Empoasca* spp.)、美洲蝽屬物種 (*Euschistus* spp.)、牡蠣介殼蟲屬物種 (*Lepidosaphes* spp.)、蝽屬物種 (*Lagynotomus* spp.)、草盲蝽屬物種 (*Lygus* spp.)、長管蚜屬物種 (*Macrosiphum* spp.)、黑尾葉蟬屬物種 (*Nephotettix* spp.)、稻綠蝽屬物種 (*Nezara* spp.)、褐飛虱屬物種 (*Nilaparvata* spp.)、長沫蟬屬物種 (*Philaenus* spp.)、植盲蝽屬物種 (*Phytocoris* spp.)、壁蝽屬物種 (*Piezodorus* spp.)、臀紋粉介殼蟲屬物種 (*Planococcus* spp.)、粉介殼蟲屬物種 (*Pseudococcus* spp.)、縊管蚜屬物種 (*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔介殼蟲屬物種 (*Saissetia* spp.)、彩斑蚜屬物種 (*Therioaphis* spp.)、龜紋蠟介殼蟲屬物種 (*Toumeyella* spp.)、桔蚜屬物種 (*Toxoptera* spp.)、粉虱屬物種 (*Trialeurodes* spp.)、錐蝽屬物種 (*Triatoma* spp.)和矢尖介殼蟲屬物種 (*Unaspis* spp.)。

【0074】在此方面的一些實施方式中，有害生物選自由以下組成之群組：擬綠蝽 (*Acrosternum hilare*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、歐洲甘藍粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、螺旋粉虱 (*Aleurodicus dispersus*)、橘綿粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、棉葉蟬 (*Amrasca biguttula biguttula*)、紅圓蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黑豆蚜 (*Aphis fabae*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、蘋果黃蚜 (*Aphis pomi*)、茄粗額蚜 (*Aulacorthum solani*)、馬鈴薯木虱 (*Bactericera cockerelli*)、采蝽 (*Bagrada hilaris*)、銀葉粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、煙粉虱 (*Bemisia tabaci*)、麥長蝽 (*Blissus leucopterus*)、箱子長輩臭蟲 (*Boisea trivittata*)、天門冬小管蚜 (*Brachycorynella asparagi*)、粉介殼蟲 (*Brevennia rehi*)、甘藍

蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、梨木虱 (*Cacopsylla pyri*)、梨黃木虱 (*Cacopsylla pyricola*)、馬鈴薯盲蝽 (*Calocoris norvegicus*)、紅蠟蚧 (*Ceroplastes rubens*)、
 熱帶臭蟲 (*Cimex hemipterus*)、溫帶臭蟲 (*Cimex lectularius*)、橘軟蠟蚧 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、法思圖盲蝽 (*Dagbertus fasciatus*)、綠腹蝽 (*Dichelops furcatus*)、
 麥雙尾蚜 (*Diuraphis noxia*)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、車前圓尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、棉黑翅紅蝽 (*Dysdercus suturellus*)、棕翅臭蟲 (*Edessa meditabunda*)、
 假眼小綠葉蟬 (*Empoasca vitis*)、蘋果綿蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、雅致斑葉蟬 (*Erythroneura elegantula*)、歐扁盾蝽 (*Eurygaster maura*)、
 斑點美洲蝽 (*Euschistus conspersus*)、英雄美洲蝽 (*Euschistus heros*)、褐蝽 (*Euschistus servus*)、茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*)、安妥角盲蝽 (*Helopeltis antonii*)、
 桃粉大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、安妥角盲蝽、茶盲蝽 (*Helopeltis theivora*)、吹綿蚧 (*Icerya purchasi*)、檬果褐葉蟬 (*Idioscopus nitidulus*)、茶小綠葉蟬 (*Jacobiasca formosana*)、
 灰飛虱 (*Laodelphax striatellus*)、水土堅蚧 (*Lecanium corni*)、大稻緣蝽 (*Leptocorisa oratorius*)、異稻緣蝽 (*Leptocorisa varicornis*)、
 豆莢草盲蝽 (*Lygus hesperus*)、桑粉介殼蟲 (*Maconellicoccus hirsutus*)、馬鈴薯長管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、麥長管蚜 (*Macrosiphum granarium*)、
 薔薇長管蚜 (*Macrosiphum rosae*)、翠菊葉蟬 (*Macrosteles quadrilineatus*)、覆盆子沫蟬 (*Mahanarva frimbiolata*)、篩豆龜蝽 (*Megacopta cribraria*)、
 麥無網長管蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、長角緣蝽 (*Mictis longicornis*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、萵苣蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾葉蟬 (*Nephotettix cincticeps*)、
 長盲蝽 (*Neurocolpus longirostris*)、稻綠蝽 (*Nezara viridula*)、褐飛虱 (*Nilaparvata lugens*)、木瓜粉蚧 (*Paracoccus marginatus*)、

馬鈴薯木虱 (*Paratrioza cockerelli*)、糠片盾蚧 (*Parlatoria pergandii*)、黑片盾蚧 (*Parlatoria ziziphi*)、玉米花翅飛虱 (*Peregrinus maidis*)、葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera vitifoliae*)、去杉球蚧 (*Physokermes piceae*)、加州植盲蝽 (*Phytocoris californicus*)、親植盲蝽 (*Phytocoris relativus*)、蓋氏壁蝽 (*Piezodorus guildinii*)、橘臀紋粉蚧 (*Planococcus citri*)、榕臀紋粉蚧 (*Planococcus ficus*)、四紋盲蝽 (*Poecilocapsus lineatus*)、越橘盲蝽 (*Psallus vaccinicola*)、鱷梨花邊蟲 (*Pseudacysta perseae*)、鳳梨潔粉蚧 (*Pseudococcus brevipes*)、梨笠圓盾蚧 (*Quadraspidiotus perniciosus*)、玉米蚜蟲 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、欖珠蠟蚧 (*Saissetia oleae*)、栗盾蝽 (*Scaptocoris castanea*)、麥二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、麥長管蚜 (*Sitobion avenae*)、白背飛虱 (*Sogatella furcifera*)、溫室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、結翅粉虱 (*Trialeurodes abutiloneus*)、柑橘矢尖蚧 (*Unaspis yanonensis*)、和恩特那葉蟬 (*Zulia entrerriana*)。

【0075】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：巢針薊馬屬物種 (*Caliothrips* spp.)、花薊馬屬物種 (*Frankliniella* spp.)、硬薊馬屬物種 (*Scirtothrips* spp.)、和薊馬屬物種 (*Thrips* spp.)。

【0076】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：六點薊馬 (*Caliothrips phaseoli*)、雙刺花薊馬 (*Frankliniella bispinosa*)、煙草褐薊馬 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬 (*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花薊馬 (*Frankliniella schultzei*)、東方花薊馬 (*Frankliniella tritici*)、玉米薊馬 (*Frankliniella williamsi*)、溫室薊馬 (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、腹鉤薊馬 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、柑桔硬薊馬 (*Scirtothrips citri*)、茶黃薊馬 (*Scirtothrips dorsalis*)、錘角帶薊馬 (*Taeniothrips rhopalantennalis*)、黃胸薊

馬 (*Thrips hawaiiensis*)、豆黃薊馬 (*Thrips nigropilosus*)、東方薊馬 (*Thrips orientalis*)、南黃薊馬 (*Thrips palmi*) 和煙薊馬 (*Thrips tabaci*)。

【0077】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：卷葉蛾屬物種 (*Adoxophyes spp.*)、地老虎屬物種 (*Agrotis spp.*)、帶卷蛾屬物種 (*Argyrotaenia spp.*)、卷葉蛾屬物種 (*Cacoecia spp.*)、麗細蛾屬物種 (*Caloptilia spp.*)、水稻螟蟲屬物種 (*Chilo spp.*)、鏤紋夜蛾屬物種 (*Chrysodeixis spp.*)、豆粉蝶屬物種 (*Colias spp.*)、草螟屬物種 (*Crambus spp.*)、絹野螟屬物種 (*Diaphania spp.*)、螟屬物種 (*Diatraea spp.*)、鑽夜蛾屬物種 (*Earias spp.*)、粉斑螟屬物種 (*Ephestia spp.*)、尺蠖蛾屬物種 (*Epimecis spp.*)、髒切夜蛾屬物種 (*Feltia spp.*)、角劍夜蛾屬物種 (*Gortyna spp.*)、鈴夜蛾屬物種 (*Helicoverpa spp.*)、實夜蛾屬物種 (*Heliothis spp.*)、根蠹屬物種 (*Indarbela spp.*)、潛夜細蛾屬物種 (*Lithocolletis spp.*)、切根蟲屬物種 (*Loxagrotis spp.*)、天幕毛蟲屬物種 (*Malacosoma spp.*)、穀蛾屬物種 (*Nemapogon spp.*)、疆夜蛾屬物種 (*Peridroma spp.*)、小潛細蛾屬物種 (*Phyllonorycter spp.*)、黏蟲屬物種 (*Pseudaletia spp.*)、菜蛾屬物種 (*Plutella spp.*)、蛀莖夜蛾屬物種 (*Sesamia spp.*)、夜盜蛾屬物種 (*Spoaoptera spp.*)、透翅蛾屬物種 (*Synanthedon spp.*) 和巢蛾屬物種 (*Yponomeuta spp.*)。

【0078】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：飛揚阿夜蛾 (*Achaea janata*)、棉褐帶卷蛾 (*Adoxophyes orana*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、棉葉波紋葉蛾 (*Alabama argillacea*)、鱧梨楔卷蛾 (*Amorbia cuneana*)、臍橙螟蛾 (*Amyelois transitella*)、棕斑灰蛾 (*Anacamptodes defectaria*)、桃條麥蛾 (*Anarsia lineatella*)、黃麻橋夜蛾 (*Anomis sabulifera*)、黎豆夜蛾

(*Anticarsia gemmatalis*)、果樹黃卷蛾(*Archips argyrospila*)、玫瑰黃卷蛾(*Archips rosana*)、桔帶卷蛾(*Argyrotaenia citrana*)、伽馬紋夜蛾(*Autographa gamma*)、蘋果小卷葉蛾(*Bonagota cranaodes*)、禾弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、煙捲蛾(*Capua reticulana*)、桃小食心蟲(*Carposina niponensis*)、橫線尾夜蛾(*Chlumetia transversa*)、薔薇斜條卷葉蛾(*Choristoneura rosaceana*)、稻縱卷葉螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、可可細蛾(*Conopomorpha cramerella*)、米蛾(*Corcyracephalonica*)、芳香木蠹蛾(*Cossus cossus*)、胡桃小卷蛾(*Cydia caryana*)、李小食心蟲(*Cydia funebrana*)、梨小食心蟲(*Cydia molesta*)、豌豆小卷蛾(*Cydia nigricana*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、蓴麻毛蟲(*Darna diducta*)、黃瓜絹野螟(*Diaphanianitidalis*)、小蔗桿草螟(*Diatraea saccharalis*)、西南玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、埃和鑽夜蛾(*Earias insulana*)、翠紋鑽夜蛾(*Earias vittella*)、橙色小卷蛾(*Ecdytolopha aurantianum*)、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、粉斑螟(*Ephestia cautella*)、煙草粉斑螟(*Ephestia elutella*)、地中海斑螟(*Ephestia kuehniella*)、菜豆小卷蛾(*Epinotia aporema*)、蘋淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、香蕉弄蝶(*Erionota thrax*)、鹽澤燈蛾(*Estigmene acrea*)、葡萄螟蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、原切根蟲(*Euxoa auxiliaris*)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、東方果實蛾(*Grapholita molesta*)、三紋螟蛾(*Hedylepta indicata*)、棉鈴蟲(*Helicoverpa armigera*)、玉米穗蟲(*Helicoverpa zea*)、美洲煙葉蛾(*Heliothis virescens*)、菜螟(*Hellula undalis*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、茄黃斑螟(*Leucinodes orbonalis*)、咖啡點潛蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛蛾(*Leucoptera malifoliella*)、葡萄漿果小卷蛾(*Lobesia botrana*)、豆白隆切根蟲(*Loxagrotis albicosta*)、舞毒蛾(*Lymantria*

dispar)、窄翅潛葉蛾 (*Lyonetia clerkella*)、油棕櫚結草蟲 (*Mahasena corbetti*)、甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、煙草天蛾 (*Manduca sexta*)、豆莢野螟 (*Maruca testulalis*)、袋蛾 (*Metisa plana*)、秘夜蛾黏蟲 (*Mythimna unipuncta*)、番茄草螟蛾 (*Neoleucinodes elegantalis*)、稻三點螟 (*Nymphula depunctalis*)、冬尺蠖蛾 (*Operophtera brumata*)、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、*Oxydiavesulia*、葡萄褐卷蛾 (*Pandemis cerasana*)、蘋褐卷蛾 (*Pandemis heparana*)、非洲達摩鳳蝶 (*Papilio demodocus*)、紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*)、豆雜角夜蛾 (*Peridroma saucia*)、咖啡潛葉蛾 (*Perileucoptera coffeella*)、馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella*)、柑橘潛葉蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、斑幕潛葉蛾 (*Phyllonorycter blancardella*)、菜粉蝶 (*Pieris rapae*)、苜蓿綠夜蛾 (*Plathypena scabra*)、蘋果芽小卷蛾 (*Platynota idaeusalis*)、印度穀螟 (*Plodia interpunctella*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、漿果小卷蛾 (*Polychrosis viteana*)、桔果巢蛾 (*Prays endocarpa*)、油橄欖巢蛾 (*Prays oleae*)、一星黏蟲 (*Pseudaletia unipuncta*)、大豆尺夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*)、三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、大螟 (*Sesamia inferens*)、莖螟 (*Sesamia nonagrioides*)、蕁麻毛蟲 (*Setora nitens*)、麥蛾 (*Sitotroga cerealella*)、葡萄長須卷葉蛾 (*Sparganothis pilleriana*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、草地貪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、亞熱帶黏蟲 (*Spodoptera eridania*)、鳳梨鑽心蟲 (*Thecla basilides*)、袋穀蛾 (*Tinea pellionella*)、衣蛾 (*Tineola bisselliella*)、粉紋夜蛾 (*Trichoplusia ni*)、番茄斑潛蠅 (*Tuta absoluta*)、咖啡木蠹蛾 (*Zeuzera coffeae*)和梨豹蠹蛾 (*Zeuzera pyrina*)。

【0079】 已經出乎意料地發現，本文所述之化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）影響成蟲甘薯粉虱（煙粉虱）的行為、神經和肌肉功能，其方式與影響本文先前所述之弦音器官的殺昆蟲劑一致。在與先前已知的化合物1的非結晶形式（無定形油）的直接比較中，出乎意料地發現本文所述之化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）出人意料地誘發了昆蟲的明顯更大的敲低，這在對影響弦音器官的先前殺昆蟲劑的先前研究中已被證明與死亡率有關。

【0080】 本揭露之另外的實施方式、特徵和優點從以下詳細說明和藉由本揭露之實踐將是清楚的。本揭露之化合物可描述為以下列舉條款中的任一項的實施方式。應當理解，本文所述之任何實施方式都可以結合本文所述之任何其他實施方式使用，只要該等實施方式彼此不矛盾。

【0081】 1. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶形式。

【0082】 2. 如實施方式1所述之結晶形式，其中該結晶形式係*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型物。

【0083】 3. 如實施方式1或2所述之結晶多晶型物，其中該結晶形式係無水或無溶劑的。

【0084】 4. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式A，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0085】 5. 如實施方式4所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0086】 6. 如實施方式4或5所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0087】 7. 如實施方式4至6中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0088】 8. 如實施方式4至7中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0089】 9. 如實施方式4至8中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0090】 10. 如實施方式4至9中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0091】 11. 如實施方式4至10中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）

為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0092】 12.如實施方式4至11中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0093】 13.如實施方式4至12中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0094】 14.如實施方式4至13中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖1或圖2所示基本相同的一個或多個峰。

【0095】 15.如實施方式4至14中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰。

【0096】 16.如實施方式4至15中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖4基本相同的DSC熱譜圖。

【0097】 17.如實施方式4至16中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、

約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【0098】 18.如實施方式4至17中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖6所示基本相同的波數處的峰。

【0099】 19. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式B，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 15.4 ± 0.2 處的峰。

【0100】 20. 如實施方式19所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。

【0101】 21. 如實施方式19或20所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0102】 22. 如實施方式19至21中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0103】 23. 如實施方式19至22中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0104】 24. 如實施方式19至23中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0105】 25. 如實施方式19至24中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0106】 26. 如實施方式19至25中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0107】 27. 如實施方式19至26中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0108】 28. 如實施方式19至27中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0109】 29. 如實施方式19至28中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖3所示基本相同的一個或多個峰。

【0110】 30. 如實施方式19至29中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約 105.24°C 的峰值溫度的吸熱峰。

【0111】 31. 如實施方式19至30中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖5基本相同的DSC熱譜圖。

【0112】 32. 如實施方式19至31中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約 266 cm^{-1} 、約 446 cm^{-1} 、約 546 cm^{-1} 、約 763 cm^{-1} 、約 987 cm^{-1} 、約 1044 cm^{-1} 、約 1137 cm^{-1} 、約 1187 cm^{-1} 和約 1308 cm^{-1} 、約 1518 cm^{-1} 、約 1573 cm^{-1} 、約 1592 cm^{-1} 、約 1673 cm^{-1} 、約 2919 cm^{-1} 、和約 2937 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【0113】 33. 如實施方式19至32中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖7所示基本相同的波數處的峰。

【0114】 34. 一種組成物，其包含根據實施方式1所述之結晶形式或根據實施方式2至33中任一項所述之結晶多晶型形式。

【0115】 35. 一種防治有害生物之方法，所述方法包括向場所應用殺有害生物有效量的根據實施方式1所述之結晶形式、根據實施方式2至33中任一項所述之結晶多晶型形式、或根據實施方式34所述之組成物。

【圖式簡單說明】

【0116】 [圖1]示出了如實例1中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之粉末X射線繞射圖。

【0117】 [圖2]示出了如實例2中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之粉末X射線繞射圖。

【0118】 [圖3]示出了如實例5中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之粉末X射線繞射圖。

【0119】 [圖4]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖。

【0120】 [圖5]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖。

【0121】 [圖6]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之拉曼光譜。

【0122】 [圖7]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之拉曼光譜。

【0123】 [圖8]係示出了敲低實驗的對照處理之圖，它記錄了隨時間的推移丙酮溶劑空白對照瓶中2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0124】 [圖9]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用25 g/ha的化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，各自來自丙酮溶劑，並記錄了多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0125】 [圖10]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用2.5 g/ha的化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，

【0130】 在進一步描述本揭露之前，應理解本揭露並不限於所描述的具體實施方式，因為該等實施方式當然可以變化。還應當理解，本文使用的術語僅是為了描述具體實施方式之目的，而並不旨在是限制性的，因為本揭露之範圍僅由所附請求項限定。

【0131】 除非另外定義，本文所用的全部技術術語和科學術語具有與本揭露所屬領域的普通技術人員通常所理解的相同意義。本文中提及的所有專利、申請、公佈的申請和其他公佈均藉由引用以其全文併入。如果本部分中闡述的定義與藉由引用併入本文的專利、申請或其他公佈中闡述的定義相反或不一致，則本部分中闡述的定義優先於藉由引用併入本文的定義。

【0132】 除非上下文另外明確指示，否則本文和所附請求項中所使用的單數形式「一個/一種（a/an）」和「該/該等（the）」包括複數指示物。還需注意的是，申請專利範圍可以經撰寫而排除任何視需要的要素。因此，此陳述旨在作為使用與請求項要素的敘述有關的排他性術語如「單獨」、「僅」等或使用「否定型」限定的前提基礎。

【0133】 下面詳細描述化合物1的多晶型形式和用於製備化合物1之方法。在一些實施方式中，化合物1的無定形形式可以根據國際專利公佈案號WO 2010/139497 A1和美國專利號8,350,044中描述之方法製備，該等專利以其全文藉由援引併入本文。

【0134】 已根據本文所述之方法製備了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的獨特物理形式，多晶型形式A。多晶型形式A的粉末X射線繞射（PXRD）圖在圖1中示出，其中相應的清單數據在表1中示出。

[表1]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
10.18	8.6823	348.6	m
10.62	8.3236	649.5	s
13.24	6.6818	56.2	vw
15.98	5.5417	331.4	m
16.68	5.3107	134.5	w
17.48	5.0694	686.4	s
17.92	4.9459	262	m
18.2	4.8704	378.7	m
18.7	4.7413	396.1	m
18.96	4.6769	203.9	w
19.96	4.4448	746.3	vs
20.36	4.3583	1000	vs
21.08	4.2111	246.9	w
21.74	4.0847	190.2	w
22.86	3.8871	189	w
23.14	3.8406	141.3	w
23.96	3.711	268.8	m
24.72	3.5986	765.1	vs
25.34	3.512	450	m
25.74	3.4583	99.4	vw
26.7	3.3361	598.7	s
28.16	3.1664	390.1	m
28.74	3.1038	265.7	m
32.16	2.7811	138.1	w
32.98	2.7138	97.9	vw

* S = 強（> 50%相對強度），M = 中等（20%-50%相對強度），W = 弱（< 20%相對強度）

【0135】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為10.2 ± 0.2、10.6 ± 0.2、13.2 ± 0.2、16.0 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、17.9 ± 0.2、18.2 ± 0.2、18.7 ± 0.2、19.0 ± 0.2、20.0 ± 0.2、20.4 ± 0.2、21.1 ± 0.2、21.7 ± 0.2、22.8 ± 0.2、23.1 ± 0.2、24.0 ± 0.2、24.7 ± 0.2、25.3 ± 0.2、25.7 ± 0.2、26.7 ± 0.2、28.2 ± 0.2、28.7 ± 0.2、32.2

± 0.2 、和 33.0 ± 0.2 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 10.2 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 13.2 ± 0.1 、 16.0 ± 0.1 、 16.7 ± 0.1 、 17.5 ± 0.1 、 17.9 ± 0.1 、 18.2 ± 0.1 、 18.7 ± 0.1 、 19.0 ± 0.1 、 20.0 ± 0.1 、 20.4 ± 0.1 、 21.1 ± 0.1 、 21.7 ± 0.1 、 22.8 ± 0.1 、 23.1 ± 0.1 、 24.0 ± 0.1 、 24.7 ± 0.1 、 25.3 ± 0.1 、 25.7 ± 0.1 、 26.7 ± 0.1 、 28.2 ± 0.1 、 28.7 ± 0.1 、 32.2 ± 0.1 、和 33.0 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角(2θ)處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表1中提供的繞射角(2θ)在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0136】 在一些實施方式中，已根據本文所述之方法製備了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的相同物理形式，如圖1和表1所示，多晶型形式A，其中該材料可以使用如本文所述之再結晶技術，諸如使用多晶型形式A的晶種、多次結晶/再結晶方法等，以更高的純度製備。熟悉該項技術者將理解，使用此類技術提供更高純度的結晶材料可以在粉末X射線繞射(PXRD)分析中提供更高的解析度。使用此類技術獲得更高純度的材料，並且從而獲得更高品質的粉末X射線繞射(PXRD)分析的多晶型形式A的粉末X射線繞射(PXRD)圖，如圖2所示，其中相應的清單數據在表2中示出。熟悉該項技術者將理解，表2所示的PXRD數據在表1提供的數據的實驗誤差範圍內，並且圖2所示的更高解析度的PXRD圖提供了增強的識別PXRD圖中緊密間隔的峰的能力，該等峰在圖1所示的PXRD圖中以前是不可見的。

[表2]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
9.94	8.8988	260.9	m
10.12	8.7337	353.9	m
10.6	8.3392	726.5	s
10.86	8.1469	228.2	w
13.15	6.7329	121	w
15.6	5.6758	121.1	w
15.94	5.5555	365.7	m
16.62	5.3297	191.1	w
17.42	5.0867	777.7	s
17.86	4.9665	256.2	m
18.16	4.8811	529.1	s
18.66	4.7514	393.9	m
18.9	4.6916	279.3	m
19.9	4.458	739	m
20.32	4.3668	1000	vs
21.04	4.219	309.3	m
21.3	4.1715	149	w
21.68	4.0959	195.3	w
21.78	4.0807	169.7	w
22.8	3.8971	223.9	w
23.08	3.8505	219.7	w
23.28	3.821	118.6	w
23.92	3.7171	277.1	m
24.66	3.6072	943.3	vs
25.28	3.5202	478	m
25.72	3.4609	175.6	w
26.16	3.4037	165.8	w
26.64	3.3435	749.4	vs
28.1	3.173	516.8	s
28.64	3.1144	294.4	m
28.84	3.0932	147.3	w
32.1	2.7861	226.4	w
32.9	2.7202	201.6	w

* S = 強（> 50%相對強度），M = 中等（20%-50%相對強度），W = 弱（< 20%相對強度）

【0137】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 10.9 ± 0.2 、 13.2 ± 0.2 、 15.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 21.3 ± 0.2 、 21.7 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 22.8 ± 0.2 、 23.1 ± 0.2 、 23.3 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 25.7 ± 0.2 、 26.2 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、 28.6 ± 0.2 、 28.8 ± 0.2 、 32.1 ± 0.2 、和 32.9 ± 0.2 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.1 、 10.1 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 10.9 ± 0.1 、 13.2 ± 0.1 、 15.6 ± 0.1 、 16.0 ± 0.1 、 16.6 ± 0.1 、 17.4 ± 0.1 、 17.9 ± 0.1 、 18.2 ± 0.1 、 18.7 ± 0.1 、 18.9 ± 0.1 、 19.9 ± 0.1 、 20.3 ± 0.1 、 21.0 ± 0.1 、 21.3 ± 0.1 、 21.7 ± 0.1 、 21.8 ± 0.1 、 22.8 ± 0.1 、 23.1 ± 0.1 、 23.3 ± 0.1 、 23.9 ± 0.1 、 24.7 ± 0.1 、 25.3 ± 0.1 、 25.7 ± 0.1 、 26.2 ± 0.1 、 26.6 ± 0.1 、 28.1 ± 0.1 、 28.6 ± 0.1 、 28.8 ± 0.1 、 32.1 ± 0.1 、和 32.9 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角（ 2θ ）處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表2中提供的繞射角（ 2θ ）在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0138】 結晶多晶型形式A的DSC熱譜圖在圖4中示出。已經確定，在如實例10所述之DSC方法過程中，多晶型形式A在約 101.09°C 下熔化並且熔化熱 = 75.707 J/g ，如圖4所示。

【0139】 結晶多晶型形式A之拉曼光譜在圖6中示出。

【0140】 已根據本文所述之方法製備了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的獨特物理形式（無溶劑且無水），多晶型形式B。多晶型形式B的粉末X射線繞射（PXRD）圖在圖3中示出，其中相應的清單數據在表3中示出。

[表3]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
7.72	11.4426	901.4	vs
10.06	8.7856	47.3	vw
10.63	8.3226	61.8	vw
12.2	7.2489	32.1	vw
12.93	6.8469	44	vw
13.96	6.3387	27.4	vw
15.04	5.8859	193.7	w
15.44	5.7343	1000	vs
16.58	5.3469	212.5	w
16.74	5.2918	472.9	m
17.27	5.1348	151.1	w
17.46	5.0752	280.7	m
18.08	4.9025	49.7	vw
18.44	4.8076	223.6	w
19.79	4.4863	127.6	w
20.16	4.4011	619.2	s
20.88	4.251	185.2	w
21.3	4.1681	47.9	vw
21.61	4.1124	119.3	w
21.78	4.0773	215.4	w
22.92	3.877	151.3	w
23.22	3.8276	55.1	vw
23.68	3.7543	103.2	w
24.14	3.6838	508.2	s
24.9	3.573	110.8	w
25.38	3.5065	23.3	vw
25.74	3.4583	199.5	w
26.06	3.4165	361.3	m
26.64	3.3435	278.8	m
26.94	3.3069	273.4	m
27.34	3.2594	57.8	vw

27.84	3.202	35.6	vw
28.12	3.1708	45.6	vw
28.42	3.138	30	vw
28.66	3.1122	22.2	vw
29.32	3.0437	21.7	vw
30.34	2.9436	59.6	vw
30.74	2.9062	54.2	vw
31.12	2.8716	412.7	m
32.28	2.7733	48.9	vw
32.8	2.7305	52.9	vw
33.4	2.6806	243.6	w
34.2	2.6219	48.4	vw
34.4	2.6049	33.2	vw
34.82	2.5766	42.5	vw
35.54	2.526	37.5	vw
36.6	2.4532	56	vw
36.92	2.4327	28.5	vw
38.44	2.3399	17.9	vw
38.82	2.3179	48.2	vw
39.88	2.2587	35.7	vw

* S = 強 (> 50%相對強度) , M = 中等 (20%-50%相對強度) , W = 弱 (< 20%相對強度)

【0141】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 12.2 ± 0.2 、 12.9 ± 0.2 、 14.0 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.1 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 20.9 ± 0.2 、 21.3 ± 0.2 、 21.6 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 22.9 ± 0.2 、 23.2 ± 0.2 、 23.7 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 24.9 ± 0.2 、 25.4 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 27.3 ± 0.2 、 27.8 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、 28.4 ± 0.2 、 28.7 ± 0.2 、 29.3 ± 0.2 、 30.3 ± 0.2 、 30.7 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、 32.3 ± 0.2 、 32.8 ± 0.2 、 33.4 ± 0.2 、 34.2 ± 0.2 、 34.4 ± 0.2 、 34.8 ± 0.2 、 35.5 ± 0.2 、 36.6 ± 0.2 、 36.9 ± 0.2 、 38.4 ± 0.2 、 38.8 ± 0.2 、和 39.9 ± 0.2 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射

線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.1 、 10.1 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 12.2 ± 0.1 、 12.9 ± 0.1 、 14.0 ± 0.1 、 15.0 ± 0.1 、 15.4 ± 0.1 、 16.6 ± 0.1 、 16.7 ± 0.1 、 17.3 ± 0.1 、 17.5 ± 0.1 、 18.1 ± 0.1 、 18.5 ± 0.1 、 19.8 ± 0.1 、 20.2 ± 0.1 、 20.9 ± 0.1 、 21.3 ± 0.1 、 21.6 ± 0.1 、 21.8 ± 0.1 、 22.9 ± 0.1 、 23.2 ± 0.1 、 23.7 ± 0.1 、 24.1 ± 0.1 、 24.9 ± 0.1 、 25.4 ± 0.1 、 25.8 ± 0.1 、 26.1 ± 0.1 、 26.6 ± 0.1 、 27.0 ± 0.1 、 27.3 ± 0.1 、 27.8 ± 0.1 、 28.1 ± 0.1 、 28.4 ± 0.1 、 28.7 ± 0.1 、 29.3 ± 0.1 、 30.3 ± 0.1 、 30.7 ± 0.1 、 31.1 ± 0.1 、 32.3 ± 0.1 、 32.8 ± 0.1 、 33.4 ± 0.1 、 34.2 ± 0.1 、 34.4 ± 0.1 、 34.8 ± 0.1 、 35.5 ± 0.1 、 36.6 ± 0.1 、 36.9 ± 0.1 、 38.4 ± 0.1 、 38.8 ± 0.1 、和 39.9 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角（ 2θ ）處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表3中提供的繞射角（ 2θ ）在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0142】 結晶多晶型形式A的DSC熱譜圖在圖5中示出。已經確定，在如實例10所述之DSC方法過程中，多晶型形式A在約 105.24°C 下熔化並且熔化熱 = 92.879 J/g ，如圖5所示。

【0143】 結晶多晶型形式A之拉曼光譜在圖7中示出。

組合

【0144】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任一種都可以與一種或多種活性成分組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0145】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與一種或多種活性成分組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或

依次應用)，該一種或多種活性成分各自具有與化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的殺昆蟲作用方式(MoA)相同、類似、但更可能地不同的MoA。在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與具有殺蟎、殺藻、殺鳥、殺細菌、殺真菌、除草、殺昆蟲、殺軟體動物、殺線蟲、殺齧齒動物、和/或殺病毒特性的一種或多種分子組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0146】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與作為拒食劑、驅鳥劑、化學不育劑、除草劑安全劑、昆蟲引誘劑、驅昆蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、植物活化劑、植物生長調節劑、和/或增效劑的一種或多種分子組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0147】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種還都可以與一種或多種生物型殺有害生物劑組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0148】 在一些實施方式中，在殺有害生物組成物中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種和活性成分的組合可以廣泛多種重量比率使用。例如，在兩種組分的混合物中，對於化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率，可使用各種比率。然而，通常，小於約10:1至約1:10的重量比率係較佳的。有時還較佳的是使用包含化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種和另外的兩種或更多種活性成分的二、三、四、五、六、七或更多種組分的混合物。

【0149】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率也可被描述為X : Y ; 其中X係化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的重量份並且Y係活性成分的重量份。X的重量份的數值範圍為 $0 < X \leq 100$ 並且Y的重量份的數值範圍為 $0 < Y < 100$ 。藉由非限制性實例的方式，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率可以是20 : 1。

配製物

【0150】 殺有害生物劑許多時候不適於以其純形式應用。通常必需添加其他物質，使得殺有害生物劑可在所需濃度下並且以適當的形式使用，從而允許易於應用、操作、運輸、儲存和最大殺有害生物劑活性。因此，將殺有害生物劑配製成例如誘餌、濃縮乳液、粉塵劑、可乳化濃縮物、熏劑、凝膠、顆粒劑、微膠囊、種子處理劑、懸浮液濃縮物、懸乳劑、片劑、水溶性液體、水可分散顆粒劑或乾燥可流動劑、可濕性粉劑、和超低容量溶液。

【0151】 殺有害生物劑最常以由此類殺有害生物劑的濃縮配製物製備的水性懸浮液或乳液形式應用。此類水溶性、水可懸浮或可乳化配製物係通常稱為可濕性粉劑、水可分散顆粒劑的固體，通常稱為可乳化濃縮物或水性懸浮液的液體。可壓實形成水可分散顆粒劑的可濕性粉劑包含殺有害生物劑、載體和表面活性劑的緊密混合物。殺有害生物劑的濃度通常為約10重量%至約90重量%。載體通常選自綠坡縷石（attapulgite）黏土、蒙脫石（montmorillonite）黏土、矽藻土、或純化矽酸鹽。占可濕性粉劑的約0.5%至約10%的有效表面活性劑被發現於磺化木質素、縮合萘磺酸鹽、萘磺酸鹽、烷基苯磺酸鹽、烷基硫酸鹽、和諸如烷基苯酚的環氧乙烷加合物的非離子表面活性劑。

【0152】 殺有害生物劑的可乳化濃縮物包含適宜濃度的溶解於載體中的殺有害生物劑（諸如約50至約500克/升（g/L）液體），該載體係水混溶性溶劑或水不可混溶性有機溶劑和乳化劑的混合物。可用的有機溶劑包括芳香族化合物（尤其是二甲苯）和石油餾分（尤其是石油的高沸點萘和烯部分，諸如重芳香族石腦油）。也可以使用其他有機溶劑，諸如包括松香衍生物的萜烯溶劑、諸如環己酮的脂族酮、和諸如2-乙氧基乙醇的複雜醇。用於可乳化濃縮物的合適乳化劑選自常規的陰離子表面活性劑和非離子表面活性劑。

【0153】 水性懸浮液包括水不溶性殺有害生物劑以約5重量%至約50重量%的濃度分散在水性載體中的懸浮液。懸浮液藉由以下方式製備：精細研磨殺有害生物劑並且將其劇烈混合到由水和表面活性劑構成的載體中。還可以添加諸如無機鹽和合成膠或天然膠的成分以增加水性載體的密度和黏度。藉由在諸如砂磨機、球磨機、或活塞型均化器的器具中製備水性混合物並且使其均化來同時研磨和混合殺有害生物劑通常是最有效的。可以將呈懸浮液的殺有害生物劑微包封在塑膠聚合物中。

【0154】 油分散體（OD）包括有機溶劑不溶性殺有害生物劑以約2重量%至約50重量%的濃度精細分散於有機溶劑和乳化劑的混合物中的懸浮液。一種或多種殺有害生物劑可以溶解於有機溶劑中。可用的有機溶劑包括芳香族化合物（尤其是二甲苯）和石油餾分（尤其是石油的高沸點萘和烯部分，諸如重芳香族石腦油）。其他溶劑可以包括植物油、種子油、和植物油和種子油的酯。用於油分散體的合適乳化劑選自常規的陰離子表面活性劑和非離子表面活性劑。在油分散體的配製中添加增稠劑或膠凝劑以改變液體的流變性或流動特性以及防止分散顆粒或液滴的分離和沈降。

【0155】 殺有害生物劑也可以以顆粒組成物的形式應用，該等顆粒組成物特別可用於應用於土壤。顆粒組成物通常含有約0.5重量%至約10重量%的殺有害生物劑，該殺有害生物劑分散於包含黏土或類似物質的載體中。通常藉由將殺有害生物劑溶解於合適的溶劑中並且將其應用到已預先形成在約0.5毫米（mm）至約3 mm的適當粒度的顆粒載體中來製備此類組成物。也可以藉由製造載體和分子的黏團或糊狀物並且然後擠壓並且乾燥以獲得所希望的顆粒粒度來配製此類組成物。顆粒的另一種形式係水可乳化顆粒劑（EG）。它係由顆粒劑組成的配製物，該配製物以一種或多種活性成分在水中崩解和溶解之後溶解或稀釋於有機溶劑中的常規水包油乳液形式應用。水可乳化顆粒劑包含溶解或稀釋於合適的有機溶劑中的一種或若干種活性成分，該一種或若干種活性成分被吸收在水溶性聚合物殼或一些其他類型的可溶性或不溶性基質中。

【0156】 藉由將呈粉末狀形式的殺有害生物劑與合適的粉塵狀農業載體（諸如高嶺土、研磨的火山岩等）緊密混合來製備含有殺有害生物劑的粉塵劑。粉塵劑可以適當含有約1%至約10%的殺有害生物劑。粉塵劑可以以拌種的形式或以使用噴粉機的葉面應用的形式進行應用。

【0157】 同樣實用的是以在適當的有機溶劑（通常為石油）中的溶液形式應用殺有害生物劑，諸如廣泛用於農業化學的噴淋油。

【0158】 殺有害生物劑也可以氣溶膠組成物的形式應用。在此類組成物中，殺有害生物劑溶解或分散於作為產生壓力的推進劑混合物的載體中。將氣溶膠組成物包裝在通過霧化閥分配混合物的容器中。

【0159】 當殺有害生物劑與食品或引誘劑或兩者混合時，形成殺有害生物劑誘餌。當有害生物食用誘餌時，它們也食用殺有害生物劑。誘餌可以呈顆粒劑、凝膠、可流動粉末、液體、或固體的形式。誘餌可用於有害生物庇護處。

【0160】 熏劑係具有相對高蒸氣壓並且因此可以足夠濃度的氣體形式存在以殺死土壤或封閉空間中的有害生物的殺有害生物劑。熏劑的毒性與其濃度和暴露時間成比例。它們藉由良好的擴散能力表徵並且藉由滲透有害生物的呼吸系統或經由有害生物的表皮吸收而起作用。應用熏劑以防治在氣密薄片下、在氣封室或建築物中或在特定腔室中的積穀有害生物（stored product pest）。

【0161】 可以藉由將殺有害生物劑顆粒或液滴懸浮於各種類型的塑膠聚合物中來將殺有害生物劑微包封。藉由改變聚合物的化學性質或藉由改變加工中的因素，可以形成具有各種尺寸、溶解度、壁厚和滲透程度的微膠囊。該等因素管控內部的活性成分釋放的速度，其繼而影響產品的殘餘性能、作用速度、和氣味。微膠囊可以配製為懸浮液濃縮物或水可分散顆粒劑。

【0162】 油溶液濃縮物係藉由將殺有害生物劑溶解在將殺有害生物劑保持在溶液中的溶劑中而製成的，殺有害生物劑的油溶液通常比其他配製物更快擊潰和殺死有害生物，因為溶劑本身具有殺有害生物作用並且外皮蠟質覆蓋物的溶解增加殺有害生物劑的攝取速度。油溶液的其他優點包括更好的儲存穩定性、更好的裂隙滲透性和更好的對油脂表面的黏附性。

【0163】 另一個實施方式係水包油乳液，其中該乳液包含各自具備層狀液晶包衣並且分散在水相中的油性小珠，其中每個油性小珠包含至少一種具有農業活性的分子並且單獨地被單層狀層或多層狀層包覆，該單層狀層或多層狀層

包含：(1) 至少一種非離子親脂性表面活性劑，(2) 至少一種非離子親水性表面活性劑，和 (3) 至少一種離子表面活性劑，其中該小珠的平均粒徑小於800奈米。

其他配製物組分

【0164】 通常，當化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種用於配製物中時，此類配製物還可含有其他組分。該等組分包括但不限於（這係非詳盡且非互相排他性清單）潤濕劑、鋪展劑、黏著劑、滲透劑、緩衝劑、螯合劑、減漂劑、相容劑、消泡劑、清潔劑、和乳化劑。接著描述數種組分。

【0165】 潤濕劑係當被添加到液體中時藉由減小液體與其所鋪展的表面之間的表面張力而增加液體的鋪展或滲透能力的物質。潤濕劑因以下兩個主要功能用於農用化學配製物：在加工和製造期間，增加粉末在水中潤濕的速率以製造可溶性液體或懸浮液濃縮物；以及在產品與水在噴灑罐中混合期間，減少可濕性粉劑的潤濕時間並且改進水到水可分散顆粒劑中的滲透。用於可濕性粉劑、懸浮液濃縮物和水可分散顆粒劑配製物的潤濕劑的實例係：月桂基硫酸鈉、二辛基磺基琥珀酸鈉、烷基酚乙氧基化物、和脂族醇乙氧基化物。

【0166】 分散劑係吸附於顆粒表面上，有助於保持顆粒的分散狀態並且防止其再聚集的物質。將分散劑添加到農用化學配製物中以促進在製造期間的分散和懸浮並且確保顆粒再分散於噴灑罐中的水中。它們廣泛用於可濕性粉劑、懸浮液濃縮物、和水可分散顆粒劑中。用作分散劑的表面活性劑具有強烈吸附於顆粒表面上並且提供針對顆粒再聚集的帶電荷的或空間屏障的能力。最常用的表面活性劑係陰離子表面活性劑、非離子表面活性劑、或兩種類型的混合物。對於可濕性粉劑配製物，最常見的分散劑係木質素磺酸鈉。對於懸浮液濃縮物，使用聚電解質（諸如萘磺酸鈉甲醛縮合物）獲得非常好的吸附性和穩定性。也使用三

苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯。諸如烷基芳基環氧乙烷縮合物和EO-PO嵌段共聚物的非離子表面活性劑有時與作為分散劑的陰離子表面活性劑組合用於懸浮液濃縮物。近年來，已開發出新型的非常高分子量聚合物表面活性劑作為分散劑。其具有非常長的疏水性「主鏈」和大量環氧乙烷鏈，形成「梳型」表面活性劑的「齒」。該等高分子量聚合物可以賦予懸浮液濃縮物非常好的長期穩定性，因為疏水性主鏈具有在顆粒表面上的許多錨點。

【0167】 用於農用化學配製物的分散劑的實例係：木質素磺酸鈉、萘磺酸鈉甲醛縮合物、三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯、脂族醇乙氧基化物、烷基乙氧基化物、EO-PO嵌段共聚物、和接枝共聚物。

【0168】 乳化劑係使一種液相的液滴在另一個液相中的懸浮液穩定的物質。在無乳化劑的情況下，可以將兩種液體分成兩種不可混溶的液相。最常用的乳化劑共混物含有具有十二個或更多個環氧乙烷單元的烷基酚或脂族醇和油溶性的十二烷基苯磺酸鈣鹽。約8至約18的親水-親油平衡（「HLB」）值將正常提供良好的穩定乳液。乳液穩定性可以有時藉由添加少量EO-PO嵌段共聚物表面活性劑來改進。

【0169】 增溶劑係將以高於臨界膠束濃度的濃度在水中形成膠束的表面活性劑。膠束然後能夠溶解或增溶膠束的疏水性部分內的水不溶性材料。通常用於增溶的表面活性劑的類型為非離子表面活性劑：脫水山梨醇單油酸酯；脫水山梨醇單油酸酯乙氧基化物；和油酸甲酯。

【0170】 表面活性劑有時單獨地或與作為用於噴灑罐混合的輔助劑的其他添加劑（諸如礦物油或植物油）一起使用，以改進殺有害生物劑對於標靶的生物性能。用於生物增強的表面活性劑的類型通常取決於殺有害生物劑的性質和

作用方式。然而，它們通常是非離子表面活性劑，諸如：烷基乙氧基化物、直鏈脂族醇乙氧基化物、和脂族胺乙氧基化物。

【0171】 農業配製物中的載體或稀釋劑係添加到殺有害生物劑中以給出所需強度的產品的材料。載體通常是具有高吸收能力的材料，而稀釋劑通常是具有低吸收能力的材料。載體和稀釋劑用於粉塵劑、可濕性粉劑、顆粒劑、和水可分散顆粒劑的配製。

【0172】 有機溶劑主要用於配製可乳化濃縮物、水包油乳液、懸乳劑、油分散體和超低容量配製物，並且在較小程度上用於配製顆粒配製物。有時使用溶劑混合物。第一主組的溶劑係脂族石蠟油，諸如煤油或精製石蠟。第二主組的（並且最常用的）溶劑包括芳香族溶劑，諸如二甲苯和較高分子量的C₉和C₁₀芳香族溶劑餾分。氯化烴可用作助溶劑以便當配製物乳化在水中時防止殺有害生物劑結晶。醇有時用作助溶劑以增加溶解能力。其他溶劑可以包括植物油、種子油、和植物油和種子油的酯。

【0173】 增稠劑或膠凝劑主要用於配製懸浮液濃縮物、油分散體、乳液和懸乳劑，以改變液體的流變或流動特性和防止分散的顆粒或液滴的分離和沈降。增稠劑、膠凝劑和防沈劑通常分成兩個類別，即水不溶性顆粒和水溶性聚合物。可以使用黏土和二氧化矽來製備懸浮液濃縮物和油分散體配製物。該等類型的材料的實例包括但不限於蒙脫石、膨潤土、矽酸鎂鋁、和綠坡縷石。水基懸浮液濃縮物中的水溶性多糖已用作增稠膠凝劑多年，最常用的多糖類型係種子和海藻的天然提取物或係纖維素的合成衍生物。該等類型的材料的實例包括但不限於瓜耳膠、刺槐豆膠、角叉菜膠、海藻酸鹽、甲基纖維素、羧甲基纖維素鈉

(SCMC)、和羥乙基纖維素(HEC)。其他類型的防沈劑係基於改性澱粉、聚丙烯酸酯、聚乙烯醇、和聚環氧乙烷的。另一種良好的防沈劑係黃原膠。

【0174】微生物可以導致配製產品的腐敗。因此，使用防腐劑消除或減輕其作用。此類藥劑的實例包括但不限於：丙酸及其鈉鹽、山梨酸及其鈉或鉀鹽、苯甲酸及其鈉鹽、對羥基苯甲酸鈉鹽、對羥基苯甲酸甲酯、和1,2-苯并異噻唑啉-3-酮(BIT)。

【0175】表面活性劑的存在通常在生產和通過噴灑罐應用中的混合操作期間導致水基配製物起泡。為了減少起泡的傾向，通常在生產階段期間或在填充至瓶中之前添加消泡劑。通常，存在兩種類型的消泡劑，即矽酮和非矽酮。矽酮通常是二甲基聚矽氧烷的水性乳液，而非矽酮消泡劑係水不溶性油(諸如辛醇和壬醇)或二氧化矽。在兩種情況下，消泡劑的功能係使表面活性劑從空氣-水介面移位。

【0176】「綠色」劑(例如輔助劑、表面活性劑、溶劑)可以減少作物保護配製物的整體環境足跡。綠色劑係可生物降解的並且通常源於天然和/或可持續源，例如植物源和動物源。具體實例係：植物油、種子油、及其酯。

應用

【0177】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於任何場所。應用此類分子的特定場所包括苜蓿、杏仁、蘋果、大麥、豆類、低芥酸菜籽、玉米、棉花、十字花科植物、花卉、飼料物種(黑麥草、蘇丹草(Sudan Grass)、高羊茅(Tall Fescue)、肯塔基藍草(Kentucky Blue Grass)和三葉草)、水果、萵苣、燕麥、油籽作物、柑橘、花生、梨、胡椒、馬鈴薯、水稻、高粱、大豆、草莓、甘蔗、糖用甜菜、向日葵、煙草、蕃茄、小麥(例如，硬紅冬小麥(Hard

Red Winter Wheat)、軟紅冬小麥(Soft Red Winter Wheat)、白冬小麥(White Winter Wheat)、硬紅春小麥(Hard Red Spring Wheat)和杜倫春小麥(Durum Spring Wheat))以及其他有價值的作物生長或要種植其種子的場所。

【0178】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以應用於植物(諸如作物)生長的地方和存在低水平(甚至實際不存在)的可能商業上損害此類植物的有害生物的地方。在此類場所應用此類分子將有益於植物在此類場所生長。此類有益效果可包括但不限於:幫助植物生長更好的根系;幫助植物更好地承受應激生長條件;改進植物的健康狀況;改進植物的產率(例如,增加的生物量和/或增加的有價值成分的含量);改進植物的活力(例如,改進的植物生長和/或更綠的葉);改進植物的品質(例如,改進某些成分的含量或組成);以及改進植物的對非生物和/或生物應激的耐受性。

【0179】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以在各種植物生長時與硫酸銨一起應用,因為這可以提供另外的益處。

【0180】可以將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用於以下植物上、中或周圍:經遺傳修飾以表現特定性狀(諸如蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*))(例如,Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1))、其他殺昆蟲毒素的植物,或表現除草劑耐受性的植物,或具有表現殺昆蟲毒素、除草劑耐受性、營養增強或任何其他有益性狀的「堆疊」外源基因的植物。

【0181】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於植物的葉和/或果實部分以防治有害生物。化合物1的此類多晶型物將與有害生物直接

接觸，或有害生物將在食用植物時或在汲取植物的汁液或其他營養物時食用化合物1的此類多晶型物。

【0182】 也可以將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用於土壤，並且當以這種方式應用時，可以防治取食根和莖的有害生物。根可吸收此類分子，由此將其向上輸送至植物的葉部分以防治地面上的咀嚼有害生物和取食汁液的有害生物。

【0183】 可以利用植物中殺有害生物劑的系統性移動來藉由將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用（例如，藉由噴灑場所）於植物的不同部分而防治在植物的一個部分上的有害生物。例如，葉取食的昆蟲的防治可以藉由滴灌或溝施、藉由用例如種植前或種植後土壤浸液處理土壤、或藉由在種植之前處理植物種子來實現。

【0184】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以與誘餌一起使用。通常在誘餌的情況下，將誘餌置於例如白蟻可與誘餌接觸和/或被引誘至誘餌處的地面。也可以將誘餌應用於例如螞蟥、白蟻、蟑螂和蒼蠅可與誘餌接觸和/或被引誘至誘餌處的建築物的表面（水平、豎直或傾斜表面）。

【0185】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以包封在膠囊內部，或放置在膠囊表面上。膠囊的尺寸可以是奈米尺寸（約100-900奈米直徑）至微米尺寸（約10-900微米直徑）。

【0186】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於有害生物的卵。由於一些有害生物的卵抵抗某些殺有害生物劑的獨特能力，因此可能希望重複應用此類分子以防治新出現的幼蟲。

【0187】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以用作種子處理劑。可以將種子處理劑應用於所有類型的種子，包括經遺傳修飾以表現特定性狀的植物的將從其萌發的種子。代表性實例包括表現對無脊椎動物有害生物有毒的蛋白質的那些，諸如蘇雲金芽孢桿菌或其他殺昆蟲毒素；表現除草劑耐受性的那些，諸如「抗草甘膦（Roundup Ready）」種子；或具有表現殺昆蟲毒素、除草劑耐受性、營養增強、耐旱性或任何其他有益性狀的「堆疊」外源基因的那些。此外，採用化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的此類種子處理劑可以進一步增強植物更好地承受應激生長條件的能力。這導致更健康、更有活力的植物，這可以在收穫時間導致較高的產率。通常，約1克至約500克此類多晶型物/100,000種子的量有望提供良好的效益；約10克至約100克/100,000種子的量有望提供更好的效益；並且約25克至約75克/100,000種子的量有望提供甚至更好的效益。化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以與土壤改良劑中的一種或多種活性成分一起應用。

【0188】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以在獸醫學領域中或在非人類動物飼養領域中用於防治體內寄生蟲和體表寄生蟲。此類分子可以藉由以下方式應用：以例如片劑、膠囊、飲料和顆粒劑的形式口服施用；以例如浸漬、噴灑、傾倒（pouring on）、點滴（spotting on）和撒粉的形式皮膚應用；以及以例如注射的形式腸胃外施用。

【0189】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以有利地用於家畜飼養，例如牛、雞、鵝、山羊、豬、綿羊和火雞。它們也可以有利地用於寵物，諸如馬、犬和貓。要防治的具體有害生物可以是令此類動物生厭的蒼蠅、

跳蚤、和扁虱。合適的配製物與飲用水或飲食一起口服施用於動物。合適的劑量和配製物取決於物種。

【0190】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以用於防治以上列出的動物中（尤其腸）的寄生蟲。化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以用於人類健康護理的治療方法中，此類方法包括但不限於以例如片劑、膠囊、飲料和顆粒劑的形式口服施用以及藉由皮膚施用。

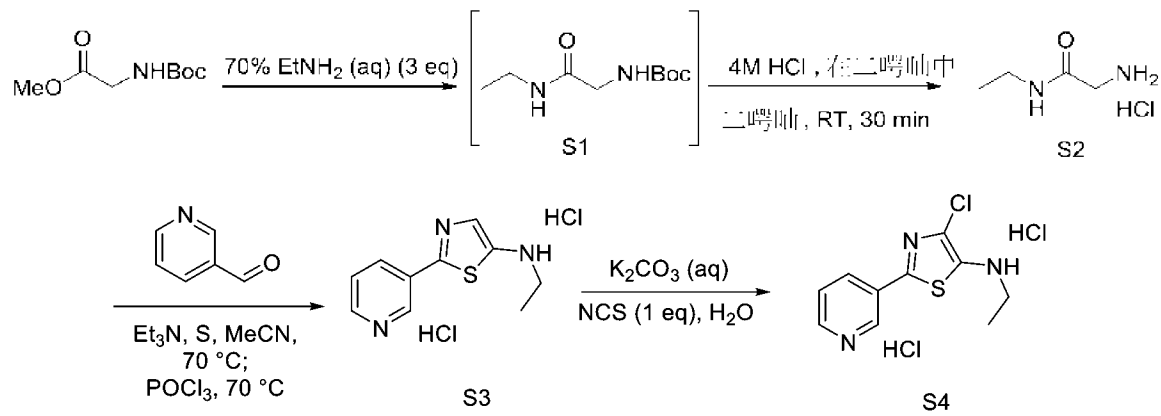
【0191】 化合物1的多晶型形式A和B也可以應用於侵入性有害生物。全世界的有害生物已遷移至新環境（對於此類有害生物而言）並且此後變成此類新環境的新侵入性物種。此類多晶型物也可以用於此類新侵入性物種以在此類新環境中對其進行防治。

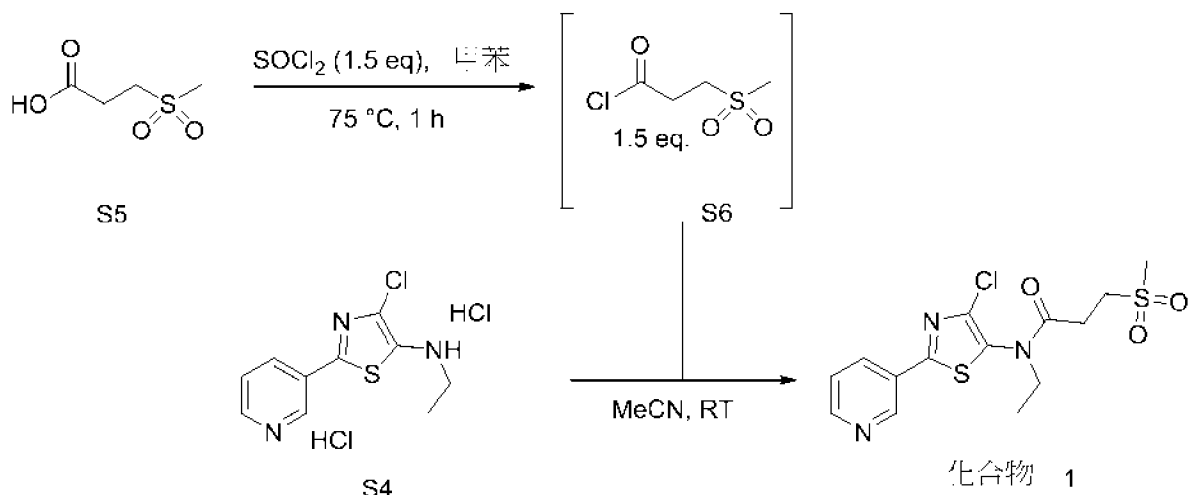
實例

【0192】 下面提供的實例和製備進一步說明和例證本揭露實施方式的特定方面。應理解，本揭露之範圍不以任何方式受到以下實例範圍的限制。

【0193】 實例1

【0194】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的合成，並且作為形式A分離





【0195】 步驟1：(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (S1) 的製備

【0196】 向1 L圓底中添加水中的70%乙胺 (347 mL, 4360 mmol, 3當量)，並分次添加(三級丁氧羰基)甘胺酸甲酯 (255 ml, 1453 mmol) 以保持溫度 $<35^\circ\text{C}$ 。在室溫下攪拌反應並使用 CDCl_3 藉由NMR監測。過量的乙胺和水藉由常壓蒸餾除去。將混合物冷卻並添加環戊基甲醚 (CPME) (400 mL)。繼續常壓蒸餾以共沸出剩餘的水 (鍋溫： 115°C ，頂溫： 95°C)。在頂部蒸餾出約260 mL的CPME。將混合物冷卻至室溫並向底部添加CPME (140 mL)。該溶液無需進一步操作即可用於下一步驟。 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ 3.77 (d, $J = 5.9$ Hz, 2H), 3.37 - 3.26 (m, 2H), 1.46 (s, 9H), 1.15 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H)。

【0197】 步驟2：步驟2：2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) 的製備

【0198】 向5L夾套反應器中添加異丙醇中的6N HCl (1055 mL, 6.3 mol, 4當量) 和CPME (1055 mL) 並將夾套設置在 30°C 。藉由蠕動泵在30分鐘內添加來自先前反應的作為在CPME中的溶液的(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (假定320 g, 1582 mmol)。將反應在 30°C 下攪拌6 h並且冷卻至 25°C

攪拌過夜。在DMSO中藉由NMR監測反應。反應形成了非常濃稠的漿液。用CPME (650 mL) 稀釋漿液並通過經由粗玻璃料過濾分離出固體，用CPME (300 mL) 洗滌。然後用一餅體積的己烷洗滌濕餅以幫助去除CPME，進行乾燥。將材料在45°C下在真空烘箱中乾燥，得到呈蓬鬆白色固體的2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) (184.11 g, 1315 mmol, 83%產率)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 3.49 (s, 2H), 3.14 (qd, *J* = 7.3, 5.4 Hz, 2H), 1.05 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)。

【0199】 步驟3：*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S3) 的製備

【0200】 向配備有回流冷凝器和熱電偶的125 mL 3頸直壁平底燒瓶中添加2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽(4.99 g, 36.0 mmol, 1.25當量)、無水乙腈(48 mL)，形成白色漿液。反應器用氮氣惰性化。添加無水三乙胺(99%, 5.60 mL, 39.7 mol, 1.38當量)並將混合物攪拌1 h，得到白色濃稠漿液。添加煙醛(98%, 2.70 mL, 28.8 mmol, 1.0當量)，得到較稀的漿液。添加硫固體粉末(1.20 g, 37.4 mmol, 1.30當量)。將混合物在70°C下攪拌並逐漸變成深紅橙色溶液。藉由HPLC監測反應直到煙醛消失，這需要約5 h並且然後冷卻至50°C。向反應混合物中逐滴添加三氯氧磷(POCl₃, 99%, 6.70 mL, 77.8 mmol, 2.50當量)，同時保持鍋溫低於60°C。將深棕色的稀漿液/油在50°C下攪拌7 h，在此期間形成黃色漿液(藉由HPLC監測)。將黃橙色漿液冷卻至15°C並添加甲苯(20 mL)。過濾混合物並用甲苯(3 X 10 mL)洗滌。將黃色濕餅在40°C下在真空中乾燥16 h以得到呈黃色固體的*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽(S3)(5.14 g)，如藉由¹H NMR測定測量的，純度為92 wt%，表明兩個步驟的產率為57.8%。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.07 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 8.71 (dd, *J* = 5.6, 1.3 Hz, 1H), 8.66 (ddd, *J* = 8.3, 2.2, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (ddd, *J* = 8.3, 5.5, 0.7 Hz, 1H), 7.54 - 7.19 (m, 1H), 7.02

(s, 1H), 3.15 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.21 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H) 。 ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO) δ 155.15, 140.81, 139.39, 139.16, 136.62, 133.13, 127.52, 120.35, 41.56, 13.89 。 ESIMS m/z 206 [(M+H-2HCl)+] 。

【0201】 步驟4：步驟4：4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4) 的製備

【0202】 向1 L圓底燒瓶中添加*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (30 g, 108 mmol) 和水 (360 mL) 並將所得橙色/紅色溶液用冰浴冷卻至約 5°C。分次添加*N*-氯代琥珀醯亞胺 (14.4 g, 108 mmol, 1當量)，保持溫度低於 7°C。將所得深色溶液在5°C下攪拌40 min，藉由HPLC監測。將反應物倒入20%的碳酸鉀溶液中，導致形成黏性紅色固體，並用乙酸乙酯萃取產物。有機層用10%硫代硫酸鈉洗滌，然後用20%碳酸鉀洗滌。有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮，得到呈紅色油的4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺 (S4) (27 g, 104%)，其無需進一步純化即可進入步驟6。 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.96 (dd, $J = 2.4$, 0.8 Hz, 1H), 8.54 (dd, $J = 4.8$, 1.6 Hz, 1H), 8.07 (ddd, $J = 8.1$, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 7.31 (ddd, $J = 8.1$, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 4.02 (s, 1H), 3.27 (qd, $J = 7.2$, 5.8 Hz, 2H), 1.34 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H) 。

【0203】 步驟5：3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6) 的製備

【0204】 在配備有氮氣入口、回流冷凝器、通向1 N NaOH鹼洗滌器的通氣管和攪拌棒的500 mL三頸圓底燒瓶中裝入3-(甲基磺醯基)丙酸 (50 g, 329 mmol) 和甲苯 (299 ml)，以得到不均勻溶液。向其中添加亞硫醯氯 (1.5當量) 並將溶液加熱至70°C-75°C的內部溫度。在此溫度下攪拌反應，藉由NMR監測。將反應冷卻至室溫，這時觀察到明顯的固體形成。向漿液中添加250 mL庚烷並將混合

物攪拌10分鐘。將固體藉由過濾分離，用庚烷洗滌（90%產率）。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 3.51 - 3.46 (m, 2H), 3.43 - 3.38 (m, 2H), 3.00 (s, 1H)；¹³C NMR (126 MHz, CDCl₃) δ 171.8, 49.5, 41.6, 39.3。

【0205】 步驟6：作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的製備

【0206】 向含有粗4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺（27 g）的1 L圓底燒瓶中添加乙腈（300 mL），製備紅色溶液。在5分鐘內分次添加3-(甲基磺醯基)丙醯氯（27.6 g，162 mmol，1.5當量），藉由HPLC監測反應直到達到> 98%的轉化率。在反應過程期間，產物的HCl鹽以黃色/棕褐色固體形成。將固體藉由過濾分離，然後用20%碳酸鉀中和，用乙酸乙酯萃取。將有機層經硫酸鈉乾燥，過濾，並濃縮，得到52.3 g的粗油。粗材料從異丙醇-庚烷中結晶以得到呈結晶固體的化合物1（35.2 g，80%）。¹H NMR (300 MHz, 氯仿-*d*) δ 9.17 - 9.06 (m, 1H), 8.74 (dd, *J* = 4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.22 (ddd, *J* = 8.0, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 7.45 (ddd, *J* = 8.0, 4.9, 0.9 Hz, 1H), 3.79 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 3.43 (s, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.80 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 1.34 - 1.15 (m, 3H)；¹³C NMR (75 MHz, CDCl₃) δ 169.43, 163.02, 152.15, 147.29, 138.62, 133.37, 131.86, 128.41, 123.92, 50.21, 45.26, 41.75, 27.29, 12.82；對於 C₁₄H₁₆ClN₃O₃S₂ 計算的 HRMS-ESI (*m/z*) [M+H]⁺ 為 373.0322；實測的是 374.0397。根據實例8藉由PXRD對結晶固體進行分析，如圖1所示，並指定名稱為形式A。

【0207】 實例2

【0208】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的合成，並且作為形式A再結晶



【0209】 步驟1：(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯(S1)的製備

【0210】 向裝備有溫度記錄儀、機械攪拌器、低流量/高流量氮氣設置的3L夾套反應器中添加水中的乙胺溶液（70%）（599 mL，7.53 mol）。反應器浴設定為23°C（內部溫度=22°C）。使用蠕動泵向此攪拌的溶液中緩慢添加(三級丁氧基羰基)甘胺酸甲酯（500 g，2510 mmol），保持內部溫度低於35°C。將反應在23°C（內部溫度）下攪拌過夜。過程 controls（¹H NMR）顯示起始材料完全轉化為產物(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (S1)。反應器設置有短程蒸餾頭並且反應器浴被加熱到127°C（內部溫度約為115°C，蒸餾頭溫度在

70°C-85°C之間波動)。接收燒瓶在冰浴中冷卻並取出約240 mL的乙胺/水/MeOH。將反應冷卻至內部溫度60°C，並添加約350 mL的CPME，然後進行第二次蒸餾以除去剩餘的乙胺（浴溫設定為117°C，內部溫度為約98°C，並且蒸餾頭溫度為約80°C）。蒸餾完成後（藉由蒸餾頭溫度的降低來確定，表明沒有餾出物），反應器浴設定為23°C（內部溫度 = 22°C）並允許攪拌過夜。產物(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯無需進一步純化即用於下一步驟。

【0211】 步驟2：2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) 的製備

【0212】 向配備有氮氣入口、蠕動泵、機械攪拌器和通過鹼洗滌器（含有10% NaOH溶液的鱷形捕集器）的排氣孔的5 L夾套反應器中添加HCl（在異丙醇中6 M）（1.67 L，10.0 mol）。使用蠕動泵將來自步驟1的醯胺從3 L夾套反應器逐滴添加到5 L夾套反應器中的酸中。在添加完成後，向3 L反應器中添加400 mL的CPME以洗淨反應器，並藉由蠕動泵將CPME液體添加到5 L反應器中。反應被攪拌過夜，在此期間形成了白色沈澱物。過濾反應器內容物以得到約100 g的2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2)，將其放在一邊進行乾燥。將濾液濃縮至1.3 L（約50%體積），然後添加600 mL的CPME和100 mL的異丙醇以誘導S2的進一步沈澱。將混合物攪拌60分鐘。過濾所得漿液，並將固體與第一批固體合併並在真空烘箱中乾燥過夜（50°C，< 50 mmHg），以得到呈白色固體的2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽（300.5 g，2168 mmol，86%產率）：¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 3.49 (s, 2H), 3.14 (qd, *J* = 7.2, 5.4 Hz, 2H), 1.05 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 103 [(*M*+H)⁺]。

【0213】 步驟3：*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S3) 的製備

【0214】 向配備有2個回流冷凝器（乾冰）、機械攪拌器、N₂入口和熱電偶的5 L夾套反應器中添加2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) (238 g, 1.72 mol) 和無水乙腈 (2.00 L)，得到白色漿液。反應器用氮氣惰性化。添加無水三乙胺 (264 ml, 1.89 mmol)，並將混合物攪拌1 h，得到白色濃稠漿液。添加煙醛 (131 ml, 1.37 mol)，得到較稀的漿液。然後，添加硫 (57.2 g, 1.78 mol)。夾套溫度設定為72°C (內部溫度 = 70°C) 並逐漸 (在30 min內) 變成暗紅橙色溶液並形成沈澱物。藉由HPLC監測反應直到煙醛消失，這需要在72°C下加熱約5 h並且然後冷卻至室溫並攪拌過夜。多相反應被再加熱到內部溫度50°C (在該溫度下它再一次變成深紅色/棕色的透明溶液)。在50°C的內部溫度下向反應中逐滴添加三氯氧磷 (321 ml, 3431 mmol) 以使內部溫度增加不超過65.5°C。藉由HPLC監測反應直到硫代醯胺中間體被消耗 (需要6小時)。將夾套溫度降至20°C (內部溫度 = 20°C)，並藉由過濾分離固體並用乙腈洗滌。反應器用100 mL乙腈洗滌。濾液被移出以進行淬滅。用300 mL DCM進一步洗滌固體。黃色/綠色濕餅在真空下在 (40°C, < 50 mmHg) 下乾燥16 h，以得到呈綠色固體的*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (200 g, 703 mmol, 51%產率)：¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.98 (dd, *J* = 2.3, 0.9 Hz, 1H), 8.53 (dd, *J* = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.07 (ddd, *J* = 8.0, 2.3, 1.6 Hz, 1H), 7.31 (ddd, *J* = 8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 6.98 (s, 1H), 3.95 (s, 1H), 3.24 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.31 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 206 [(M+H)⁺]。

【0215】 步驟4：4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4) 的製備

【0216】 向配備有機械攪拌器、N₂入口和溫度探頭的5 L反應器中添加*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (210 g, 755 mmol) 和水 (630 mL)，然後添加乙酸乙酯 (2.10 L)。在十分鐘內藉由蠕動泵向此攪拌的暗紅色溶液中

逐滴添加碳酸鉀（209 g，1.51 mol）在水（209 mL）中的溶液。完成後，夾套溫度被設定為45°C（內部溫度 = 44°C）並將反應攪拌2 h。然後將反應物轉移到分離漏斗中並除去底部水層。水層係透明的淺橙色。丟棄水層（HPLC顯示沒有希望的產物）。將有機層倒入配備有磁力攪拌器和MgSO₄（210 g）的愛倫美氏（Erlenmeyer）燒瓶中。將燒瓶攪拌3 h，直到藉由卡爾-費歇爾滴定測得有機溶液的水水平 < 0.5 wt%。過濾混合物，並將無機固體用EtOAc（100 mL）洗滌。將濾液倒回5 L反應器中並冷卻至內部溫度為0°C，在此期間深橙色溶液變成不均勻的。向不均勻的漿液中添加呈固體的1-氯吡咯啉-2,5-二酮（101 g，755 mmol），保持內部溫度低於12°C。添加完成後，反應物變成均勻的，並藉由HPLC監測反應。添加完成後十分鐘，藉由HPLC確定反應完成。然後在90分鐘內藉由蠕動泵滴入在二噁呋喃中的4 M HCl（566 mL，2.27 mol）。夾套溫度被設定為23°C（內部溫度 = 22°C）並允許在室溫下攪拌反應過夜。攪拌過夜後，過濾不均勻的漿液以得到黃色/棕色固體，將其在真空烘箱（30°C，< 50 mmHg）中乾燥以得到呈黃色/棕色固體的4-氯-N-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4)（195 g，629 mmol，83%產率）：¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.05 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 8.66 (dd, *J* = 5.3, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (dt, *J* = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 3.19 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.23 (t, *J* = 7.1 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 240 [(M+H)⁺]。

【0217】 步驟5：3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6) 的製備

【0218】 將3-(甲基磺醯基)丙酸 (S5)（101 g，663 mmol，購自Orchev公司）裝入1 L夾套反應器中，然後是乙腈（304 g），並且然後攪拌以溶解酸。在五分鐘內逐滴添加亞硫醯氯（83.7 g，697 mmol）。溶液在25°C下保持3小時以允許酸

(S5) 轉化為醯氯，3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6)。醯氯產物無需進一步純化即可用於下一步驟。

【0219】 步驟6：*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的製備

【0220】 在單獨的5 L反應器中裝入4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽（164 g，84 wt%純，442 mmol，1.0當量），然後是MeCN（415 g，22.9當量）和碳酸鉀（156 g，1.11 mol）。在從1 L反應器中轉移醯氯溶液之前攪拌橙色漿液。藉由蠕動泵在15分鐘內轉移步驟5中製備的3-(甲基磺醯基)丙醯氯溶液，並觀察到+3°C的放熱。將反應在室溫下攪拌過夜。

【0221】 攪拌過夜後，將漿液冷卻至內部溫度為8°C，然後藉由蠕動泵在3小時內將水（554 g）轉移到5 L反應器中。在固體溶解後，停止攪拌以允許雙相混合物分離。丟棄下部水相並且然後在旋轉蒸發器上在50°C下濃縮有機相，以得到呈粗棕色油的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）。

【0222】 步驟7：*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的分離

【0223】 將來自步驟6的油溶解在1-丁醇（497 g）中並將溶液重新裝入1 L反應器中。將反應器溫熱至30°C並用*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1，形式A）（8.18 g，21.9 mmol）引晶。漿液在30°C下保持8小時，然後在12小時內冷卻至18°C。漿液在18°C下保持4小時並且然後隨後在8小時內冷卻至10°C。過濾漿液並用庚烷洗滌濕餅。濕餅在烘箱中在< 50 mmHg下在50°C下乾燥。在這種情況下，烘箱中發生了不可控的加熱，

這導致一些濕餅熔化。所得固體（150 g，90%）無需進一步純化即用於下一步驟中。

【0224】 步驟8：作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的再結晶

【0225】 將來自步驟7的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（150 g，401 mmol）裝入1 L反應器中，然後是MeOH（176 g）。用氮氣填充反應器並開始攪拌。將內容物加熱至55°C以將固體溶解為溶液。將深棕色溶液冷卻至25°C並用*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1，形式A）（1.50 g，4.01 mmol）引晶。漿液保持5小時，然後藉由蠕動泵在3小時內將水（253 g）添加到反應器中。漿液在25°C下保持過夜。第二天，在過濾漿液之前，將其在4小時內冷卻至內部溫度為4°C。濕餅用水中的10% MeOH（100 g）洗滌並且然後在真空烘箱中在55°C下乾燥以得到呈結晶固體的化合物1（92.15 g，61%，99.3 wt%純度）。根據實例8藉由PXRD對固體進行分析，如圖2所示，並指定名稱形式A。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.12 (d, *J* = 2.3 Hz, 1H), 8.77 - 8.71 (m, 1H), 8.22 (dt, *J* = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 7.45 (dd, *J* = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 3.43 (s, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.80 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 1.23 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 374 [(*M*+H)⁺]。

【0226】 實例3

【0227】 作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從1,4-二噁咻中結晶。

【0228】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的25.2 mg的化合物1形式A溶於500 μL的1,4-二噁咻中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將小瓶置於通風櫥中

以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式A。

【0229】 實例4

【0230】 作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從MeOH中替代結晶。

【0231】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的24.9 mg的化合物1形式A溶於1 mL MeOH中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式A。

【0232】 實例5

【0233】 作為形式B的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從乙腈中結晶。

【0234】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的24.6 mg的化合物1形式A溶於500 μ L乙腈中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，如圖3所示，並指定名稱為形式B。

【0235】 實例6

【0236】 作為形式B的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從EtOH中替代結晶。

【0237】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的25.2 mg的化合物1形式A溶於2 mL EtOH中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸

發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式B。

【0238】 實例7

【0239】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的蒸發結晶溶劑篩選。

【0240】 按照如實例3-6中所述之相同的通用程序，將如實例2中製備的化合物1形式A溶於各種溶劑中並進行蒸發結晶程序。結果總結在表4中，並根據實例9確認了PXRD圖。

[表4]

溶劑	條件	多晶型形式
丙酮	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	A
二氯甲烷	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	A
乙酸乙酯	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
異丙醇	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
乙酸異丙酯	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
2-甲基-四氫呋喃	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
四氫呋喃	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B

【0241】 實例8

【0242】 化合物1的結晶多晶型形式A和B的粉末X射線繞射（PXRD）。

【0243】 使用Rigaku Miniflex II臺式X射線繞射儀對樣品進行分析。X射線源係在30 kV和15 mA下操作的Cu正常聚焦（Normal Focus）管。在下表中提供了另外的操作參數。

X射線	30 kV，15 mA	掃描速度/持續時間	0.2000度/分鐘
測角儀		步寬	0.0100度
附件	-	掃描軸	2 θ / θ
濾波器		掃描範圍	3.0000 - 40.0000度

CBO選擇狹縫	-	入射狹縫	1.25度
繞射光束單色儀	固定單色儀	限長狹縫	-
檢測器	MiniFlex2計數器	接收狹縫 #1	1.25度
掃描模式	連續	接收狹縫 #2	0.3 mm

【0244】 藉由向玻璃樣品支架中添加至少20 mg並使用輕微手動壓力保持樣品表面平坦且與樣品支架的參考表面齊平來製備粉末樣品。將玻璃支架放置在鋁支撐件的頂部。使用5 °2 θ /分鐘的連續掃描以0.02 °2 θ 的有效步長從3 °2 θ 至40 °2 θ 對每個樣品進行分析。使用0.2 °2 θ /分鐘的連續掃描和0.01 °2 θ 的有效步長分析高解析度樣品。

【0245】 實例9

【0246】 化合物1的結晶多晶型形式A和B的替代的粉末X射線繞射（PXRD）。

【0247】 樣品係使用被配置成使用線源X射線束用於反射布拉格布倫塔諾（BraggBrentano）幾何體的Rigaku Smart-Lab X射線繞射系統分析的。x射線源係在40 kV和44 ma下操作的Cu長細聚焦（Long Fine Focus）管。該源在樣品處提供從高角度的窄線變為低角度的寬矩形的入射光束輪廓。線上X射線源上使用光束調節狹縫，以確保沿線和垂直於線的最大光束大小小於10 mm。布拉格-布倫塔諾幾何體係由被動發散和接收狹縫控制的伸聚焦幾何體，其中樣品本身作為光學元件的聚焦部件。布拉格-布倫塔諾幾何體的固有分辨率部分上取決於繞射儀半徑和所用接收狹縫的寬度。典型地，操作Rigaku Smart-Lab以得到0.1 °2 θ 或更小的峰值寬度。X射線束的軸向發散由入射和繞射光束路徑中的5.0度索勒（Soller）狹縫控制。在低背景Si支架中使用輕微手動壓力保持樣品表面平坦且

與樣品支架的參考表面齊平來製備粉末樣品。使用 $6^\circ 2\theta$ /分鐘的連續掃描以 $0.02^\circ 2\theta$ 的有效步長從 $2^\circ 2\theta$ 至 $40^\circ 2\theta$ 對每個樣品進行分析。

【0248】 實例10：化合物1的多晶型形式A和B的差示掃描量熱法（DSC）。

【0249】 使用TA Instruments Q2500 DSC進行DSC分析。在運行樣品之前，完成鋼校準和驗證。將約3-5 mg多晶型形式A和B樣品在空氣中裝入氣密密封的鋁盤中。將樣品在TA Q2500 DSC中以 $10^\circ\text{C}/\text{分鐘}$ 的速率從 0°C 加熱至 120°C 。使用TRIOS軟體分析所得的熱譜圖，以計算熔點和熔化熱。結果在圖4（多晶型形式A）和圖5（多晶型形式B）中示出。

【0250】 實例11：化合物1的多晶型形式A和B的低頻拉曼光譜。

【0251】 拉曼光譜係使用配備有785 nm Invictus雷射器（15 mW）的Kaiser RXN2光譜儀獲得的。光譜係使用具有Kaiser宇宙射線抑制的准直光束探頭和每個光譜4分鐘的採集時間收集的。結果在圖6（多晶型形式A）和圖7（多晶型形式B）中示出。

【0252】 實例12：多晶型A和多晶型B材料的空氣研磨

【0253】 化合物1多晶型A和化合物1多晶型B樣品分別用噴磨機進行空氣研磨直到粒度 $d(0.5) < 6\ \mu\text{m}$ 且 $d(0.9) < 15\ \mu\text{m}$ 。粉末X射線繞射（PXRD）係在空氣研磨過程之前和之後對樣品進行的。PXRD數據表明，樣品的多晶型形式藉由研磨過程沒有改變。研磨後，PXRD數據顯示，研磨後的化合物1多晶型A與本文所述之化合物1多晶型A的PXRD數據一致。研磨後，PXRD數據顯示，研磨後的化合物1多晶型B與本文所述之化合物1多晶型B的PXRD數據一致。

【0254】 實例13：在頭對頭的成蟲甘薯粉虱煙粉虱敲低研究中，結晶化合物1多晶型A和化合物1多晶型B與非結晶化合物1（無定形油）的比較

【0255】 在此研究中，評價了化合物1對成蟲甘薯粉虱、煙粉虱的行為的影響。一般來說，將不同形式的化合物1（本發明之多晶型形式A、本發明之多晶型形式B、或非結晶化合物1無定形油）施加到玻璃小瓶的內部並將成蟲煙粉虱轉移到經處理的小瓶中，藉由與經處理的玻璃表面接觸使它們暴露於化合物1。為了量化先前報告的敲低效果（Lee等人2013），在經處理的小瓶底部以上2 cm處劃了一條線並在初始暴露後的前三個小時記錄2 cm線以上的煙粉虱的數量。雖然被敲低的粉虱沒有立即被殺死，但在田間模擬試驗和經處理的植物上的田間試驗中，此效果已被證明藉由饑餓和脫水導致死亡。

【0256】 此研究使用常見的經處理的玻璃小瓶生物測定藉由直接接觸暴露測試昆蟲（Busvine 1971），表徵了化合物1多晶型A和化合物1多晶型B對成蟲煙粉虱粉虱行為的影響，並在與非結晶化合物1的直接頭對頭比較中比較了該等影響。將測試化合物溶於丙酮中（實例11A）或懸浮於揮發性反溶劑（己烷）中（實例11B），並且然後使用實驗室輥均勻地塗在玻璃小瓶的內部。

【0257】 實例13A：丙酮實驗

【0258】 在此實驗中，評價了化合物1的兩種形式（多晶型形式B和無定形油）對煙粉虱行為的影響。對於每種形式的化合物1評價了三種施用比率（25 g/ha、2.5 g/ha和0.25 g/ha），此外還有溶劑空白對照。每個處理和對照都重複了三次。化合物1樣品溶於丙酮中並塗在11打蘭螺旋蓋玻璃小瓶（Fisherbrand 03-339-21N）（新罕布什爾州漢普頓飛世爾科技公司（Fisher Scientific, Hampton, NH））內部。每個小瓶的內部尺寸為2.5 × 9 cm，導致處理面積為75.6 cm²。為了處理小瓶，首先藉由將1 mg的化合物1樣品（多晶型形式B或無定形油）溶於2 ml的丙酮中來製備每個樣品的儲備溶液。使用實驗室渦旋混合器攪拌儲備溶液以確保溶液完全

混合。將151 μL 的每種儲備溶液添加到11.85 mL的丙酮中以產生25 g/ha比率的處理溶液（導致0.25 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ）。將25 g/ha的處理溶液連續稀釋十倍，兩次以產生2.5和0.25 g/ha比率的處理溶液。將3 mL的每種處理溶液轉移到11打蘭小瓶中並將小瓶置於實驗室試管輓上並在室溫下旋轉直到丙酮完全蒸發，在小瓶的內部留下化合物1的塗層。用3 mL的丙酮處理溶劑空白小瓶。處理後，小瓶在室溫下在通風櫥中敞開過夜，為第二天的測試做準備。從Corteva Agriscience公司（印第安那州印第安納波里斯（Indianapolis, IN））維護的易感菌群中收集混合性別成蟲煙粉虱粉虱（中東小亞細亞1（MEAM1）生物型）。用 CO_2 麻醉成蟲煙粉虱並將大約66.5，32-102（平均值，最小值-最大值）引入每個經處理的小瓶中，並記錄其行為。為了評價煙粉虱行為，在小瓶底部以上2 cm處劃了一條線，並在引入後的15、30、45、60、90、120、150和180 min記錄線以上的個體數量。實驗結束後，昆蟲藉由在 -30°C 下冷凍72 h失去生命，之後記錄每個小瓶中昆蟲的總數。計算每個比率的2 cm線以上的煙粉虱的百分比並用於繪製隨時間的推移化合物1對粉虱的影響的圖。

【0259】統計分析

【0260】對於每個試驗和比率，使用用於具有二項式響應和logit連接函數的重複測量的廣義線性混合模型（GLMM）分析2 cm線以上的昆蟲的比例（Stroup, 2012）。使用具有響應的二項式分佈的廣義線性模型，而不是具有正態分佈的線性模型（ANOVA），允許正確使用實驗中使用的分佈假設和實際樣本量（昆蟲的數量）。

【0261】 該模型包括作為固定效應的處理、時間點和交互作用處理 $\times$ 時間點以及作為隨機效應的重複（實驗單元）。重複測量之間的相關性用複合對稱協方差矩陣進行建模。

【0262】 廣義線性混合模型用殘差偽似然法估計，並用圖基（Tukey）檢驗（ $\alpha = 0.05$ ）比較處理比例的平均值（Stroup 2012）。統計分析用 SAS Proc GLIMMIX（SAS軟體，9.4版，北卡羅來納州卡裡SAS研究所公司（SAS Institute Inc., Cary, NC））進行。

【0263】 結果

【0264】 在溶劑空白對照中，在任何給定時間在2 cm線以上都有大約20%-30%的昆蟲（ $34.1\% \pm 2.18$ ，平均值 $\pm$ SEM）（圖8）。在25 g/ha的最高比率下，隨時間的推移化合物1暴露有明顯的影響，由隨時間的推移2 cm線以上的昆蟲數量減少證明，因為暴露於化合物1開始對它們的行為產生負面影響（圖9，表5）。然而，處理沒有明顯的影響並且處理與時間點之間沒有交互作用，表明在25 g/ha比率下多晶型B和無定形油的影響沒有差異（表5）。在2.5 g/ha的中間比率下，多晶型B與無定形油的影響之間有顯著差異，其中2 cm線以上的暴露於多晶型B的昆蟲更少，因為它們的行為比在此比率下暴露於無定形油的昆蟲受到的影響更大（圖10，表6）。在2.5 g/ha比率下，時間或處理與時間之間的交互作用沒有影響（表6）。最後，在0.25 g/ha的最低比率下，任何模型效應都沒有明顯的影響，表明在此比率下多晶型B和無定形油的影響沒有差異（表7）。

[表5]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	4.127	1.06	0.359
時間點	7	30.11	18.57	<.0001
處理 x 時間點	7	30.11	1.55	0.1883
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.167	0.042	a	
多晶型B	0.115	0.030	a	

[表6]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	4.278	17.31	0.0123
時間點	7	26.5	0.65	0.7085
處理 x 時間點	7	26.5	0.52	0.81
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.326	0.035	a	
多晶型B	0.156	0.022	b	

[表7]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	3.976	4.36	0.1054
時間點	7	25.51	0.53	0.8014
處理 x 時間點	7	25.51	0.28	0.9554
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.295	0.062	a	
多晶型B	0.502	0.074	a	

【0265】 實例13B：己烷實驗

【0266】 在此實驗中，評價了化合物1的三種形式（多晶型形式A、多晶型形式B和非結晶無定形油）對煙粉虱行為的影響，多晶型形式A、多晶型形式B和無定形油。多晶型形式A和多晶型形式B的樣品如實例12所述進行了精細研磨。己烷實驗的實驗設計，包括比率（25、2.5和0.25 g/ha）、重複（每個處理三次重複）和處理懸浮液的製備與實例13A所述之過程相似。然而，使用己烷代替丙酮。因為化合物1不容易溶於己烷，將其用作反溶劑來懸浮化合物1的每種多晶型形式的顆粒和非結晶的無定形油化合物1，以施加到玻璃小瓶的內表面，同時保留多晶型結構。因為化合物1不容易溶於己烷，為了使顆粒盡可能一致地分佈在每個小瓶中，使用實驗室渦旋混合器將儲備懸浮液混合30秒，然後在超音波波浴（Branson 2800，康涅狄格州丹伯里必能信超音波公司(Branson Ultrasonics Corp., Danbury, CT)）中攪拌5分鐘。超音波處理後，在將151 μ l的每種儲備懸浮液轉移到11.85 mL的己烷中以產生25 g/ha比率的處理懸浮液(導致0.25 μ g/cm²)之前，

立即再次使用渦旋混合器混合樣品。將25 g/ha的處理懸浮液連續稀釋十倍，兩次以產生2.5和0.25 g/ha比率的處理懸浮液。將3 mL的每種處理懸浮液轉移到11打蘭小瓶中並將小瓶置於實驗室試管輓上並在室溫下旋轉直到己烷完全蒸發，在小瓶的內部留下化合物1顆粒的均勻塗層。用3 mL的己烷處理溶劑空白小瓶。處理後，將小瓶儲存，用大約117.4，47-219（平均值，最小值-最大值）的成蟲煙粉虱侵染，並如丙酮實驗中所述進行評價。

【0267】 統計分析

【0268】 對於每個試驗和比率，使用用於具有二項式響應和logit連接函數的重複測量的廣義線性混合模型（GLMM）分析2 cm線以上的昆蟲的比例（Stroup，2012）。使用具有響應的二項式分佈的廣義線性模型，而不是具有正態分佈的線性模型（ANOVA），允許正確使用實驗中使用的分佈假設和實際樣本量（昆蟲的數量）。

【0269】 該模型包括作為固定效應的處理、時間點和交互作用處理 $\times$ 時間點以及作為隨機效應的重複（實驗單元）。重複測量之間的相關性用複合對稱協方差矩陣進行建模。

【0270】 廣義線性混合模型用殘差偽似然法估計，並用圖基（Tukey）檢驗（ $\alpha = 0.05$ ）比較處理比例的平均值（Stroup 2012）。統計分析用SAS Proc GLIMMIX（SAS軟體，9.4版，北卡羅來納州卡裡SAS研究所公司（SAS Institute Inc., Cary, NC））進行。

【0271】 結果

【0272】 在溶劑空白對照中，在任何給定時間在2 cm線以上都有大約30%-50%的昆蟲（ $42.1\% \pm 3.31$ ，平均值 $\pm$ SEM）（圖11）。與丙酮實驗類似，在最

高比率（25 g/ha）下，對於多晶型形式和無定形油而言隨時間的推移的化合物1暴露都有明顯的影響，由隨時間的推移2 cm線以上的昆蟲數量減少證明，因為殺昆蟲劑開始對它們的行為產生負面影響（圖12，表8）。然而，處理沒有明顯的影響，表明在此比率下多晶型A、B和無定形油的影響沒有差異（表8）。在2.5 g/ha的中間比率下，處理有明顯的影響，其中在與無定形油直接比較時，暴露於多晶型形式A或多晶型形式B的粉虱受到明顯影響（圖13，表9）。此外，在2.5 g/ha比率下，隨時間的推移化合物1暴露有明顯的影響，這在多晶型形式A和多晶型形式B處理中都非常明顯（圖13，表9）。最後，在2.5 g/ha比率下，處理和時間有明顯的交互作用，表明在每個處理中昆蟲如何隨時間的推移響應係有差異的，如隨時間的推移與無定形油相比多晶型形式A與多晶型形式B處理之間的響應曲線的不同形狀證明的（圖13，表9）。在最低比率（0.25 g/ha）下，得到了與在2.5 g/ha比率下觀察到的結果相似的結果。在0.25 g/ha下，處理、時間、以及處理和時間的交互作用都有明顯的影響（圖14，表10）。與2.5 g/ha比率類似，在0.25 g/ha比率下暴露於多晶型形式A和多晶型形式B處理的昆蟲比在0.25 g/ha比率下暴露於無定形油的昆蟲受到的負面影響更大（圖14，表10）。

[表8]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	5.737	1.32	0.3366
時間點	7	62	40.81	<.0001
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.029	0.011	a	
多晶型B	0.013	0.005	a	
多晶型A	0.015	0.006	a	

*交互作用處理 x 時間點，沒有明顯的影響，從模型中刪除以達到收斂。

[表9]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	6.859	1.32	0.3366
時間點	7	48	50.19	<.0001
處理 x 時間點	14	48	13.84	<.0001
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.453	0.053	a	
多晶型B	0.079	0.017	b	
多晶型A	0.080	0.017	b	

[表10]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	5.764	23.38	0.0017
時間點	7	40.95	10.47	<.0001
處理 x 時間點	14	40.42	4.1	0.0002
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.601	0.030	a	
多晶型B	0.345	0.028	b	
多晶型A	0.342	0.028	b	

【符號說明】

【0273】 無

【發明申請專利範圍】

【請求項1】 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶形式。

【請求項2】 如請求項1所述之結晶形式，其中，該結晶形式係*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式。

【請求項3】 如請求項1或2所述之結晶多晶型物，其中，該結晶形式係無水或無溶劑的。

【請求項4】 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式A，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項5】 如請求項4所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項6】 如請求項4或5所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項7】 如請求項4至6中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項8】 如請求項4至7中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項9】 如請求項4至8中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項10】 如請求項4至9中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項11】 如請求項4至10中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項12】 如請求項4至11中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項13】 如請求項4至12中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【請求項14】 如請求項4至13中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖1或圖2所示基本相同的一個或多個峰。

【請求項15】 如請求項4至14中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約101.09°C的峰值溫度的吸熱峰。

【請求項16】 如請求項4至15中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖4基本相同的DSC熱譜圖。

【請求項17】 如請求項4至16中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約255 cm^{-1} 、約441 cm^{-1} 、約539 cm^{-1} 、約778 cm^{-1} 、約921 cm^{-1} 、約991 cm^{-1} 、約1048 cm^{-1} 、約1123 cm^{-1} 、約1191 cm^{-1} 、約1526 cm^{-1} 、約1569 cm^{-1} 、約1588 cm^{-1} 、約1701 cm^{-1} 、約2949 cm^{-1} 和約3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【請求項18】 如請求項4至17中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖6所示基本相同的波數處的峰。

【請求項19】 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式B，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 15.4 ± 0.2 處的峰。

【請求項20】 如請求項19所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。

【請求項21】 如請求項19或20所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項22】 如請求項19至21中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項23】 如請求項19至22中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項24】 如請求項19至23中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項25】 如請求項19至24中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項26】 如請求項19至25中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項27】 如請求項19至26中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項28】 如請求項19至27中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【請求項29】 如請求項19至28中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖3所示基本相同的一個或多個峰。

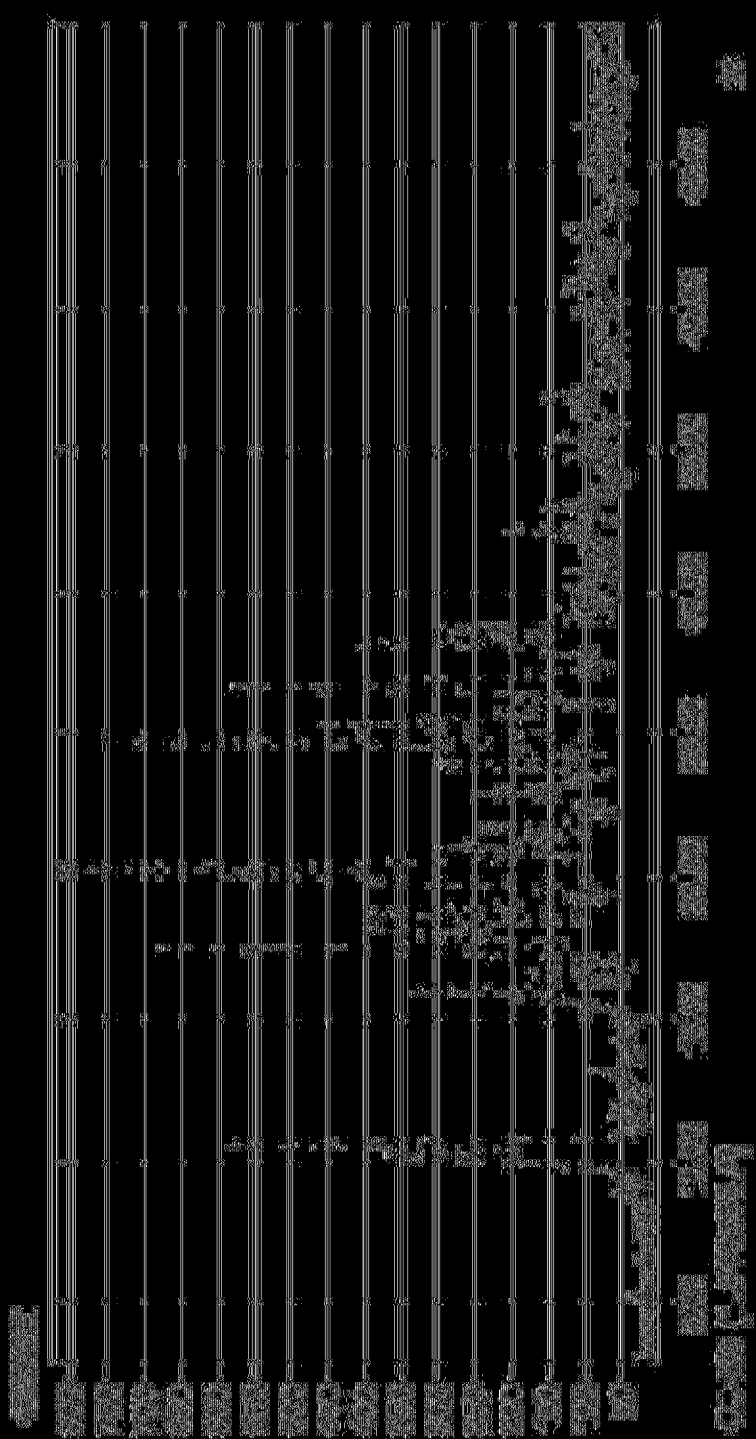
【請求項30】 如請求項19至29中任一項所述之結晶多晶型形式，其中，該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約 105.24°C 的峰值溫度的吸熱峰。

【請求項31】 如請求項19至30中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖5基本相同的DSC熱譜圖。

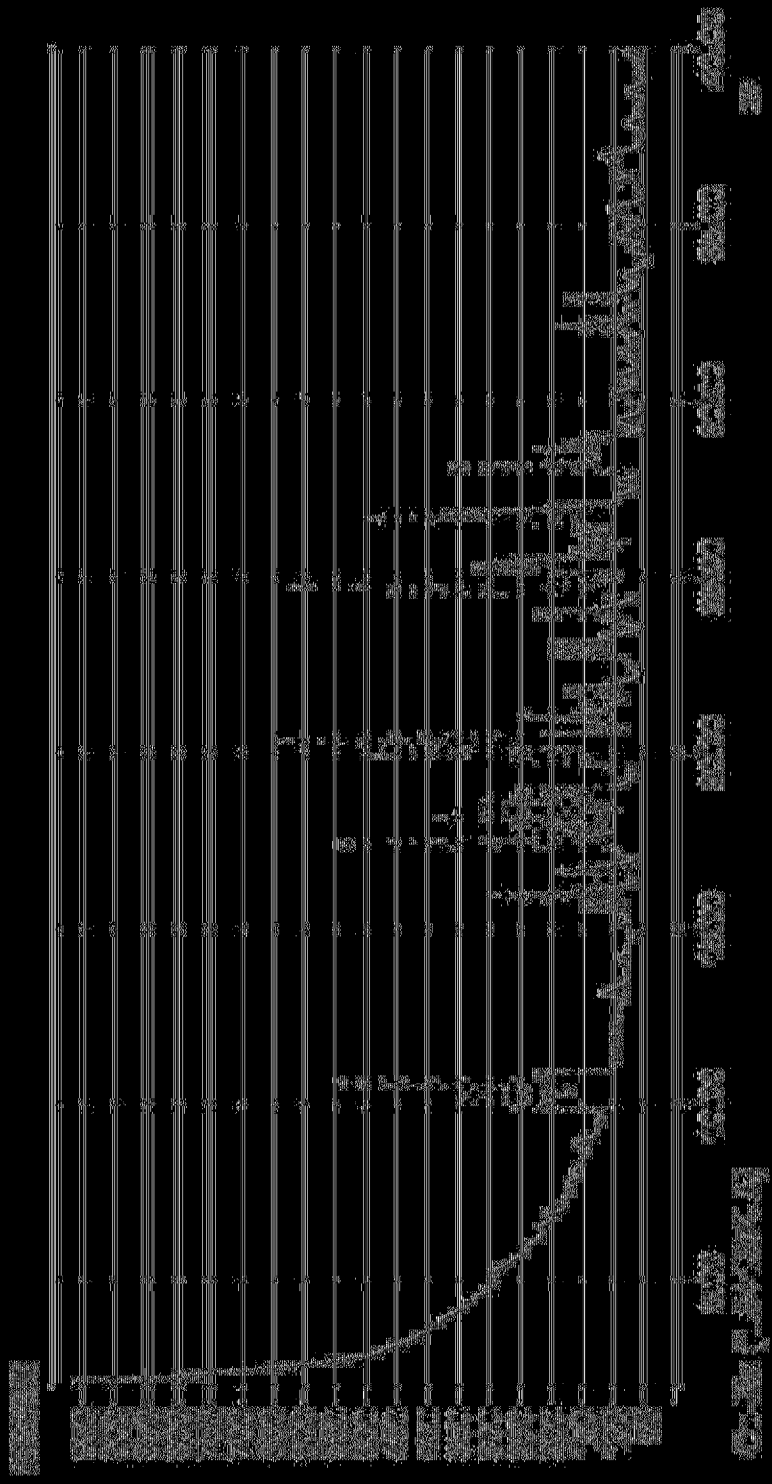
【請求項32】 如請求項19至31中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約 266 cm^{-1} 、約 446 cm^{-1} 、約 546 cm^{-1} 、約 763 cm^{-1} 、約 987 cm^{-1} 、約 1044 cm^{-1} 、約 1137 cm^{-1} 、約 1187 cm^{-1} 和約 1308 cm^{-1} 、約 1518 cm^{-1} 、約 1573 cm^{-1} 、約 1592 cm^{-1} 、約 1673 cm^{-1} 、約 2919 cm^{-1} 、和約 2937 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【請求項33】 如請求項19至32中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖7所示基本相同的波數處的峰。

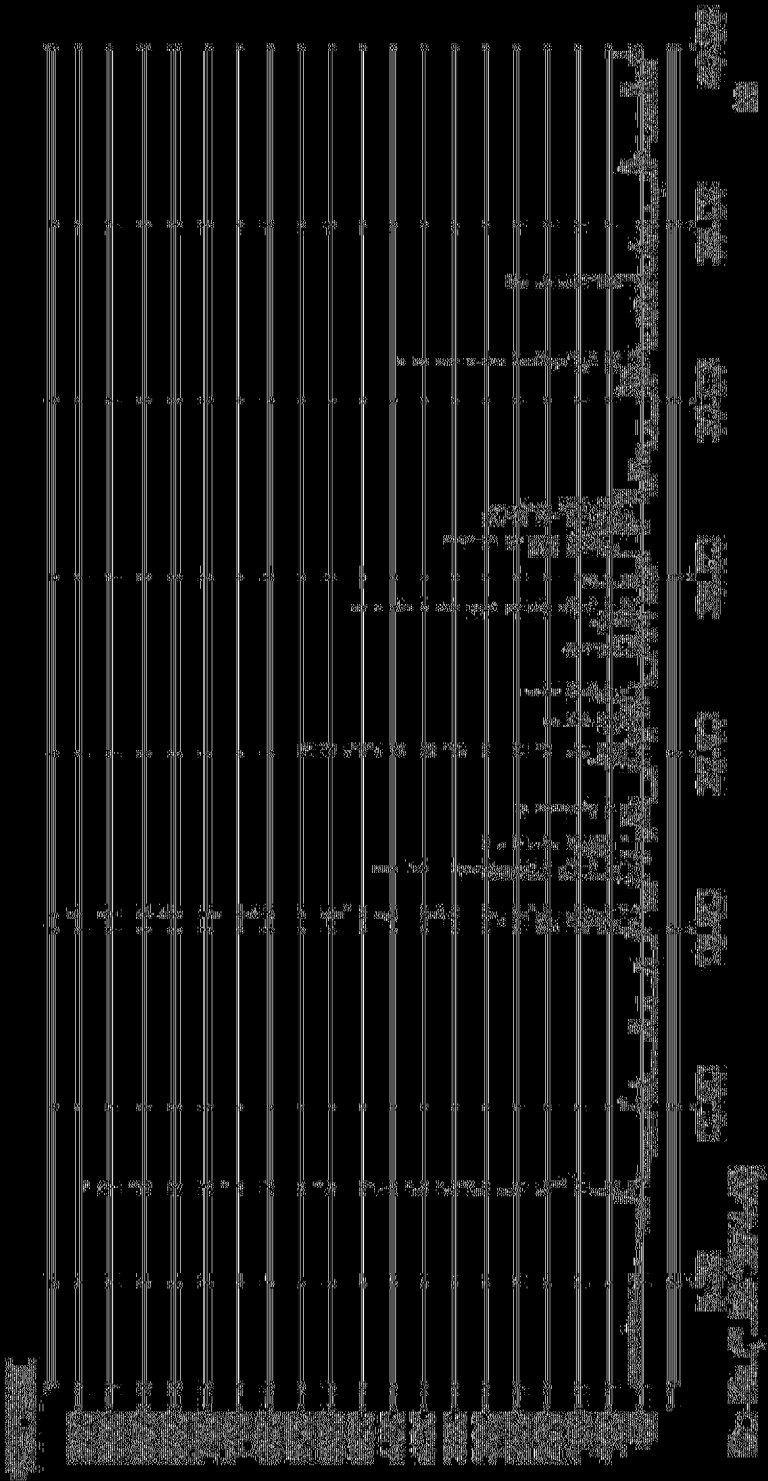
〔發明圖式〕



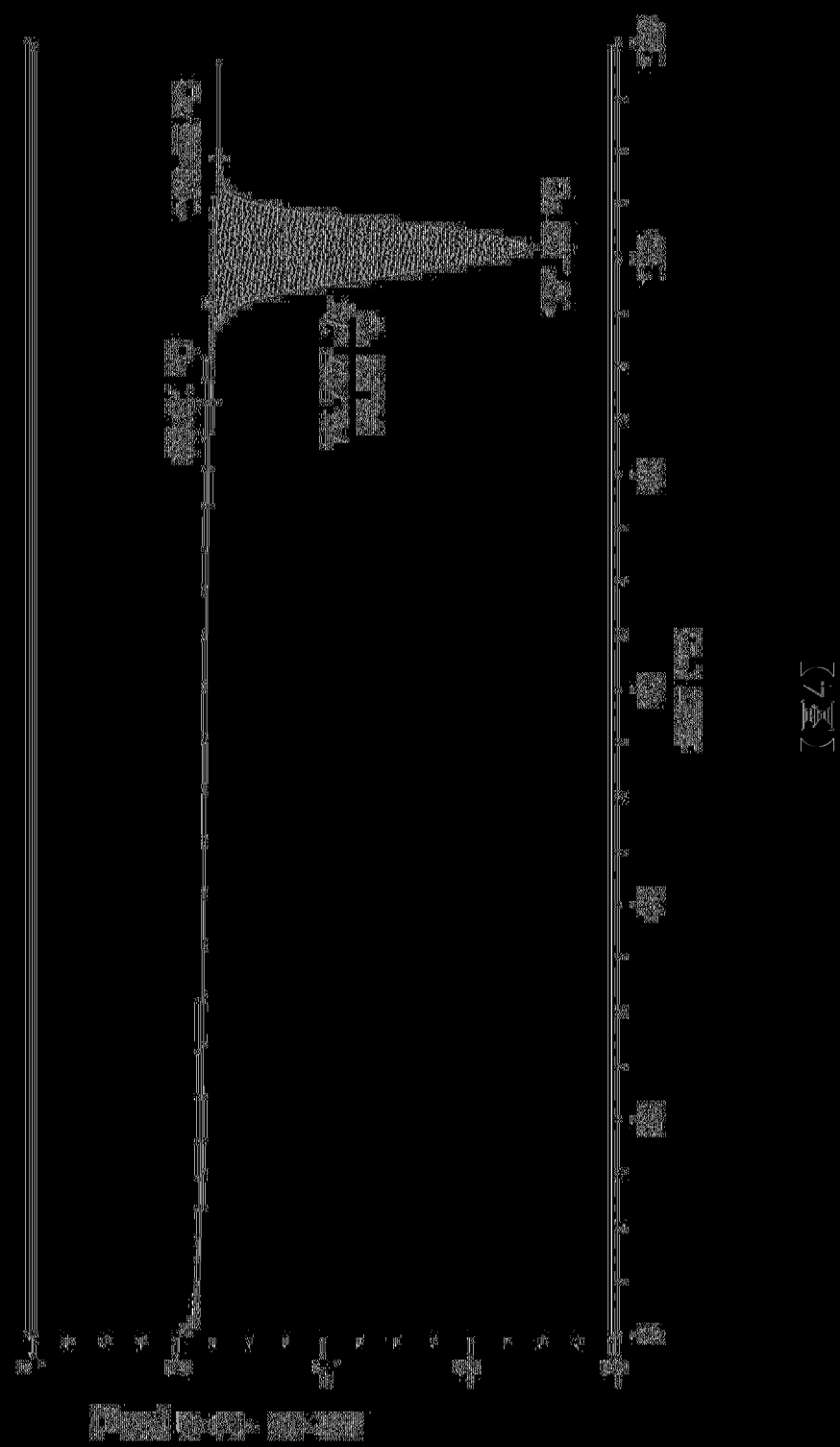
〔圖〕

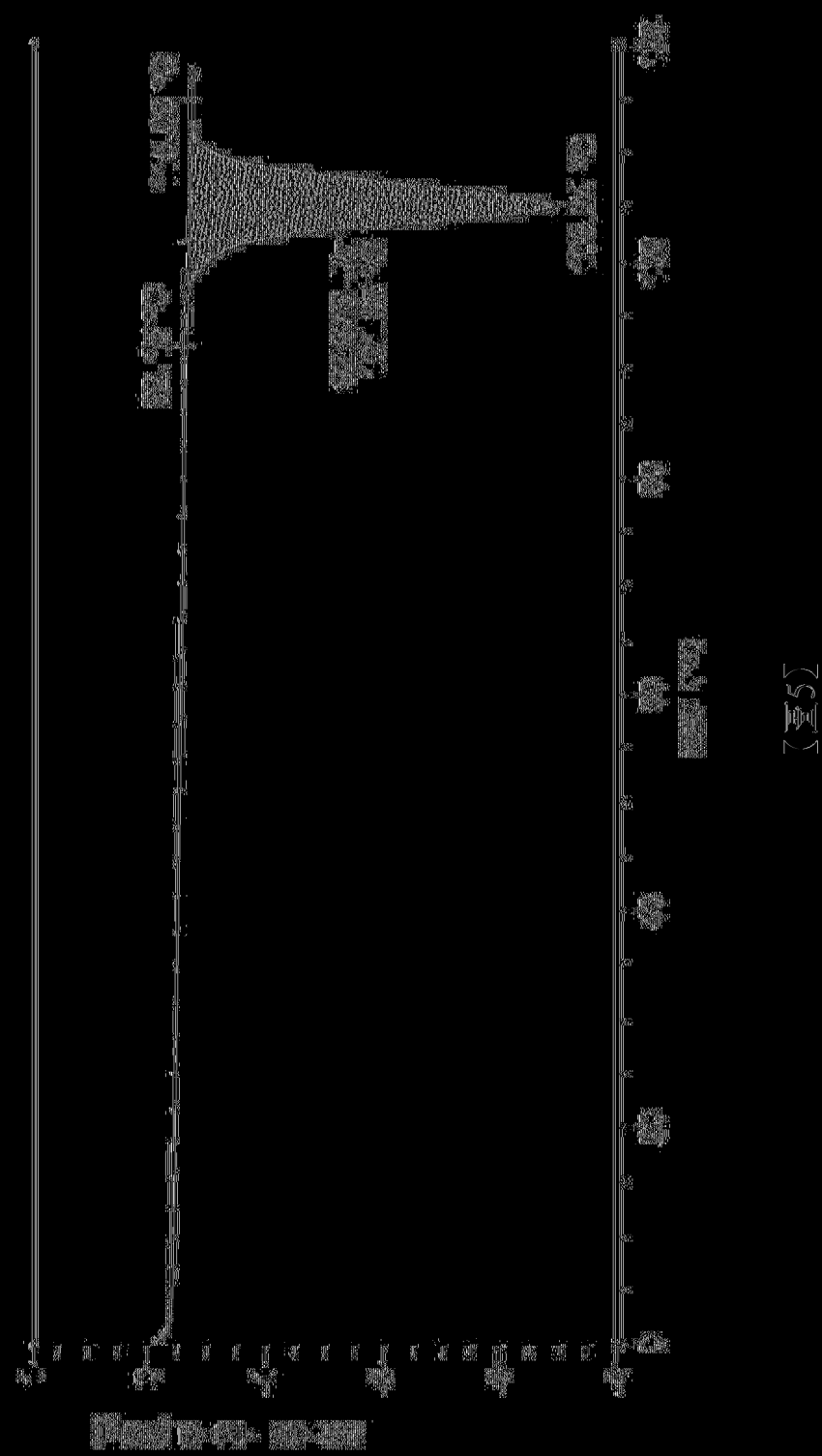


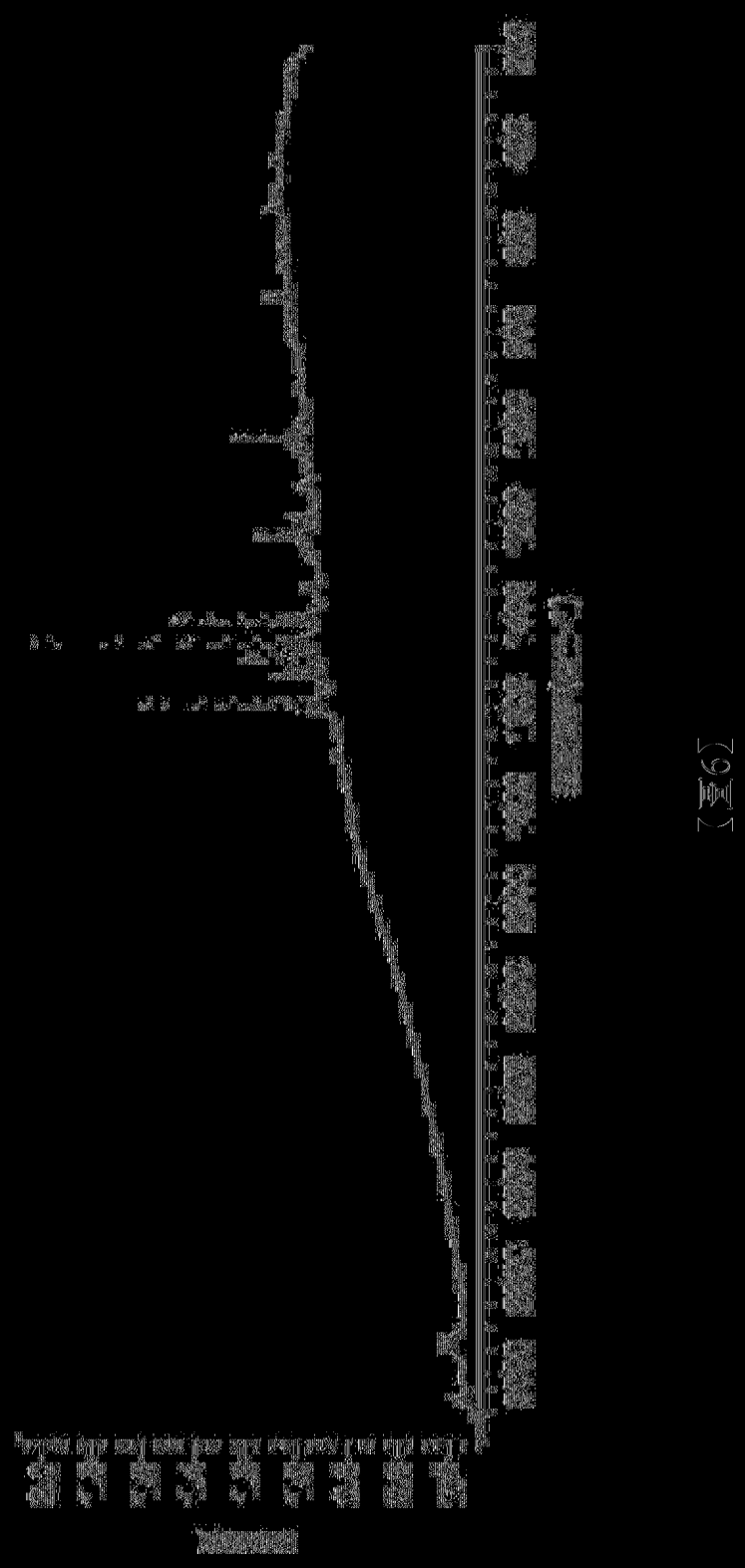
[圖2]

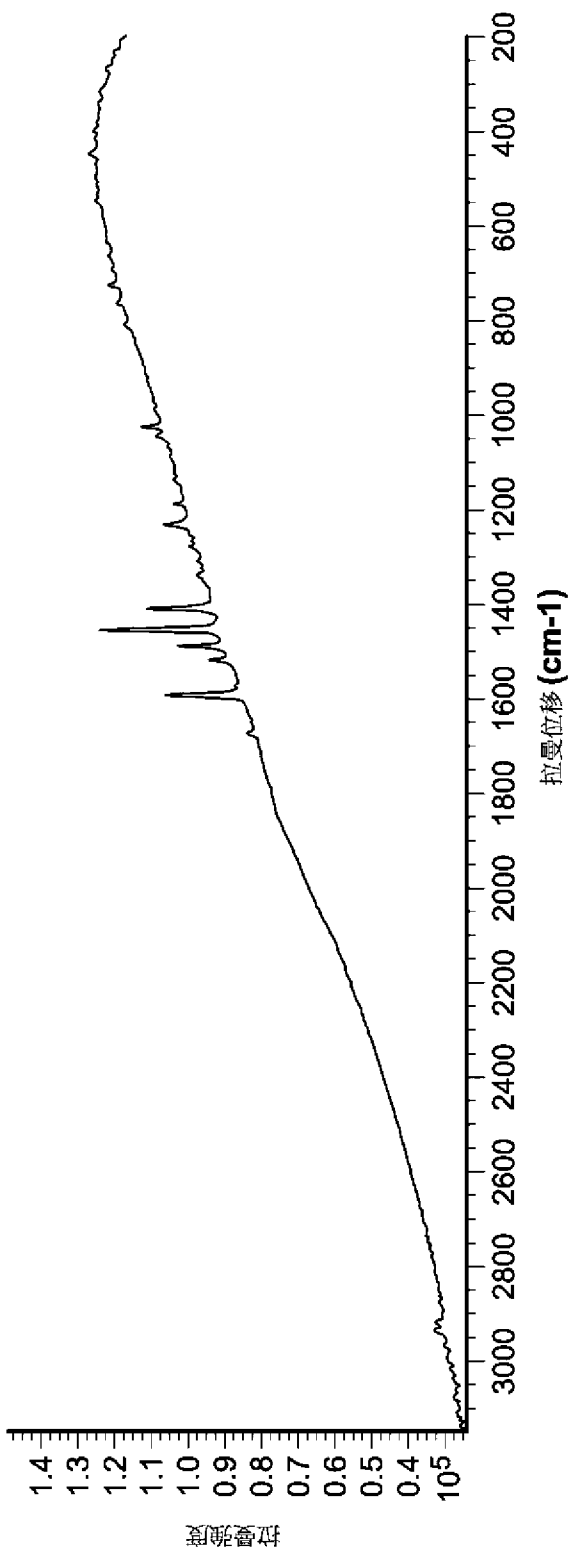


[圖3]

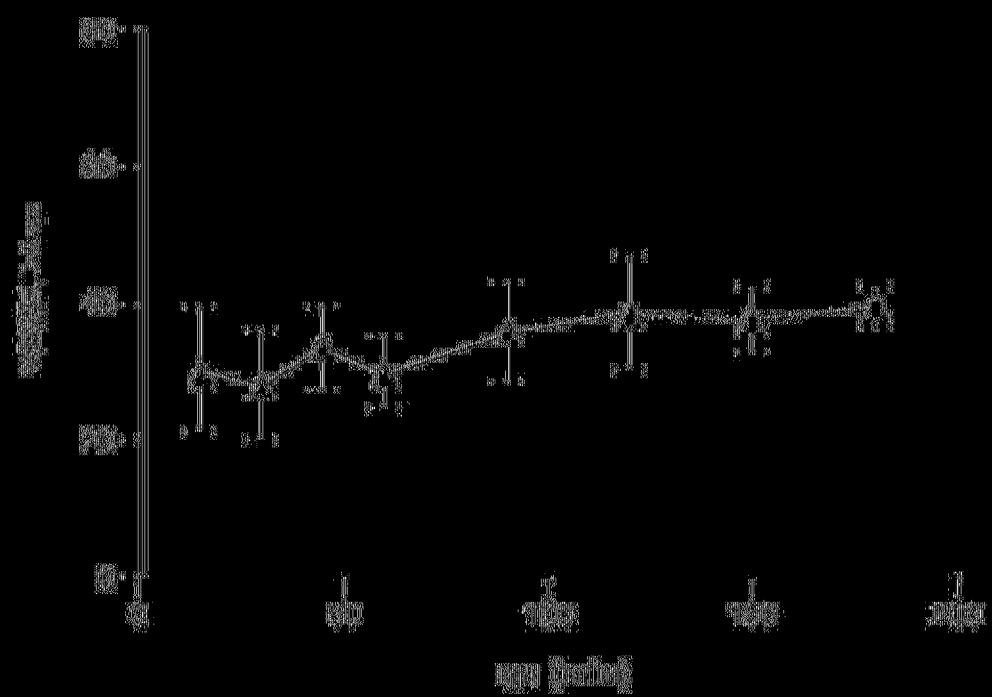




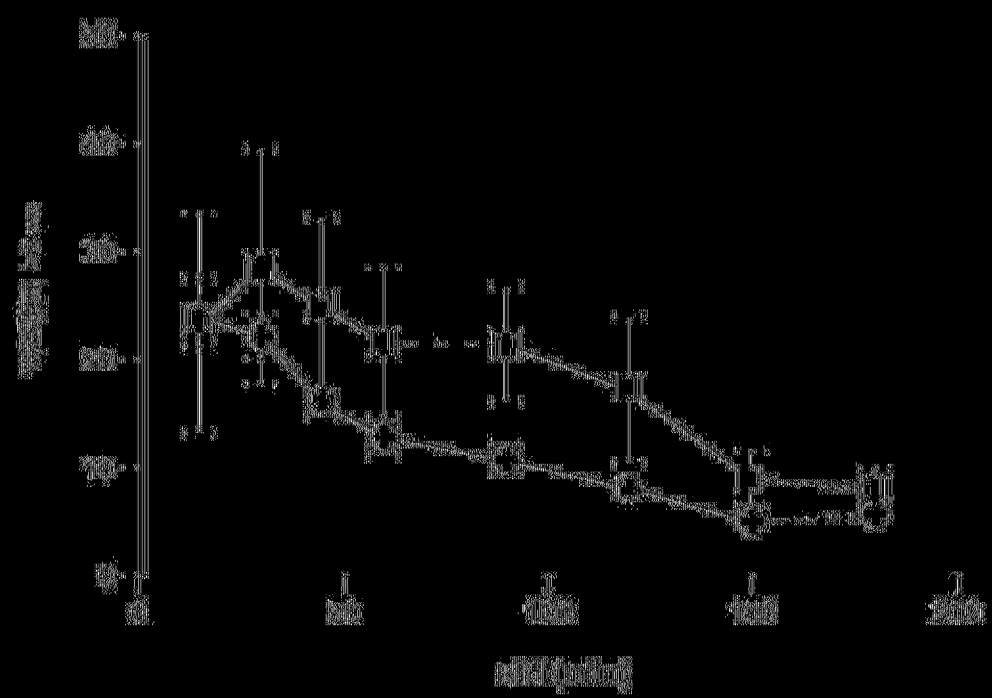




【圖7】



[(同8)]



[(同9)]

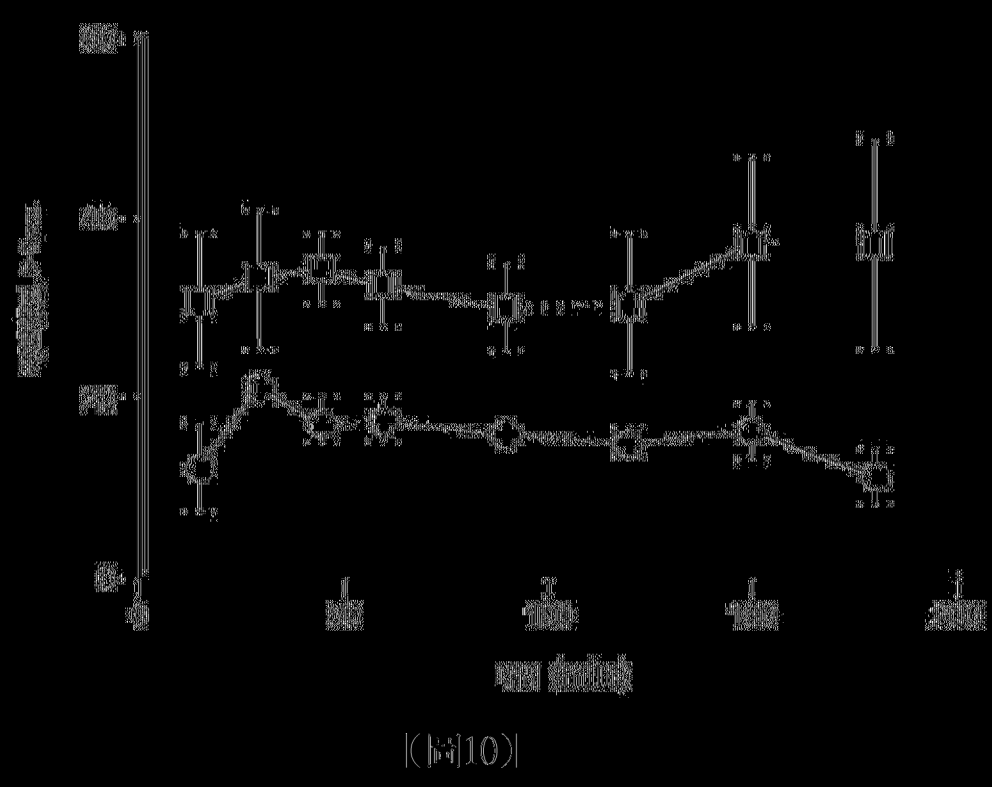


Figure 10

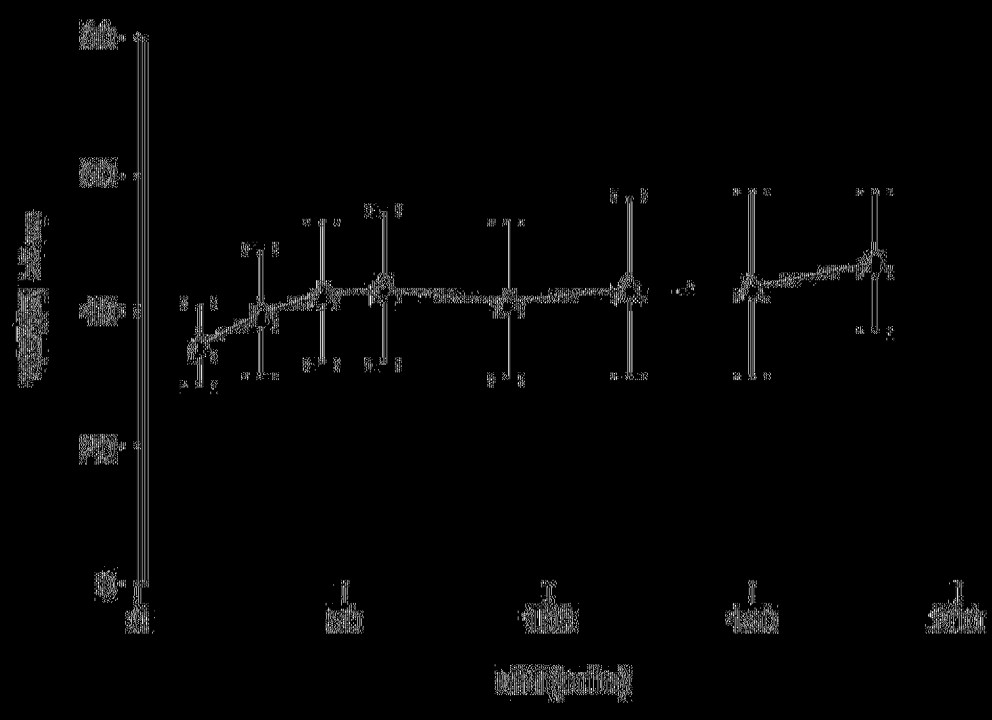
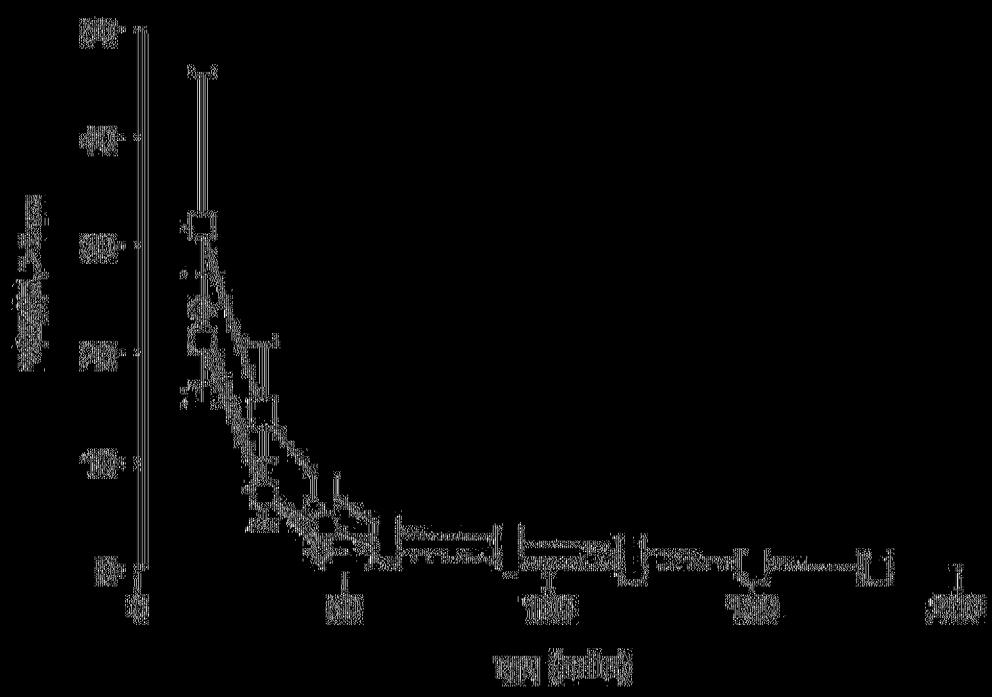
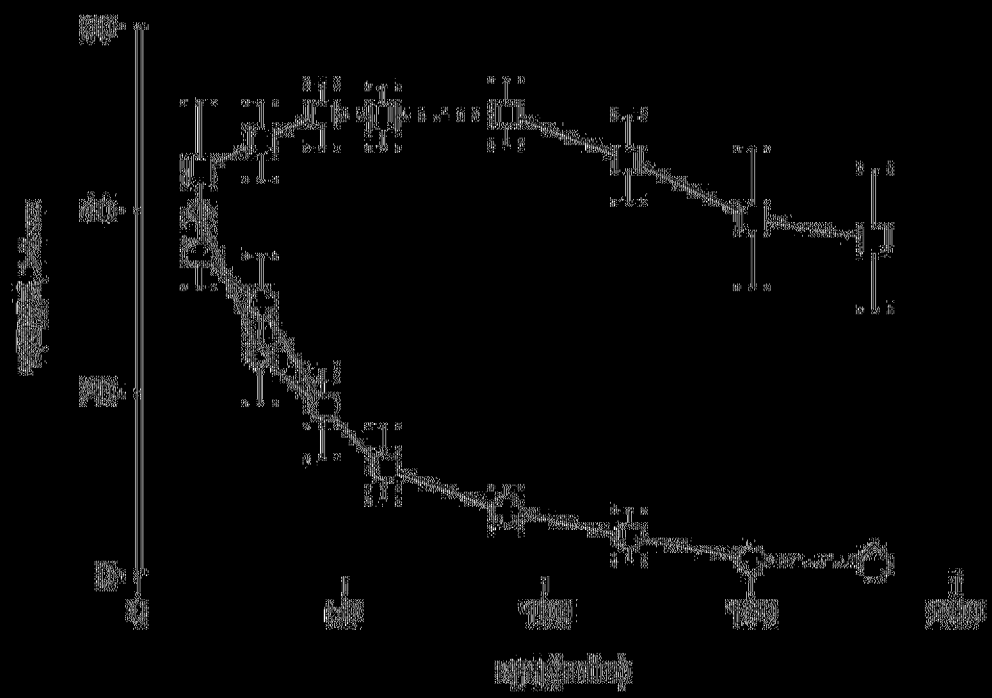


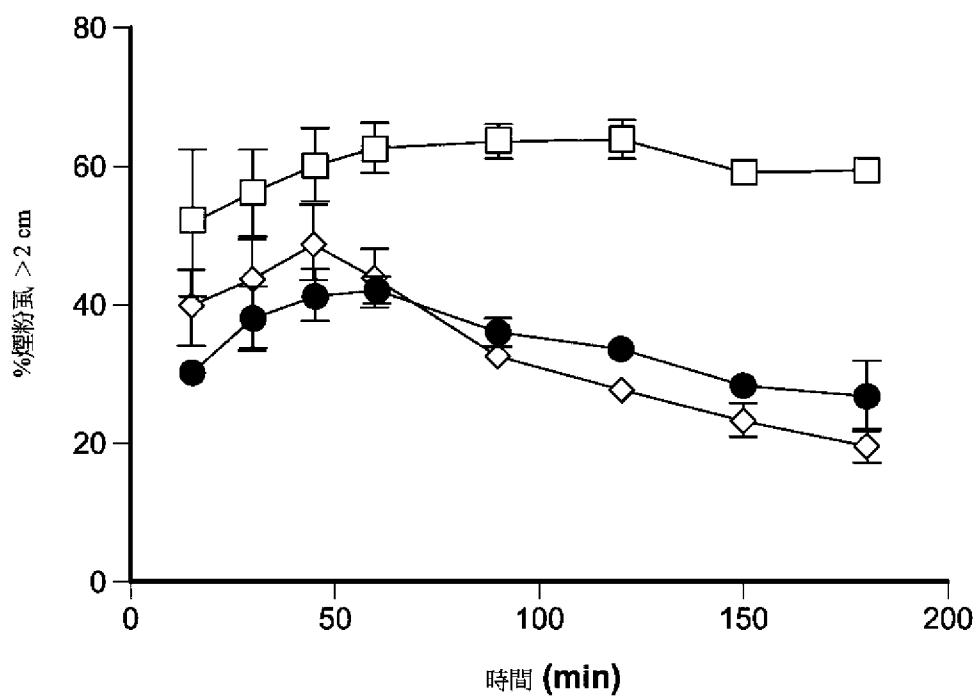
Figure 11



[(図]12)]



[(図]13)]



【圖14】

【發明說明書】

【中文發明名稱】 具有殺有害生物活性之多晶型物

【英文發明名稱】 POLYMORPHS HAVING PESTICIDAL ACTIVITY

【技術領域】

相關申請的交叉引用

【0001】 本申請根據35 U.S.C. § 119(e)要求2021年8月3日提交的美國臨時申請案序號63/228,910和2022年7月15日提交的美國臨時申請案序號63/368,548的優先權，該等申請之全部揭露內容藉由援引併入本文。

【0002】 本揭露關於*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式，其可用於防治半翅目、縷翅目、鱗翅目等之有害生物；生產此類多晶型形式之方法；在此類方法中使用的中間體；含有此類多晶型形式的殺有害生物組成物；以及使用此類殺有害生物組成物對抗此類有害生物之方法。

【先前技術】

【0003】 「許多最危險的人類疾病皆為藉由昆蟲介體傳播」(Rivero等人)。「在歷史上，瘧疾、登革熱、黃熱病、鼠疫、絲蟲病、虱傳斑疹傷寒、錐蟲病、利什曼病、和其他介體傳播的疾病在17世紀至20世紀初造成的人類疾病和死亡超過所有其他原因的總和」(Gubler)。介體傳播的疾病占全球寄生蟲和感染性疾病的約17%。僅瘧疾每年就造成超過800,000人死亡，其中85%發生於五歲以下的兒童。每年有約5千萬至約1億例登革熱病例。每年還發生250,000至500,000例

登革出血熱 (Matthews)。介體防治在感染性疾病的預防和防治中起著至關重要的作用。然而，在作為人類疾病的主要介體的所有昆蟲物種中都出現了對殺昆蟲劑的抗性，包括對多種殺昆蟲劑的抗性 (Rivero 等人)。最近，超過 550 種節肢動物物種已產生了對至少一種殺有害生物劑的抗性 (Whalon 等人)。此外，昆蟲抗性的案例到目前為止繼續在超過除草劑和殺真菌劑抗性的案例的數目 (Sparks 等人)。

【0004】 每年，昆蟲、植物病原體、和雜草破壞了所有食品生產中的多於 40%。儘管應用了殺有害生物劑並且使用了多種多樣的非化學防治措施 (諸如輪作) 和生物防治措施，這種損失仍然發生。如果可以僅挽救此食物中的一部分，則可以將其用來養活世界上多於三十億營養不良的人 (Pimental)。

【0005】 植物寄生線蟲係最普遍的有害生物之一，並且通常是最隱蔽且最昂貴的有害生物之一。據估計，可歸因於線蟲的損失為從發達國家的約 9% 至不發達國家的約 15%。然而，在美國對 35 個州關於各種作物的調查指示，由線蟲引起的損失高達 25% (Nicol 等人)。

【0006】 值得注意的是，腹足類 (蛞蝓和蝸牛) 係比其他節肢動物或線蟲經濟重要性低的有害生物，但在某些地方，它們可能大幅降低產率，嚴重影響收穫產品的品質，並且傳播人類、動物、和植物疾病。儘管僅幾十種腹足類物種係嚴重的區域性有害生物，而少數物種係在全球範圍上的重要有害生物。特別地，腹足類會影響多種多樣的農業和園藝作物，諸如可耕地、牧場 (pastoral)、和纖維作物；蔬菜；灌木和樹木果實；藥草；以及觀賞植物 (Speiser)。

【0007】白蟻對各種私人和公共建築都造成了損害。每年，全球範圍的白蟻損害損失量達數十億美元。2005年，據估計，白蟻每年在全球範圍內造成超過500億美元的損失（Korb）。

【0008】因此，出於許多原因（包括上述那些），對昂貴（2010年估計每種殺有害生物劑約2.56億美元）、耗時（每種殺有害生物劑平均約10年）並且困難地開發新殺有害生物劑的需求持續存在（美國植保協會（CropLife America））。

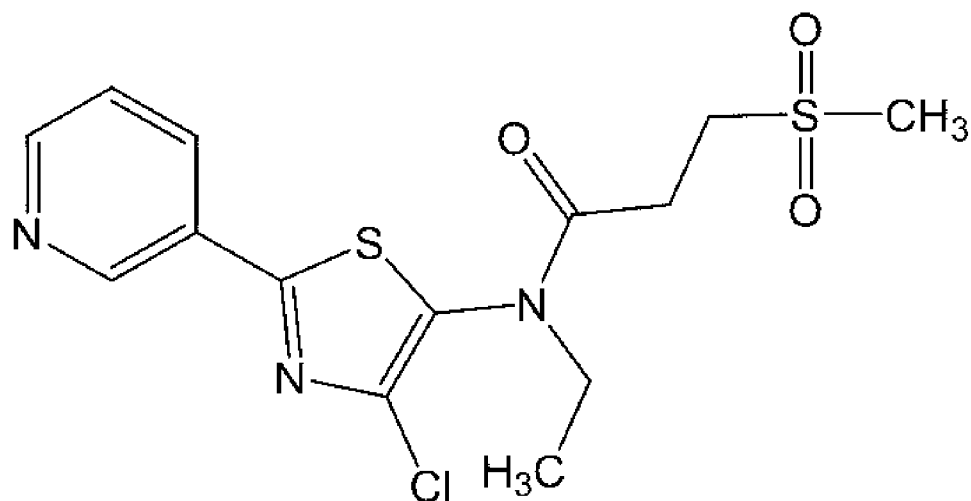
【0009】急需新的殺有害生物劑。某些有害生物不斷發展對當前使用的殺有害生物劑的抗性。數百種有害生物物種對於一種或多種殺有害生物劑存在抗性。對一些更老的殺有害生物劑，諸如DDT、胺基甲酸酯類、和有機磷酸酯類的抗性發展係眾所周知的。但是甚至對一些較新的殺有害生物劑也已經發展了抗性。

【0010】某些殺有害生物劑，諸如殺昆蟲劑，已被證明藉由干擾對目標有害生物的發育、繁殖或生存至關重要的生理過程來消滅昆蟲有害生物。該等生理干擾可以以各種方式發生，這導致了發現和開發藉由許多不同作用方式發揮作用的化合物。屬於殺昆蟲劑類別的殺有害生物劑具有各種作用方式，基於該等殺有害生物劑干擾的生理過程，該等作用方式可以大體上分為不同的組。示例性的作用方式包括神經和肌肉、生長和發育、呼吸、中腸靶標、以及具有未知或非特定作用的殺昆蟲劑（IRAC 2022）。儘管該等係廣義上的分類，但目標有害生物死亡的原因並不總是與殺昆蟲劑的特定作用方式一致（Matsumura 1985）。

【0011】一個實例係殺昆蟲劑影響弦音器官。此類殺昆蟲劑的實例係可商購的，並且包括諸如吡蚜酮、氟蟲吡啶（pyrifluquinazon）和氟啶蟲醯胺等化合物，以及最近引入市場的較新成員，諸如雙丙環蟲酯（afidopyropen）。雖然廣

義上被分類為目標係神經和肌肉組織，但弦音調節劑在目標有害生物物種中會誘發各種行為症狀，包括干擾協調和進食能力，最終導致因饑餓和脫水而死亡（Kandasamy等人2017，Morita等人2007，Maienfisch 2019，Wang等人2011，Zhou等人2021）。行為學研究已經研究了弦音調節劑的行為效果。例如，Lee和同事（Lee等人2013）評價了pyrifluquinazon對煙粉虱（*Bemisia tabaci*）和白粉虱（*Trialeurodes vaporariorum*）成蟲的影響並注意到快速敲低效果和強烈的中毒症狀，包括抽搐和麻痺。在黑腹果蠅（*Drosophila melanogaster*）中報告了類似的行為效果，其中暴露於弦音調節劑強烈抑制了處理過的蒼蠅的攀爬行為（Nesterov等人2015，Wang等人2019）。由於弦音調節劑殺昆蟲劑影響活動性和進食，因饑餓和脫水導致的死亡的發生比其他殺昆蟲劑諸如新菸鹼更慢（He等人2010，Maienfisch 2019）。然而，中毒症狀在暴露後不久可見並且可以診斷其作用（Lee等人2013，Morita等人2007）。因此，已經證明，弦音調節劑的行為效果，諸如敲低效果，係導致死亡率增加的變化並且可以作為死亡率的指標提供。

【0012】因此，由於包括上述原因在內的許多原因，對新殺有害生物劑存在著需求。一種這樣的化合物，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺，或其溶劑化物或水合物（本文中也被稱為「化合物1」，也被稱為*N*-(4-氯-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-基)-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺），其由式1表示



N-(4-氯-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-基)-*N*-乙基-3-(甲基磺酰基)丙酰胺

1

係表現出對抗多種有害生物的活性的有效小分子。研究了化合物1的殺昆蟲效用。與化合物1相關的化合物揭露於國際專利公佈案號WO 2010/139497 A1和美國專利號8,350,044中，該等專利以其全文藉由援引併入本文。

【0013】雖然化合物1已被用作殺有害生物劑，但具有以下多晶型形式係有利的，該等多晶型形式具有改進的特性，諸如改進的結晶度、溶解特性、降低的吸濕性和/或易於在商業上可行的組成物中配製以用於現場應用；同時保持化學穩定性特性。

本揭露中引用的某些參考文獻

【0014】 Busvine, J. R. (1971). Contact poisons in solid form: residual films of contact insecticides [呈固體形式的接觸性毒劑：接觸性殺昆蟲劑的殘留膜]. In *A Critical Review of the Techniques for Testing Insecticides* [在測試殺昆蟲劑的技術的批判性評論中] (第二版編輯, 第102-128頁). Commonwealth Agricultural Bureaux [聯邦農業局]。

【0015】 CropLife America [美國植保協會], The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future [新農用化學品發現、開發和註冊以及未來研究與開發預測的成本], 2010。

【0016】 Drewes, M., Tietjen, K., Sparks, T.C., High-Throughput Screening in Agrochemical Research, *Modern Methods in Crop Protection Research, Part I, Methods for the Design and Optimization of New Active Ingredients* [農業化學研究中的高通量篩選，作物保護研究中的現代方法，第I部分，用於設計和優化新活性成分之方法], 由Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., 和Matthias W.編輯, 第1-20頁, 2012。

【0017】 Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, *Emerging Infectious Diseases* [作為全球健康問題的複現的介體傳播的疾病，新出現的感染性疾病], 第4卷, 第3期, 第442-450頁, 1998。

【0018】 He, Y., Chen, L., Chen, J., Zhang, J., Chen, L., Shen, J., & Cheng Zhu, Y. (2011). Electrical penetration graph evidence that pymetrozine toxicity to the rice brown planthopper is by inhibition of phloem feeding [電穿透圖證明吡蚜酮對水稻褐飛虱的毒性係藉由抑制韌皮部攝食]. *Pest Management Science* [害蟲管理科學], 67(4), 483-491。

【0019】 IRAC Insecticide Resistance Action Committee [IRAC 殺蟲劑抗性行動委員會] (2022). IRAC Mode of Action Classification Scheme [IRAC 作用方式分類表], 版本 10.2. 39. 2022 年 3 月檢索, 從 <https://irac-online.org/mode-of-action/>

【0020】 Kandasamy, R., London, D., Stam, L., von Deyn, W., Zhao, X., Salgado, V. L., & Nesterov, A. (2017). Afidopyropen: New and potent modulator of insect transient receptor potential channels [雙丙環蟲酯：昆蟲瞬時受體電位通道的新型且有效的調節劑]. *Insect Biochemistry and Molecular Biology* [昆蟲生物化學和分子生物學], 84, 32-39。

【0021】 Korb, J., Termites, *Current Biology* [白蟻類，現代生物學], 第17卷, 第23號, 2007。

【0022】 Lee, S.-W., Song, M.-K., Ahn, Y. J., Kim, Y.-J., Moon, Y.-S., Koo, H. N., & Kim, G. H. (2013). Insecticidal Activity and Behavioral Disorders by Pyriproxyfen to *Trialeurodes vaporariorum* and *Bemisia tabaci* [Pyriproxyfen對白粉虱和煙粉虱的殺昆蟲活性和行為紊亂]. *The Korean Journal of Pesticide Science* [韓國農藥科學雜誌], 17(1), 33-40

【0023】 Maienfisch, P. (2019). Selective feeding blockers: pymetrozine, flonicamid, and pyriproxyfen [選擇性進食阻斷劑：吡蚜酮、氟啶蟲醯胺和pyriproxyfen]. 在P. Jeschke, M. Witschel, W. Krämer, & U. Schirmer (編輯), *Modern Crop Protection Compounds* [現代作物保護化合物] (第三版編輯, 第3卷: Insecticides [殺昆蟲劑], 第1501-1526頁). 威利-VCH出版社 (Wiley-VCH) 中。

【0024】 Matsumura, F. (1985). Modes of action of insecticides [殺昆蟲劑的作用方式]. 在*Toxicology of Insecticides* [殺昆蟲劑的毒理學]: 第二版 (第111-202頁). 普萊紐姆出版社 (Plenum Press) 中。

【0025】 Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases [綜合的介體管理：防治瘧疾介體和其他昆蟲介體傳播的疾病], 第1章, 第1頁, 2011。

【0026】 Morita, M., Ueda, T., Yoneda, T., Koyanagi, T., & Haga, T. (2007). Flonicamid, a novel insecticide with a rapid inhibitory effect on aphid feeding [氟啶蟲醯胺，一種對蚜蟲攝食有快速抑制作用的新型殺昆蟲劑]. *Pest Management Science* [害蟲管理科學], 63, 969-973。

【0027】 Nesterov, A., Spalthoff, C., Kandasamy, R., Katana, R., Rankl, Nancy B., Andrés, M., Jähde, P., Dorsch, John A., Stam, Lynn F., Braun, F.-J., Warren, B., Salgado, Vincent L., & Göpfert, Martin C. (2015). TRP Channels in Insect Stretch Receptors as Insecticide Targets [作為殺昆蟲劑靶標的昆蟲牽張感受器中的TRP通道]. *Neuron* [神經元], 86(3), 665-671。

【0028】 Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, Genomic and Molecular Genetics of Plant - Nematode Interactions [當前對世界農業的線蟲威脅，植物的基因組和分子遺傳學 - 線蟲相互作用], 第21-43頁, 2011。

【0029】 Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, Agricultural Sciences [世界農業中的有害生物防治，農業科學] - 第II卷, 2009。

【0030】 Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector- Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem? [介體傳播的疾病的昆蟲防治：何時昆蟲抗性成為問題？]Public Library of Science Pathogens [公共科學圖書館病原體], 第6卷, 第8期, 第1-9頁, 2010。

【0031】 Sparks T.C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management [IRAC：作用方式分類和殺昆蟲劑抗性管理], Pesticide Biochemistry and Physiology [農藥生物化學和生理學] (2014)，可線上接入，2014年12月4日。

【0032】 Speiser, B., Molluscicides, Encyclopedia of Pest Management [殺軟體動物劑，有害生物管理百科全書], 第219章, 第506-508頁, 2002。

【0033】 Stroup, W.W. (2012). Generalized Linear Mixed Models: Modern Concepts, Methods and Applications [廣義線性混合模型：現代概念、方法和應用]. CRC出版社. 第555頁。

【0034】 Wang, H., Lei, Z., Mei, Y., Shuo, L., & YunLiang, J. (2011). Effect of pymetrozine interferes with feeding behavior of *Bemisia tabaci* (Homoptera, Aleyrodidae) [吡蚜酮干擾煙粉虱（同翅目，粉虱科）的攝食行為的影響]. *Chinese Journal of Applied Entomology* [中國應用昆蟲學雜誌], 48(1), 54-59。

【0035】 Wang, L.-X., Niu, C.-D., Salgado, V. L., Lelito, K., Stam, L., Jia, Y.-L., Zhang, Y., Gao, C.-F., & Wu, S.-F. (2019). Pymetrozine activates TRPV channels of brown planthopper *Nilaparvata lugens* [吡蚜酮活化褐飛虱 *Nilaparvata lugens* 的 TRPV 通道]. *Pesticide Biochemistry and Physiology* [農藥生物化學和生理學], 153, 77-86。

【0036】 Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, Global Pesticide Resistance in Arthropods [全球節肢動物的殺有害生物劑抗性的分析，節肢動物的全球殺有害生物劑抗性], 第1章, 第5-33頁, 2008。

【0037】 Zhou, X., Zhang, Z., Zheng, H., Zhang, Q., Gong, J., Li, C., & Wang, R. (2021). Physiological and Biochemical Responses to Sublethal Concentrations of the Novel Pyropene Insecticide, Afidopyropen, in Whitefly *Bemisia tabaci* MED (Q Biotype) [粉虱煙粉虱MED (Q生物型) 對亞致死濃度的新型Pyropene殺昆蟲劑雙丙環蟲酯的生理和生物化學反應]. *Agronomy [農藝學]*, 11(11)。

本揭露之定義

【0038】 該等定義中給出的實例通常是非詳盡的，並且不得解釋為限制本揭露。可以理解的是，取代基應相對於與其附接的特定分子遵從化學鍵合規則和空間相容性約束。該等定義僅用於本揭露之目的。

【0039】 短語「活性成分」意指具有可用於防治有害生物的活性的材料和/或可用於幫助使其他材料具有較好的防治有害生物的活性的材料；此類材料的實例包括但不限於殺蜚蠊亞綱動物劑、殺藻劑、拒食劑、殺鳥劑、殺細菌劑、驅鳥劑、化學不育劑、殺真菌劑、除草劑安全劑、除草劑、昆蟲引誘劑、驅昆蟲劑、殺昆蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、植物活化劑、植物生長調節劑、殺齧齒動物劑、增效劑、和殺病毒劑（參見**bcpc.org**）。

【0040】 短語「活性成分組α」（在下文中為「AIGA」）共同意指以下材料：阿維菌素、阿維菌素胺甲基、脫落酸、ACC、乙醯甲胺磷、滅蟎醃、啖蟲脒、家蠅磷、乙草胺、三氯殺蟲酯、乙酯磷、乙醯蟲脒、阿拉酸式苯、三氟羧草醚、苯草醚、ACN、阿萊普、氟丙菊酯、丙烯醛、丙烯腈、阿西非那比（**acynonapyr**）、阿普泰克、雙丙環蟲酯（**afidopyropen**）、阿福拉納、(S)-阿福拉納、AITC、甲草胺、抑草生、棉鈴威、阿苯達唑、涕滅威、涕滅威砒、阿迪味啉、涕滅威砒、艾氏劑、丙烯菊酯、右旋反式丙烯菊酯、蒜素、草毒死、阿洛胺菌素、禾草滅、烯

丙醇、異硫氰酸烯丙酯、除害威、五氯戊酮酸、 α -溴敵隆、 α -氯氰菊酯、 α -硫丹、甲體氯氰菊酯、六甲蜜胺、磷化鋁（aluminium phosphide）、磷化鋁（aluminum phosphide）、辛啞啞菌胺、胺吡啶、莠滅淨（ametryn）、莠滅淨（ametryne）、特草吡啶、胺啞草酮、拌種靈、賽果、先甲草胺（amidochlor）、磺胺嘧啶、噻啞啞隆、滅害威、環丙啞啞啞酸、氯胺吡啞啞酸、4-胺基吡啞啞、胺基吡芬、胺基三啞、甲基胺草磷、胺草磷、甲基-胺草磷、吡啞啞菌胺、胺吸磷、雙甲脒、殺草強、胺基磺酸銨、代森銨、氣相二氧化矽、無定形二氧化矽、胺丙膦酸、AMS、新菸鹼、啞啞醇、敵菌靈、莎稗磷、anisiflupurin、疏草隆、蔥醌、酒石酸銻鉀、安妥、啞啞吡、殺嘧特、殘殺威、三氧化二砷、福美砷、黃草靈、乙基殺撲磷、阿特拉通、阿特拉津、金色製酶素、阿維菌素B₁、AVG、艾維激素、阿紫康啞、印苦楝子素、草芬定、甲基吡啞啞、滅蚜松、四啞啞啞隆、益棉磷（azinphos-ethyl）、益棉磷（azinphosethyl）、保棉磷（azinphos-methyl）、保棉磷（azinphosmethyl）、疊氮津（aziprotryn）、疊氮津、氧化福美雙、偶氮苯、三啞錫、偶氮磷、啞菌酯、菊乙胺酯、燕麥靈（barban）、燕麥靈（barbanate）、六氟矽酸鋁、多硫化鋁、氟矽酸鋁、熏菊酯、鹼式碳酸銅、鹼式氯化銅、鹼式硫酸銅、BCPC、氟丁噻草胺、氟丁噻草胺-M、苯霜靈、精苯霜靈、草除靈、苯卡巴腓、苯氯噻、苯啞吡丙酯（bendaqingbingzhi）、啞蟲威、苯達松、倍尼芬（benefin）、氟草胺、丙硫克百威、呋草黃、苯啞啞草胺、麥鏽靈、苯菌靈、解草酮、苯啞磷、敵菌腓、啞草酮、苧啞啞隆、地散磷、殺蟲磷、苯它隆、噻草平、滅草松、苯噻菌胺、苯噻硫氰、禾草滅、苯草滅、胺酸殺、苯紫氯銨、苧烯酸、異惡草胺、抑菌啞、六氯化苯、雙苯啞草酮、苯甲亞胺、苧草胺、苯并雙環酮、硫丹、吡草酮、氟磺胺草、基異脛肟酸、苯嘧特（benzomate）、苯并磷酸鹽（Benzophosphate）、苯并噻二

唑、苯丙烯氟菌唑、苯蟊特(benzoximate)、新燕靈、苯并嘧啶烷(benzpyrimoxan)、
苯噻隆、苯唑草酮(benzuocaotong)、苄腺嘌呤、苯甲酸苄酯、小蘗鹼、 β -氟氯
氰菊酯、 β -氯氰菊酯、苯噻吡、BHC、 γ -BHC、雙丙胺磷、雙環哌喃酮、聯苯肼
酯、必芬諾、聯苯菊酯、 κ -聯苯菊酯、吡氟菌酯、畢拉草、樂殺蟊、丙環唑、病
氰硝、生物丙烯菊酯、S-生物丙烯菊酯、戊環苄呋菊酯、生物氯菊酯、生物苄呋
菊酯、聯苯、雙唑草酮、吡殺茲、噻枯唑、噻枯唑銅、亞甲基二(x-萘-y-磺酸)二
苯汞(bisphenylmercury methylenedi(x-naphthalene-y-sulphonate))、雙草醚、雙三
氟蟲脲、殺蟲雙、比多農、硫雙二氯酚、必殺吩、比克羅宗、殺稻瘟菌素S、硼
砂、波爾多混合液、硼酸、白可列、BPCMS、BPMC、BPPS、芸薹素內酯、乙
基芸薹素內酯、小蠹性資訊素、溴鼠靈、溴氟醚菊酯(brofenprox)、溴滅菊酯、
溴氟鹽胺、溴氟菊酯、除草定、溴敵隆、 α -溴敵隆、二溴磷(bromchlophos)、
溴鼠胺、溴苄呋菊酯、溴苯烯磷、溴乙鹽胺、糠草腈、溴丁鹽草胺、溴西克林、
溴烯殺、溴-DDT、殺草全、溴硫磷(bromofos)、溴甲烷、溴硫磷(bromophos)、
乙基溴硫磷、溴蟊酯、溴菌腈、溴苯腈、溴莠敏、溴唑草酮(brompyrazone)、
糠菌唑、溴硝醇、bropropdifacoum、BRP、BTH、增效特、合殺威、特克草、布
瑞莫、噻吡酮、伯更狄混合液、白消安(busulfan)、白消安(busulphan)、畜
蟲威、丁草胺、氟丙嘧草酯、牧草胺、抑草磷、丁烷氟蟲腈、特嘧硫磷、丁烯草
胺、丁烯氟蟲腈、苄烯菊酯、特咪唑草、丁硫啶、丁噻隆、脫葉亞磷(butifos)、
丁酮威、丁酯磷、避蚊酮、丁酮虱威、地樂胺、葉鏽特、丁苯草酮、炔草隆、丁
胺、丁草敵、丁酯磷(butylchlorophos)、丁烯氟蟲腈、二甲胂酸、硫線磷、唑
草胺、鈣化醇、砷酸鈣、氯酸鈣、氰胺鈣、氰化鈣、多硫化鈣、敵敵鈣、克草胺
酯、毒殺芬、樟腦、*d*-樟腦、硝硫氰醚(cantrodifene)、敵菌丹、克菌丹、威百

畝、嗎菌威、氯滅殺威、卡巴立 (carbaril)、西維因、卡巴草靈、硫威鈉、卡巴松、貝芬替、多菌靈、長殺草、卡波硫磷、克百威、二硫化碳、四氯化碳、硫化羰、三硫磷、馬拉硫磷 (carbophos)、丁硫克百威、甲草威、環二混劑、菱鏽靈、唑草酮、環丙噻菌胺、殺螟丹、香芹酚、香芹酮、CAVP、CDAA、CDEA、CDEC、葉枯炔、CEPC、賽拉羅、敵菌脲、cetocaelat、沙巴草、切欣特混合液、奎硫磷 (chinalphos)、甲基愛奎硫磷 (chinalphos-méthyl)、滅蟪猛 (chinomethionat)、滅蟪猛 (chinomethionate)、赤拉靈、殼聚糖、滅瘟唑、甲氧除草醚、氯-IPC、氯醛糖、草滅平、氯胺磷、抑黴唑、氯黴素、雙胺靈、四氯化苯醌、丁噻草胺、氯蟲苯甲噻胺、炔禾靈、可樂津、氯殺蟪、滅幼脲、冰片丹、氯溴隆、氯炔靈、氯丹、十氯酮、殺蟲脒、氯烯炔菊酯、玉雄殺、乙烯利、蟲脒、鹽酸殺蟲脒、伐草克、蟲蟪脲、苯咪唑菌、殺蟪醇、滅草隆、燕麥酯、殺蟪酯、敵蟪特、毒蟲畏、甲基毒蟲畏、定蟲隆、氟啶殺、氯甲丹、氯茆羧酸、氯茆素、氯草敏、氯嘧磺隆、氯化物、氯甲磷、矮壯素、磺草酮、甲氧除草醚、氯乙靈、草枯醚、氯乙酸、乙酯殺蟪醇、氯二硝萘、殺蟪酯、氯仿、 α -氯代醇、氯吡啶噻肼、伊托明、滅蟲脲、地茂散、氯敵鼠、敵百蟲、氯酞亞胺 (chlorophthalim)、氯化苦、三氯丙酸、氯炔丙菊酯、丙酯殺蟪醇、百菌清、氯麥隆、氯醚隆 (chloroxifenidim)、枯草隆 (chloroxuron)、羥敵草脲、三丁氯苄脲、氯辛硫磷、氯噻亞胺 (chlorphthalim)、氯吡唑磷、草敗死、氯苯胺靈、毒死蜱、甲基毒死蜱、四氯喹啉、氯磺隆、敵草索、草克樂、蟲蟪磷、綠麥隆、克氯得、殼聚糖、膽鈣化醇、氯化膽鹼、環蟲噻肼、環己米特、抗倒酯 (cimectacarb)、抗倒酯 (cimetacarb)、瓜菊酯I、瓜菊酯II、瓜菊酯、吡啶酮草酯、環庚草醚、醚磺隆、津奧琳、氯苯噻胺、咯草隆、順式苄炔菊酯、氯噻草脲、環苯草酮、克侖吡林、氯苯氫吡咯 (clenpyrin)、克

草同、氯咪巴唑、碘氯啉酯、炔草酸、地蟲威、苯嗒吡啶、滴滴涕、四蟎吡、氯
芬磷、降固醇酸、草氯丙酸、廣滅靈、稗草胺、貝螺殺、氯羥吡啶、坐果安、氯
丙氧定、畢克草、解毒啞、氯酯磺草胺酸、氯氰碘柳胺、噻蟲胺、克黴唑、坐果
酸、克拉壟 (cloxylacon)、克紫壟 (clozylacon)、CMA、CMMP、CMP、CMU、
科得引誘劑、膽骨化醇、噻唑硫磷、醋酸銅、亞砷酸銅、砷酸銅、碳酸銅、鹼式、
氫氧化銅、環烷酸銅、油酸銅、氧氯化銅、8-羥基喹啉銅、矽酸銅、硫酸銅、鹼
式硫酸銅、鉻酸鋅銅、氯殺鼠靈、殺鼠靈、庫馬磷 (coumafos)、克滅鼠、蠅毒
磷、殺鼠迷、甲香菌酯、畜蟲磷、丁香菌酯、4-CPA、4-CPB、CPMC、CPMF、
4-CPP、CPPC、醚草敏、甲酚、甲苯基酸、鼠立死、氯康唑、克羅米通、巴毒磷
(crotoxyfos)、丁烯磷 (crotoxyphos)、育畜磷、冰晶石、誘蠅酮、硫雜靈、枯
草酮 (cumyleron)、苜草隆、福美銅氯、氧化亞銅、莠術醇、CVMP、胺腈、氰
草淨、氰草津、苯腈磷、氰、殺螟腈、果蟲磷、氰蟲醯胺、三聚氰酸、氰霜唑、
灑布淨、環菌胺、環丙酸醯胺、環溴蟲醯胺、環蟲菊酯、環草敵、cyclobutrifluram、
環己醯亞胺、環蟎酯、乙氰菊酯、環吡喃 (cyclopyranil)、環噻草特、環磺隆、
環氧蟲啉、環殺草、環莠隆、腈吡蟎酯、乙唑蟎腈、環氟菌胺、丁氟蟎酯、氟氯
氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、環鹵二醯胺 (cyhalodiamide)、氟氯草酯、氯氟氰菊酯、
 γ -氯氟氰菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、三環錫、cymergan、蟎婢胺、霜脲氰、解草胺腈、
氰菌靈、氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 β -氯氰菊酯、 θ -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、牧草
快、苯醚氰菊酯、環草津、三環塞草胺、環克座、啞菌環胺、環丙氟蟲胺、酯菌
胺、環丙草胺、可普磺醯胺、環吡氟草酮、環丙馬秦、畜婢磷、多果定、1,3-D、
2,4-D、3,4-DA、殺草隆、茅草枯、丁醯肼、噻幼酮、棉隆、2,4-DB、3,4-DB、
DBCP、d-樟腦、DCB、DCD、DCIP、DCPA (美國)、DCPA (日本)、DCPTA、

DCU、DDD、DDPP、DDT、pp'-DDT、DDVP、2,4-DEB、咪菌威、癸磷錫、溴
氰菊酯（decamethrin）、一甲呋喃丹、避蚊胺、去氧乙酸、敵草快（deiquat）、
異丁草胺、環氧硫磷、溴氰菊酯（deltamethrin）、田樂磷、田樂磷-O、田樂磷-
S、內吸磷、甲基內吸磷、內吸磷-O、甲基內吸磷-O、內吸磷-S、甲基內吸磷-S、
內吸磷-S-甲磺酸、甲基內吸磷-S磺、DEP、2,4-DEP、生物丙烯菊酯、魚藤酮、
2,4-DES、甜菜安、敵草淨（desmetryn）、敵草淨（desmetryne）、d-反式鹵炔丙
菊酯、DFDT、丁醚脲、氯亞磷、氯亞胺硫磷、燕麥敵（di-allate）、燕麥敵（diallate）、
二胺磷、diamiphenethide、麥草畏（dianat）、矽藻土（diatomaceous earth）、矽
藻土（diatomite）、二吡農、二溴磷、1,2-二溴乙烷、鄰苯二甲酸二丁酯、驅蟲
特、麥草畏（dicamba）、異氯磷、dicarbasulf、dicarbosulf、敵草腈、二氯苯噻唑
（dichlobentiazox）、dichlobenz-methyl、除線磷、益發靈、二氯萘醌、氯全隆、
二滅幼脲、敵草隆、羧酸萆、二氯萆醇（dichlorflurenol）、苄胺靈、二氯丙烯胺、
鄰二氯苯（o-dichlorobenzene）、鄰二氯苯（ortho-dichlorobenzene）、對二氯苯
（p-dichlorobenzene）、對二氯苯（para-dichlorobenzene）、2,5-二氯苯甲酸、1,2-
二氯乙烷、二氯甲烷、二氯酚、3,6-二氯吡啶酸、1,2-二氯丙烷、1,3-二氯丙烯、
滴丙酸、滴丙酸-P、敵敵畏、菌核利（dichlozolin）、菌核利（dichlozoline）、苄
氯三唑醇、二氯西莫、二草氯丙酸、達滅淨、氯硝胺、敵克美施、雙氯磺草胺、
三氯殺蟎醇、滴滴涕、雙殺鼠靈、敵來死、百治磷、地快樂、雙香豆素、地昔尼
爾、迪賽隆、狄氏劑、除蟎靈、二乙除草雙、甘草鎖、二愛殺松、乙硫磷（diéthion）、
乙黴威、增效磷、乙硫磷（diéthion）、焦碳酸二乙酯、待乙妥、鼠得克、待克利、
戊味禾草靈、枯莠隆、苯敵快、噻鼠靈、氟蟎吡、二福隆、吡氟草胺、吡氟醚草
胺、二氟吡隆、二氟林、敵草克、雙羥丙茶鹼、敵瑪替夫、dimefluazole、四氟甲

醚菊酯、甲氟磷、噁唑隆、殺蟲雙、dimenoxypyrin、哌草丹、dimesulfazet、菌核淨、地麥威、混滅威、菌核淨、二甲草胺、異戊淨、二甲噻草胺、二甲噻草胺-P、噻節因、二甲嘧啶、樂果、達滅芬、苄菌酯、驅蚊靈、二甲基二硫醚、二甲基鄰苯二甲酸酯、二甲基亞硝胺、敵蠅威、草滅散、草噻酮、地莫菌胺、滅草靈（dimpropyridaz）、二吡農、殺草隆、消螨酚、啞菌噁唑、烯唑醇、烯唑醇-M、R-烯唑醇、敵樂胺、二硝基酚、大脫螨、消螨普、消螨普-4、消螨普-6、鄰敵螨消、迪樂芬諾、硝戊酯、丙硝酚、戊硝酚、地樂酚、硝辛酯、呋蟲胺、特樂酚、硝丁酯、苯蟲醚、蔬果磷、二氧威、敵殺磷、敵惡磷、dioxopyritrione、敵鼠（diphacin）、敵鼠（diphacinone）、二苯茛酮、草乃敵（diphenamid）、草乃敵（diphenamide）、二苯胺、二苯砒、二苯硫醚、調味酸、地樂靈、異丙淨、敵百蟲、敵派美創、雙硫氧吡啶、敵草快、殺蟲雙、雌舞毒蛾引誘劑、麥草畏甲酯、賽松、雙硫命、乙拌磷、滅菌磷、腈硫醯、噻喃磷、二甲基二硫醚、甲基乙拌磷、氟硫草定、dithiuron、達有龍、雙黃藥、*d*-檸檬烯、DMDS、DMPA、DNOC、嗎菌靈、多地辛、多寧、苯氧炔螨、十二烷基胍醋酸鹽、穀蠹引誘劑、朵拉克汀、2,4-DP、3,4-DP、DPC、敵菌酮、DSMA、右旋七氟甲醚菊酯、右旋反式丙烯菊酯、右旋反式苄呋菊酯、毒氟磷、莎撲隆、EBEP、EBP、硫線磷、 α -蛻皮激素、 β -蛻皮激素、蛻皮甾酮、氯唑靈、EDB、EDC、EDDP、克瘟散、甘草津、甲胺基阿維菌素、EMPC、烯炔菊酯、烯腺嘌呤、硫丹、 α -硫丹、草多索、草藻滅、因毒磷、安特靈、烯肱菌酯（enestroburin）、恩康唑、烯肱菌酯（enoxastrobin）、螨淨、24-表藝薹素內酯、EPN、丙醯藝薹素內酯、保幼醚、依普座、依立諾克丁、磺唑草、 ϵ -甲氧苄氟菊酯、 ϵ -莫氟殺林、EPTC、epyrifenacil、抑草蓬、麥角鈣化醇、二氯己醯草胺、esafoxolaner、生物烯丙菊酯、高氰戊菊酯、ESP、戊草

丹、乙烯矽、乙環唑、依他伏殺、代森硫、噻唑菌胺、克草胺、乙丁烯氟靈、胺
苯磺隆、殺草胺、乙烯利、噻二唑隆、殺蟲丹、抑草威、愛殺松、乙吡草酮、乙
蟲腈、依瑞莫、益硫、乙氧本草胺、乙呋草黃、驅蚊醇、滅克磷、普伏松、氯氟
草醚、(3-乙氧基丙基)溴化汞、促長啉、乙氧嘧磺隆、吲熟酯、乙滴滴、乙基-DDD、
乙烯、二溴乙烯、二氯乙烯、氧化乙烯、甲酸乙酯、乙蒜素、乙酸乙基汞、溴化
乙基汞、氯化乙基汞、2,3-二羥基丙基硫醇化乙基汞、磷酸乙基汞、N-(乙基汞)-
對甲苯磺醯苯胺(sulfonanilide)、N-(乙基汞)-對甲苯磺醯苯胺(sulphonanilide)、
焦磷酸乙酯、乙拌磷、戊唑醇(ethyltrianol)、戊唑醇(etiltrianol)、硝草酚、
ETM、乙胺草醚、乙氧苯草胺、依芬普司、乙蟎唑、依得利、乙嘧硫磷(etrifos)、
丁香酚、EXD、famoxacarb、凡殺同、胺磺磷、右旋反式氯丙炔菊酯、伐草克、
咪唑菌酮、敵克松、烯肟菌胺、芬滅松、咪菌腈、芬瑞莫、醯苯磺威(fenasulam)、
抗蟎唑、啞蟎醚、芬克座、苯丁錫、解草唑、皮蠅硫磷、芬氯磷、解草啞、乙苯
威、fenetrazole、五氟苯菊酯、甲呋醯胺、環醯菌胺、非草隆、種衣酯、撲滅松、
除蟎酯、酚菌酮、fenmezoditiaz、仲丁威、毒菌錫、涕丙酸、苯硫威、非諾克林、
氰菌胺、啞唑禾草靈、啞唑禾草靈-P、異啞苯砒、芬諾克、拌種咯、芬哌沙米
(fempicoxamid)、吡氯氰菊酯、甲氰菊酯、苯鏽啞、芬普福、胺苯吡菌酮、苯
唑氟草酮、啞蟎酯、芬奎三酮、塔吡抑雄素、除蟎酯、豐索磷、氯苯氧乙醇、噻
唑禾草靈、芬殺松、乙基芬殺松、噻唑禾草靈、三苯錫、四唑醯草胺、芳氟胺、
非草隆、非草隆-TCA、氰戊菊酯、福美鐵、富米綜、磷酸鐵、硫酸亞鐵、氟蟲
腈、氟燕靈、氟燕靈-M、嘧啶磺隆、氟鼠靈、氟美托奎、氟啞蟲醯胺、雙氟磺草
胺、氯氟吡啞酯、氟吡草胺(florylpicoxamid)、嘧蟎酯、三氟咪啞醯胺
(fluazaindolizine)、吡氟禾草靈、吡氟禾草靈-P、扶吉胺、異丙吡草酯、氟佐

隆、氟蟲雙醯胺、氟苯醚醯胺、氟蟥嗪、溴氟菊酯、氟酮磺隆、氟吡磺隆、氟消
草、fluchloraminopyr、氟氯蟲雙醯胺 (fluchlordiniliprole)、伏康脲、氟環脲、氟
氰菊酯、護汰寧、聯氟蟥 (fluénéthyl)、聯氟蟥 (fluenetil)、氟噻蟲𨮷、氟噻
草胺、氟芬內林、吡氟草胺、flufenoxadiazam、氟蟲脲、氟菌蟥酯、三氟醚、氟
嗒吡草酯、氟蟥吡、丁烯氟蟲脲、氟己芬、氟茚啉菌胺 (fluindapyr)、氟氯苯菊
酯、氟噻菌胺、氟節胺、啞啞磺草胺、flumetylsulforim、氟默吡、氟烯草酸、丙
炔氟草胺、氟米丙平、氟味啉、伏草隆、氟吡菌胺、氟吡胺 (fluopimomide)、
氟吡菌醯胺、氟殺蟥、增糖胺、氟乙醯胺、氟乙酸、氟咯草酮、氟-DDT、消草
醚、氟滴滴涕、乙羧氟草醚、啞啞草、氟氯菌核利 (fluoromide)、啞啞草、氟
除草醚、氯氟吡氧乙酸、氟硫隆、三氟苯啞、氟氧雜吡乙酮 (fluoxapiprolin)、
氟啞菌酯、fluoxytioconazole、flupentiofenox、氟胺草啞、氟丙啞草、氟鼠啞、四
氟丙酸、氟吡啞喃酮、吡氟硫磷 (flupyrazofos)、氟啞啞 (flupyrimin)、氟啞
啞磺隆、氟啞啞、氟拉藍那、解草安、抑草丁、羧萆素、氟啞草酮、氟咯草酮、
氟定咪、氟草定、調啞醇、氟磺醯胺、啞草酮、護矽得、氟硫滅、氟蟥吡、吡草
酸、氟噻草胺、氟替尼、福多果定、護汰芬、氟胺氰菊酯、 τ -氟胺氰菊酯、氟甲
醯胺 (fluxametamide)、氟啞菌醯胺、肱草安、福爾培 (folpel)、滅菌丹 (folpet)、
氟磺胺草醚、地蟲磷、甲醯啞磺隆、氟吡脲、甲醛、伐蟲脛、安果、胺甲威、殺
木磷、福賽得、丁苯硫磷、福司吡酯、噻啞磷、丁硫環磷、弗羅塔林、四氯苯酞、
麥穗靈、氟草淨、氟草醚、啞喃蟲醯胺、氟菌蟥酯 (fujunmanzhi)、氟氯醚 (fulumi)、
氟乙醯胺、氟蔡禾草靈、啞苯硫脲、乙二醇縮糖醛、啞霜靈、炔啞菊酯、福拉比、
啞喃蟲醯胺、啞線威、二甲啞醯胺、氟康啞、順式氟康啞、抗蟲菊、糠醛、啞喃
解草啞、拌種胺、啞菌隆、啞氧草醚、 γ -BHC、 γ -氯氟氰菊酯、 γ -HCH、格蟥酯、

赤黴酸、赤黴素A3、激勃素、鼠甘伏（gliftor）、鼠甘伏（glitor）、氯醛糖、草
銨磷、草銨磷-P、L-草銨磷、果綠定、乙二肼、草甘膦、草甘二膦、棉紅鈴蟲性
誘劑、誘殺烯混劑、灰黃黴素、胍諾克汀、雙胍鹽、丙烯酸喹啉酯、氟氯吡啶酯、
苄蟊醚、氯蟲醯肼、氟硝磺醯胺、氯吡嘧磺隆、氟啶草、吡氟氯禾靈、吡氟氯禾
靈-P、吡氟氯禾靈-R、HCA、HCB、HCH、 γ -HCH、六甲密胺、六甲磷、HEOD、
七氯、禾他氟林、heptamaloxyloglucan、庚烯磷、增產肼、除莠黴素、除莠黴素
A、速殺硫磷、六氯、六氯環己烷、六氯丙酮、六氯苯（hexachlorobenzene）、
六氯丁二烯、六氯苯（hexachlorophene）、菲克利、氟鈴脲、六氟拉敏、六氟砷
酸鉀、己誘劑、己醯胺、六吡同、己硫磷、噻蟊酮、HHDN、霍洛硫、高油菜素
內酯、環吡氟草酮、環草肼、環蟲腈（huanchongjing）、磺草靈、環菌唑、氟蟻
肼、汞加芬、水合石灰、胺腈化氫、氰化氫、烯蟲乙酯、S-烯蟲乙酯、土菌消、
4-羥基苯乙醇、8-羥基喹啉硫酸鹽、惡黴靈、奮淋威、IAA、IBA、IBP、埃卡瑞
丁、伊米薩利、咪草酸、imazamethapyr、甲氧咪草煙、甲咪唑菸酸、滅草煙、滅
草喹、咪草煙、唑吡嘧磺隆、亞胺唑、新煙磷、吡蟲啉、氯噻啉、克熱淨、炔咪
菊酯、依納素、茚草酮、indazapyroxamet、茚吡氟草胺、茚蟲威、枯瘟淨、纖毛
蟲土（infusorial earth）、茚吡氟西姆（inpyrfluxam）、碘草腈、碘克威、碘硫磷、
碘甲烷、碘甲磺隆、優芬磺隆、碘苯腈、抑草津、IPBC、IPC、種菌唑、艾分卡
巴肼、艾分氟康唑、伊匹芬喹（ipflufenquin）、丙基喜樂松、依普同、顯黴威、
丙草定、齒小蠹二烯醇、小蠹烯醇、IPSP、IPX、氯唑磷、依殺松、碳氯靈、丁
咪胺、丁咪胺、水胺硫磷、異草定、異環斯蘭（isocycloseram）、異艾氏劑、異
柳磷、甲基異柳磷、艾索非他米、異氟普蘭（isoflucypram）、異索威、丁吡草
酮、異草完隆、異派磷、氮草草、葉蟬散、異草定、異樂靈、異丙吡草酯、稻瘟

靈、異丙隆、異吡瑞沙、異噻醇、異拌磷、異噻菌胺、異惡隆、異噻菌酮、異噁噻草胺、isoxacarbole、異惡氯草酮、雙苯噁唑酸、異噁唑草酮、異惡草醚、異噁唑磷、異惡隆、伊維菌素、異惡草胺、浸種磷(izopamfos)、浸種磷(izopamphos)、日本麗金龜引誘劑、喃烯菊酯、茉莉菊酯I、茉莉菊酯II、茉莉酸、甲磺蟲脒、甲基增效磷、甲香菌酯、解草烷、解草烯、井崗黴素A、碘硫磷、保幼激素I、保幼激素II、保幼激素III、噻啞菊酯、κ-聯苯菊酯、κ-七氟菊酯、卡草靈、卡日塔贊、春日黴素、克菌靈、氯戊環、克螺多、矽藻土(kieselguhr)、活動素、烯蟲炔酯、S-烯蟲炔酯、精苯霜靈、克收欣、啞草烯、乳氟禾草靈、λ-氯氟氰菊酯、蘭考三酮(lancotrione)、拉替魯爾、砒酸鉛、環草定、雷皮菌素、溴苯磷、L-草銨膦、聯苯腈酯(lianbenjingzhi)、石硫合劑、右旋檸檬烯、靈丹、三甲基二氧三環壬烷、利穀隆、啞蟲磷、夜蛾性誘劑、粉紋夜蛾性誘劑、洛替拉納(lotilaner)、氯芬奴隆、氯氟氰蟲噻胺(lüfuqingchongxianan)、氯噻草磷(lüxiancaolin)、氯啞菌酯、氯氟醚菊酯(lvfumijvzhi)、氯噻草膦、噻啞磷、M-74、M-81、MAA、磷化鎂、馬拉硫磷(malathion)、馬拉硫磷(maldison)、馬來噻肼、丙蟎氰、麥芽糊精、MAMA、manam、代森錳銅、代森錳鋅、曼得羅賓、雙炔噻菌胺、錳乃浦、苦參鹼、疊氮磷、MCA、MCC、MCP、1-MCP、MCPA、2,4-MCPA、MCPA-硫代乙基、MCPB、2,4-MCPB、MCPB、滅鏽胺、滅蚜磷、甲威苯咪、甲基滅蚜磷、甲氯丙酸、甲氯丙酸-P、殺蟎脒、地樂施、誘殺酯、苯噻噻草胺、精甲霜靈、吡啶解草酸、甲芬氟康唑(mefentrifluconazole)、氟磺噻草胺、美加特酸、蜂花醇、雙殺鼠靈、MEMC、滅蚜松、MEP、噻菌胺、氯氟醚菊酯、滅芬酯、地安磷、壯棉素、mepitriflufenpyr、滅普寧、消蟎多、滅蟲威、倍硫磷、倍硫磷硫醇(mercaptophos thiol)、馬拉硫磷(mercaptotion)、氯化汞、氧化汞、氯化亞

汞、脫葉亞磷、氧化脫葉亞磷、滅莠津、甲基二磺隆、甲基磺草酮、甲硫芬（mesulfen）、甲亞磺磷（mesulfenfos）、甲硫芬（mesulphen）、間甲酚、氰氟蟲胺、甲霜靈、甲霜靈-M、R-甲霜靈、蝸牛敵、威百畝、惡唑醯草胺、苯吡草酮、甲基對硫磷、metarylpicoxamid、滅他熏、吡草胺、雙醚氯吡嘧磺隆、間氯敵菌酮、美卡芬（metcamifen）、滅特座、甲基涕巴、二甲達草伏、噻嗪隆、蟲蟎畏、美索丙鉑林、威百畝、甲胺磷、滅速克、滅草啞、呋菌胺、甲草苯隆、殺撲磷、甲硫苯威、滅賜克、甲硫嘧磺隆、甲硫涕巴、甲硫啞啞、滅草恒、殺蟲乙烯磷、速滅威、醚草通、滅多威、甲氧普林、S-甲氧普林、格草淨、蓋草津、丁基奎納克林、甲醚菊酯、甲氧滴滴涕、2-甲氧基乙基氯化汞、甲氧蟲醯肼、去草酮、甲基啞磷吡、甲基溴、甲基丁香酚、甲基碘、甲基異柳磷、異硫氰酸甲酯、甲基對硫磷、甲基乙酯磷、甲基氯仿、1-甲基環丙烯、二硫代胺基甲酸甲酯、甲基殺草隆、二氯甲烷、甲基倍硫磷、氧化甲基倍硫磷、甲基倍硫磷硫醇、甲基汞苯甲酸鹽、氰胍甲汞、甲基汞五氯酚鹽、甲基新癸胺、殺螟硫磷、保棉磷、甲硫啞啞、代森聯、代森聯鋅、吡喃隆、溴穀隆、甲氧苄氟菊酯、ε-甲氧苄氟菊酯、異丙甲草胺、S-異丙甲草胺、速滅威、氯苯咯菌胺、苯磺隆、苯氧菌胺、磺草啞啞、惡蟲酮、甲氧隆、滅芬農、代森聯、賽克津、美曲磷酯、敵百蟲、噻菌胺、甲磺隆、metyltetraprole、速滅磷、茲克威、滅除威（miechuwei）、滅鼠安、滅蚊菊酯（miewenjuzhi）、米爾蟎素、米爾貝肼、代森環、醚蟎胺（mimanan）、丙胺氟磷、MIPC、滅蟻靈、MITC、mivorilane、MNAF、modoflaner、蘑菇醇、草達滅、殺蟲單、莫氟殺林、ε-莫氟殺林、庚醯草胺、monisouron、特啞啞隆（monisuron）、單甲脒、單氯乙酸、久效磷、綠穀隆、殺蟲單（monomethypo）、舒非侖、嘧磺隆、單嘧磺酯、殺蟲單（monosultap）、滅草隆、滅草隆-TCA、伐草快、咪啞脒

胍、茂果、莫茲得、莫昔克丁、MPMC、MSMA、MTMC、 α -multistriatin、家蠅引誘劑、腈菌唑、米克啞、蜂花基醇、NAA、NAAm、鈉乃浦、萘酞磷、二溴磷、萘、萘乙醯胺、 α -萘乙酸、萘酸酐、萘肽磷、1-萘酚、萘氧基乙酸、萘乙酸、萘基二氫茛-1,3-二酮、萘氧基乙酸、萘丙胺、敵草胺、敵草胺-M、萘草胺、游黴素、NBPOS、草不隆（neburea）、草不隆（neburon）、異狄氏劑、毒藜鹼、對氯硫磷（nichlorfos）、除草醚、氯硝柳胺、啶醯菌胺、nicofluprole、煙嘧磺隆、菸鹼、氟蟻靈、尼克黴素、ningnamycin、寧南黴素、NIP、氟氯草胺、吡氯草胺（nipyralofen）、烯啶蟲胺、硝乙脲噻唑、磺樂靈、氯啶、戊氰威、除草醚、三氟甲草醚、硝基苯乙烯、異丙消、NNM、滅鼠寧、王醇、鼠特靈、草完隆、達草滅、降菸鹼、草完隆、氟噻脲、多氟脲、NPA、尼瑞莫、奴南酮（nuranone）、OCH、八氯二丙醚、辛噻酮、2-(辛硫基)乙醇、鄰二氯苯、呋噻胺、氧樂果、鄰苯基苯酚、坪草丹、歐福綠、旱草丹、鄰二氯苯、苯腈素、噻苯胺磺隆、奧克綠、肟醚菌胺、胺磺樂靈、蛇床子素（osthol）、蛇床子素（osthole）、歐斯摧蒙（ostramone）、歐威壯（ovatron）、殺蟎酯、解草腈、丙炔啶草酮、啶草酮、歐殺斯、草胺酸鹽、歐殺滅、草噻松（oxapyrazon）、草噻松（oxapyrazone）、環氧嘧磺隆、奧賽普林、啶啉草酮、啶唑硫（oxazosulfonyl）、啶啉銅（oxine-copper）、啶啉銅（oxine-Cu）、歐索林酸、啶咪唑、氧化萎鏽靈、甲基磺吸磷、異亞磺磷、磺拌磷、羥烯腺嘌呤、oxyfenthiin、oxyfenthin、乙氧氟草醚、氧化苦參鹼、土黴素、氧化克殺蟎、PAC、巴克素、啞蟲啉、丙烯除蟲菊、PAP、對二氯苯、對氟隆、百草枯、對硫磷、甲基對硫磷、苯吡醇、巴黎綠、PCNB、PCP、PCP-Na、對二氯苯、PDJ、克草猛、消蟎酚、披扶座、天竺葵酸、平克座、賓克隆、二甲戊樂靈、三氯殺蟲酯、噴福芬、氟幼脲、二甲戊樂靈、平速爛、五氯苯酚、五氯

苯基月桂酸鹽、戊醯苯草胺、吡嗪菌胺、戊烯氰氯菊酯、環戊嘧草酮、perbutin、滅蟻靈、氟草磺胺、苧氯菊酯、乙滴涕、烯草胺、PHC、氰烯菌酯、乙基氰烯菌酯、敵磺鈉（phénaminosulf）、葉枯淨、雙乙威（phénétacarbe）、棉胺寧、芬硫磷、甜菜寧、乙基甜菜寧、稀草隆、酚硫殺、苯醚菊酯、苯蟊醚、稻豐散、8-苯基汞氧基喹啉（8-phenylmercurioxyquinoline）、苯汞脲、乙酸苯基汞、氯化苯基汞、鄰苯二酚的苯基汞衍生物、硝酸苯基汞、水楊酸苯基汞、2-苯基苯酚、甲拌磷、毒鼠磷（phosazetim）、伏殺磷、磷滅丁（phosametine）、毒鼠磷（phosazetim）、毒鼠磷（phosazetin）、三磷錫、氯瘟磷、黴疫淨（phosethyl）、硫環磷、甲基硫環磷、甘胺硫磷、亞胺硫磷、對氯硫磷、磷醯胺、磷胺、磷烷、草丁膦、磷蟲威、磷、丁基嘧啶磷、三磷錫、辛硫磷、甲基辛硫磷、四氯苯酞、萘酞磷（phthalophos）、似蟲菊、皮卡布西、派卡瑞丁、毒莠定、氟吡草胺、啉氧菌酯、匹馬菌素、殺鼠酮、唑啉草酯、粉病靈、吡啉、胡椒基丁醚、胡椒基環己烯酮、吡草磷、吡壯素（piroctanly）、吡壯素、增效醛、甲胺嘧磷（pirimetaphos）、比加普、滅鼠優、嘧啶氧磷、乙基蟲蟊磷、甲基蟲蟊磷、鼠完（pival）、殺鼠酮、三氯殺蟲酯、PMA、PMP、聚丁烯、聚胺基甲酸酯、毒殺芬、聚乙氧基喹啉、多氧菌素D、多氧菌素（polyoxins）、保粒黴素、代森聯、多噻吡、亞砷酸鉀、疊氮化鉀、氰酸鉀、乙基黃原酸鉀、環烷酸鉀、多硫化鉀、硫氰酸鉀、pp'-DDT、丙炔菊酯、早熟素I、早熟素II、早熟素III、丙草胺、乙醯嘧啶磷、氟嘧磺隆、撲殺熱、咪醯胺、丙氯醇、環丙腈津、撲滅寧、胺氟樂靈、丙溴磷、氟唑草胺、環丙氟靈、丙氟菊酯、環苯草酮、殺蟲胺、甘撲津、調環酸、茉莉酮、蟬虱威、猛殺威、撲滅通、撲草淨（prometryn）、撲草淨（prometryne）、捕滅鼠、前尼替丁（pronitridine）、拿草特、撲草胺、丙蟲磷、普羅帕脒、霜黴威、敵稗、丙蟲磷、啉草酯、克蟊特、

撲蟲菊、撲滅津、巴胺磷、苯胺靈、普克利、丙匹定 (propidine)、甲基鋅乃浦、異丙草胺、安丹、丙苯磺隆、增效酯、丙嘧磺隆、戊炔草胺、丙氧喹啉、補骨內酯、甲硫磺樂靈、苄草丹、氟磺隆、乙噻唑磷、硫菌威、丙硫菌唑、普硫松、發硫磷、丙苯炔菊酯、撲滅生、派密多磷 (pyrimidophos)、廣草胺、補骨脂素 (psoralen)、補骨脂素 (psoralene)、比達農、氟唑菌醯胺 (pydiflumetofen)、派氟丁胺、派滅淨、比鏽靈、吡唑硫磷、雙唑草腈、百克敏、吡草醚、氟蟲腈、嘧啶威、唑胺菌酯、唑菌酯、吡丙炔 (pyrapropoyne)、磺醯草吡唑、派拉氟胺、吡唑特 (pyrazolate)、吡唑特 (pyrazolynate)、殺草敏、白粉松、吡嘧磺隆、硫吡唑磷、苄草唑、反滅蟲菊、必列寧I、必列寧II、除蟲菊精、異丙酯草醚、丙酯草醚、吡菌苯威、嘧啶肟草醚、稗草丹、氯草定、噻蟎靈、吡啶氯甲基 (pyridachlometyl)、吡啶達醇、啖蟲丙醚、嗒吡硫磷 (pyridaphenthion)、嗒吡硫磷 (pyridaphenthione)、噻草特、啖菌腈、比芬諾、氟蟲吡啶、環酯草醚、派滅他磷 (pyrimétaphos)、啖黴胺、抗蚜威、啖蟎醚、啖草醚、啖蟎胺、乙基嘧啶磷、甲基嘧啶磷、啖啖硫蕃、啖硫磷、滅鼠優、派瑞芬酮、派瑞樂、吡啶醇、吡丙醚、啖菌嘧啶、啖硫草醚、吡啶威、百快隆、啖氧磺、甲氧磺草胺、吡氯靈、吡氧呋、吡草酸 (qincaosuan)、氰枯靈 (qingkuling)、苦木素、羥基喹啉基乙酮、喹硫磷、甲基喹硫磷、醌菌脒、二氯喹啉酸、喹克唑、喹草酸、滅藻醌、奎諾夫林 (quinofumelin)、滅蟎猛、氯藻胺、畜寧磷、喹草酮、快諾芬、喹硫磷、五氯硝基苯、二氯喹啉草酮、喹禾靈、喹禾靈-P、驅蚊酯、驅蠅定、吡咪唑、碘醚柳胺、R-烯唑醇、熱必得、敵草快、氯氟醚菊酯、雷度隆 (renriduron)、紅圓介殼蟲引誘劑、滅蟲菊、右旋反式苄呋菊酯、硫氰苯乙胺、鬧羊花毒素III、病毒唑、rimisoxafen、嘧嘧磺隆、丁烯氟蟲腈 (rizazole)、R-甲霜靈、硫氰苯胺

(rodéthanil)、皮蠅磷、魚藤酮、魚尼丁、藜蘆鹼、苯嘧磺草胺、噻菌茂、噻森銅、水楊醯苯胺、氟矽菊酯、血根鹼、散道萆、沙羅拉納(sarolaner)、S-生物丙烯菊酯、八甲磷、海蔥糖苷、辛菌胺、另丁津、密草通、氟唑環菌胺、司拉克丁、單甲脒、增效菊、芝麻林素、賽松、西殺草、西維因、S-烯蟲乙酯、雙甲胺草磷、雙鹼胺草磷(shuangjianancaolin)、環草隆、四氟醚菊酯(sifumijvzhi)、誘蟲環、矽護芬、毒鼠矽、二氧化矽氣凝膠、矽膠、矽噻菌胺(silthiofam)、矽噻菌胺(silthiopham)、矽噻菌胺(silthiophan)、三氯苯氧丙酸、西瑪津、矽氟唑、西瑪通、西草淨(simetryn)、西草淨(simetryne)、殺雄啉、S-烯蟲炔酯、消石灰、SMA、S-甲氧普林、S-異丙甲草胺、亞砷酸鈉、疊氮化鈉、氯酸鈉、氯乙酸鈉、氰化鈉、氟化鈉、氟乙酸鈉、六氟矽酸鈉、環烷酸鈉、鄰苯基酚鈉(sodium orthophenylphenoxide)、五氯酚鈉(sodium pentachlorophenate)、五氯酚鈉(sodium pentachlorophenoxide)、鄰苯基酚鈉(sodium o-phenylphenoxide)、多硫化鈉、氟矽酸鈉、四硼酸二鈉、四硫代碳酸鈉、硫氰酸鈉、蔬草滅、蘇硫磷、spidoxamat、乙基多殺菌素、賜諾殺、螺螨雙酯(spirobudifen)、螺螨酯、螺甲螨酯、螺環啉(spiropidion)、螺蟲乙酯、螺環菌胺、司替羅磷、鏈黴素、番木鱉鹼、食菌甲誘醇、磺苯醚隆、磺草酮、草克死、sulfathiadiazuron、sulfathiazuron、甲磺草胺、舒非侖、氟蟲胺、磺噻隆(sulfodiazole)、甲嘧磺隆、草硫膦、磺醯磺隆、治螟磷(sulfotep)、硫特普(sulfotepp)、氟啉蟲胺脒、亞砷、硫脲醚、硫、硫酸、氟化硫醯、吡啶磺酯、草硫膦、硫丙磷、戊苯砷、suthiazuron、苄氯菊酯、滅草靈、2,4,5-T、吐酒石、 τ -氟胺氰菊酯、稗草烯、噻蟎威、2,4,5-TB、2,3,6-TBA、TBTO、TBZ、TCA、TCBA、TCMTB、TCNB、TDE、得克利、蟲醯肼、吡蟎胺、特普弗洛奎(tebufloquin)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、丁基嘧啶磷

(tebupirimphos)、牧草胺、丁噻隆、克枯爛、四氯硝基苯、福美雙聯、三氯殺蟎虱、得福隆、七氟菊酯、 κ -七氟菊酯、右旋七氟甲醚菊酯、特呋喃隆、環磷酮、替美福司、雙硫磷、涕巴、TEPP、哌喃草酮 (tepraloxymid)、哌喃草酮 (teproloxydim)、環戊烯菊酯、特草定、特草靈、猛殺草、terbuconazole、特丁硫磷、甲氧去草淨、特丁津、芽根靈、terbutrazole、去草淨 (terbutryn)、去草淨 (terbutryne)、五氯硝基苯、土黴素 (terramycin)、土黴素 (terramycin)、特效烯、四氟吡咯啉 (tetflupyrolimet)、四氯蟲醯胺、四氯乙烷、司替羅磷、四克利、三氯殺蟎虱、殺蟎好 (tetradisul)、四氟隆、胺菊酯、四氟醚菊酯、四胺、殺蟎素、氟氰蟲醯胺、四氟丙酸鈉、殺蟎好、硫酸鉈、硫酸亞鉈、甲氧噻草胺、 θ -氯氰菊酯、腐絕、噻蟲啉、噻二吡、噻二氟、噻蟲吡、噻磺隆、噻丙腈、噻氟隆 (thiazafluron)、噻氟隆 (thiazfluron)、噻酮、噻草定、苯噻硫磷、噻菌腈、噻二唑胺、噻苯隆、噻酮磺隆、噻吩磺隆、賽氟滅、硫柳汞、甲拌磷、禾草丹、抗蟲威、硫氯苯亞胺、硫氰基二硝基苯 (thiocyanatodinitrobenzenes)、殺蟲環、硫丹、乙拌磷、噻菌銅、硫敵克、久效威 (thiofanocarb)、久效威 (thiofanox)、硫氟肟醚、噻赫派 (thiohempa)、硫柳汞、甲基乙拌磷、硫磷吡、多保淨、乙基多保淨、甲基多保淨、對硫磷、克殺蟎、胺基硫脲、殺蟲雙、噻替派、殺線威 (thioxamyl)、福美雙、秋蘭姆、蘇雲金素、噻苯達唑、汰敵寧、汰芬那、調節安、TIBA、蟬蟬胺、替戈拉納 (tigolaner)、仲草丹、替可裡姆 (tioclorim)、硫蟲醯胺、替噶殺芬 (tioazafen)、硫氰苯甲醯胺、TMTD、威線肟、甲基脫克松、噻蟲醯胺、甲磺菌胺、托普洛卡 (tolprocarb)、托吡拉特 (tolpyralate)、甲苯氟磺胺、甲基益發靈、乙酸甲苯汞、托瑪琳 (tomarin)、苯吡唑草酮、毒殺芬、2,4,5-TP、2,3,3-TPA、TPN、肟草酮、溴氯氰菊酯、四溴菊酯、吡咯腈、右

旋反式丙烯菊酯、右旋反式苄呋菊酯、拜富寧、反式苄氯菊酯、不孕津、野麥畏 (tri-allate)、三十烷醇、三泰芬、三泰隆、氟酮磺草胺、野麥畏 (triallate)、威菌磷、抑芽唑、苯蟊嗪、嘧菌醇、醚苯磺隆、啞蚱威、葉鏽特、三吡氟草胺、triazofenamide、三唑硫磷、三唑磷 (triazothion)、咪唑吡啶、三元氯化銅、三元硫酸銅、苯磺隆、脫葉磷、三丁基氧化錫、殺草畏、水楊菌胺、trichlophenidine、三氯吡氧乙酸 (trichlopyr)、敵百蟲、異皮蠅磷-3、毒壤磷 (trichloronat)、毒壤磷 (trichloronate)、三氯三硝基苯 (Trichlorotrinitrobenzenes)、敵百蟲 (trichlorphon)、綠草定、氯啶菌酯、三甲酚、三環唑、三環己基氫氧化錫、三得芬、滅草環、草達津、蝸螺淨、三氯丙氧磷、三氟敏、三氟啶磺隆、三氟地殺吡啶、三氟殺線酯、三氟苯嘧啶、賽福座、三福隆、氟樂靈、氟胺磺隆、翠福、三氟禾草肟 (trifopsime)、賽福寧、三羥基三吡啶、2,3,5-三-碘苯甲酸、2,3,5-三碘苯甲酸、特誘酮、trimefluor、混滅威、三甲隆、三氯咪啶乙基甲醯胺 (trimorfamid)、三氯咪啶乙基甲醯胺 (trimorphamide)、抗倒酯、三苯基錫、烯蟲硫酯、弗草酮、雷公藤內酯、三唑磺草酮、草達克、殺蟲釘、滅菌唑、三氟甲磺隆、增效醛、創克考、脫葉磷 (tuoyelin)、泰勒吡氟 (tyclopyrazoflor)、umifoxolaner、烯效唑、烯效唑-P、福美甲肟、烏瑞替派、戊酸酯、維利微素、維利微素A、霜黴滅、異殺鼠酮、蚜滅多、抑黴胺、凡尼普羅、增效炔醚、滅草猛、免克寧、烯霜苄唑 (viniconazole)、維生素D3、華法林、硝蟲硫磷、辛菌胺、烯肟菌胺、烯肟菌酯、XMC、二甲苯草胺、二甲苯酚、xyloxadine、滅殺威、殺滅唑 (xymiazole)、抑食肟、氰菌胺、玉米素、增效胺、增效磷 (zengxiaolin)、ζ-氯氰菊酯、環烷酸鋅、磷化鋅、噻唑鋅 (zinc thiazole)、噻唑鋅 (zinc thiozole)、三氯酚鋅、三氯酚鋅 (zinc trichlorophenoxide)、鋅乃浦、福美鋅、左拉普磷、殺鼠靈、苯醯

菌胺、唑胺菌酯（zuojunzhi）、唑草胺（zuocaoan）、唑菌酯（zuojunzhi）、
唑嘧磺隆、1-MCP、1-甲基環丙烯、1-萘酚、1,2-二氯丙烷、1,3-D、1,3-二氯丙烯、
2iP、2M-4C、2M-4CM、2-甲氧基乙基氯化汞、2-(辛硫基)乙醇、2-苯基苯酚、
2,2,3-TPA、2,3,5-三碘苯甲酸、2,3,6-TBA、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、
2,4-DES、2,4-DP、2,4-MCPA、2,4-MCPB、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4,5-TP、2,5-二
氯苯甲酸、(3-乙氧基丙基)溴化汞、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、3,6-二氯吡啶酸、
4-胺基吡啶、4-CPA、4-CPB、4-CPP、4-羥基苯乙醇、8-羥基喹啉硫酸鹽、8-苯
基汞氧基喹啉和24-表薹素內酯。

【0041】 如本揭露中所使用的，以上每一個均是活性成分。關於更多資訊
查閱「Compendium of Pesticide Common Names [農藥通用名綱要]」中列出的材
料，網址係<https://pesticidecompendium.bcpc.org>。

【0042】 活性成分的特別較佳的選擇係氯蟲苯甲醯胺、氰蟲醯胺、氟鈴脲、
滅多威、甲氧蟲醯肼、多氟脲、草胺醯、乙基多殺菌素、多殺菌素、氟啶蟲胺脒
和三氟苯嘧啶（在下文中為「AIGA-2」）。

【0043】 另外，活性成分的另外的特別較佳的選擇係滅蟎醯、啶蟲脒、乙
醯蟲脒、阿維菌素、穀硫磷-甲基、聯苯肼酯、聯苯菊酯、西維因、克百威、蟲
蟎脒、定蟲隆、環蟲醯肼、噻蟲胺、氟氯氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、丁醚脲、
甲胺基阿維菌素苯甲酸鹽、硫丹、高氰戊菊酯、乙蟲脒、乙蟎唑、氟蟲脒、氟啶
蟲醯胺、啞蟎酯、 γ -氯氟氰菊酯、氯蟲醯肼、茚蟲威、 λ -氯氟氰菊酯、虱蟎脲、
馬拉硫磷、滅多威、氟醯脲、苄氯菊酯、啶蟲丙醚、啞蟎醚、螺蟎酯、蟲醯肼、
噻蟲啉、噻蟲吡、硫雙威、啶蟲醯胺、和 ζ -氯氰菊酯（在下文中為「AIGA-3」）。

【0044】種子處理劑單獨使用或組合使用，以解決或預防多種有害生物，疾病，營養缺乏症，並促進植物生長。該等種子處理劑可以包括殺真菌劑、殺昆蟲劑、接種劑、植物生長調節劑、肥料和肥料增強劑。目前，以下殺真菌劑可以與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用：*(R)*-粉唑醇、*(R)*-己唑醇、*(S)*-粉唑醇、*(S)*-己唑醇、10,10'-氧基雙吩啶砒、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、2,2-二溴-3-次氨基丙醯胺、2,4,5-三氯苯酚、2,4-二甲苯酚、2,5-二氯苯甲酸甲酯、2,6-二氯-*N*-((4-(三氟甲基)苯基)甲基-苯甲醯胺、24-表油菜素內酯、2-烯丙基苯酚、2-胺基丁烷、乙酸2-甲氧基乙基汞、氯化2-甲氧基乙基汞、2-苯基苯酚、8-羥基喹啉、阿拉酸式苯-*S*-甲基、阿迪味啉、噻啉菌胺、安美速、乙酸銨、碳酸銨、胺丙膦酸、敵菌靈、蔥油、福美砒、阿紫康唑、氧化福美雙、噻菌酯、多硫化鋇、精苯霜靈、精苯霜靈-M、麥鏽靈、苯菌靈、敵菌脒、苯它隆、苯噻菌胺酯、異丙基苯噻菌胺酯、苯紫氯銨、苧烯酸、異丁基苧烯酸、抑菌啉、苯甲酸、苯丙烯氟菌唑、Bethoxazin、樂殺蟎、聯苯、硫酸(雙甲基汞)、噻枯唑、雙三氯甲基砒、聯苯三唑醇、硫雙二氯酚、聯苯吡菌胺、波爾多混合物、硼酸、啞醯菌胺、糠菌唑、溴硝醇、乙噻酚磺酸酯、丁硫啞、碳酸鈣、氯化鈣、氰胺鈣、氫氧化鈣、磷酸鈣、敵菌丹、克菌丹、嗎菌威、貝芬替、萎鏽靈、環丙醯菌胺、滅蟎猛、滅瘟唑、雙胺靈、四氯化苯醌、十氯酮、苯咪唑菌、地茂散、百菌清、氯二甲苯酚、四氯喹啉、乙菌利、順式-丙環唑、氯咪巴唑、氧化銅(1)、松脂酸銅、雙(3-苯基水楊酸)銅、乙酸銅II、碳酸銅II、氯化銅II、氫氧化銅II、環烷酸銅、氯氧化銅、硫酸銅、COS-OGA、甲香菌酯、丁香菌酯、硫雜靈、福美銅氯、氰霜唑、環己醯亞胺、環氟菌胺、霜脲氰、氰菌靈、環丙唑醇、噻菌環胺、酯菌胺、棉隆、D-D、咪菌威、癸磷錫、脫氫乙酸、仲乙基雙(二硫代胺基甲酸)二胺、二溴氯丙烷、

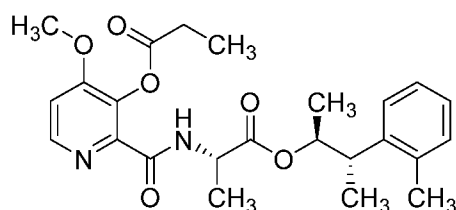
Dichlobentiazox、抑菌靈、二氯萘醌、二氯芬、苄氯三唑醇、二氯氰菌胺、達滅淨、氯硝胺、二癸基二甲基氯化銨、乙黴威、苯醚甲環唑、燕麥枯、野燕枯、二氟林、菌核淨、二甲嘧吩、烯醯味啉、二甲基二硫醚、醚菌胺、烯唑醇、烯唑醇-M、消蟎通、消蟎普、鄰敵蟎消、硝戊酯、硝辛酯、二苯胺、敵派美創、雙硫氧吡啶、四水八硼酸二鈉、磷酸二鈉、滅菌磷、二腈蔥醌、DNOC、嗎菌靈、嗎菌靈乙酸酯、多寧、敵菌酮、克瘟散、烯肱菌酯、依普座、乙環唑、代森硫、噻唑菌胺、依瑞莫、促長啉、仲乙基雙異硫氰酸酯硫化物、乙蒜素、氯化乙基汞、土菌靈、啞唑菌酮、咪唑菌酮、敵克松、烯肱菌胺、咪菌腈、芬瑞莫、芬克座、甲呋醯胺、環醯菌胺、種衣酯、氰菌胺、拌種咯、芬哌沙米、苯鏽啶、芬普福、胺苯吡菌酮、薯瘟錫、三苯錫氯、毒菌錫、福美鐵、氟吡草胺、氟啶胺、氟苯醚醯胺、氟蟎噻、咯菌腈、氟菌蟎酯、氟味啉、氟吡菌胺、氟吡胺、氟吡菌醯胺、唑呋草、三氟苯唑、氟氧雜吡乙酮、氟嘧菌酯、氟喹唑、護矽得、氟硫滅、氟噻唑菌腈、氟醯胺、粉唑醇、氟唑菌醯胺、福爾培、甲醛、福賽得、三乙膦酸鋁、麥穗寧、呋霜靈、呋霜靈-M、福拉比、氟康唑、順式氟康唑、糠醛、拌種胺、呋氧草醚、膠黴素、戊二醛、果綠定、灰黃黴素、雙胍鹽、丙烯酸喹啉酯、六氯苯、六氯酚、己唑醇、己硫磷、環菌唑、過氧化氫、惡黴靈、伊米薩利、亞胺唑、克熱淨、雙胍辛胺三乙酸酯、雙胍三辛烷基(苯基磺酸鹽)、枯瘟淨、種菌唑、艾分氟康唑、伊匹芬喹、異稻瘟淨、依普同、顯黴威、異丁酸、艾索非他米、異氟普蘭、氯草草、稻瘟靈、吡唑萘菌胺、異噻菌胺、浸種磷、克收欣、石硫合劑、代森錳銅、代森錳鋅、曼得羅賓、雙炔醯菌胺、錳乃浦、滅鏽胺、甲威苯咪、氯氟醚菌唑、嘧菌胺、滅普寧、消蟎多、氧化汞、氯化亞汞、甲霜靈、甲霜靈-M、威百畝-鉀、威百畝-鈉、間氯敵菌酮、滅特座、滅速克、呋菌胺、異硫氰酸甲酯、

甲基硫化肼、二硫氰基甲烷、代森聯、苯氧菌胺、滅芬農、噻菌胺、Metyltetraprole、黏氯酸酐、腈菌唑、米克啉、N-(3-氯-2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氫-2-側氧基-3-呋喃基)乙醯胺、鈉乃浦、雙(二甲基二硫代胺基甲酸酯)鎳、氯硝柳胺、異丙消、尼瑞莫、辛噻酮、呋醯胺、呋醯菌胺、歐殺斯、氟噻唑吡乙酮、噁唑硫、噻啉銅、富馬酸噁咪唑、氧化萎鏽靈、巴克素、石蠟油(C11-C25) (4a)、石蠟油(C11-C30) (4c)、石蠟油(C15-C30) (4b)、苯吡醇、平克座、賓克隆、氟唑菌苯胺、五氯苯酚、吡噻菌胺、過氧乙酸、乙酸苯基汞、氯化苯基汞、硝酸苯基汞、氯瘟磷、四氯苯酞、皮卡布西、啉氧菌酯、粉病靈、碳酸氫鉀、碘化鉀、磷酸鉀、硫氰酸鉀、撲殺熱、咪鮮胺、撲滅寧、普羅帕脒、霜黴威、霜黴威鹽酸鹽、普克利、甲基鋅乃浦、丙酸、丙氧喹啉、硫菌威、丙硫菌唑、氟唑菌醯脲胺、比鏽靈、唑菌胺酯、唑菌酯、吡丙炔、派拉氟胺、吡唑特、吡菌苯威、吡啉氯甲基、啉菌腈、比芬諾、嘧黴胺、丁吡咪啉、派瑞芬酮、啉菌噁唑、咯噻酮、奎諾夫林、噻氧靈、五氯硝基苯、噻森銅、氟唑環菌胺、矽噻菌胺、矽氟唑、亞砷酸鈉、碳酸鈉、碳酸氫鈉、次氯酸鈉、四硼酸鈉、甲氧吡啶乙酯、螺環菌胺、磺醯氟、硫、戊唑醇、特普弗洛奎、克枯爛、四氯硝基苯、四克利、噻苯咪唑、噻菌腈、噻呋醯胺、硫柳汞、多保淨、甲基托布津、克殺蟎、福美雙、汰敵寧、甲基脫克松、唑蟲醯胺、托普洛卡、甲苯氟磺胺、反式丙環唑、三唑酮、三唑醇、威菌磷、咪唑吡、三丁基氧化錫、水楊菌胺、氯啉菌酯、三環唑、克啉菌、呋菌酯、賽福座、賽福寧、三聚甲醛、滅菌唑、脲、霜黴滅、乙烯菌核利、氰菌胺、硼酸鋅、氧化鋅、鋅乃浦、福美鋅和苯醯菌胺，此殺真菌劑組在下文中是「FGK-1」。

【0045】 在種子處理劑中與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用的另一組較佳的殺真菌劑係嘧菌酯、苯菌靈、苯丙烯氟菌唑、聯苯吡菌胺、

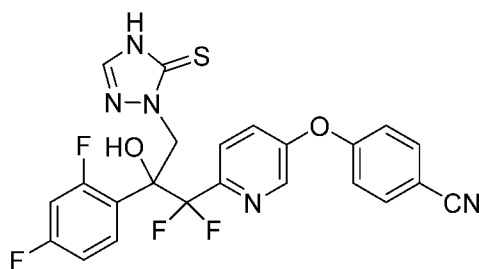
貝芬替、百菌清、霜脲氰、環丙唑醇、Dichlobentiazox、苯醚甲環唑、噻唑菌胺、噁唑菌酮、芬克座、氟吡菌醯胺、氟節唑菌胺、咯菌腈、福爾培、節吡氟西姆、種菌唑、艾分氟康唑、異氟普蘭、代森錳鋅、錳乃浦、氯氟醚菌唑、消蟎多、甲霜靈和甲霜靈-M（精甲霜靈）、氟噻唑吡乙酮、氟唑菌苯胺、氧菌酯、咪鮮胺、丙氧喹啉、丙硫菌唑、唑菌胺酯、啞氧靈、氟唑環菌胺、噻苯咪唑、福美雙、三環唑和肟菌酯，此殺菌劑組在下文中是「FGK-2」。

【0046】 以下兩種殺真菌劑分子也較佳的是與化合物1的多晶型形式A和B（本文揭露的）一起使用；



(2S,3S)-3-(鄰甲苯基)丁-2-基 (4-甲氧基-3-(丙醯氧基)吡啶甲醯基)-L-丙胺酸酯

下文中是「FGK-3」；以及



4-((6-(2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4,5-二氫-1H-1,2,4-三唑-1-基)

丙基)吡啶-3-基)氧基)苯甲腈

下文中是「FGK-4」。

【0047】 在WO 2019173665中以化合物編號278描述了FGK-3，並且在WO 2016187201實例2中描述了FGK-4。

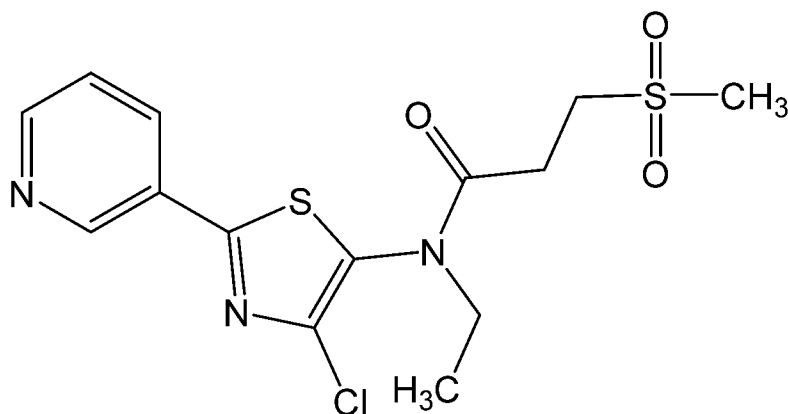
【0048】術語「場所」意指有害生物正在生長、可能生長、或可能經過的棲息地、育種地、植物、種子、土壤、材料、或環境。例如，場所包括但不限於作物、樹木、果實、穀物、飼料物種、藤蔓、草坪和/或觀賞植物生長的區域；家畜居住的地方；建築物的內部或外部表面（諸如儲存穀物的地方）；建築物中使用的裡面和周圍建築材料（諸如浸漬木材）；和建築物周圍的土壤。

【0049】短語「MoA材料」意指具有如在IRAC MoA分類v. 10.3（位於irac-online.org.）中指示的作用方式（「MoA」）的活性成分。

【0050】短語「殺有害生物有效量」意指對有害生物實現可觀測的作用所需的殺有害生物劑的量，該作用例如壞死、死亡、阻滯、預防、消除、摧毀、或在其他方面減少有害生物在場所中的出現和/或活性的作用。當有害生物群體從場所被驅逐、有害生物在場所中或周圍喪失能力、和/或有害生物在場所中或周圍被根除時，這種作用可以出現。當然，可出現該等作用的組合。通常，有害生物群體、活性或兩者都希望降低多於50百分比，較佳的是多於90百分比，並且最較佳的是多於99百分比。通常，用於農業目的的殺有害生物有效量為約0.0001克/公頃至約5000克/公頃，較佳的是約0.0001克/公頃至約500克/公頃，並且甚至更較佳的是約0.0001克/公頃至約50克/公頃。

【發明內容】

【0051】在一個方面，本揭露提供了由下式表示的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的一種或多種結晶形式



【0052】 在一個實施方式中，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的一種或多種結晶形式。

【0053】 在另一個實施方式中，*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的一種或多種結晶形式係無水和無溶劑結晶多晶型形式。

【0054】 在另一個實施方式中，一種或多種結晶形式係化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）。

【0055】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 $19.9 \pm$

0.2、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0056】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 和 24.7 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式

中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、和 24.7 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、和 26.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2

± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。

【0057】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 28.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 $16.0 \pm$

0.2、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、和 28.6 ± 0.2 處的峰。

【0058】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在與圖1或圖2所示基本相同的繞射角（ 2θ ）處的峰。

【0059】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰和 $= 75.707 \text{ J/g}$ 或與圖4基本相同的熔化熱。

【0060】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖6所示基本相同的波數處的峰。

【0061】 在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式A之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式A還包含（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰；和/或低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含

在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式A之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式A還包含與圖4基本相同的DSC熱譜圖和/或包含與圖6所示基本相同的波數處的峰的低頻拉曼光譜。

【0062】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具

有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0063】在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、和 24.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、和 24.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在

繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、和 31.1 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、

17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。

【0064】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 20.9 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 20.9 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 22.9 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 27.0 ± 0.2 、 31.1 ± 0.2 、和 33.4 ± 0.2 處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.5 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 20.9 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 22.9 ± 0.2 、 24.1 ± 0.2 、 25.8 ± 0.2 、 26.1 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、

27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為7.7 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.3 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.5 ± 0.2、19.8 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.8 ± 0.2、22.9 ± 0.2、24.1 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、31.1 ± 0.2、和33.4 ± 0.2處的峰。

【0065】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在與圖3所示基本相同的繞射角（2θ）處的峰。

【0066】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約105.24°C的峰值溫度的吸熱峰和 = 92.879 J/g或與圖5基本相同的熔化熱。

【0067】 在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約266 cm⁻¹、約446 cm⁻¹、約546 cm⁻¹、約763 cm⁻¹、約987 cm⁻¹、約1044 cm⁻¹、約1137 cm⁻¹、約1187 cm⁻¹和約1308 cm⁻¹、約1518 cm⁻¹、約1573 cm⁻¹、約1592 cm⁻¹、約1673 cm⁻¹、約2919 cm⁻¹、和約2937 cm⁻¹處的一個或多個峰。在另一個實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖7所示基本相同的波數處的峰。

【0068】 在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式B之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式B還包含（DSC）熱譜圖，該熱譜圖包含具有在約105.24°C的峰值溫度的吸熱峰；和/或低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在波數為約266 cm⁻¹、約446 cm⁻¹、約546 cm⁻¹、約763 cm⁻¹、約987 cm⁻¹、約

1044 cm^{-1} 、約1137 cm^{-1} 、約1187 cm^{-1} 和約1308 cm^{-1} 、約1518 cm^{-1} 、約1573 cm^{-1} 、約1592 cm^{-1} 、約1673 cm^{-1} 、約2919 cm^{-1} 、和約2937 cm^{-1} 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，結合如本文所述之結晶多晶型形式B之任何粉末X射線繞射圖，結晶多晶型形式B還包含與圖5基本相同的DSC熱譜圖和/或包含與圖7所示基本相同的波數處的峰的低頻拉曼光譜。

【0069】 本揭露進一步提供了一種包含化合物1的多晶型形式A和B中的一種或多種的組成物。

【0070】 在另一方面，本揭露提供了一種防治有害生物之方法，所述方法包括向場所應用殺有害生物有效量的如本文所述之*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式A和B中的一種或多種、或包含如本文所述之*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的多晶型形式A和B中的一種或多種的組成物。

【0071】 在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：螞蟻、蚜蟲、臭蟲（bed bug）、甲蟲、蛀蟲、毛毛蟲、蟑螂、蟋蟀、蠼蠋、跳蚤、蒼蠅、草蜢、蛆、葉跳蟲（leafhoppers）、虱、蝗蟲、蛆蟲、蟎、線蟲、飛虱（planthopper）、木虱、葉蜂、介殼蟲、蠹蟲、蛞蝓、蝸牛、蜘蛛、跳蟲、椿象、綜合綱、白蟻、薊馬、扁虱、黃蜂、粉虱和鐵線蟲。在一些實施方式中，所述有害生物係取食汁液的有害生物或咀嚼有害生物。

【0072】 在一些實施方式中，所述有害生物來自半翅目、縷翅目、鱗翅目等。

【0073】 在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：球蚜屬物種（*Adelges spp.*）、白輪盾介殼蟲屬物種（*Aulacaspis spp.*）、沫

蟬屬物種 (*Aphrophora* spp.)、蚜屬物種 (*Aphis* spp.)、小粉虱屬物種 (*Bemisia* spp.)、蠟介殼蟲屬物種 (*Ceroplastes* spp.)、雪盾介殼蟲屬物種 (*Chionaspis* spp.)、褐圓盾介殼蟲屬物種 (*Chrysomphalus* spp.)、軟介殼蟲屬物種 (*Coccus* spp.)、小綠葉蟬屬物種 (*Empoasca* spp.)、美洲蝽屬物種 (*Euschistus* spp.)、牡蠣介殼蟲屬物種 (*Lepidosaphes* spp.)、蝽屬物種 (*Lagynotomus* spp.)、草盲蝽屬物種 (*Lygus* spp.)、長管蚜屬物種 (*Macrosiphum* spp.)、黑尾葉蟬屬物種 (*Nephotettix* spp.)、稻綠蝽屬物種 (*Nezara* spp.)、褐飛虱屬物種 (*Nilaparvata* spp.)、長沫蟬屬物種 (*Philaenus* spp.)、植盲蝽屬物種 (*Phytocoris* spp.)、壁蝽屬物種 (*Piezodorus* spp.)、臀紋粉介殼蟲屬物種 (*Planococcus* spp.)、粉介殼蟲屬物種 (*Pseudococcus* spp.)、縊管蚜屬物種 (*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔介殼蟲屬物種 (*Saissetia* spp.)、彩斑蚜屬物種 (*Therioaphis* spp.)、龜紋蠟介殼蟲屬物種 (*Toumeyella* spp.)、桔蚜屬物種 (*Toxoptera* spp.)、粉虱屬物種 (*Trialeurodes* spp.)、錐蝽屬物種 (*Triatoma* spp.) 和矢尖介殼蟲屬物種 (*Unaspis* spp.)。

【0074】在此方面的一些實施方式中，有害生物選自由以下組成之群組：擬綠蝽 (*Acrosternum hilare*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、歐洲甘藍粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、螺旋粉虱 (*Aleurodicus dispersus*)、橘綿粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、棉葉蟬 (*Amrasca biguttula biguttula*)、紅圓蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黑豆蚜 (*Aphis fabae*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、蘋果黃蚜 (*Aphis pomi*)、茄粗額蚜 (*Aulacorthum solani*)、馬鈴薯木虱 (*Bactericera cockerelli*)、采蝽 (*Bagrada hilaris*)、銀葉粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、煙粉虱 (*Bemisia tabaci*)、麥長蝽 (*Blissus leucopterus*)、箱子長輩臭蟲 (*Boisea trivittata*)、天門冬小管蚜 (*Brachycorynella asparagi*)、粉介殼蟲 (*Brevennia rehi*)、甘藍

蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、梨木虱 (*Cacopsylla pyri*)、梨黃木虱 (*Cacopsylla pyricola*)、馬鈴薯盲蝽 (*Calocoris norvegicus*)、紅蠟蚧 (*Ceroplastes rubens*)、熱帶臭蟲 (*Cimex hemipterus*)、溫帶臭蟲 (*Cimex lectularius*)、橘軟蠟蚧 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、法思圖盲蝽 (*Dagbertus fasciatus*)、綠腹蝽 (*Dichelops furcatus*)、麥雙尾蚜 (*Diuraphis noxia*)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、車前圓尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、棉黑翅紅蝽 (*Dysdercus suturellus*)、棕翅臭蟲 (*Edessa meditabunda*)、假眼小綠葉蟬 (*Empoasca vitis*)、蘋果綿蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、雅致斑葉蟬 (*Erythroneura elegantula*)、歐扁盾蝽 (*Eurygaster maura*)、斑點美洲蝽 (*Euschistus conspersus*)、英雄美洲蝽 (*Euschistus heros*)、褐蝽 (*Euschistus servus*)、茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*)、安妥角盲蝽 (*Helopeltis antonii*)、桃粉大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、安妥角盲蝽、茶盲蝽 (*Helopeltis theivora*)、吹綿蚧 (*Icerya purchasi*)、檬果褐葉蟬 (*Idioscopus nitidulus*)、茶小綠葉蟬 (*Jacobiasca formosana*)、灰飛虱 (*Laodelphax striatellus*)、水土堅蚧 (*Lecanium corni*)、大稻緣蝽 (*Leptocorisa oratorius*)、異稻緣蝽 (*Leptocorisa varicornis*)、豆莢草盲蝽 (*Lygus hesperus*)、桑粉介殼蟲 (*Maconellicoccus hirsutus*)、馬鈴薯長管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、麥長管蚜 (*Macrosiphum granarium*)、薔薇長管蚜 (*Macrosiphum rosae*)、翠菊葉蟬 (*Macrosteles quadrilineatus*)、覆盆子沫蟬 (*Mahanarva frimbiolata*)、篩豆龜蝽 (*Megacopta cribraria*)、麥無網長管蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、長角緣蝽 (*Mictis longicornis*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、萵苣蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、黑尾葉蟬 (*Nephotettix cincticeps*)、長盲蝽 (*Neurocolpus longirostris*)、稻綠蝽 (*Nezara viridula*)、褐飛虱 (*Nilaparvata lugens*)、木瓜粉蚧 (*Paracoccus marginatus*)、

馬鈴薯木虱 (*Paratrioza cockerelli*)、糠片盾蚧 (*Parlatoria pergandii*)、黑片盾蚧 (*Parlatoria ziziphi*)、玉米花翅飛虱 (*Peregrinus maidis*)、葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera vitifoliae*)、去杉球蚧 (*Physokermes piceae*)、加州植盲蝽 (*Phytocoris californicus*)、親植盲蝽 (*Phytocoris relativus*)、蓋氏壁蝽 (*Piezodorus guildinii*)、橘臀紋粉蚧 (*Planococcus citri*)、榕臀紋粉蚧 (*Planococcus ficus*)、四紋盲蝽 (*Poecilocapsus lineatus*)、越橘盲蝽 (*Psallus vaccinicola*)、鱷梨花邊蟲 (*Pseudacysta perseae*)、鳳梨潔粉蚧 (*Pseudococcus brevipes*)、梨笠圓盾蚧 (*Quadraspidiotus perniciosus*)、玉米蚜蟲 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、欖珠蠟蚧 (*Saissetia oleae*)、栗盾蝽 (*Scaptocoris castanea*)、麥二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、麥長管蚜 (*Sitobion avenae*)、白背飛虱 (*Sogatella furcifera*)、溫室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、結翅粉虱 (*Trialeurodes abutiloneus*)、柑橘矢尖蚧 (*Unaspis yanonensis*)、和恩特那葉蟬 (*Zulia entrerriana*)。

【0075】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：巢針薊馬屬物種 (*Caliothrips* spp.)、花薊馬屬物種 (*Frankliniella* spp.)、硬薊馬屬物種 (*Scirtothrips* spp.)、和薊馬屬物種 (*Thrips* spp.)。

【0076】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：六點薊馬 (*Caliothrips phaseoli*)、雙刺花薊馬 (*Frankliniella bispinosa*)、煙草褐薊馬 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬 (*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花薊馬 (*Frankliniella schultzei*)、東方花薊馬 (*Frankliniella tritici*)、玉米薊馬 (*Frankliniella williamsi*)、溫室薊馬 (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、腹鉤薊馬 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、柑桔硬薊馬 (*Scirtothrips citri*)、茶黃薊馬 (*Scirtothrips dorsalis*)、錘角帶薊馬 (*Taeniothrips rhopalantennalis*)、黃胸薊

馬 (*Thrips hawaiiensis*)、豆黃薊馬 (*Thrips nigropilosus*)、東方薊馬 (*Thrips orientalis*)、南黃薊馬 (*Thrips palmi*) 和煙薊馬 (*Thrips tabaci*)。

【0077】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：卷葉蛾屬物種 (*Adoxophyes spp.*)、地老虎屬物種 (*Agrotis spp.*)、帶卷蛾屬物種 (*Argyrotaenia spp.*)、卷葉蛾屬物種 (*Cacoecia spp.*)、麗細蛾屬物種 (*Caloptilia spp.*)、水稻螟蟲屬物種 (*Chilo spp.*)、鏤紋夜蛾屬物種 (*Chrysodeixis spp.*)、豆粉蝶屬物種 (*Colias spp.*)、草螟屬物種 (*Crambus spp.*)、絹野螟屬物種 (*Diaphania spp.*)、螟屬物種 (*Diatraea spp.*)、鑽夜蛾屬物種 (*Earias spp.*)、粉斑螟屬物種 (*Ephestia spp.*)、尺蠖蛾屬物種 (*Epimecis spp.*)、髒切夜蛾屬物種 (*Feltia spp.*)、角劍夜蛾屬物種 (*Gortyna spp.*)、鈴夜蛾屬物種 (*Helicoverpa spp.*)、實夜蛾屬物種 (*Heliothis spp.*)、根蠹屬物種 (*Indarbela spp.*)、潛夜細蛾屬物種 (*Lithocolletis spp.*)、切根蟲屬物種 (*Loxagrotis spp.*)、天幕毛蟲屬物種 (*Malacosoma spp.*)、穀蛾屬物種 (*Nemapogon spp.*)、疆夜蛾屬物種 (*Peridroma spp.*)、小潛細蛾屬物種 (*Phyllonorycter spp.*)、黏蟲屬物種 (*Pseudaletia spp.*)、菜蛾屬物種 (*Plutella spp.*)、蛀莖夜蛾屬物種 (*Sesamia spp.*)、夜盜蛾屬物種 (*Spoaoptera spp.*)、透翅蛾屬物種 (*Synanthedon spp.*) 和巢蛾屬物種 (*Yponomeuta spp.*)。

【0078】在此方面的一些實施方式中，所述有害生物選自由以下組成之群組：飛揚阿夜蛾 (*Achaea janata*)、棉褐帶卷蛾 (*Adoxophyes orana*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、棉葉波紋葉蛾 (*Alabama argillacea*)、鱧梨楔卷蛾 (*Amorbia cuneana*)、臍橙螟蛾 (*Amyelois transitella*)、棕斑灰蛾 (*Anacamptodes defectaria*)、桃條麥蛾 (*Anarsia lineatella*)、黃麻橋夜蛾 (*Anomis sabulifera*)、黎豆夜蛾

(*Anticarsia gemmatalis*)、果樹黃卷蛾(*Archips argyrospila*)、玫瑰黃卷蛾(*Archips rosana*)、桔帶卷蛾(*Argyrotaenia citrana*)、伽馬紋夜蛾(*Autographa gamma*)、蘋果小卷葉蛾(*Bonagota cranaodes*)、禾弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、煙捲蛾(*Capua reticulana*)、桃小食心蟲(*Carposina niponensis*)、橫線尾夜蛾(*Chlumetia transversa*)、薔薇斜條卷葉蛾(*Choristoneura rosaceana*)、稻縱卷葉螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、可可細蛾(*Conopomorpha cramerella*)、米蛾(*Corcyracephalonica*)、芳香木蠹蛾(*Cossus cossus*)、胡桃小卷蛾(*Cydia caryana*)、李小食心蟲(*Cydia funebrana*)、梨小食心蟲(*Cydia molesta*)、豌豆小卷蛾(*Cydia nigricana*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、蓴麻毛蟲(*Darna diducta*)、黃瓜絹野螟(*Diaphanianitidalis*)、小蔗桿草螟(*Diatraea saccharalis*)、西南玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、埃和鑽夜蛾(*Earias insulana*)、翠紋鑽夜蛾(*Earias vittella*)、橙色小卷蛾(*Ecdytolopha aurantianum*)、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、粉斑螟(*Ephestia cautella*)、煙草粉斑螟(*Ephestia elutella*)、地中海斑螟(*Ephestia kuehniella*)、菜豆小卷蛾(*Epinotia aporema*)、蘋淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、香蕉弄蝶(*Erionota thrax*)、鹽澤燈蛾(*Estigmene acrea*)、葡萄螟蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、原切根蟲(*Euxoa auxiliaris*)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、東方果實蛾(*Grapholita molesta*)、三紋螟蛾(*Hedylepta indicata*)、棉鈴蟲(*Helicoverpa armigera*)、玉米穗蟲(*Helicoverpa zea*)、美洲煙葉蛾(*Heliothis virescens*)、菜螟(*Hellula undalis*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、茄黃斑螟(*Leucinodes orbonalis*)、咖啡點潛蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛蛾(*Leucoptera malifoliella*)、葡萄漿果小卷蛾(*Lobesia botrana*)、豆白隆切根蟲(*Loxagrotis albicosta*)、舞毒蛾(*Lymantria*

dispar)、窄翅潛葉蛾 (*Lyonetia clerkella*)、油棕櫚結草蟲 (*Mahasena corbetti*)、甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、煙草天蛾 (*Manduca sexta*)、豆莢野螟 (*Maruca testulalis*)、袋蛾 (*Metisa plana*)、秘夜蛾黏蟲 (*Mythimna unipuncta*)、番茄草螟蛾 (*Neoleucinodes elegantalis*)、稻三點螟 (*Nymphula depunctalis*)、冬尺蠖蛾 (*Operophtera brumata*)、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、*Oxydiavesulia*、葡萄褐卷蛾 (*Pandemis cerasana*)、蘋褐卷蛾 (*Pandemis heparana*)、非洲達摩鳳蝶 (*Papilio demodocus*)、紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*)、豆雜角夜蛾 (*Peridroma saucia*)、咖啡潛葉蛾 (*Perileucoptera coffeella*)、馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella*)、柑橘潛葉蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、斑幕潛葉蛾 (*Phyllonorycter blancardella*)、菜粉蝶 (*Pieris rapae*)、苜蓿綠夜蛾 (*Plathypena scabra*)、蘋果芽小卷蛾 (*Platynota idaeusalis*)、印度穀螟 (*Plodia interpunctella*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、漿果小卷蛾 (*Polychrosis viteana*)、桔果巢蛾 (*Prays endocarpa*)、油橄欖巢蛾 (*Prays oleae*)、一星黏蟲 (*Pseudaletia unipuncta*)、大豆尺夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*)、三化螟 (*Scirpophaga incertulas*)、大螟 (*Sesamia inferens*)、莖螟 (*Sesamia nonagrioides*)、蕁麻毛蟲 (*Setora nitens*)、麥蛾 (*Sitotroga cerealella*)、葡萄長須卷葉蛾 (*Sparganothis pilleriana*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、草地貪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、亞熱帶黏蟲 (*Spodoptera eridania*)、鳳梨鑽心蟲 (*Thecla basilides*)、袋穀蛾 (*Tinea pellionella*)、衣蛾 (*Tineola bisselliella*)、粉紋夜蛾 (*Trichoplusia ni*)、番茄斑潛蠅 (*Tuta absoluta*)、咖啡木蠹蛾 (*Zeuzera coffeae*) 和梨豹蠹蛾 (*Zeuzera pyrina*)。

【0079】已經出乎意料地發現，本文所述之化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）影響成蟲甘薯粉虱（煙粉虱）的行為、神經和肌肉功能，其方式與影響本文先前所述之弦音器官的殺昆蟲劑一致。在與先前已知的化合物1的非結晶形式（無定形油）的直接比較中，出乎意料地發現本文所述之化合物1的結晶多晶型形式A和B（在本文中分別被稱為多晶型形式A和多晶型形式B）出人意料地誘發了昆蟲的明顯更大的敲低，這在對影響弦音器官的先前殺昆蟲劑的先前研究中已被證明與死亡率有關。

【0080】本揭露之另外的實施方式、特徵和優點從以下詳細說明和藉由本揭露之實踐將是清楚的。本揭露之化合物可描述為以下列舉條款中的任一項的實施方式。應當理解，本文所述之任何實施方式都可以結合本文所述之任何其他實施方式使用，只要該等實施方式彼此不矛盾。

【0081】1. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶形式。

【0082】2. 如實施方式1所述之結晶形式，其中該結晶形式係*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型物。

【0083】3. 如實施方式1或2所述之結晶多晶型物，其中該結晶形式係無水或無溶劑的。

【0084】4. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式A，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0085】 5. 如實施方式4所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0086】 6. 如實施方式4或5所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0087】 7. 如實施方式4至6中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0088】 8. 如實施方式4至7中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0089】 9. 如實施方式4至8中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0090】 10. 如實施方式4至9中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0091】 11. 如實施方式4至10中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）

為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0092】 12.如實施方式4至11中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0093】 13.如實施方式4至12中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、和 20.3 ± 0.2 處的峰。

【0094】 14.如實施方式4至13中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖1或圖2所示基本相同的一個或多個峰。

【0095】 15.如實施方式4至14中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約 101.09°C 的峰值溫度的吸熱峰。

【0096】 16.如實施方式4至15中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖4基本相同的DSC熱譜圖。

【0097】 17.如實施方式4至16中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約 255 cm^{-1} 、約 441 cm^{-1} 、約 539 cm^{-1} 、約 778 cm^{-1} 、約 921 cm^{-1} 、約 991 cm^{-1} 、約 1048 cm^{-1} 、約 1123 cm^{-1} 、約 1191 cm^{-1} 、

約 1526 cm^{-1} 、約 1569 cm^{-1} 、約 1588 cm^{-1} 、約 1701 cm^{-1} 、約 2949 cm^{-1} 和約 3053 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【0098】 18.如實施方式4至17中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖6所示基本相同的波數處的峰。

【0099】 19. 一種*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的結晶多晶型形式B，其具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 15.4 ± 0.2 處的峰。

【0100】 20. 如實施方式19所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 和 15.4 ± 0.2 處的峰。

【0101】 21. 如實施方式19或20所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0102】 22. 如實施方式19至21中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0103】 23. 如實施方式19至22中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0104】 24. 如實施方式19至23中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0105】 25. 如實施方式19至24中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2 θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0106】 26. 如實施方式19至25中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2 θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0107】 27. 如實施方式19至26中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2 θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0108】 28. 如實施方式19至27中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角(2 θ)為 7.7 ± 0.2 、 15.0 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.3 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、 19.8 ± 0.2 、和 20.2 ± 0.2 處的峰。

【0109】 29. 如實施方式19至28中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含與圖3所示基本相同的一個或多個峰。

【0110】 30. 如實施方式19至29中任一項所述之結晶多晶型形式，其中該結晶多晶型形式具有DSC熱譜圖，該DSC熱譜圖包含具有在約 105.24°C 的峰值溫度的吸熱峰。

【0111】 31. 如實施方式19至30中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有與圖5基本相同的DSC熱譜圖。

【0112】 32. 如實施方式19至31中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有拉曼光譜，該拉曼光譜包含在波數為約 266 cm^{-1} 、約 446 cm^{-1} 、約 546 cm^{-1} 、約 763 cm^{-1} 、約 987 cm^{-1} 、約 1044 cm^{-1} 、約 1137 cm^{-1} 、約 1187 cm^{-1} 和約 1308 cm^{-1} 、約 1518 cm^{-1} 、約 1573 cm^{-1} 、約 1592 cm^{-1} 、約 1673 cm^{-1} 、約 2919 cm^{-1} 、和約 2937 cm^{-1} 處的一個或多個峰。

【0113】 33. 如實施方式19至32中任一項所述之結晶多晶型形式，其具有低頻拉曼光譜，該低頻拉曼光譜包含在與圖7所示基本相同的波數處的峰。

【0114】 34. 一種組成物，其包含根據實施方式1所述之結晶形式或根據實施方式2至33中任一項所述之結晶多晶型形式。

【0115】 35. 一種防治有害生物之方法，所述方法包括向場所應用殺有害生物有效量的根據實施方式1所述之結晶形式、根據實施方式2至33中任一項所述之結晶多晶型形式、或根據實施方式34所述之組成物。

【圖式簡單說明】

【0116】 [圖1]示出了如實例1中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之粉末X射線繞射圖。

【0117】 [圖2]示出了如實例2中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之粉末X射線繞射圖。

【0118】 [圖3]示出了如實例5中製備的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之粉末X射線繞射圖。

【0119】 [圖4]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖。

【0120】 [圖5]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之差示掃描量熱法（DSC）熱譜圖。

【0121】 [圖6]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式A）之拉曼光譜。

【0122】 [圖7]示出了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（無溶劑且無水）的結晶形式（多晶型形式B）之拉曼光譜。

【0123】 [圖8]係示出了敲低實驗的對照處理之圖，它記錄了隨時間的推移丙酮溶劑空白對照瓶中2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0124】 [圖9]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用25 g/ha的化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，各自來自丙酮溶劑，並記錄了多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0125】 [圖10]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用2.5 g/ha的化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，

各自來自丙酮溶劑，並記錄了多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0126】 [圖11]係示出了敲低實驗的對照處理之圖，它記錄了隨時間的推移己烷溶劑空白對照瓶中2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0127】 [圖12]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用25 g/ha的化合物1多晶型形式A、化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，各自來自己烷反溶劑懸浮液，並記錄了多晶型A小瓶（◆）、多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0128】 [圖13]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用2.5 g/ha的化合物1多晶型形式A、化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，各自來自己烷反溶劑懸浮液，並記錄了多晶型A小瓶（◆）、多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【0129】 [圖14]係示出了敲低實驗的結果之圖，其中將成蟲粉虱煙粉虱置於用0.25 g/ha的化合物1多晶型形式A、化合物1多晶型形式B或化合物1非結晶無定形油預處理的小瓶中，各自來自己烷反溶劑懸浮液，並記錄了多晶型A小瓶（◆）、多晶型B小瓶（●）或非結晶無定形油小瓶（■）中隨時間的推移2 cm線以上的煙粉虱成蟲的百分比。

【實施方式】

【0130】在進一步描述本揭露之前，應理解本揭露並不限於所描述的具體實施方式，因為該等實施方式當然可以變化。還應當理解，本文使用的術語僅是為了描述具體實施方式之目的，而並不旨在是限制性的，因為本揭露之範圍僅由所附請求項限定。

【0131】除非另外定義，本文所用的全部技術術語和科學術語具有與本揭露所屬領域的普通技術人員通常所理解的相同意義。本文中提及的所有專利、申請、公佈的申請和其他公佈均藉由引用以其全文併入。如果本部分中闡述的定義與藉由引用併入本文的專利、申請或其他公佈中闡述的定義相反或不一致，則本部分中闡述的定義優先於藉由引用併入本文的定義。

【0132】除非上下文另外明確指示，否則本文和所附請求項中所使用的單數形式「一個/一種 (a/an)」和「該/該等 (the)」包括複數指示物。還需注意的是，申請專利範圍可以經撰寫而排除任何視需要的要素。因此，此陳述旨在作為使用與請求項要素的敘述有關的排他性術語如「單獨」、「僅」等或使用「否定型」限定的前提基礎。

【0133】下面詳細描述化合物1的多晶型形式和用於製備化合物1之方法。在一些實施方式中，化合物1的無定形形式可以根據國際專利公佈案號WO 2010/139497 A1和美國專利號8,350,044中描述之方法製備，該等專利以其全文藉由援引併入本文。

【0134】已根據本文所述之方法製備了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的獨特物理形式，多晶型形式A。多晶型形式A的粉末X射線繞射 (PXRD) 圖在圖1中示出，其中相應的清單數據在表1中示出。

[表1]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
10.18	8.6823	348.6	m
10.62	8.3236	649.5	s
13.24	6.6818	56.2	vw
15.98	5.5417	331.4	m
16.68	5.3107	134.5	w
17.48	5.0694	686.4	s
17.92	4.9459	262	m
18.2	4.8704	378.7	m
18.7	4.7413	396.1	m
18.96	4.6769	203.9	w
19.96	4.4448	746.3	vs
20.36	4.3583	1000	vs
21.08	4.2111	246.9	w
21.74	4.0847	190.2	w
22.86	3.8871	189	w
23.14	3.8406	141.3	w
23.96	3.711	268.8	m
24.72	3.5986	765.1	vs
25.34	3.512	450	m
25.74	3.4583	99.4	vw
26.7	3.3361	598.7	s
28.16	3.1664	390.1	m
28.74	3.1038	265.7	m
32.16	2.7811	138.1	w
32.98	2.7138	97.9	vw

* S = 強（> 50%相對強度），M = 中等（20%-50%相對強度），W = 弱（< 20%相對強度）

【0135】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（2θ）為10.2 ± 0.2、10.6 ± 0.2、13.2 ± 0.2、16.0 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.5 ± 0.2、17.9 ± 0.2、18.2 ± 0.2、18.7 ± 0.2、19.0 ± 0.2、20.0 ± 0.2、20.4 ± 0.2、21.1 ± 0.2、21.7 ± 0.2、22.8 ± 0.2、23.1 ± 0.2、24.0 ± 0.2、24.7 ± 0.2、25.3 ± 0.2、25.7 ± 0.2、26.7 ± 0.2、28.2 ± 0.2、28.7 ± 0.2、32.2

± 0.2 、和 33.0 ± 0.2 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物 1 的結晶多晶型形式 A 具有粉末 X 射線繞射圖，該粉末 X 射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為 10.2 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 13.2 ± 0.1 、 16.0 ± 0.1 、 16.7 ± 0.1 、 17.5 ± 0.1 、 17.9 ± 0.1 、 18.2 ± 0.1 、 18.7 ± 0.1 、 19.0 ± 0.1 、 20.0 ± 0.1 、 20.4 ± 0.1 、 21.1 ± 0.1 、 21.7 ± 0.1 、 22.8 ± 0.1 、 23.1 ± 0.1 、 24.0 ± 0.1 、 24.7 ± 0.1 、 25.3 ± 0.1 、 25.7 ± 0.1 、 26.7 ± 0.1 、 28.2 ± 0.1 、 28.7 ± 0.1 、 32.2 ± 0.1 、和 33.0 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物 1 的結晶多晶型形式 A 具有粉末 X 射線繞射圖，該粉末 X 射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角 (2θ) 處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表 1 中提供的繞射角 (2θ) 在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0136】 在一些實施方式中，已根據本文所述之方法製備了 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的相同物理形式，如圖 1 和表 1 所示，多晶型形式 A，其中該材料可以使用如本文所述之再結晶技術，諸如使用多晶型形式 A 的晶種、多次結晶/再結晶方法等，以更高的純度製備。熟悉該項技術者將理解，使用此類技術提供更高純度的結晶材料可以在粉末 X 射線繞射 (PXRD) 分析中提供更高的解析度。使用此類技術獲得更高純度的材料，並且從而獲得更高品質的粉末 X 射線繞射 (PXRD) 分析的多晶型形式 A 的粉末 X 射線繞射 (PXRD) 圖，如圖 2 所示，其中相應的清單數據在表 2 中示出。熟悉該項技術者將理解，表 2 所示的 PXRD 數據在表 1 提供的數據的實驗誤差範圍內，並且圖 2 所示的更高解析度的 PXRD 圖提供了增強的識別 PXRD 圖中緊密間隔的峰的能力，該等峰在圖 1 所示的 PXRD 圖中以前是不可見的。

[表2]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
9.94	8.8988	260.9	m
10.12	8.7337	353.9	m
10.6	8.3392	726.5	s
10.86	8.1469	228.2	w
13.15	6.7329	121	w
15.6	5.6758	121.1	w
15.94	5.5555	365.7	m
16.62	5.3297	191.1	w
17.42	5.0867	777.7	s
17.86	4.9665	256.2	m
18.16	4.8811	529.1	s
18.66	4.7514	393.9	m
18.9	4.6916	279.3	m
19.9	4.458	739	m
20.32	4.3668	1000	vs
21.04	4.219	309.3	m
21.3	4.1715	149	w
21.68	4.0959	195.3	w
21.78	4.0807	169.7	w
22.8	3.8971	223.9	w
23.08	3.8505	219.7	w
23.28	3.821	118.6	w
23.92	3.7171	277.1	m
24.66	3.6072	943.3	vs
25.28	3.5202	478	m
25.72	3.4609	175.6	w
26.16	3.4037	165.8	w
26.64	3.3435	749.4	vs
28.1	3.173	516.8	s
28.64	3.1144	294.4	m
28.84	3.0932	147.3	w
32.1	2.7861	226.4	w
32.9	2.7202	201.6	w

* S = 強（> 50%相對強度），M = 中等（20%-50%相對強度），W = 弱（< 20%相對強度）

【0137】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.2 、 10.1 ± 0.2 、 10.6 ± 0.2 、 10.9 ± 0.2 、 13.2 ± 0.2 、 15.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 17.9 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.2 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、 20.3 ± 0.2 、 21.0 ± 0.2 、 21.3 ± 0.2 、 21.7 ± 0.2 、 21.8 ± 0.2 、 22.8 ± 0.2 、 23.1 ± 0.2 、 23.3 ± 0.2 、 23.9 ± 0.2 、 24.7 ± 0.2 、 25.3 ± 0.2 、 25.7 ± 0.2 、 26.2 ± 0.2 、 26.6 ± 0.2 、 28.1 ± 0.2 、 28.6 ± 0.2 、 28.8 ± 0.2 、 32.1 ± 0.2 、和 32.9 ± 0.2 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 10.0 ± 0.1 、 10.1 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 10.9 ± 0.1 、 13.2 ± 0.1 、 15.6 ± 0.1 、 16.0 ± 0.1 、 16.6 ± 0.1 、 17.4 ± 0.1 、 17.9 ± 0.1 、 18.2 ± 0.1 、 18.7 ± 0.1 、 18.9 ± 0.1 、 19.9 ± 0.1 、 20.3 ± 0.1 、 21.0 ± 0.1 、 21.3 ± 0.1 、 21.7 ± 0.1 、 21.8 ± 0.1 、 22.8 ± 0.1 、 23.1 ± 0.1 、 23.3 ± 0.1 、 23.9 ± 0.1 、 24.7 ± 0.1 、 25.3 ± 0.1 、 25.7 ± 0.1 、 26.2 ± 0.1 、 26.6 ± 0.1 、 28.1 ± 0.1 、 28.6 ± 0.1 、 28.8 ± 0.1 、 32.1 ± 0.1 、和 32.9 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式A具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角（ 2θ ）處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表2中提供的繞射角（ 2θ ）在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0138】 結晶多晶型形式A的DSC熱譜圖在圖4中示出。已經確定，在如實例10所述之DSC方法過程中，多晶型形式A在約 101.09°C 下熔化並且熔化熱 = 75.707 J/g ，如圖4所示。

【0139】 結晶多晶型形式A之拉曼光譜在圖6中示出。

【0140】 已根據本文所述之方法製備了*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺的獨特物理形式（無溶劑且無水），多晶型形式B。多晶型形式B的粉末X射線繞射（PXRD）圖在圖3中示出，其中相應的清單數據在表3中示出。

[表3]

2θ（度）	晶面間距（Å）	相對峰值高度	定性強度
7.72	11.4426	901.4	vs
10.06	8.7856	47.3	vw
10.63	8.3226	61.8	vw
12.2	7.2489	32.1	vw
12.93	6.8469	44	vw
13.96	6.3387	27.4	vw
15.04	5.8859	193.7	w
15.44	5.7343	1000	vs
16.58	5.3469	212.5	w
16.74	5.2918	472.9	m
17.27	5.1348	151.1	w
17.46	5.0752	280.7	m
18.08	4.9025	49.7	vw
18.44	4.8076	223.6	w
19.79	4.4863	127.6	w
20.16	4.4011	619.2	s
20.88	4.251	185.2	w
21.3	4.1681	47.9	vw
21.61	4.1124	119.3	w
21.78	4.0773	215.4	w
22.92	3.877	151.3	w
23.22	3.8276	55.1	vw
23.68	3.7543	103.2	w
24.14	3.6838	508.2	s
24.9	3.573	110.8	w
25.38	3.5065	23.3	vw
25.74	3.4583	199.5	w
26.06	3.4165	361.3	m
26.64	3.3435	278.8	m
26.94	3.3069	273.4	m
27.34	3.2594	57.8	vw

27.84	3.202	35.6	vw
28.12	3.1708	45.6	vw
28.42	3.138	30	vw
28.66	3.1122	22.2	vw
29.32	3.0437	21.7	vw
30.34	2.9436	59.6	vw
30.74	2.9062	54.2	vw
31.12	2.8716	412.7	m
32.28	2.7733	48.9	vw
32.8	2.7305	52.9	vw
33.4	2.6806	243.6	w
34.2	2.6219	48.4	vw
34.4	2.6049	33.2	vw
34.82	2.5766	42.5	vw
35.54	2.526	37.5	vw
36.6	2.4532	56	vw
36.92	2.4327	28.5	vw
38.44	2.3399	17.9	vw
38.82	2.3179	48.2	vw
39.88	2.2587	35.7	vw

* S = 強 (> 50%相對強度) , M = 中等 (20%-50%相對強度) , W = 弱 (< 20%相對強度)

【0141】 在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角 (2θ) 為7.7 ± 0.2、10.1 ± 0.2、10.6 ± 0.2、12.2 ± 0.2、12.9 ± 0.2、14.0 ± 0.2、15.0 ± 0.2、15.4 ± 0.2、16.6 ± 0.2、16.7 ± 0.2、17.3 ± 0.2、17.5 ± 0.2、18.1 ± 0.2、18.5 ± 0.2、19.8 ± 0.2、20.2 ± 0.2、20.9 ± 0.2、21.3 ± 0.2、21.6 ± 0.2、21.8 ± 0.2、22.9 ± 0.2、23.2 ± 0.2、23.7 ± 0.2、24.1 ± 0.2、24.9 ± 0.2、25.4 ± 0.2、25.8 ± 0.2、26.1 ± 0.2、26.6 ± 0.2、27.0 ± 0.2、27.3 ± 0.2、27.8 ± 0.2、28.1 ± 0.2、28.4 ± 0.2、28.7 ± 0.2、29.3 ± 0.2、30.3 ± 0.2、30.7 ± 0.2、31.1 ± 0.2、32.3 ± 0.2、32.8 ± 0.2、33.4 ± 0.2、34.2 ± 0.2、34.4 ± 0.2、34.8 ± 0.2、35.5 ± 0.2、36.6 ± 0.2、36.9 ± 0.2、38.4 ± 0.2、38.8 ± 0.2、和39.9 ± 0.2處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射

線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在繞射角（ 2θ ）為 7.7 ± 0.1 、 10.1 ± 0.1 、 10.6 ± 0.1 、 12.2 ± 0.1 、 12.9 ± 0.1 、 14.0 ± 0.1 、 15.0 ± 0.1 、 15.4 ± 0.1 、 16.6 ± 0.1 、 16.7 ± 0.1 、 17.3 ± 0.1 、 17.5 ± 0.1 、 18.1 ± 0.1 、 18.5 ± 0.1 、 19.8 ± 0.1 、 20.2 ± 0.1 、 20.9 ± 0.1 、 21.3 ± 0.1 、 21.6 ± 0.1 、 21.8 ± 0.1 、 22.9 ± 0.1 、 23.2 ± 0.1 、 23.7 ± 0.1 、 24.1 ± 0.1 、 24.9 ± 0.1 、 25.4 ± 0.1 、 25.8 ± 0.1 、 26.1 ± 0.1 、 26.6 ± 0.1 、 27.0 ± 0.1 、 27.3 ± 0.1 、 27.8 ± 0.1 、 28.1 ± 0.1 、 28.4 ± 0.1 、 28.7 ± 0.1 、 29.3 ± 0.1 、 30.3 ± 0.1 、 30.7 ± 0.1 、 31.1 ± 0.1 、 32.3 ± 0.1 、 32.8 ± 0.1 、 33.4 ± 0.1 、 34.2 ± 0.1 、 34.4 ± 0.1 、 34.8 ± 0.1 、 35.5 ± 0.1 、 36.6 ± 0.1 、 36.9 ± 0.1 、 38.4 ± 0.1 、 38.8 ± 0.1 、和 39.9 ± 0.1 處的一個或多個峰。在一些實施方式中，化合物1的結晶多晶型形式B具有粉末X射線繞射圖，該粉末X射線繞射圖包含在如上述實施方式中提供的繞射角（ 2θ ）處的兩個或更多個峰的組合。應理解，表3中提供的繞射角（ 2θ ）在上面提供且也在本揭露提及的值的實驗誤差範圍內。

【0142】結晶多晶型形式A的DSC熱譜圖在圖5中示出。已經確定，在如實例10所述之DSC方法過程中，多晶型形式A在約 105.24°C 下熔化並且熔化熱 = 92.879 J/g ，如圖5所示。

【0143】結晶多晶型形式A之拉曼光譜在圖7中示出。

組合

【0144】在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任一種都可以與一種或多種活性成分組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0145】在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與一種或多種活性成分組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或

依次應用)，該一種或多種活性成分各自具有與化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的殺昆蟲作用方式(MoA)相同、類似、但更可能地不同的MoA。在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與具有殺蟎、殺藻、殺鳥、殺細菌、殺真菌、除草、殺昆蟲、殺軟體動物、殺線蟲、殺齧齒動物、和/或殺病毒特性的一種或多種分子組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0146】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種都可以與作為拒食劑、驅鳥劑、化學不育劑、除草劑安全劑、昆蟲引誘劑、驅昆蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、植物活化劑、植物生長調節劑、和/或增效劑的一種或多種分子組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0147】 在一些實施方式中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種還都可以與一種或多種生物型殺有害生物劑組合使用（諸如以組分混合物形式、或同時或依次應用）。

【0148】 在一些實施方式中，在殺有害生物組成物中，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種和活性成分的組合可以廣泛多種重量比率使用。例如，在兩種組分的混合物中，對於化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率，可使用各種比率。然而，通常，小於約10:1至約1:10的重量比率係較佳的。有時還較佳的是使用包含化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種和另外的兩種或更多種活性成分的二、三、四、五、六、七或更多種組分的混合物。

【0149】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率也可被描述為X : Y ; 其中X係化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的重量份並且Y係活性成分的重量份。X的重量份的數值範圍為 $0 < X \leq 100$ 並且Y的重量份的數值範圍為 $0 < Y < 100$ 。藉由非限制性實例的方式，化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種與活性成分的重量比率可以是20 : 1。

配製物

【0150】 殺有害生物劑許多時候不適於以其純形式應用。通常必需添加其他物質，使得殺有害生物劑可在所需濃度下並且以適當的形式使用，從而允許易於應用、操作、運輸、儲存和最大殺有害生物劑活性。因此，將殺有害生物劑配製成例如誘餌、濃縮乳液、粉塵劑、可乳化濃縮物、熏劑、凝膠、顆粒劑、微膠囊、種子處理劑、懸浮液濃縮物、懸乳劑、片劑、水溶性液體、水可分散顆粒劑或乾燥可流動劑、可濕性粉劑、和超低容量溶液。

【0151】 殺有害生物劑最常以由此類殺有害生物劑的濃縮配製物製備的水性懸浮液或乳液形式應用。此類水溶性、水可懸浮或可乳化配製物係通常稱為可濕性粉劑、水可分散顆粒劑的固體，通常稱為可乳化濃縮物或水性懸浮液的液體。可壓實形成水可分散顆粒劑的可濕性粉劑包含殺有害生物劑、載體和表面活性劑的緊密混合物。殺有害生物劑的濃度通常為約10重量%至約90重量%。載體通常選自綠坡縷石（attapulgite）黏土、蒙脫石（montmorillonite）黏土、矽藻土、或純化矽酸鹽。占可濕性粉劑的約0.5%至約10%的有效表面活性劑被發現於磺化木質素、縮合萘磺酸鹽、萘磺酸鹽、烷基苯磺酸鹽、烷基硫酸鹽、和諸如烷基苯酚的環氧乙烷加合物的非離子表面活性劑。

【0152】 殺有害生物劑的可乳化濃縮物包含適宜濃度的溶解於載體中的殺有害生物劑（諸如約50至約500克/升（g/L）液體），該載體係水混溶性溶劑或水不可混溶性有機溶劑和乳化劑的混合物。可用的有機溶劑包括芳香族化合物（尤其是二甲苯）和石油餾分（尤其是石油的高沸點萘和烯部分，諸如重芳香族石腦油）。也可以使用其他有機溶劑，諸如包括松香衍生物的萜烯溶劑、諸如環己酮的脂族酮、和諸如2-乙氧基乙醇的複雜醇。用於可乳化濃縮物的合適乳化劑選自常規的陰離子表面活性劑和非離子表面活性劑。

【0153】 水性懸浮液包括水不溶性殺有害生物劑以約5重量%至約50重量%的濃度分散在水性載體中的懸浮液。懸浮液藉由以下方式製備：精細研磨殺有害生物劑並且將其劇烈混合到由水和表面活性劑構成的載體中。還可以添加諸如無機鹽和合成膠或天然膠的成分以增加水性載體的密度和黏度。藉由在諸如砂磨機、球磨機、或活塞型均化器的器具中製備水性混合物並且使其均化來同時研磨和混合殺有害生物劑通常是最有效的。可以將呈懸浮液的殺有害生物劑微包封在塑膠聚合物中。

【0154】 油分散體（OD）包括有機溶劑不溶性殺有害生物劑以約2重量%至約50重量%的濃度精細分散於有機溶劑和乳化劑的混合物中的懸浮液。一種或多種殺有害生物劑可以溶解於有機溶劑中。可用的有機溶劑包括芳香族化合物（尤其是二甲苯）和石油餾分（尤其是石油的高沸點萘和烯部分，諸如重芳香族石腦油）。其他溶劑可以包括植物油、種子油、和植物油和種子油的酯。用於油分散體的合適乳化劑選自常規的陰離子表面活性劑和非離子表面活性劑。在油分散體的配製中添加增稠劑或膠凝劑以改變液體的流變性或流動特性以及防止分散顆粒或液滴的分離和沈降。

【0155】 殺有害生物劑也可以以顆粒組成物的形式應用，該等顆粒組成物特別可用於應用於土壤。顆粒組成物通常含有約0.5重量%至約10重量%的殺有害生物劑，該殺有害生物劑分散於包含黏土或類似物質的載體中。通常藉由將殺有害生物劑溶解於合適的溶劑中並且將其應用到已預先形成在約0.5毫米（mm）至約3 mm的適當粒度的顆粒載體中來製備此類組成物。也可以藉由製造載體和分子的黏團或糊狀物並且然後擠壓並且乾燥以獲得所希望的顆粒粒度來配製此類組成物。顆粒的另一種形式係水可乳化顆粒劑（EG）。它係由顆粒劑組成的配製物，該配製物以一種或多種活性成分在水中崩解和溶解之後溶解或稀釋於有機溶劑中的常規水包油乳液形式應用。水可乳化顆粒劑包含溶解或稀釋於合適的有機溶劑中的一種或若干種活性成分，該一種或若干種活性成分被吸收在水溶性聚合物殼或一些其他類型的可溶性或不溶性基質中。

【0156】 藉由將呈粉末狀形式的殺有害生物劑與合適的粉塵狀農業載體（諸如高嶺土、研磨的火山岩等）緊密混合來製備含有殺有害生物劑的粉塵劑。粉塵劑可以適當含有約1%至約10%的殺有害生物劑。粉塵劑可以以拌種的形式或以使用噴粉機的葉面應用的形式進行應用。

【0157】 同樣實用的是以在適當的有機溶劑（通常為石油）中的溶液形式應用殺有害生物劑，諸如廣泛用於農業化學的噴淋油。

【0158】 殺有害生物劑也可以氣溶膠組成物的形式應用。在此類組成物中，殺有害生物劑溶解或分散於作為產生壓力的推進劑混合物的載體中。將氣溶膠組成物包裝在通過霧化閥分配混合物的容器中。

【0159】 當殺有害生物劑與食品或引誘劑或兩者混合時，形成殺有害生物劑誘餌。當有害生物食用誘餌時，它們也食用殺有害生物劑。誘餌可以呈顆粒劑、凝膠、可流動粉末、液體、或固體的形式。誘餌可用於有害生物庇護處。

【0160】 熏劑係具有相對高蒸氣壓並且因此可以足夠濃度的氣體形式存在以殺死土壤或封閉空間中的有害生物的殺有害生物劑。熏劑的毒性與其濃度和暴露時間成比例。它們藉由良好的擴散能力表徵並且藉由滲透有害生物的呼吸系統或經由有害生物的表皮吸收而起作用。應用熏劑以防治在氣密薄片下、在氣封室或建築物中或在特定腔室中的積穀有害生物（stored product pest）。

【0161】 可以藉由將殺有害生物劑顆粒或液滴懸浮於各種類型的塑膠聚合物中來將殺有害生物劑微包封。藉由改變聚合物的化學性質或藉由改變加工中的因素，可以形成具有各種尺寸、溶解度、壁厚和滲透程度的微膠囊。該等因素管控內部的活性成分釋放的速度，其繼而影響產品的殘餘性能、作用速度、和氣味。微膠囊可以配製為懸浮液濃縮物或水可分散顆粒劑。

【0162】 油溶液濃縮物係藉由將殺有害生物劑溶解在將殺有害生物劑保持在溶液中的溶劑中而製成的，殺有害生物劑的油溶液通常比其他配製物更快擊潰和殺死有害生物，因為溶劑本身具有殺有害生物作用並且外皮蠟質覆蓋物的溶解增加殺有害生物劑的攝取速度。油溶液的其他優點包括更好的儲存穩定性、更好的裂隙滲透性和更好的對油脂表面的黏附性。

【0163】 另一個實施方式係水包油乳液，其中該乳液包含各自具備層狀液晶包衣並且分散在水相中的油性小珠，其中每個油性小珠包含至少一種具有農業活性的分子並且單獨地被單層狀層或多層狀層包覆，該單層狀層或多層狀層

包含：(1) 至少一種非離子親脂性表面活性劑，(2) 至少一種非離子親水性表面活性劑，和 (3) 至少一種離子表面活性劑，其中該小珠的平均粒徑小於800奈米。

其他配製物組分

【0164】 通常，當化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種用於配製物中時，此類配製物還可含有其他組分。該等組分包括但不限於（這係非詳盡且非互相排他性清單）潤濕劑、鋪展劑、黏著劑、滲透劑、緩衝劑、螯合劑、減漂劑、相容劑、消泡劑、清潔劑、和乳化劑。接著描述數種組分。

【0165】 潤濕劑係當被添加到液體中時藉由減小液體與其所鋪展的表面之間的表面張力而增加液體的鋪展或滲透能力的物質。潤濕劑因以下兩個主要功能用於農用化學配製物：在加工和製造期間，增加粉末在水中潤濕的速率以製造可溶性液體或懸浮液濃縮物；以及在產品與水在噴灑罐中混合期間，減少可濕性粉劑的潤濕時間並且改進水到水可分散顆粒劑中的滲透。用於可濕性粉劑、懸浮液濃縮物和水可分散顆粒劑配製物的潤濕劑的實例係：月桂基硫酸鈉、二辛基磺基琥珀酸鈉、烷基酚乙氧基化物、和脂族醇乙氧基化物。

【0166】 分散劑係吸附於顆粒表面上，有助於保持顆粒的分散狀態並且防止其再聚集的物質。將分散劑添加到農用化學配製物中以促進在製造期間的分散和懸浮並且確保顆粒再分散於噴灑罐中的水中。它們廣泛用於可濕性粉劑、懸浮液濃縮物、和水可分散顆粒劑中。用作分散劑的表面活性劑具有強烈吸附於顆粒表面上並且提供針對顆粒再聚集的帶電荷的或空間屏障的能力。最常用的表面活性劑係陰離子表面活性劑、非離子表面活性劑、或兩種類型的混合物。對於可濕性粉劑配製物，最常見的分散劑係木質素磺酸鈉。對於懸浮液濃縮物，使用聚電解質（諸如羧基磺酸鈉甲醛縮合物）獲得非常好的吸附性和穩定性。也使用三

苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯。諸如烷基芳基環氧乙烷縮合物和EO-PO嵌段共聚物的非離子表面活性劑有時與作為分散劑的陰離子表面活性劑組合用於懸浮液濃縮物。近年來，已開發出新型的非常高分子量聚合物表面活性劑作為分散劑。其具有非常長的疏水性「主鏈」和大量環氧乙烷鏈，形成「梳型」表面活性劑的「齒」。該等高分子量聚合物可以賦予懸浮液濃縮物非常好的長期穩定性，因為疏水性主鏈具有在顆粒表面上的許多錨點。

【0167】用於農用化學配製物的分散劑的實例係：木質素磺酸鈉、萘磺酸鈉甲醛縮合物、三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯、脂族醇乙氧基化物、烷基乙氧基化物、EO-PO嵌段共聚物、和接枝共聚物。

【0168】乳化劑係使一種液相的液滴在另一個液相中的懸浮液穩定的物質。在無乳化劑的情況下，可以將兩種液體分成兩種不可混溶的液相。最常用的乳化劑共混物含有具有十二個或更多個環氧乙烷單元的烷基酚或脂族醇和油溶性的十二烷基苯磺酸鈣鹽。約8至約18的親水-親油平衡（「HLB」）值將正常提供良好的穩定乳液。乳液穩定性可以有時藉由添加少量EO-PO嵌段共聚物表面活性劑來改進。

【0169】增溶劑係將以高於臨界膠束濃度的濃度在水中形成膠束的表面活性劑。膠束然後能夠溶解或增溶膠束的疏水性部分內的水不溶性材料。通常用於增溶的表面活性劑的類型為非離子表面活性劑：脫水山梨醇單油酸酯；脫水山梨醇單油酸酯乙氧基化物；和油酸甲酯。

【0170】表面活性劑有時單獨地或與作為用於噴灑罐混合的輔助劑的其他添加劑（諸如礦物油或植物油）一起使用，以改進殺有害生物劑對於標靶的生物性能。用於生物增強的表面活性劑的類型通常取決於殺有害生物劑的性質和

作用方式。然而，它們通常是非離子表面活性劑，諸如：烷基乙氧基化物、直鏈脂族醇乙氧基化物、和脂族胺乙氧基化物。

【0171】 農業配製物中的載體或稀釋劑係添加到殺有害生物劑中以給出所需強度的產品的材料。載體通常是具有高吸收能力的材料，而稀釋劑通常是具有低吸收能力的材料。載體和稀釋劑用於粉塵劑、可濕性粉劑、顆粒劑、和水可分散顆粒劑的配製。

【0172】 有機溶劑主要用於配製可乳化濃縮物、水包油乳液、懸乳劑、油分散體和超低容量配製物，並且在較小程度上用於配製顆粒配製物。有時使用溶劑混合物。第一主組的溶劑係脂族石蠟油，諸如煤油或精製石蠟。第二主組的（並且最常用的）溶劑包括芳香族溶劑，諸如二甲苯和較高分子量的C₉和C₁₀芳香族溶劑餾分。氯化烴可用作助溶劑以便當配製物乳化在水中時防止殺有害生物劑結晶。醇有時用作助溶劑以增加溶解能力。其他溶劑可以包括植物油、種子油、和植物油和種子油的酯。

【0173】 增稠劑或膠凝劑主要用於配製懸浮液濃縮物、油分散體、乳液和懸乳劑，以改變液體的流變或流動特性和防止分散的顆粒或液滴的分離和沈降。增稠劑、膠凝劑和防沈劑通常分成兩個類別，即水不溶性顆粒和水溶性聚合物。可以使用黏土和二氧化矽來製備懸浮液濃縮物和油分散體配製物。該等類型的材料的實例包括但不限於蒙脫石、膨潤土、矽酸鎂鋁、和綠坡縷石。水基懸浮液濃縮物中的水溶性多糖已用作增稠膠凝劑多年，最常用的多糖類型係種子和海藻的天然提取物或係纖維素的合成衍生物。該等類型的材料的實例包括但不限於瓜耳膠、刺槐豆膠、角叉菜膠、海藻酸鹽、甲基纖維素、羧甲基纖維素鈉

(SCMC)、和羥乙基纖維素(HEC)。其他類型的防沈劑係基於改性澱粉、聚丙烯酸酯、聚乙烯醇、和聚環氧乙烷的。另一種良好的防沈劑係黃原膠。

【0174】微生物可以導致配製產品的腐敗。因此，使用防腐劑消除或減輕其作用。此類藥劑的實例包括但不限於：丙酸及其鈉鹽、山梨酸及其鈉或鉀鹽、苯甲酸及其鈉鹽、對羥基苯甲酸鈉鹽、對羥基苯甲酸甲酯、和1,2-苯并異噻唑啉-3-酮(BIT)。

【0175】表面活性劑的存在通常在生產和通過噴灑罐應用中的混合操作期間導致水基配製物起泡。為了減少起泡的傾向，通常在生產階段期間或在填充至瓶中之前添加消泡劑。通常，存在兩種類型的消泡劑，即矽酮和非矽酮。矽酮通常是二甲基聚矽氧烷的水性乳液，而非矽酮消泡劑係水不溶性油(諸如辛醇和壬醇)或二氧化矽。在兩種情況下，消泡劑的功能係使表面活性劑從空氣-水介面移位。

【0176】「綠色」劑(例如輔助劑、表面活性劑、溶劑)可以減少作物保護配製物的整體環境足跡。綠色劑係可生物降解的並且通常源於天然和/或可持續源，例如植物源和動物源。具體實例係：植物油、種子油、及其酯。

應用

【0177】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於任何場所。應用此類分子的特定場所包括苜蓿、杏仁、蘋果、大麥、豆類、低芥酸菜籽、玉米、棉花、十字花科植物、花卉、飼料物種(黑麥草、蘇丹草(Sudan Grass)、高羊茅(Tall Fescue)、肯塔基藍草(Kentucky Blue Grass)和三葉草)、水果、萵苣、燕麥、油籽作物、柑橘、花生、梨、胡椒、馬鈴薯、水稻、高粱、大豆、草莓、甘蔗、糖用甜菜、向日葵、煙草、蕃茄、小麥(例如，硬紅冬小麥(Hard

Red Winter Wheat)、軟紅冬小麥(Soft Red Winter Wheat)、白冬小麥(White Winter Wheat)、硬紅春小麥(Hard Red Spring Wheat)和杜倫春小麥(Durum Spring Wheat))以及其他有價值的作物生長或要種植其種子的場所。

【0178】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以應用於植物(諸如作物)生長的地方和存在低水平(甚至實際不存在)的可能商業上損害此類植物的有害生物的地方。在此類場所應用此類分子將有益於植物在此類場所生長。此類有益效果可包括但不限於：幫助植物生長更好的根系；幫助植物更好地承受應激生長條件；改進植物的健康狀況；改進植物的產率(例如，增加的生物量和/或增加的有價值成分的含量)；改進植物的活力(例如，改進的植物生長和/或更綠的葉)；改進植物的品質(例如，改進某些成分的含量或組成)；以及改進植物的對非生物和/或生物應激的耐受性。

【0179】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以在各種植物生長時與硫酸銨一起應用，因為這可以提供另外的益處。

【0180】 可以將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用於以下植物上、中或周圍：經遺傳修飾以表現特定性狀(諸如蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*))(例如，Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1))、其他殺昆蟲毒素的植物，或表現除草劑耐受性的植物，或具有表現殺昆蟲毒素、除草劑耐受性、營養增強或任何其他有益性狀的「堆疊」外源基因的植物。

【0181】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於植物的葉和/或果實部分以防治有害生物。化合物1的此類多晶型物將與有害生物直接

接觸，或有害生物將在食用植物時或在汲取植物的汁液或其他營養物時食用化合物1的此類多晶型物。

【0182】也可以將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用於土壤，並且當以這種方式應用時，可以防治取食根和莖的有害生物。根可吸收此類分子，由此將其向上輸送至植物的葉部分以防治地面上的咀嚼有害生物和取食汁液的有害生物。

【0183】可以利用植物中殺有害生物劑的系統性移動來藉由將化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種應用（例如，藉由噴灑場所）於植物的不同部分而防治在植物的一個部分上的有害生物。例如，葉取食的昆蟲的防治可以藉由滴灌或溝施、藉由用例如種植前或種植後土壤浸液處理土壤、或藉由在種植之前處理植物種子來實現。

【0184】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以與誘餌一起使用。通常在誘餌的情況下，將誘餌置於例如白蟻可與誘餌接觸和/或被引誘至誘餌處的地面。也可以將誘餌應用於例如螞蟥、白蟻、蟑螂和蒼蠅可與誘餌接觸和/或被引誘至誘餌處的建築物的表面（水平、豎直或傾斜表面）。

【0185】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以包封在膠囊內部，或放置在膠囊表面上。膠囊的尺寸可以是奈米尺寸（約100-900奈米直徑）至微米尺寸（約10-900微米直徑）。

【0186】化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以應用於有害生物的卵。由於一些有害生物的卵抵抗某些殺有害生物劑的獨特能力，因此可能希望重複應用此類分子以防治新出現的幼蟲。

【0187】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以用作種子處理劑。可以將種子處理劑應用於所有類型的種子，包括經遺傳修飾以表現特定性狀的植物的將從其萌發的種子。代表性實例包括表現對無脊椎動物有害生物有毒的蛋白質的那些，諸如蘇雲金芽孢桿菌或其他殺昆蟲毒素；表現除草劑耐受性的那些，諸如「抗草甘膦（Roundup Ready）」種子；或具有表現殺昆蟲毒素、除草劑耐受性、營養增強、耐旱性或任何其他有益性狀的「堆疊」外源基因的那些。此外，採用化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種的此類種子處理劑可以進一步增強植物更好地承受應激生長條件的能力。這導致更健康、更有活力的植物，這可以在收穫時間導致較高的產率。通常，約1克至約500克此類多晶型物/100,000種子的量有望提供良好的效益；約10克至約100克/100,000種子的量有望提供更好的效益；並且約25克至約75克/100,000種子的量有望提供甚至更好的效益。化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以與土壤改良劑中的一種或多種活性成分一起應用。

【0188】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種可以在獸醫學領域中或在非人類動物飼養領域中用於防治體內寄生蟲和體表寄生蟲。此類分子可以藉由以下方式應用：以例如片劑、膠囊、飲料和顆粒劑的形式口服施用；以例如浸漬、噴灑、傾倒（pouring on）、點滴（spotting on）和撒粉的形式皮膚應用；以及以例如注射的形式腸胃外施用。

【0189】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以有利地用於家畜飼養，例如牛、雞、鵝、山羊、豬、綿羊和火雞。它們也可以有利地用於寵物，諸如馬、犬和貓。要防治的具體有害生物可以是令此類動物生厭的蒼蠅、

跳蚤、和扁虱。合適的配製物與飲用水或飲食一起口服施用於動物。合適的劑量和配製物取決於物種。

【0190】 化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以用於防治以上列出的動物中（尤其腸）的寄生蟲。化合物1的多晶型形式A和B中的任何一種或多種也可以用於非人類健康護理的治療方法中，此類方法包括但不限於以例如片劑、膠囊、飲料和顆粒劑的形式口服施用以及藉由皮膚施用。

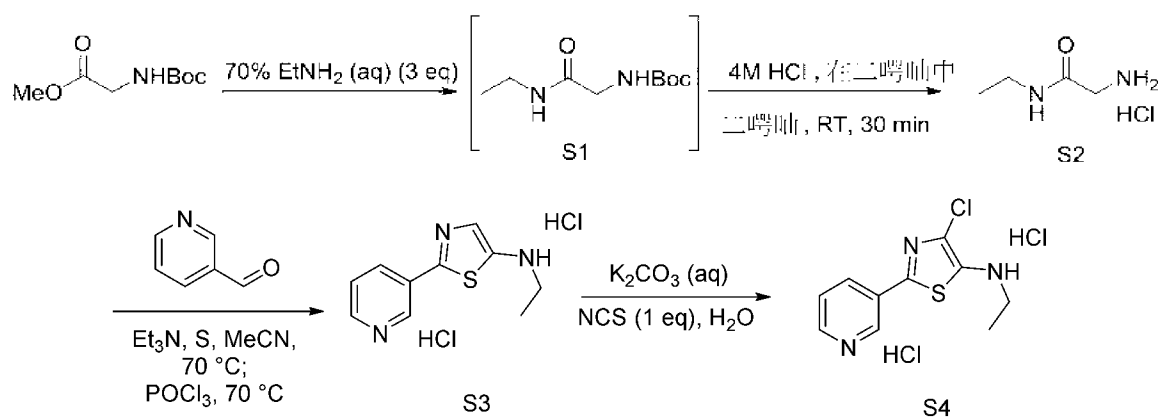
【0191】 化合物1的多晶型形式A和B也可以應用於侵入性有害生物。全世界的有害生物已遷移至新環境（對於此類有害生物而言）並且此後變成此類新環境的新侵入性物種。此類多晶型物也可以用於此類新侵入性物種以在此類新環境中對其進行防治。

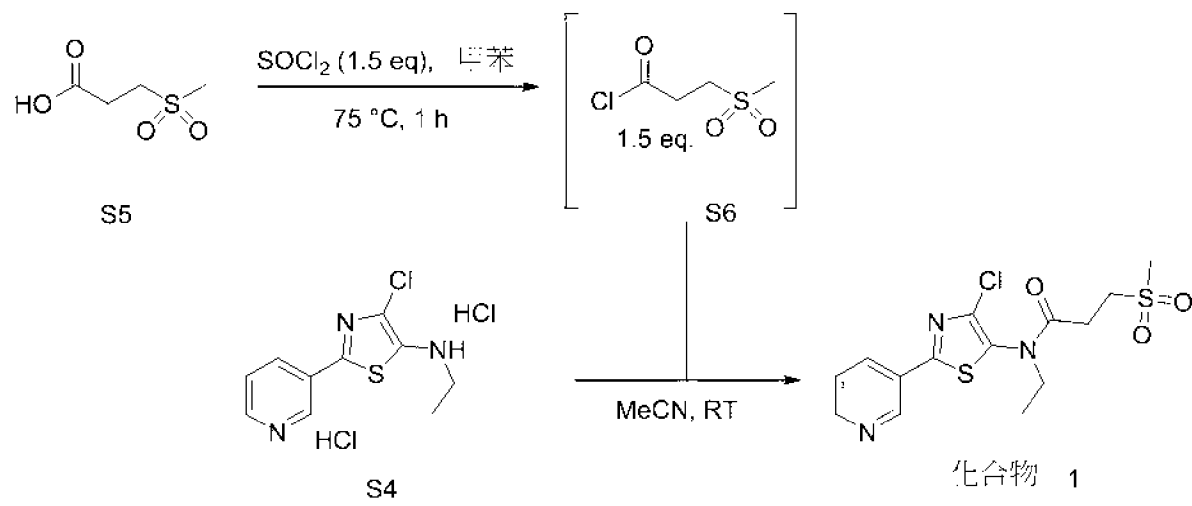
實例

【0192】 下面提供的實例和製備進一步說明和例證本揭露實施方式的特定方面。應理解，本揭露之範圍不以任何方式受到以下實例範圍的限制。

【0193】 實例1

【0194】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的合成，並且作為形式A分離





【0195】 步驟1：(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (S1) 的製備

【0196】 向1 L圓底中添加水中的70%乙胺（347 mL，4360 mmol，3當量），並分次添加(三級丁氧羰基)甘胺酸甲酯（255 ml，1453 mmol）以保持溫度<35°C。在室溫下攪拌反應並使用CDCl₃藉由NMR監測。過量的乙胺和水藉由常壓蒸餾除去。將混合物冷卻並添加環戊基甲醚（CPME）（400 mL）。繼續常壓蒸餾以共沸出剩餘的水（鍋溫：115°C，頂溫：95°C）。在頂部蒸餾出約260 mL的CPME。將混合物冷卻至室溫並向底部添加CPME（140 mL）。該溶液無需進一步操作即可用於下一步驟。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ 3.77 (d, *J* = 5.9 Hz, 2H), 3.37 - 3.26 (m, 2H), 1.46 (s, 9H), 1.15 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)。

【0197】 步驟2：2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) 的製備

【0198】 向5L夾套反應器中添加異丙醇中的6N HCl（1055 mL，6.3 mol，4當量）和CPME（1055 mL）並將夾套設置在30°C。藉由蠕動泵在30分鐘內添加來自先前反應的作為在CPME中的溶液的(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯（假定320 g，1582 mmol）。將反應在30°C下攪拌6 h並且冷卻至25°C

攪拌過夜。在DMSO中藉由NMR監測反應。反應形成了非常濃稠的漿液。用CPME (650 mL) 稀釋漿液並通過經由粗玻璃料過濾分離出固體，用CPME (300 mL) 洗滌。然後用一餅體積的己烷洗滌濕餅以幫助去除CPME，進行乾燥。將材料在45°C下在真空烘箱中乾燥，得到呈蓬鬆白色固體的2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) (184.11 g, 1315 mmol, 83%產率)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 3.49 (s, 2H), 3.14 (qd, *J* = 7.3, 5.4 Hz, 2H), 1.05 (t, *J* = 7.3 Hz, 3H)。

【0199】 步驟3：*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S3) 的製備

【0200】 向配備有回流冷凝器和熱電偶的125 mL 3頸直壁平底燒瓶中添加2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽(4.99 g, 36.0 mmol, 1.25當量)、無水乙腈(48 mL)，形成白色漿液。反應器用氮氣惰性化。添加無水三乙胺(99%, 5.60 mL, 39.7 mol, 1.38當量)並將混合物攪拌1 h，得到白色濃稠漿液。添加煙醛(98%, 2.70 mL, 28.8 mmol, 1.0當量)，得到較稀的漿液。添加硫固體粉末(1.20 g, 37.4 mmol, 1.30當量)。將混合物在70°C下攪拌並逐漸變成深紅橙色溶液。藉由HPLC監測反應直到煙醛消失，這需要約5 h並且然後冷卻至50°C。向反應混合物中逐滴添加三氯氧磷(POCl₃, 99%, 6.70 mL, 77.8 mmol, 2.50當量)，同時保持鍋溫低於60°C。將深棕色的稀漿液/油在50°C下攪拌7 h，在此期間形成黃色漿液(藉由HPLC監測)。將黃橙色漿液冷卻至15°C並添加甲苯(20 mL)。過濾混合物並用甲苯(3 X 10 mL)洗滌。將黃色濕餅在40°C下在真空中乾燥16 h以得到呈黃色固體的*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽(S3)(5.14 g)，如藉由¹H NMR測定測量的，純度為92 wt%，表明兩個步驟的產率為57.8%。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.07 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 8.71 (dd, *J* = 5.6, 1.3 Hz, 1H), 8.66 (ddd, *J* = 8.3, 2.2, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (ddd, *J* = 8.3, 5.5, 0.7 Hz, 1H), 7.54 - 7.19 (m, 1H), 7.02

(s, 1H), 3.15 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.21 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。¹³C NMR (101 MHz, DMSO) δ 155.15, 140.81, 139.39, 139.16, 136.62, 133.13, 127.52, 120.35, 41.56, 13.89。
ESIMS m/z 206 [(M+H-2HCl)+]。

【0201】 步驟4：步驟4：4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4) 的製備

【0202】 向1 L圓底燒瓶中添加*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (30 g, 108 mmol) 和水 (360 mL) 並將所得橙色/紅色溶液用冰浴冷卻至約 5°C。分次添加*N*-氯代琥珀醯亞胺 (14.4 g, 108 mmol, 1當量)，保持溫度低於 7°C。將所得深色溶液在 5°C 下攪拌 40 min，藉由HPLC監測。將反應物倒入20%的碳酸鉀溶液中，導致形成黏性紅色固體，並用乙酸乙酯萃取產物。有機層用10%硫代硫酸鈉洗滌，然後用20%碳酸鉀洗滌。有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮，得到呈紅色油的4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺 (S4) (27 g, 104%)，其無需進一步純化即可進入步驟6。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.96 (dd, $J = 2.4$, 0.8 Hz, 1H), 8.54 (dd, $J = 4.8$, 1.6 Hz, 1H), 8.07 (ddd, $J = 8.1$, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 7.31 (ddd, $J = 8.1$, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 4.02 (s, 1H), 3.27 (qd, $J = 7.2$, 5.8 Hz, 2H), 1.34 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

【0203】 步驟5：3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6) 的製備

【0204】 在配備有氮氣入口、回流冷凝器、通向1 N NaOH鹼洗滌器的通氣管和攪拌棒的500 mL三頸圓底燒瓶中裝入3-(甲基磺醯基)丙酸 (50 g, 329 mmol) 和甲苯 (299 ml)，以得到不均勻溶液。向其中添加亞硫醯氯 (1.5當量) 並將溶液加熱至70°C-75°C的內部溫度。在此溫度下攪拌反應，藉由NMR監測。將反應冷卻至室溫，這時觀察到明顯的固體形成。向漿液中添加250 mL庚烷並將混合

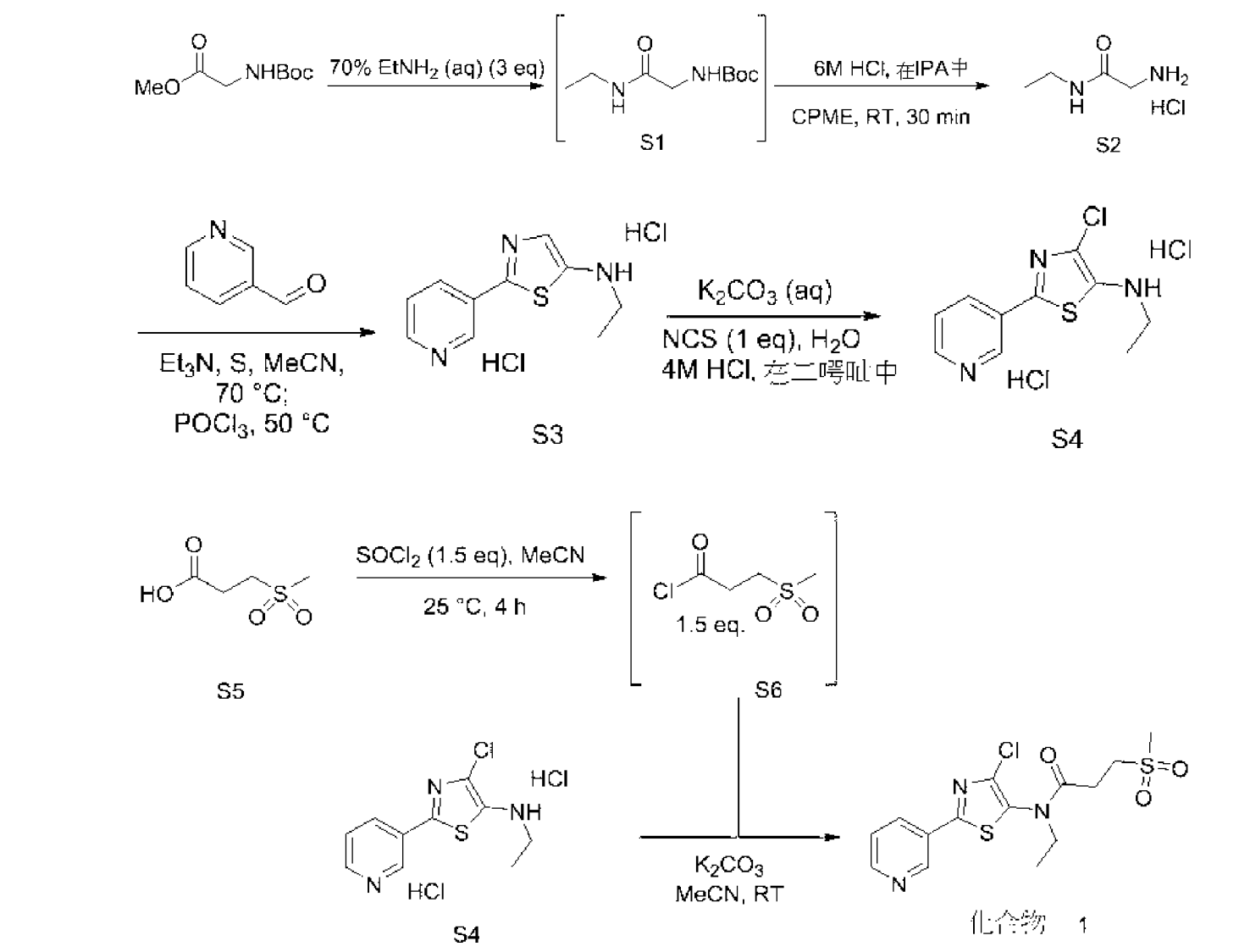
物攪拌10分鐘。將固體藉由過濾分離，用庚烷洗滌（90%產率）。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 3.51 - 3.46 (m, 2H), 3.43 - 3.38 (m, 2H), 3.00 (s, 1H)；¹³C NMR (126 MHz, CDCl₃) δ 171.8, 49.5, 41.6, 39.3。

【0205】 步驟6：作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的製備

【0206】 向含有粗4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺（27 g）的1 L圓底燒瓶中添加乙腈（300 mL），製備紅色溶液。在5分鐘內分次添加3-(甲基磺醯基)丙醯氯（27.6 g，162 mmol，1.5當量），藉由HPLC監測反應直到達到>98%的轉化率。在反應過程期間，產物的HCl鹽以黃色/棕褐色固體形成。將固體藉由過濾分離，然後用20%碳酸鉀中和，用乙酸乙酯萃取。將有機層經硫酸鈉乾燥，過濾，並濃縮，得到52.3 g的粗油。粗材料從異丙醇-庚烷中結晶以得到呈結晶固體的化合物1（35.2 g，80%）。¹H NMR (300 MHz, 氯仿-*d*) δ 9.17 - 9.06 (m, 1H), 8.74 (dd, *J* = 4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.22 (ddd, *J* = 8.0, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 7.45 (ddd, *J* = 8.0, 4.9, 0.9 Hz, 1H), 3.79 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 3.43 (s, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.80 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 1.34 - 1.15 (m, 3H)；¹³C NMR (75 MHz, CDCl₃) δ 169.43, 163.02, 152.15, 147.29, 138.62, 133.37, 131.86, 128.41, 123.92, 50.21, 45.26, 41.75, 27.29, 12.82；對於 C₁₄H₁₆ClN₃O₃S₂ 計算的 HRMS-ESI (*m/z*) [M+H]⁺ 為 373.0322；實測的是 374.0397。根據實例8藉由PXRD對結晶固體進行分析，如圖1所示，並指定名稱為形式A。

【0207】 實例2

【0208】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的合成，並且作為形式A再結晶



【0209】 步驟1：(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (S1) 的製備

【0210】 向裝備有溫度記錄儀、機械攪拌器、低流量/高流量氮氣設置的3L夾套反應器中添加水中的乙胺溶液（70%）（599 mL，7.53 mol）。反應器浴設定為23°C（內部溫度 = 22°C）。使用蠕動泵向此攪拌的溶液中緩慢添加(三級丁氧基羰基)甘胺酸甲酯（500 g，2510 mmol），保持內部溫度低於35°C。將反應在23°C（內部溫度）下攪拌過夜。過程 controls（¹H NMR）顯示起始材料完全轉化為產物(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯 (S1)。反應器設置有短程蒸餾頭並且反應器浴被加熱到127°C（內部溫度約為115°C，蒸餾頭溫度在

70°C-85°C之間波動)。接收燒瓶在冰浴中冷卻並取出約240 mL的乙胺/水/MeOH。將反應冷卻至內部溫度60°C，並添加約350 mL的CPME，然後進行第二次蒸餾以除去剩餘的乙胺（浴溫設定為117°C，內部溫度為約98°C，並且蒸餾頭溫度為約80°C）。蒸餾完成後（藉由蒸餾頭溫度的降低來確定，表明沒有餾出物），反應器浴設定為23°C（內部溫度 = 22°C）並允許攪拌過夜。產物(2-(乙基胺基)-2-側氧基乙基)胺基甲酸三級丁酯無需進一步純化即用於下一步驟。

【0211】 步驟2：2-胺基-N-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2) 的製備

【0212】 向配備有氮氣入口、蠕動泵、機械攪拌器和通過鹼洗滌器（含有10% NaOH溶液的鱷形捕集器）的排氣孔的5L夾套反應器中添加HCl（在異丙醇中6 M）（1.67 L，10.0 mol）。使用蠕動泵將來自步驟1的醯胺從3 L夾套反應器逐滴添加到5 L夾套反應器中的酸中。在添加完成後，向3 L反應器中添加400 mL的CPME以洗淨反應器，並藉由蠕動泵將CPME液體添加到5 L反應器中。反應被攪拌過夜，在此期間形成了白色沈澱物。過濾反應器內容物以得到約100 g的2-胺基-N-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2)，將其放在一邊進行乾燥。將濾液濃縮至1.3 L（約50%體積），然後添加600 mL的CPME和100 mL的異丙醇以誘導S2的進一步沈澱。將混合物攪拌60分鐘。過濾所得漿液，並將固體與第一批固體合併並在真空烘箱中乾燥過夜（50°C，< 50 mmHg），以得到呈白色固體的2-胺基-N-乙基乙醯胺鹽酸鹽（300.5 g，2168 mmol，86%產率）：¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 3.49 (s, 2H), 3.14 (qd, J = 7.2, 5.4 Hz, 2H), 1.05 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS m/z 103 [(M+H)⁺]。

【0213】 步驟3：N-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S3) 的製備

【0214】 向配備有2個回流冷凝器（乾冰）、機械攪拌器、N₂入口和熱電偶的5 L夾套反應器中添加2-胺基-*N*-乙基乙醯胺鹽酸鹽 (S2)（238 g，1.72 mol）和無水乙腈（2.00 L），得到白色漿液。反應器用氮氣惰性化。添加無水三乙胺（264 ml，1.89 mmol），並將混合物攪拌1 h，得到白色濃稠漿液。添加煙醛（131 ml，1.37 mol），得到較稀的漿液。然後，添加硫（57.2 g，1.78 mol）。夾套溫度設定為72°C（內部溫度 = 70°C）並逐漸（在30 min內）變成暗紅橙色溶液並形成沈澱物。藉由HPLC監測反應直到煙醛消失，這需要在72°C下加熱約5 h並且然後冷卻至室溫並攪拌過夜。多相反應被再加熱到內部溫度50°C（在該溫度下它再一次變成深紅色/棕色的透明溶液）。在50°C的內部溫度下向反應中逐滴添加三氯氧磷（321 ml，3431 mmol）以使內部溫度增加不超過65.5°C。藉由HPLC監測反應直到硫代醯胺中間體被消耗（需要6小時）。將夾套溫度降至20°C（內部溫度 = 20°C），並藉由過濾分離固體並用乙腈洗滌。反應器用100 mL乙腈洗滌。濾液被移出以進行淬滅。用300 mL DCM進一步洗滌固體。黃色/綠色濕餅在真空下在（40°C，< 50 mmHg）下乾燥16 h，以得到呈綠色固體的*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽（200 g，703 mmol，51%產率）：¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.98 (dd, *J* = 2.3, 0.9 Hz, 1H), 8.53 (dd, *J* = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.07 (ddd, *J* = 8.0, 2.3, 1.6 Hz, 1H), 7.31 (ddd, *J* = 8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 6.98 (s, 1H), 3.95 (s, 1H), 3.24 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.31 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 206 [(M+H)⁺]。

【0215】 步驟4：4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4) 的製備

【0216】 向配備有機械攪拌器、N₂入口和溫度探頭的5 L反應器中添加*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-胺二鹽酸鹽（210 g，755 mmol）和水（630 mL），然後添加乙酸乙酯（2.10 L）。在十分鐘內藉由蠕動泵向此攪拌的暗紅色溶液中

逐滴添加碳酸鉀（209 g，1.51 mol）在水（209 mL）中的溶液。完成後，夾套溫度被設定為45°C（內部溫度 = 44°C）並將反應攪拌2 h。然後將反應物轉移到分離漏斗中並除去底部水層。水層係透明的淺橙色。丟棄水層（HPLC顯示沒有希望的產物）。將有機層倒入配備有磁力攪拌器和MgSO₄（210 g）的愛倫美氏（Erlenmeyer）燒瓶中。將燒瓶攪拌3 h，直到藉由卡爾-費歇爾滴定測得有機溶液的水水平 < 0.5 wt%。過濾混合物，並將無機固體用EtOAc（100 mL）洗滌。將濾液倒回5 L反應器中並冷卻至內部溫度為0°C，在此期間深橙色溶液變成不均勻的。向不均勻的漿液中添加呈固體的1-氯吡咯啉-2,5-二酮（101 g，755 mmol），保持內部溫度低於12°C。添加完成後，反應物變成均勻的，並藉由HPLC監測反應。添加完成後十分鐘，藉由HPLC確定反應完成。然後在90分鐘內藉由蠕動泵滴入在二噁呋喃中的4 M HCl（566 mL，2.27 mol）。夾套溫度被設定為23°C（內部溫度 = 22°C）並允許在室溫下攪拌反應過夜。攪拌過夜後，過濾不均勻的漿液以得到黃色/棕色固體，將其在真空烘箱（30°C，< 50 mmHg）中乾燥以得到呈黃色/棕色固體的4-氯-N-乙基-2-(吡啶-3-基)噻唑-5-胺二鹽酸鹽 (S4)（195 g，629 mmol，83%產率）：¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.05 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 8.66 (dd, *J* = 5.3, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (dt, *J* = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 3.19 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.23 (t, *J* = 7.1 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 240 [(M+H)⁺]。

【0217】 步驟5：3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6) 的製備

【0218】 將3-(甲基磺醯基)丙酸 (S5)（101 g，663 mmol，購自Orchev公司）裝入1 L夾套反應器中，然後是乙腈（304 g），並且然後攪拌以溶解酸。在五分鐘內逐滴添加亞硫醯氯（83.7 g，697 mmol）。溶液在25°C下保持3小時以允許酸

(S5) 轉化為醯氯，3-(甲基磺醯基)丙醯氯 (S6)。醯氯產物無需進一步純化即可用於下一步驟。

【0219】 步驟6：*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的製備

【0220】 在單獨的5 L反應器中裝入4-氯-*N*-乙基-2-(吡啶-3-基)噁唑-5-胺二鹽酸鹽（164 g，84 wt%純，442 mmol，1.0當量），然後是MeCN（415 g，22.9當量）和碳酸鉀（156 g，1.11 mol）。在從1 L反應器中轉移醯氯溶液之前攪拌橙色漿液。藉由蠕動泵在15分鐘內轉移步驟5中製備的3-(甲基磺醯基)丙醯氯溶液，並觀察到+3°C的放熱。將反應在室溫下攪拌過夜。

【0221】 攪拌過夜後，將漿液冷卻至內部溫度為8°C，然後藉由蠕動泵在3小時內將水（554 g）轉移到5 L反應器中。在固體溶解後，停止攪拌以允許雙相混合物分離。丟棄下部水相並且然後在旋轉蒸發器上在50°C下濃縮有機相，以得到呈粗棕色油的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）。

【0222】 步驟7：*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的分離

【0223】 將來自步驟6的油溶解在1-丁醇（497 g）中並將溶液重新裝入1 L反應器中。將反應器溫熱至30°C並用*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1，形式A）（8.18 g，21.9 mmol）引晶。漿液在30°C下保持8小時，然後在12小時內冷卻至18°C。漿液在18°C下保持4小時並且然後隨後在8小時內冷卻至10°C。過濾漿液並用庚烷洗滌濕餅。濕餅在烘箱中在< 50 mmHg下在50°C下乾燥。在這種情況下，烘箱中發生了不可控的加熱，

這導致一些濕餅熔化。所得固體（150 g，90%）無需進一步純化即用於下一步驟中。

【0224】 步驟8：作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的再結晶

【0225】 將來自步驟7的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（150 g，401 mmol）裝入1 L反應器中，然後是MeOH（176 g）。用氮氣填充反應器並開始攪拌。將內容物加熱至55°C以將固體溶解為溶液。將深棕色溶液冷卻至25°C並用*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1，形式A）（1.50 g，4.01 mmol）引晶。漿液保持5小時，然後藉由蠕動泵在3小時內將水（253 g）添加到反應器中。漿液在25°C下保持過夜。第二天，在過濾漿液之前，將其在4小時內冷卻至內部溫度為4°C。濕餅用水中的10% MeOH（100 g）洗滌並且然後在真空烘箱中在55°C下乾燥以得到呈結晶固體的化合物1（92.15 g，61%，99.3 wt%純度）。根據實例8藉由PXRD對固體進行分析，如圖2所示，並指定名稱形式A。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.12 (d, *J* = 2.3 Hz, 1H), 8.77 - 8.71 (m, 1H), 8.22 (dt, *J* = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 7.45 (dd, *J* = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 3.43 (s, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.80 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 1.23 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H)。ESIMS *m/z* 374 [(*M*+H)⁺]。

【0226】 實例3

【0227】 作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從1,4-二噁咻中結晶。

【0228】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的25.2 mg的化合物1形式A溶於500 μL的1,4-二噁咻中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將小瓶置於通風櫥中

以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式A。

【0229】 實例4

【0230】 作為形式A的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從MeOH中替代結晶。

【0231】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的24.9 mg的化合物1形式A溶於1 mL MeOH中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式A。

【0232】 實例5

【0233】 作為形式B的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從乙腈中結晶。

【0234】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的24.6 mg的化合物1形式A溶於500 μ L乙腈中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，如圖3所示，並指定名稱為形式B。

【0235】 實例6

【0236】 作為形式B的*N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）從EtOH中替代結晶。

【0237】 在1打蘭小瓶中將如實例2中製備的25.2 mg的化合物1形式A溶於2 mL EtOH中。用箔上有小孔的鋁箔覆蓋小瓶，並將其置於通風櫥中以使溶劑蒸

發3天，以得到結晶固體。根據實例9藉由PXRD對樣品進行分析，並指定名稱為形式B。

【0238】 實例7

【0239】 *N*-[4-氯-2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]-*N*-乙基-3-(甲基磺醯基)丙醯胺（化合物1）的蒸發結晶溶劑篩選。

【0240】 按照如實例3-6中所述之相同的通用程序，將如實例2中製備的化合物1形式A溶於各種溶劑中並進行蒸發結晶程序。結果總結在表4中，並根據實例9確認了PXRD圖。

[表4]

溶劑	條件	多晶型形式
丙酮	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	A
二氯甲烷	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	A
乙酸乙酯	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
異丙醇	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
乙酸異丙酯	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
2-甲基-四氫呋喃	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B
四氫呋喃	箔覆蓋的小瓶，1個小孔，室溫	B

【0241】 實例8

【0242】 化合物1的結晶多晶型形式A和B的粉末X射線繞射（PXRD）。

【0243】 使用Rigaku Miniflex II臺式X射線繞射儀對樣品進行分析。X射線源係在30 kV和15 mA下操作的Cu正常聚焦（Normal Focus）管。在下表中提供了另外的操作參數。

X射線	30 kV，15 mA	掃描速度/持續時間	0.2000度/分鐘
測角儀		步寬	0.0100度
附件	-	掃描軸	2θ/θ
濾波器		掃描範圍	3.0000 - 40.0000度

CBO選擇狹縫	-	入射狹縫	1.25度
繞射光束單色儀	固定單色儀	限長狹縫	-
檢測器	MiniFlex2計數器	接收狹縫 #1	1.25度
掃描模式	連續	接收狹縫 #2	0.3 mm

【0244】藉由向玻璃樣品支架中添加至少20 mg並使用輕微手動壓力保持樣品表面平坦且與樣品支架的參考表面齊平來製備粉末樣品。將玻璃支架放置在鋁支撐件的頂部。使用5 °2 θ /分鐘的連續掃描以0.02 °2 θ 的有效步長從3 °2 θ 至40 °2 θ 對每個樣品進行分析。使用0.2 °2 θ /分鐘的連續掃描和0.01 °2 θ 的有效步長分析高解析度樣品。

【0245】 實例9

【0246】 化合物1的結晶多晶型形式A和B的替代的粉末X射線繞射（PXRD）。

【0247】 樣品係使用被配置成使用線源X射線束用於反射布拉格布倫塔諾（BraggBrentano）幾何體的Rigaku Smart-Lab X射線繞射系統分析的。x射線源係在40 kV和44 ma下操作的Cu長細聚焦（Long Fine Focus）管。該源在樣品處提供從高角度的窄線變為低角度的寬矩形的入射光束輪廓。線上X射線源上使用光束調節狹縫，以確保沿線和垂直於線的最大光束大小小於10 mm。布拉格-布倫塔諾幾何體係由被動發散和接收狹縫控制的仲聚焦幾何體，其中樣品本身作為光學元件的聚焦部件。布拉格-布倫塔諾幾何體的固有分辨率部分上取決於繞射儀半徑和所用接收狹縫的寬度。典型地，操作Rigaku Smart-Lab以得到0.1 °2 θ 或更小的峰值寬度。X射線束的軸向發散由入射和繞射光束路徑中的5.0度索勒（Soller）狹縫控制。在低背景Si支架中使用輕微手動壓力保持樣品表面平坦且

與樣品支架的參考表面齊平來製備粉末樣品。使用 $6^\circ 2\theta$ /分鐘的連續掃描以 $0.02^\circ 2\theta$ 的有效步長從 $2^\circ 2\theta$ 至 $40^\circ 2\theta$ 對每個樣品進行分析。

【0248】 實例10：化合物1的多晶型形式A和B的差示掃描量熱法（DSC）。

【0249】 使用TA Instruments Q2500 DSC進行DSC分析。在運行樣品之前，完成鋼校準和驗證。將約3-5 mg多晶型形式A和B樣品在空氣中裝入氣密密封的鋁盤中。將樣品在TA Q2500 DSC中以 $10^\circ\text{C}/\text{分鐘}$ 的速率從 0°C 加熱至 120°C 。使用TRIOS軟體分析所得的熱譜圖，以計算熔點和熔化熱。結果在圖4（多晶型形式A）和圖5（多晶型形式B）中示出。

【0250】 實例11：化合物1的多晶型形式A和B的低頻拉曼光譜。

【0251】 拉曼光譜係使用配備有785 nm Invictus雷射器（15 mW）的Kaiser RXN2光譜儀獲得的。光譜係使用具有Kaiser宇宙射線抑制的准直光束探頭和每個光譜4分鐘的採集時間收集的。結果在圖6（多晶型形式A）和圖7（多晶型形式B）中示出。

【0252】 實例12：多晶型A和多晶型B材料的空氣研磨

【0253】 化合物1多晶型A和化合物1多晶型B樣品分別用噴磨機進行空氣研磨直到粒度 $d(0.5) < 6\ \mu\text{m}$ 且 $d(0.9) < 15\ \mu\text{m}$ 。粉末X射線繞射（PXRD）係在空氣研磨過程之前和之後對樣品進行的。PXRD數據表明，樣品的多晶型形式藉由研磨過程沒有改變。研磨後，PXRD數據顯示，研磨後的化合物1多晶型A與本文所述之化合物1多晶型A的PXRD數據一致。研磨後，PXRD數據顯示，研磨後的化合物1多晶型B與本文所述之化合物1多晶型B的PXRD數據一致。

【0254】 實例13：在頭對頭的成蟲甘薯粉虱煙粉虱敲低研究中，結晶化合物1多晶型A和化合物1多晶型B與非結晶化合物1（無定形油）的比較

【0255】 在此研究中，評價了化合物1對成蟲甘薯粉虱、煙粉虱的行為的影響。一般來說，將不同形式的化合物1（本發明之多晶型形式A、本發明之多晶型形式B、或非結晶化合物1無定形油）施加到玻璃小瓶的內部並將成蟲煙粉虱轉移到經處理的小瓶中，藉由與經處理的玻璃表面接觸使它們暴露於化合物1。為了量化先前報告的敲低效果（Lee等人2013），在經處理的小瓶底部以上2 cm處劃了一條線並在初始暴露後的前三個小時記錄2 cm線以上的煙粉虱的數量。雖然被敲低的粉虱沒有立即被殺死，但在田間模擬試驗和經處理的植物上的田間試驗中，此效果已被證明藉由饑餓和脫水導致死亡。

【0256】 此研究使用常見的經處理的玻璃小瓶生物測定藉由直接接觸暴露測試昆蟲（Busvine 1971），表徵了化合物1多晶型A和化合物1多晶型B對成蟲煙粉虱粉虱行為的影響，並在與非結晶化合物1的直接頭對頭比較中比較了該等影響。將測試化合物溶於丙酮中（實例11A）或懸浮於揮發性反溶劑（己烷）中（實例11B），並且然後使用實驗室輥均勻地塗在玻璃小瓶的內部。

【0257】 實例13A：丙酮實驗

【0258】 在此實驗中，評價了化合物1的兩種形式（多晶型形式B和無定形油）對煙粉虱行為的影響。對於每種形式的化合物1評價了三種施用比率（25 g/ha、2.5 g/ha和0.25 g/ha），此外還有溶劑空白對照。每個處理和對照都重複了三次。化合物1樣品溶於丙酮中並塗在11打蘭螺旋蓋玻璃小瓶（Fisherbrand 03-339-21N）（新罕布什爾州漢普頓飛世爾科技公司（Fisher Scientific, Hampton, NH））內部。每個小瓶的內部尺寸為2.5 × 9 cm，導致處理面積為75.6 cm²。為了處理小瓶，首先藉由將1 mg的化合物1樣品（多晶型形式B或無定形油）溶於2 ml的丙酮中來製備每個樣品的儲備溶液。使用實驗室渦旋混合器攪拌儲備溶液以確保溶液完全

混合。將151 μL 的每種儲備溶液添加到11.85 mL的丙酮中以產生25 g/ha比率的處理溶液（導致0.25 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ）。將25 g/ha的處理溶液連續稀釋十倍，兩次以產生2.5和0.25 g/ha比率的處理溶液。將3 mL的每種處理溶液轉移到11打蘭小瓶中並將小瓶置於實驗室試管輓上並在室溫下旋轉直到丙酮完全蒸發，在小瓶的內部留下化合物1的塗層。用3 mL的丙酮處理溶劑空白小瓶。處理後，小瓶在室溫下在通風櫥中敞開過夜，為第二天的測試做準備。從Corteva Agriscience公司（印第安那州印第安納波里斯（Indianapolis, IN））維護的易感菌群中收集混合性別成蟲煙粉虱粉虱（中東小亞細亞1（MEAM1）生物型）。用 CO_2 麻醉成蟲煙粉虱並將大約66.5，32-102（平均值，最小值-最大值）引入每個經處理的小瓶中，並記錄其行為。為了評價煙粉虱行為，在小瓶底部以上2 cm處劃了一條線，並在引入後的15、30、45、60、90、120、150和180 min記錄線以上的個體數量。實驗結束後，昆蟲藉由在 -30°C 下冷凍72 h失去生命，之後記錄每個小瓶中昆蟲的總數。計算每個比率的2 cm線以上的煙粉虱的百分比並用於繪製隨時間的推移化合物1對粉虱的影響的圖。

【0259】統計分析

【0260】對於每個試驗和比率，使用用於具有二項式響應和logit連接函數的重複測量的廣義線性混合模型（GLMM）分析2 cm線以上的昆蟲的比例（Stroup, 2012）。使用具有響應的二項式分佈的廣義線性模型，而不是具有正態分佈的線性模型（ANOVA），允許正確使用實驗中使用的分佈假設和實際樣本量（昆蟲的數量）。

【0261】該模型包括作為固定效應的處理、時間點和交互作用處理 $\times$ 時間點以及作為隨機效應的重複（實驗單元）。重複測量之間的相關性用複合對稱協方差矩陣進行建模。

【0262】廣義線性混合模型用殘差偽似然法估計，並用圖基（Tukey）檢驗（ $\alpha = 0.05$ ）比較處理比例的平均值（Stroup 2012）。統計分析用 SAS Proc GLIMMIX（SAS軟體，9.4版，北卡羅來納州卡裡SAS研究所公司（SAS Institute Inc., Cary, NC））進行。

【0263】結果

【0264】在溶劑空白對照中，在任何給定時間在2 cm線以上都有大約20%-30%的昆蟲（ $34.1\% \pm 2.18$ ，平均值 $\pm$ SEM）（圖8）。在25 g/ha的最高比率下，隨時間的推移化合物1暴露有明顯的影響，由隨時間的推移2 cm線以上的昆蟲數量減少證明，因為暴露於化合物1開始對它們的行為產生負面影響（圖9，表5）。然而，處理沒有明顯的影響並且處理與時間點之間沒有交互作用，表明在25 g/ha比率下多晶型B和無定形油的影響沒有差異（表5）。在2.5 g/ha的中間比率下，多晶型B與無定形油的影響之間有顯著差異，其中2 cm線以上的暴露於多晶型B的昆蟲更少，因為它們的行為比在此比率下暴露於無定形油的昆蟲受到的影響更大（圖10，表6）。在2.5 g/ha比率下，時間或處理與時間之間的交互作用沒有影響（表6）。最後，在0.25 g/ha的最低比率下，任何模型效應都沒有明顯的影響，表明在此比率下多晶型B和無定形油的影響沒有差異（表7）。

[表5]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	4.127	1.06	0.359
時間點	7	30.11	18.57	<.0001
處理 x 時間點	7	30.11	1.55	0.1883
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.167	0.042	a	
多晶型B	0.115	0.030	a	

[表6]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	4.278	17.31	0.0123
時間點	7	26.5	0.65	0.7085
處理 x 時間點	7	26.5	0.52	0.81
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.326	0.035	a	
多晶型B	0.156	0.022	b	

[表7]

固定效應的III型測試				
效應	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	1	3.976	4.36	0.1054
時間點	7	25.51	0.53	0.8014
處理 x 時間點	7	25.51	0.28	0.9554
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.295	0.062	a	
多晶型B	0.502	0.074	a	

【0265】 實例13B：己烷實驗

【0266】 在此實驗中，評價了化合物1的三種形式（多晶型形式A、多晶型形式B和非結晶無定形油）對煙粉虱行為的影響，多晶型形式A、多晶型形式B和無定形油。多晶型形式A和多晶型形式B的樣品如實例12所述進行了精細研磨。己烷實驗的實驗設計，包括比率（25、2.5和0.25 g/ha）、重複（每個處理三次重複）和處理懸浮液的製備與實例13A所述之過程相似。然而，使用己烷代替丙酮。因為化合物1不容易溶於己烷，將其用作反溶劑來懸浮化合物1的每種多晶型形式的顆粒和非結晶的無定形油化合物1，以施加到玻璃小瓶的內表面，同時保留多晶型結構。因為化合物1不容易溶於己烷，為了使顆粒盡可能一致地分佈在每個小瓶中，使用實驗室渦旋混合器將儲備懸浮液混合30秒，然後在超音波波浴（Branson 2800，康涅狄格州丹伯里必能信超音波公司（Branson Ultrasonics Corp., Danbury, CT））中攪拌5分鐘。超音波處理後，在將151 μ l的每種儲備懸浮液轉移到11.85 mL的己烷中以產生25 g/ha比率的處理懸浮液（導致0.25 μ g/cm²）之前，

立即再次使用渦旋混合器混合樣品。將25 g/ha的處理懸浮液連續稀釋十倍，兩次以產生2.5和0.25 g/ha比率的處理懸浮液。將3 mL的每種處理懸浮液轉移到11打蘭小瓶中並將小瓶置於實驗室試管輓上並在室溫下旋轉直到己烷完全蒸發，在小瓶的內部留下化合物1顆粒的均勻塗層。用3 mL的己烷處理溶劑空白小瓶。處理後，將小瓶儲存，用大約117.4，47-219（平均值，最小值-最大值）的成蟲煙粉虱侵染，並如丙酮實驗中所述進行評價。

【0267】 統計分析

【0268】 對於每個試驗和比率，使用用於具有二項式響應和logit連接函數的重複測量的廣義線性混合模型（GLMM）分析2 cm線以上的昆蟲的比例（Stroup，2012）。使用具有響應的二項式分佈的廣義線性模型，而不是具有正態分佈的線性模型（ANOVA），允許正確使用實驗中使用的分佈假設和實際樣本量（昆蟲的數量）。

【0269】 該模型包括作為固定效應的處理、時間點和交互作用處理 $\times$ 時間點以及作為隨機效應的重複（實驗單元）。重複測量之間的相關性用複合對稱協方差矩陣進行建模。

【0270】 廣義線性混合模型用殘差偽似然法估計，並用圖基（Tukey）檢驗（ $\alpha = 0.05$ ）比較處理比例的平均值（Stroup 2012）。統計分析用SAS Proc GLIMMIX（SAS軟體，9.4版，北卡羅來納州卡裡SAS研究所公司（SAS Institute Inc., Cary, NC））進行。

【0271】 結果

【0272】 在溶劑空白對照中，在任何給定時間在2 cm線以上都有大約30%-50%的昆蟲（ $42.1\% \pm 3.31$ ，平均值 $\pm$ SEM）（圖11）。與丙酮實驗類似，在最

高比率（25 g/ha）下，對於多晶型形式和無定形油而言隨時間的推移的化合物1暴露都有明顯的影響，由隨時間的推移2 cm線以上的昆蟲數量減少證明，因為殺昆蟲劑開始對它們的行為產生負面影響（圖12，表8）。然而，處理沒有明顯的影響，表明在此比率下多晶型A、B和無定形油的影響沒有差異（表8）。在2.5 g/ha的中間比率下，處理有明顯的影響，其中在與無定形油直接比較時，暴露於多晶型形式A或多晶型形式B的粉虱受到明顯影響（圖13，表9）。此外，在2.5 g/ha比率下，隨時間的推移化合物1暴露有明顯的影響，這在多晶型形式A和多晶型形式B處理中都非常明顯（圖13，表9）。最後，在2.5 g/ha比率下，處理和時間有明顯的交互作用，表明在每個處理中昆蟲如何隨時間的推移響應係有差異的，如隨時間的推移與無定形油相比多晶型形式A與多晶型形式B處理之間的響應曲線的不同形狀證明的（圖13，表9）。在最低比率（0.25 g/ha）下，得到了與在2.5 g/ha比率下觀察到的結果相似的結果。在0.25 g/ha下，處理、時間、以及處理和時間的交互作用都有明顯的影響（圖14，表10）。與2.5 g/ha比率類似，在0.25 g/ha比率下暴露於多晶型形式A和多晶型形式B處理的昆蟲比在0.25 g/ha比率下暴露於無定形油的昆蟲受到的負面影響更大（圖14，表10）。

[表8]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	5.737	1.32	0.3366
時間點	7	62	40.81	<.0001
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.029	0.011	a	
多晶型B	0.013	0.005	a	
多晶型A	0.015	0.006	a	

*交互作用處理 x 時間點，沒有明顯的影響，從模型中刪除以達到收斂。

[表9]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	6.859	1.32	0.3366
時間點	7	48	50.19	<.0001
處理 x 時間點	14	48	13.84	<.0001
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.453	0.053	a	
多晶型B	0.079	0.017	b	
多晶型A	0.080	0.017	b	

[表10]

固定效應的III型測試				
效應*	Num DF	Den DF	F值	Pr > F
處理	2	5.764	23.38	0.0017
時間點	7	40.95	10.47	<.0001
處理 x 時間點	14	40.42	4.1	0.0002
處理最小二乘均值（比例標度）				
處理	平均值	平均標準誤差	處理最小二乘均值的Tukey-Kramer分組（ $\alpha = 0.05$ ）	
無定形油	0.601	0.030	a	
多晶型B	0.345	0.028	b	
多晶型A	0.342	0.028	b	

【符號說明】

【0273】 無