

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2024-530164
(P2024-530164A)

(43)公表日 令和6年8月16日(2024.8.16)

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

C 0 7 D 417/04 (2006.01) C 0 7 D 417/04 C S P 4 H 0 1 1

A 0 1 P 7/04 (2006.01) A 0 1 P 7/04

A 0 1 N 43/78 (2006.01) A 0 1 N 43/78 B

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全80頁)

(21)出願番号	特願2024-506619(P2024-506619)	(71)出願人	501035309
(86)(22)出願日	令和4年7月29日(2022.7.29)		コルテバ アグリサイエンス エルエルシー
(85)翻訳文提出日	令和6年3月19日(2024.3.19)		アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2
(86)国際出願番号	PCT/US2022/074322		6 8 , インディアナポリス, ジオンス
(87)国際公開番号	WO2023/015135		ヴィレ ロード, 9 3 3 0
(87)国際公開日	令和5年2月9日(2023.2.9)	(74)代理人	100092783
(31)優先権主張番号	63/228,910		弁理士 小林 浩
(32)優先日	令和3年8月3日(2021.8.3)	(74)代理人	100095360
(33)優先権主張国・地域又は機関			弁理士 片山 英二
	米国(US)	(74)代理人	100120134
(31)優先権主張番号	63/368,548		弁理士 大森 規雄
(32)優先日	令和4年7月15日(2022.7.15)	(74)代理人	100139310
(33)優先権主張国・地域又は機関			弁理士 吉光 真紀
	米国(US)	(72)発明者	ベトリ, リック
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA		アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2
	最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 殺生物活性を有する多形

(57)【要約】

本開示は、カメムシ目 (Hemiptera)、アザミウマ目 (Thysanoptera)、チョウ目 (Lepidoptera)、及び同類のものの有害生物の防除で有用なN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの多形形態、そのような多形形態を製造する方法、そのよう方法で使用される中間体、そのような多形形態を含む殺生物組成物、並びにそのような殺生物組成物をそのような有害生物に対して使用する方法に関する。

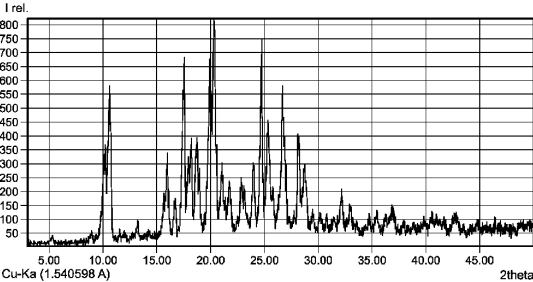


FIG. 1

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1, 3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶形態。

【請求項 2】

前記結晶形態は、N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1, 3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶多形形態である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 3】

前記結晶形態は、無水又は無溶媒である、請求項 1 又は 2 に記載の結晶多形。

10

【請求項 4】

20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1, 3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶多形形態 A。

【請求項 5】

前記結晶多形形態は、17.4 ± 0.2 及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 4 に記載の結晶多形形態。

【請求項 6】

前記結晶多形形態は、17.4 ± 0.2、19.9 ± 0.2、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 5 に記載の結晶多形形態。

20

【請求項 7】

前記結晶多形形態は、10.6 ± 0.2、17.4 ± 0.2、19.9 ± 0.2、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 6 に記載の結晶多形形態。

【請求項 8】

前記結晶多形形態は、10.6 ± 0.2、17.4 ± 0.2、18.2 ± 0.2、19.9 ± 0.2、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 7 に記載の結晶多形形態。

【請求項 9】

前記結晶多形形態は、10.6 ± 0.2、17.4 ± 0.2、18.2 ± 0.2、18.7 ± 0.7、19.9 ± 0.2、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 8 に記載の結晶多形形態。

30

【請求項 10】

前記結晶多形形態は、10.6 ± 0.2、16.0 ± 0.2、17.4 ± 0.2、18.2 ± 0.2、18.7 ± 0.7、19.9 ± 0.2、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 9 に記載の結晶多形形態。

【請求項 11】

前記結晶多形形態は、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、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 10 に記載の結晶多形形態。

40

【請求項 12】

前記結晶多形形態は、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、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（2θ）でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 11 に記載の結晶多形形態。

【請求項 13】

前記結晶多形形態は、10.0 ± 0.2、10.1 ± 0.2、10.6 ± 0.2、16

50

・ 0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 18.9 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 12 に記載の結晶多形形態。

【請求項 14】

前記結晶多形形態は、図 1 及び図 2 で示されているものと本質的に同一の 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 13 に記載の結晶多形形態。

【請求項 15】

前記結晶多形形態は、約 101.09°C でのピーク温度を有する吸熱ピークを含む DSC サーマグラムを有する、請求項 4～14 のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項 16】

図 4 と実質的に同一の DSC サーマグラムを有する、請求項 4～14 のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項 17】

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} 、及び約 3053 cm^{-1} の波数での 1 つ又は複数のピークを含むラマンスペクトルを有する請求項 4～16 のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項 18】

図 6 で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する請求項 4～17 のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項 19】

15.4 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する N-〔4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの結晶多形形態 B。

【請求項 20】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 及び 15.4 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 19 に記載の結晶多形形態。

【請求項 21】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 20 に記載の結晶多形形態。

【請求項 22】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 21 に記載の結晶多形形態。

【請求項 23】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 22 に記載の結晶多形形態。

【請求項 24】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 23 に記載の結晶多形形態。

【請求項 25】

前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 24 に記載の結晶多形形態。

【請求項 26】

10

20

30

40

50

前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項25に記載の結晶多形形態。

【請求項27】

前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項26に記載の結晶多形形態。

【請求項28】

前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項27に記載の結晶多形形態。

【請求項29】

前記結晶多形形態は、図3で示されているものと本質的に同一の1つ又は複数のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項28に記載の結晶多形形態。

【請求項30】

前記結晶多形形態は、約 105.24°C でのピーク温度を有する吸熱ピークを含むDSCサーモグラムを有する、請求項19～29のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項31】

図5と実質的に同一のDSCサーモグラムを有する、請求項19～29のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項32】

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} 及び約 1308 cm^{-1} 、約 1518 cm^{-1} 、約 1573 cm^{-1} 、約 1592 cm^{-1} 、約 1673 cm^{-1} 、約 2919 cm^{-1} 、及び 2937 cm^{-1} の波数での1つ又は複数のピークを含むラマンスペクトルを有する請求項19～31のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項33】

図7で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する請求項19～32のいずれか一項に記載の結晶多形形態。

【請求項34】

請求項1に記載の結晶形態、又は請求項2～33のいずれか一項に記載の結晶多形形態を含む組成物。

【請求項35】

有害生物を防除する方法であって、請求項1に記載の結晶形態、請求項2～23のいずれか一項に記載の結晶多形形態、又は請求項34に記載の組成物の殺生物有効量を領域に施用することを含む方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2021年8月3日に出願された米国仮出願第63/228,910号、及び2022年7月15日に出願された米国仮出願第63/368,548号に対する35 U.S.C. § 119(e)の下での優先権を主張しており、これらの明細書の全開示が、参照により本明細書に組み込まれる。

【0002】

本開示は、カメムシ目(Hemiptera)、アザミウマ目(Thysanoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、及び同類のものの有害生物の防除で有用

10

20

30

40

50

なN-〔4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの多形形態、そのような多形形態を製造する方法、そのような方法で使用する中間体、そのような多形形態を含む殺生物組成物、並びにそのような殺生物組成物をそのような有害生物に対して使用する方法に関する。

【背景技術】

【0003】

「ヒトにとって最も危険な疾患の多くは、媒介昆虫によって伝播される」(Riveroら)。「歴史的には、マラリア、デング熱、黄熱病、ペスト、フィラリア症、シラミ媒介性チフス、トリパノミアシス(trypanomiasis)、リーシュマニア症、及び他の生物媒介性疾患は、17世紀から20世紀初頭にかけて、ヒトの疾患及び死亡の原因として他の全ての原因を組み合わせたよりも多かった」(Gubler)。生物媒介性疾患は、全世界の寄生虫症及び感染症の約17%を占めている。マラリア単独でも、年間800,000人以上の死亡原因となっており、その85%は、5歳未満の子供に起きている。毎年、約5千万～約1億件のデング熱発症がある。さらに、25万～50万件のデング出血熱が毎年起きている(Matthews)。媒介生物の防除が感染症の予防及び防除に果たす役割は大きい。しかしながら、ヒト疾患の主要媒介生物である全ての昆虫種において、殺虫剤への耐性(殺虫剤に対する多剤耐性を含む)が起きてきている(Riveroら)。近年では、550種を超える節足動物種が少なくとも1種の農薬に対する耐性を獲得している(Whalonら)。さらに、昆虫の耐性の例は、除草剤及び殺真菌剤の耐性の例の数をはるかに超え続けている(Sparkesら)。

10

20

【0004】

毎年、昆虫、植物病原体、及び雑草が、全食料生産の40%超を損なっている。農薬の施用、並びに輪作及び生物学的防除等の多様な非化学的防除の使用にもかかわらず、この損失が発生している。この食料の幾分かでも救うことができれば、30億人を超える世界中の栄養不良の人々に食糧供給することが可能となるであろう(Pimental)。

【0005】

植物寄生性の線虫は、最も広まっている有害生物の1つであり、多くの場合、最も駆除が難しく、且つコストがかかるものである。線虫が原因の損失は、約9%(先進国)～約15%(発展途上国)であると推計されている。しかしながら、米国では、35州の各種の作物についての調査では、線虫が原因の損失は、25%にも上ることが示されている(Nicolら)。

30

【0006】

腹足類(ナメクジ及びカタツムリ)は、他の節足動物又は線虫より経済的重要性の低い有害生物であるとされているが、ある地域では、それらは、収量を実質的に低下させ、収穫物の品質に悪影響を与え、さらにヒト、動物、及び植物の病気を伝染させる可能性があることに留意されたい。地域的には、わずか数十種の腹足類が有害生物であるが、全世界規模では数百種が重要な有害生物である。特に、腹足類は、広く各種の農耕作物及び園芸作物、例えば耕作作物、牧畜作物及び繊維作物；野菜；灌木及び果樹；薬草；並びに観賞植物に影響を及ぼす(Speiser)。

40

【0007】

シロアリは、あらゆる種類の民間及び公共の構造物に被害を及ぼす。全世界でのシロアリによる被害は、毎年、数十億米ドルに達する。2005年には、シロアリは、毎年、世界中で500億米ドルを超す被害を与えていると推定された(Korb)。

【0008】

従って、上述のものも含めて多くの理由から、コストがかかり(2010年で1種の農薬当たり約2.56億米ドルかかると推定されている)、時間がかかり(平均して1種の農薬当たり約10年)、且つ困難な新規農薬の開発が継続的に必要とされている(CropLife America)。

【0009】

50

新しい農薬が緊急に必要とされている。ある特定の有害生物は、現在使用されている農薬に対する耐性を発達させている。数百もの有害生物種が、1種又は複数種の農薬に耐性を示す。DDT、カルバメート、及び有機リン酸エステル等の比較的古い農薬の内のいくつかに対する耐性の発現は、よく知られている。しかし、耐性は、いくつかの新しい農薬に対しても発現している。

【0010】

ある特定の農薬（例えば、殺虫剤）は、標的有害生物の発生、繁殖、又は生存に不可欠な生理的プロセスを乱すことにより、昆虫有害生物を駆除することが示されている。これらの生理的混乱は様々な方法で起こり得、そのため、多くの様々な作用様式を介して作用する化合物が発見されて開発されている。殺虫剤のカテゴリに分類される農薬には、どの生理的プロセスを乱すかに基づいて様々なグループに大別され得る様々な作用様式がある。例示的な作用様式として、神経及び筋肉、成長及び発達、呼吸、中腸標的、並びに作用が未知であるか又は非特異的な殺虫剤が挙げられる（IRAC 2022）。これらは大まかな分類であるが、標的有害生物の死亡原因は、必ずしも殺虫剤の特定の作用様式と一致するとは限らない（Matsumura 1985）。

10

【0011】

一例は、弦音器官に影響を及ぼす殺虫剤である。そのような殺虫剤の例は市販されており、ピメトロジン、ピリフルキナゾン、及びフロニカミド等の化合物、並びにアフィドピロペン等の最近市場に導入された新規のメンバーが挙げられる。神経及び筋肉組織を標的とするものとして大別されるが、弦音器官調節剤は、標的有害生物種で様々な行動症状（例えば、協調及び摂食能力の崩壊）を誘発し、最終的には、飢餓及び乾燥に起因する死に至る（Kandasamy et al. 2017, Morita et al. 2007, Maienfisch 2019, Wang et al. 2011, Zhou et al. 2021）。行動学的研究では、弦音器官調節剤の行動学的効果が研究されている。例えば、Lee及びcolleagues（Lee et al. 2013）は、ベミシア・タバシ（*Bemisia tabaci*）及びトリアレウロデス・バポラリウム（*Trialeurodes vaporariorum*）の成虫へのピリフルキナゾンの効果を評価しており、迅速なノックダウン効果、並びに痙攣及び麻痺等の強い中毒症状に言及した。同様の行動学的効果が、ドロソフィラ・メラノガスター（*Drosophila melanogaster*）でも報告されており、弦音器官調節剤への暴露により、処理されたハエの登はん行動が強く阻害された（Nesterov et al. 2015, Wang et al. 2019）。弦音器官調節殺虫剤は、移動及び接触に影響を及ぼすことから、飢餓及び乾燥による死亡の発生は、ネオニコチノイド等の他の殺虫剤と比べて緩やかに起こる（He et al. 2010, Maienfisch 2019）。しかしながら、中毒症状は、暴露後すぐに見られ、且つその作用を診断し得る（Lee et al. 2013, Morita et al. 2007）。従って、ノックダウン効果等の弦音器官調節剤の行動学的効果は、死亡率の増加につながる変化であり、且つ死亡率の指標として提供され得ることが示されている。

20

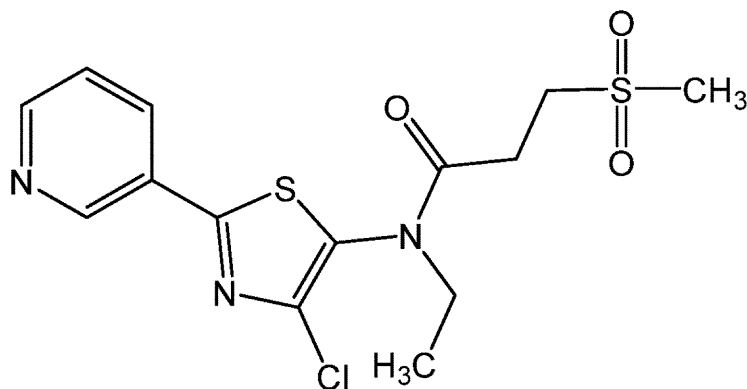
30

【0012】

従って、上記の理由を含む多くの理由により、新規な農薬の必要性が存在する。そのような一化合物である、式1

40

【化 1】



N-(4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)チアゾール-5-イル)-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド

1

で表される N-〔4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド、又はその溶媒和物若しくは水和物（本明細書ではまた、N-(4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)チアゾール-5-イル)-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドとしても既知の「化合物 1」とも称される）は、様々な有害生物に対する活性を示す強力な低分子である。化合物 1 は、殺虫有用性に関して研究されている。化合物 1 に関連する化合物は、国際公開第 2010/139497 A 1 号パンフレット及び米国特許第 8,350,044 号明細書で開示されており、これらは、その全体が参照により本明細書に組み込まれる。

【0013】

化合物 1 は、農薬としての用途が見出されているが、化学的安定性を維持しつつ特性が改善されている（例えば、結晶性の改善、溶解性、吸湿性の低下、及び／又は現場での施用のための商業的に実現可能な組成物の製剤化の容易さ）多形形態を有することが有利である。

【0014】

本開示に引用された特定の参考文献

Busvine, J. R. (1971). Contact poisons in solid form: residual films of contact insecticides. In A Critical Review of the Techniques for Testing Insecticides (Second Edition ed., pp. 102-128). Commonwealth Agricultural Bureaux.

CropLife America, The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future, 2010.

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, Edited by Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., and Matthias W., p. 1-20, 2012.

Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, Emerging Inf

- ectious Diseases, Vol. 4, No. 3, p. 442–450, 1998.
- 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. *Pest Management Science*, 67 (4), 483–491.
- IRAC Insecticide Resistance Action Committee (2022). IRAC Mode of Action Classification Scheme, Version 10.2.39. Retrieved March 2022, from <https://irac-online.org/mode-of-action/> 10
- 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. *Insect Biochemistry and Molecular Biology*, 84, 32–39.
- Korb, J., Termites, *Current Biology*, Vol. 17, No. 23, 2007. 20
- 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 Pyrifluquinazon to *Trialeurodes vaporariorum* and *Bemisia tabaci*. *The Korean Journal of Pesticide Science*, 17 (1), 33–40
- Maienfisch, P. (2019). Selective feeding blockers: pymetrozine, flonicamid, and pyrifluquinazon. In P. Jeschke, M. Witschel, W. Kraemer, & U. Schirmer (Eds.), *Modern Crop Protection Compounds (Third Edition ed., Vol. Volume 3: Insecticides, pp. 1501–1526)*. Wiley-VCH. 30
- Matsumura, F. (1985). Modes of action of insecticides. In *Toxicology of Insecticides: Second Edition* (pp. 111–202). Plenum Press.
- Matthews, G., *Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases*, Ch. 1, p. 1, 2011. 40
- Morita, M., Ueda, T., Yoneda, T., Koyanagi, T., & Haga, T. (2007). Flonicamid, a novel insecticide with a rapid inhibitory effect on aphid feeding. *Pest Management Science*, 63, 969–973.
- Nesterov, A., Spalthoff, C., Kandasamy, R., Kataka, R., Rankl, Nancy B., Andres, M., Jaehde, P., Dorsch, John A., Stam, Lynn F., Braun, F.-J., Warren, B., Salgado, Vincent L., & Goepfe 50

- rt, Martin C. (2015). TRP Channels in Insect Stretch Receptors as Insecticide Targets. *Neuron*, 86 (3), 665–671.
- Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockland, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, *Genomic and Molecular Genetics of Plant-Nematode Interactions*, p. 21–43, 2011.
- Pimental, D., *Pest Control in World Agriculture*, *Agricultural Sciences – Vol. , II*, 2009. 10
- Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., *Insect Control of Vector-Borne Diseases: When Is Insect Resistance a Problem?* *Public Library of Science Pathogens*, Vol. 6, No. 8, p. 1–9, 2010.
- Sparks T. C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management, *Pesticide Biochemistry and Physiology* (2014) available online 4 December 2014. 20
- Speiser, B., *Molluscicides*, *Encyclopedia of Pest Management*, Ch. 219, p. 506–508, 2002.
- Stroup, W. W. (2012). *Generalized Linear Mixed Models: Modern Concepts, Methods and Applications*. CRC Press. 555 pp.
- Wang, H., Lei, Z., Mei, Y., Shuo, L., & YunLiang, J. (2011). Effect of pymetrozine interferes with feeding behavior of *Bemisia tabaci* (Homoptera, Aleyrodidae). *Chinese Journal of Applied Entomology*, 48 (1), 54–59. 30
- 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*. *Pesticide Biochemistry and Physiology*, 153, 77–86.
- Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., *Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods*, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Ch. 1, p. 5–33, 2008. 40
- 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). *Agronomy*, 11 (11). [0015]

本開示の定義

これらの定義において与えられる例は、一般的に非網羅的なものであり、本開示を限定 50

すると解釈されてはならない。置換基は、それが結合している特定の分子に関して、化学結合規則及び立体的適合性の制限に従うべきであることを理解されたい。これらの定義は、本開示の目的のためにのみ使用されるものである。

【0016】

「有効成分」という語句は、有害生物を防除するのに有用な活性を有し、且つ／又は有害生物を防除するのにより良好な活性を有するように他の物質を支援するのに有用な物質を意味し、そのような物質の例として下記が挙げられるが、これらに限定されない：ダニ駆除剤、殺藻剤、摂食阻害剤、殺鳥剤、殺菌剤、鳥忌避剤、化学不妊剤、殺真菌剤、除草剤、毒性緩和剤、除草剤、昆虫誘引剤、昆虫忌避剤、殺虫剤、哺乳動物忌避剤、交尾阻害剤、軟体動物駆除剤、線虫駆除剤、植物活性化剤、植物成長調節剤、殺鼠剤、相乗剤、及び殺ウイルス剤が挙げられる（b c p c . o r g を参照されたい）。

10

【0017】

「有効成分群アルファ」（以降「A I G A」）という語句は、下記の物質を集合的に意味する：アバメクチン、アバメクチン-アミノメチル、アブシジン酸、A C C、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アセチオン、アセトクロル、アセトフェネート、アセトホス、アセトプロール、アシベンゾラル、アシフルオルフェン、アクロニフェン、A C N、アクレブ（a c r e p）、アクリナトリン、アクロレイン、アクリロニトリル、アシノナビル、アシペタクス、アフィドピロペン、アフォキサネール、（S）-アフォキサネール、A I T C、アラクロル、アラナップ、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジカルブ、アルジカルブスルホン、アルジモルフ、アルドキシカルブ、アルドリン、アレスリン、d-トランス-アレスリン、アリシン、アリドクロル、アロサミジン、アロキシジウム、アリルアルコール、アリルイソチオシアネート、アリキシカルブ、アロラック、アルファ-プロマジオロン、アルファ-シペルメトリン、アルファ-エンドスルファン、アルファメトリン、アルトレタミン、リン化アルミニウム、リン化アルミニウム、アメトクトラジン、アメトリジオン、アメトリン（a m e t r y n）、アメトリン（a m e t r y n e）、アミブジン、アミカルバゾン、アミカルチアゾール、アミジチオン、アミドクロル、アミドフルメット、アミドスルフロリン、アミノカルブ、アミノシクロピラクロル、アミノピラリド、4-アミノピリジン、アミノピリフェン、アミノトリアゾール、アミプロホス-メチル、アミプロホス、アミプロホス-メチル、アミスルプロム、アミトン、アミトラズ、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アモバム、非晶質シリカゲル、非晶質二酸化ケイ素、アンプロピルホス、A M S、アナバシン、アンシミドール、アニラジン、アニロホス、アニシフルプリン、アニスロン、アントラキノン、酒石酸アンチモンカリウム、アンツ、アホレート、アラマイト、ア-プロカルブ、三酸化ヒ素、アソメイト、アシュラム、アチダチオン、アトラトン、アトラジン、オーレオフンギン（a u r e o f u n g i n）、アベルメクチンB₁、A V G、アビグリシン、アザコナゾール、アザジラクチン、アザフェニジン、アザメチホス、アジディチオン、アジウムスルフロリン、アジンホス-エチル、アジンホスエチル、アジンホス-メチル、アジンホスメチル、アジプロトリン（a z i p r o t r y n）、アジプロトリン（a z i p r o t r y n e）、アジチラム、アゾベンゼン、アゾシクロチン、アゾトエート、アゾキシストロビン、バクメデシュ（b a c h m e d e s h）、バルバン、バーバネート、ヘキサフルオロケイ酸バリウム、多硫化バリウム、ケイフッ化バリウム、バルスリン（b a r t h r i n）、塩基性炭酸銅、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、B C P C、ベフルブタミド、ベフルブタミド-M、ベナラキシル、ベナラキシル-M、ベナゾリン、ベンカルバゾン、ベנקロチアズ、ベンダキングチ（b e n d a q i n g b i n g z h i）、ベンジオカルブ、ベンジオキシド、ベネフィン、ベNFLラリン、ベNFLラカルブ、ベNFLセート、ベNFLファンカオアン（b e n m i h u a n g c a o a n）、ベノダニル、ベノミル、ベノキサコール、ベノキサホス、ベノキノックス、ベノキトリオン、ベンスルフロリン、ベンスリド、ベンスルタップ（b e n s u l t a p）、ベントラルロン、ベントラゾン（b e n t a z o n）、ベントラゾン（b e n t a z o n e）、ベンチアバリカルブ、ベンチアゾール、ベンチオカルブ、ベントラニル、ベンザドクス（b e n z a d o x）、ベンズアルコニウムクロリド、ベンザ

20

30

40

50

マクリル、ベンザミゾール、ベンザモルフ、ベンゼンヘキサクロリド、ベンズフェンジ
ン、ベンズイミン、ベンジプラム、ベンゾビシクロン、ベンゾエピン、ベンゾフェナ
p)、ベンゾフルオル、ベンゾヒドロキシム酸、ベンゾメート、ベン
ゾホスフェート、ベンゾチアジアゾール、ベンゾビンジフルピル、ベンゾキシメート、
ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンズピリモキサン (benzpyri
moxan)、ベンズチアズロン、ベンズオカオトング (benzuocaotong)
、ベンジルアデニン、安息香酸ベンジル、ベルベリン、ベーターシフルトリン、ベーター
シペルメトリン、ベトキサジン、BHC、ガンマーBHC、ピアラホス、ビシクロピロン
、ビフェナゼート、ビフェノックス、ビフェントリン、カップービフェントリン、ビフジ
ユンチ (bifujunzhi)、ビラナホス (bilanafos)、ビナパクリル、
ビングアンズオ (binghuanzuo)、ビングキングキシアオ (bingqing
xiao)、バイオアレトリン (bioal lethrin)、S-バイオアレトリン、バイオ
エタノメトリン、バイオペルメトリン、バイオレスメトリン、ビフェニル、ビピラゾン、ビサ
ジル、ビスメルチアゾール、ビスメルチアゾール-銅、メチレンジ (x-ナフタレン-y
ースルホネート) ビスフェニル水銀 (bisphenylmercury methyl
enedi (x-naphthalene-y-sulphonate))、ビスピリバ
ック (bispyribac)、ビストリフルロン、ビスルタップ (bisultap)
、ビテルタノール、ビチオノール、ビキサフェン、ビキシロゾン、ブラスチシジン-S、
ボラックス、ボルドー液、ホウ酸、ボスカリド、BPCMS、BPMC、BPPS、ブラ
シノリド (brassinolide)、ブラシノリド-エチル、ブレビコミン (bre
vivicomin)、ブロディファコウム (brodifacoum)、プロフェンプロク
クス、プロフェンバレート、プロフラニリド、プロフルトリネート、プロマシル、プロ
マジオロン、アルファ-プロマジオロン、ブロムクロホス、プロメタリン、プロメトリン
、ブロムフェンビンホス、プロモアセトアミド、プロモボニル、プロモブチド、プロモシ
クレン (bromociclen)、プロモシクレン (bromocyclen)、プロ
モ-DDT、プロモフェノキシム、プロモホス、プロモメタン、プロモホス、プロモホス
-エチル、プロモプロピレート、プロモタロニル、プロモキシニル、ブロムピラゾン (b
rompyrazon)、ブロムピラゾン (brompyrazone)、ブロムコナゾ
ール (bromuconazole)、プロノポール、プロプロブジファコム (brop
ropdifacoum)、BRP、BTH、ブカルポラート (bucarpolate)
、ブフェンカルブ (bufencarb)、ブミナホス (buminafos)、ブピ
リメート (bupirimate)、ブプロフェジン、ブルガンディ混合物、ブスルファ
ン (busulfan)、ブスルファン (busulphan)、ブタカルブ (buta
carb)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafena
cil)、ブタム (butam)、ブタミホス (butamifos)、ブタン-フィ
プロニル、ブタチオホス、ブテナクロール、ブテン-フィプロニル、ブテトリン、ブチダ
ゾール、ブチオベート、ブチウロン、ブチホス、ブトカルボキシム、ブトネート、ブトピ
ロキシム、ブトキシカルボキシム、ブトラリン、ブトリゾール、ブトロキシジム、ブツ
ロン、ブチルアミン、ブチレート、ブチルクロロホス、ブチレン-フィプロニル、カ
コジル酸、カズサホス、カフェンストロール、カルシフェロール、ヒ酸カルシウム、塩
素酸カルシウム、カルシウムシアナミド、シアン化カルシウム、カルシウムポリスル
フィド、カル
ビンホス、カムベンジクロ (cambendichlor)、カムフェクロル、ショウ
ウ、d-ショウノウ、カントロジフェン、カプタホール、カプタン、カルバム、カルバ
モルフ、カルバノレート、カルバリル (carbaril)、カルバリル (carbaryl)
、カルバスラム、カルバチン (carbathiin)、カルバチオン (carb
athion)、カルベンダジム、カルベンダゾール、カルベタミド、カルボフェノチ
オン、カルボフラン、二硫化炭素、四塩化炭素、硫化カルボニル、カルボフェノチ
オン、カルボホス、カルボスルファン、カルボキサゾール、カルボキシド、カルボ
キシム、カル
フェントラゾン、カルプロパミド、カルタップ、カルバクロール、カルボン、CAVP、
CDA A、CDE A、CDE C、セロシジン、CEPC、セラルア、セレノックス、セトク

10

20

30

40

50

タラット (cet oct a e l a t)、サバジラ、チェシャント混合物 (Cheshunt mixture)、キナルホス (chinalphos)、キナルホスーメチル、キノメチオナト (chinomethionat)、キノメチオネート (chinomethionate)、キララキシル (chiralaxyly)、キトサン、クロベンチアゾン、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロルーIPC、クロラロース、クロラムベン、クロラミンホスホラス、クロラミゾール、クロラムフェニコル、クロラニホルメタン、クロラニル、クロラノクリル、クロラントラニリブロール、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン、クロルベンシド、クロルベンズロン、クロルビシクレン、クロルブロムロン、クロルブファム、クロルデン、クロルデコン、クロルジメフォルム、クロレンベントリン、クロルエタゼート (chloretazate) 10
)、クロルエセホン (chlorethephon)、クロレトキシホス (chlorethoxyfos)、クロレツロン、クロルフェナク、クロルフェナピル、クロルフェナゾール、クロルフェネトール (chlorfenethol)、クロルフェニジム、クロルフェンプロップ、クロルフェンソン、クロルフェンスルフィド、クロルフェンビンホス、クロルフェンビンホスーメチル、クロルフルアズロン、クロルフルラゾール、クロルフルレコール (chlorflurecol)、クロルフルレン、クロルフルレノール、クロリダゾン、クロリムロン、クロリネート、クロルメホス、クロルメコート (chlormequat)、クロルメスロン、クロルメトキシニル、クロルニジン、クロルニトロフェン、クロロ酢酸、クロロベンジレート、クロロジニトロナフタレン類、クロロフェニゾン、クロロホルム、 α -クロロヒドリン、クロロインコナジド、クロロメブホルム、クロ 20
 ロメチウロン、クロロネブ、クロロファシノン、クロロホス、クロロフタリム (chlorophthalim)、クロロピクリン、クロロポン、クロロプラレトリン (chloropralléthrin)、クロロプロピレート (chloropropylate)、クロロタロニル、クロロトルロン、クロロキシフェニジム (chloroxifenidim)、クロロクスロン、クロロキシニル、クロルホニウム、クロルホキシム、クロルファリム (chlorophthalim)、クロルプラゾホス (chlorprazophos)、クロルプロカルブ (chlorprocarb)、クロルプロファム、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスーメチル、クロルキノクス、クロルスルフロン、クロルタル、クロルチアミド、クロルチオホス (chlorthiophos)、クロルトルロン (chlortoluron)、クロゾリネート (chlo 30
 zolinate)、クルトサン (chltosan)、コレカルシフェロール、コリンクロリド、クロマフェノジド、シクロヘキシミド、シメクタカルブ、シメタカルブ、シネリンI、シネリンII、シネリン類、シニドンーエチル、シンメチリン、シノスルフロン、シントフェン、シオブチド、シサニリド、シスメトリン、クラシホス、クレホキシジム、クレンピリン、クレンピリン、クレトジム、クリムバゾール、クリオジネート、クロジナホップ (clodinafop)、クロエトカルブ、クロフェンセト、クロフェノタン、クロフェンテジン、クロフェンビンホス、クロフィブリン酸、クロフォブ (clofop) 40
 p)、クロマゾン、クロメプロップ (clomeprop)、クロニトラリド (clonitralid)、クロピンドル (clopindol)、クロプロップ (cloprop)、クロプロキシジム、クロピラリド、クロキントセット (cloquin
 to cet)、クロランスラム、クロサンテル、クロチアニジン、クロトリマゾール、クロキホナック (cloxyfonac)、クロキシラコン、クロジラコン、CMA、CMMP、CMP、CMU、コドレルア (codle lure)、コレカルシフェロール、クロホネート、酢酸銅、アセト亜ヒ酸銅、ヒ酸銅、炭酸銅 (塩基性)、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、銅 8-キノリノレート (copper 8-quinolino late)、ケイ酸銅、硫酸銅、硫酸銅 (塩基性)、クロム酸亜鉛銅、クマクロル (coumachlor)、クマフェン、クマホス、クマフリル、クマホス、クマテトラリル、クメトキシストロビン、クミトエート (coumithoate)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、4-CPA、4-CPB、CPMC 50

、CPMF、4-CPP、CPPC、クレダジン、クレゾール、クレゾール酸、クリミジン、クロコナゾール、クロタミトン、クロトキシホス (crotoxyfos)、クロトキシホス (crotoxyphos)、クルホメート、氷晶石、キュウルア (cueelure)、クフラネブ、クミレロン、クミルロン、クプロバム、酸化第一銅、クルクメノール、CVMP、シアナミド、シアナトリン、シアナジン、シアノフェンホス、シアノゲン、シアノホス、シアントエート (cyanthoate)、シアントラニリプロール、シアヌル酸、シアゾファミド (cyazofamid)、シブトリン (cybutryne)、シクラフラミド、シクラニリド、シクラニリプロール、シクレトリン、シクロエート、シクロブトリフルラム、シクロヘキシミド、シクロプレート、シクロプロトリン、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジウム、シクルロン、シエノピラフェン、シエトピラフェン、シフルフェナミド、シフルメトフェン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロジアミド、シハロホップ (cyhalofop)、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シヘキサチン、シメルガン、シミアゾール、シモキサニル、シオメトリニル、シペンダゾール、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シペルコート (cyperquat)、シフェノトリン、シブラジン、シブラゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、シプロフラニリド、シプロフラム、シプロミド、シプロスルファミド、シピラフルオン、シロマジン、シチオエート、シトレックス、1, 3-D、2, 4-D、3, 4-DA、ダイムロン、ダラポン、ダミノジッド、ダイオウトング (dayoutong)、ダゾメット (dazomet)、2, 4-DB、3, 4-DB、DBC P、d-ショウノウ、DCB、DCD、DCIP、DCP A (米国)、DCP A (日本)、DCPTA、DCU、DDD、DDPP、DDT、pp'-DDT、DDVP、2, 4-DEB、デバカルブ、デカフェンチン、デカメトリン、デカルボフラン、ディート、デヒドロ酢酸、ジクワット (deiquat)、デラクロール、デルナブ (delnav)、デルタメトリン、デメフィオン、デメフィオン-O、デメフィオン-S、デメトン、デメトン-メチル、デメトン-O、デメトン-O-メチル、デメトン-S、デメトン-S-メチル、デメトン-S-メチルスルホン (demeton-S-methyl sulphone)、デメトン-S-メチルスルホン (demeton-S-methylsulphon)、DEP、2, 4-DEP、デパレトリン、デリス、2, 4-DES、デスメジファミン、デスメトリン (desmetryn)、デスメトリン (desmetryne)、d-ファンシルクエビンギュチ (d-fanshiluquebingjuzhi)、DFDT、ジアフェンチウロン (diafenthion)、ジアリホル (dialifor)、ジアリホス (dialifos)、ジアレート (di-allate)、ジアレート (diallate)、ジアミダホス、ジアミフェネチド (diamiphenethide)、ジアナット (dianat)、珪藻土、珪藻岩、ダイアジノン (diazinon)、ジブロム、1, 2-ジブロモエタン、フタル酸ジブチル、コハク酸ジブチル、ジカンバ、ジカプトン、ジカルバスルフ、ジカルボスルフ、ジクロベニル、ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazox)、ジクロロベンソーメチル、ジクロフェンチオン、ジクロフルアニド、ジクロロン、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジクロルベンズロン、ジクロルフェニジウム、ジクロルフルレコール、ジクロルフルレノール、ジクロルメート、ジクロルミド、o-ジクロロベンゼン、オルト-ジクロロベンゼン、p-ジクロロベンゼン、パラ-ジクロロベンゼン、2, 5-ジクロロ安息香酸、1, 2-ジクロロエタン、ジクロロメタン、ジクロロフェン、3, 6-ジクロロピコリン酸、1, 2-ジクロロプロパン、1, 3-ジクロロプロペン、ジクロロプロップ (dichloroprop)、ジクロロプロップ-P、ジクロロボス、ジクロゾリン (dichlozolin)、ジクロゾリン (dichlozoline)、ジクロブトラゾル (diclobutrazol)、ジクロシメット (diclocymet)、ジクロホブ (diclofop)、ジクロメジン、ジクロラン、ジクロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジクロスラム、ジコホル、ジコファン、ジクマロール (dicoumarol)、ジクレシル (dicresyl)、ジクロ

10

20

30

40

50

トホス、ジクリル、ジクマロール、ジシクラニル、ジシクロノン、ジエルドリン、ジエノクロル、ジエタムコート (diethamquat)、ジエタチル (diethatyl)、ジエチオン (diethion)、ジエチオン (diethion)、ジエトフェンカルブ、ジエトレート、ジエトン、ピロ炭酸ジエチル、ジエチルトルアミド、ジフェナクム (difenacoum)、ジフェノコナゾール、ジフェノペンテン、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、ジフェチアロン、ジフロビダジン、ジフルベンズロン、ジフルフェニカン、ジフルフェニカニル、ジフルフェンゾビル、ジフルメトリム、ジケグラック (dikegulac)、ジロル (dilor)、ジマチフ、ジメフルアゾール、ジメフルトリン、ジメフォクス、ジメフロン、ジメヒポ (dimehypo)、ジメノキシピリン、ジメピペレート、ジメスルファゼト (dimesulfazet)、ジメタクロン、ジメタン、ジメタカルブ、ジメタクロン、ジメタクロル、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド-P、ジメチピン、ジメチリモール、ジメトエート、ジメトモルフ、ジメトリン、ジメチルカルバート、ジメチルジスルフィド、フタル酸ジメチル、ジメチルビンホス、ジメチラン、ジメキサノ、ジミダゾン、ジモキシストロビン、ジンプロピリダズ (dimpropyridaz)、ジムピラート、ダイムロン、ジネックス、ジングュネズオ (dingjunezu)、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、R-ジニコナゾール、ジニトラミン、ジニトロフェノール類、ジノブトン、ジノカップ (dinocap)、ジノカップ-4、ジノカップ-6、ジノクトン、ジノフェネート、ジノペントン、ジノプロップ、ジノサム、ジノセブ、ジノスルホン、ジノテフラン、ジノテルブ、ジノテルボン、ジオフェノラン、ジオキサベンゾホス、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジオキサチオン、ジオキソピリトリオン (dioxopyritrione)、ジファシン、ジファシノン、ジフェナジオン、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェナミド (diphenamide)、ジフェニルアミン、ジフェニルスルホン、ジフェニルスルフィド、ジプログル酸 (diprogulic acid)、ジプロパリン、ジプロペトリン、ジブテレックス、ジビメチロン、ジピリチオン、ジクワット (diquat)、ジソスルタップ (disosultap)、ジスパルア (disparlure)、ジスグラン、ジスル、ジスルフィラム、ジスルホトン、ジタリムホス、ジチアノン、ジチクロホス、ジチオエーテル、ジチオメトン、ジチオビル、ジチウロン、ジウロン、ジキサントゲン、d-リモネン、DMDS、DMPA、DNOC、ドデモルフ、ドジン、ドジン、ドフェナピン (dofenapyn)、ドグアジン、ドミニカルア (dominicalure)、ドラメクチン、2, 4-DP、3, 4-DP、DPC、ドラゾキシロン、DSMA、d-テフルメトリン、d-トランス-アレトリン、d-トランス-レスメトリン、ズフリン (dufulin)、ダイムロン (dymron)、EBEP、EBP、エブホス、 α -エクジソン、 β -エクジソン、エクジステロン、エクロメゾール、EDB、EDC、EDDP、ジフェンホス (edifenphos)、エグリナジン (eglinazine)、エマメクチン、EMPC、エンペントリン、エナデニン、エンドスルファン、アルファ-エンドスルファン、エンドタール (endothal)、エンドタール (endothall)、エンドチオン、エンドリン、エネストロブリン、エニルコナゾール、エノキサストロビン、エフィルスルホネート (ephirsulfonate)、24-エピブラシノリド、EPN、エポコレオン (epocholeone)、エポフェノナン、エポキシコナゾール、エプリノメクチン、エプロナズ (epronaz)、イプシロン-メトフルトリン、イプシロン-モムフルオロトリン、EPTC、イプリフェナシル (epyrifenacil)、エルボン (erbon)、エルゴカルシフェロール、エルルジキシアнкаオアン (erlujixiancaosan)、エサフォキサネール (esafoxolaner)、エスデパレトリン、エスフェンバレレート、ESP、エスプロカルブ、エタセラシル、エタコナゾール、エタホス、エテム (etem)、エタボキサム、エタクロル、エタルフルラリン、エタメツルフロン、エタプロクロル、エテフォン (ethephon)、エチジムロン (ethidimuron)、エチオフエンカルブ、エチオレート、エチオン、エチオジン、エチプロール、エチリモール (ethirimol)、エトエート-メチル (ethoa

10

20

30

40

50

t e - m e t h y l) 、 エ ト ベ ン ザ ニ ド 、 エ ト フ メ セ ー ト 、 エ ト ヘ キ サ ジ オ ー ル 、 エ ト プ
ロ ッ プ (e t h o p r o p) 、 エ ト プ ロ ホ ス 、 エ ト キ シ フ ェ ン 、 (3 - エ ト キ シ プ ロ ピ ル
) 水 銀 プ ロ ミ ド 、 エ ト キ シ キ ン (e t h o x y q u i n) 、 エ ト キ シ ス ル フ ロ ン 、 エ チ ク
ロ ゼ ー ト (e t h y c h l o z a t e) 、 エ チ ラ ン 、 エ チ ル - D D D 、 エ チ レ ン 、 エ チ レ
ン ジ プ ロ ミ ド 、 エ チ レ ン ジ ク ロ リ ド 、 エ チ レ ン オ キ シ ド 、 ギ 酸 エ チ ル 、 エ チ リ シ ン 、 エ チ
ル 水 銀 ア セ テ ー ト 、 エ チ ル 水 銀 プ ロ ミ ド 、 エ チ ル 水 銀 ク ロ リ ド 、 エ チ ル 水 銀 2 , 3 - ジ ヒ
ド ロ キ シ プ ロ ピ ル メ リ カ プ チ ド 、 エ チ ル 水 銀 ホ ス フ ェ ー ト 、 N - (エ チ ル 水 銀) - p - ト
ル エ ン ス ル ホ ン ア ニ リ ド 、 N - (エ チ ル 水 銀) - p - ト ル エ ン ス ル ホ ン ア ニ リ ド 、 エ チ ル
ピ ロ ホ ス フ ェ ー ト 、 エ チ ル チ オ メ ト ン 、 エ チ ル ト リ ア ノ ー ル (e t h y l t r i a n o l
) 、 エ チ ル ト リ ア ノ ー ル (e t h y l t r i a n o l) 、 エ チ ノ フ ェ ン (e t i n o f e
n) 、 E T M 、 エ ト ニ プ ロ ミ ド 、 エ ト ベ ン ザ ニ ド 、 エ ト フ ェ ン プ ロ ッ ク ス 、 エ ト キ サ ザ ー
ル 、 エ ト リ ジ ア ザ ー ル 、 エ ト リ ム ホ ス 、 オ イ ゲ ノ ー ル 、 E X D 、 ファ モ キ サ カ ル ブ 、 ファ
モ キ サ ド ン 、 ファ ム フ ル 、 d - ファ ン シ ル チ ュ エ ビ ン チ ュ ツ イ (d - f a n s h i l u q
u e b i n g j u z h i) 、 フェ ナ ッ ク (f e n a c) 、 フェ ナ ミ ド ン 、 フェ ナ ミ ノ ス ル
フ 、 フェ ナ ミ ン ス ト ロ ビ ン 、 フェ ナ ミ ホ ス 、 フェ ナ パ ニ ル 、 フェ ナ リ モ ル 、 フェ ナ ス ラ ム
、 フェ ナ ザ フ ロ ル (f e n a z a f l o r) 、 フェ ナ ザ キ ン 、 フェ ン プ コ ナ ザ ー ル 、 フェ
ン プ タ チ ン オ キ シ ド 、 フェ ン ク ロ ラ ザ ー ル 、 フェ ン ク ロ ル ホ ス (f e n c h l o r p h o
s) 、 フェ ン ク ロ ホ ス (f e n c l o f o s) 、 フェ ン ク ロ リ ム 、 フェ ネ タ カ ル ブ (f e
n e t h a c a r b) 、 フェ ネ ト ラ ザ ー ル (f e n e t r a z o l e) 、 フェ ン フ ル ト リ
ン

10

20

、 フェ ン フ ラ ム 、 フェ ン ヘ キ サ ミ ド (f e n h e x a m i d) 、 フェ ニ ジ ム 、 フェ ニ ト ロ
パ ン 、 フェ ニ ト ロ チ オ ン 、 フェ ニ ゾ ン 、 フェ ン ジ ユ ン ト ン グ (f e n j u n t o n g) 、
フェ ン メ ゾ ジ チ ア ズ (f e n m e z o d i t i a z) 、 フェ ノ プ カ ル ブ 、 フェ ノ ロ ボ 、 フェ
ノ プ ロ ッ プ 、 フェ ノ チ オ カ ル ブ 、 フェ ノ キ サ ク リ ム 、 フェ ノ キ サ ニ ル 、 フェ ノ キ サ プ ロ
ッ プ (f e n o x a p r o p) 、 フェ ノ キ サ プ ロ ッ プ - P 、 フェ ノ キ サ ス ル ホ ン 、 フェ ノ
キ シ カ ル ブ 、 フェ ン ピ ク ロ ニ ル 、 フェ ン ピ コ キ サ ミ ド 、 フェ ン ピ リ ト リ ン (f e n p i r
i t h r i n) 、 フェ ン プ ロ パ ト リ ン 、 フェ ン プ ロ ピ ジ ン 、 フェ ン プ ロ ピ モ ル フ 、 フェ ン
ピ ラ ザ ミ ン 、 フェ ン ピ ラ ザ ン 、 フェ ン ピ ロ キ シ メ ー ト 、 フェ ン キ ノ ト リ オ ン 、 フェ ン リ ダ
ゾ ン 、 フェ ン ソ ン 、 フェ ン ス ル フ オ チ オ ン (f e n s u l f o t h i o n) 、 フェ ン テ ラ
コ ー ル (f e n t e r a c o l) 、 フェ ン チ ア プ ロ ッ プ (f e n t h i a p r o p) 、 フェ ン チ オ ン 、 フェ ン チ オ ン - エ チ ル 、 フェ ン チ ア プ ロ ッ プ (f e n t i a p r o p) 、 フェ ン チ ン (f e n t i n) 、 フェ ン ト ラ ザ ミ ド 、 フェ ン ト リ ファ ニ ル 、 フェ ヌ ロ ン 、 フェ ヌ ロ ン - T C A 、 フェ ン バ レ レ ー ト (f e n v a l e r a t e) 、 フェ ル バ ム (f e r b a m) 、 フェ リ ム ゾ ン (f e r i m z o n e) 、 リ ン 酸 第 二 鉄 、 硫 酸 第 一 鉄 、 フィ プ ロ ニ ル 、 フ ラ ム プ ロ ッ プ (f l a m p r o p) 、 フ ラ ム プ ロ ッ プ - M 、 フ ラ ザ ス ル フ ロ ン 、 フ ロ ク マ フェ ン (f l o c o u m a f e n) 、 フ ロ メ ト キ ン (f l o m e t o q u i n) 、 フ ロ ニ カ ミ ド 、 フ ロ ラ ス ラ ム (f l o r a s u l a m) 、 フ ロ ル ピ ラ ウ キ シ フ ェ ン 、 フ ロ リ ル ピ コ キ サ ミ ド 、 フ ル ア ク リ ピ リ ム (f l u a c r y p y r i m) 、 フ ル ア ザ イ ン ド リ ジ ン 、 フ ル ア ジ ホ ッ プ (f l u a z i f o p) 、 フ ル ア ジ ホ ッ プ - P 、 フ ル ア ジ ナ ム (f l u a z i n a m) 、 フ ル ア ザ レ ー ト 、 フ ル ア ザ ロ ン 、 フ ル ベ ン ジ ア ミ ド 、 フ ル ベ ネ テ ラ ム 、 フ ル ベ ン ジ ミ ン 、 フ ル プ ロ シ ト リ ネ ー ト 、 フ ル カ ル バ ザ ン 、 フ ル セ ト ス ル フ ロ ン 、 フ ル ク ロ ラ リ ン 、 フ ル ク ロ ラ ミ ノ ピ ル 、 フ ル ク ロ ル ジ ニ リ ポ ー ル 、 フ ル コ フ ロ ン 、 フ ル シ ク ロ ク ス ロ ン 、 フ ル シ ト リ ネ ー ト 、 フ ル ジ オ キ ソ ニ ル 、 フ ル エ ネ チ ル (f l u e n e t h y l) 、 フ ル エ ネ チ ル (f l u e n e t i l) 、 フ ル エ ン ス ル ホ ン (f l u e n s u l f o n e) 、 フ ル フェ ナ セ ッ ト (f l u f e n a c e t) 、 フ ル フェ ネ リ ム 、 フ ル フェ ニ カ ン 、 フ ル フェ ノ キ サ ジ ア ザ ム 、 フ ル フェ ノ ク ス ロ ン 、 フ ル フェ ノ キ シ ス ト ロ ビ ン 、 フ ル フェ ン プ ロ ッ ク ス 、 フ ル フェ ン ピ ル 、 フ ル フェ ン ジ ン (f l u f e n z i n e) 、 フ ル フィ プ ロ ー ル 、 フ ル ヘ キ サ フ ォ ン 、 フ ル イ ン ダ ピ ル 、 フ ル メ ト リ ン 、 フ ル メ ト ベ ル 、 フ ル メ ト ラ リ ン 、 フ ル メ ツ ラ ム 、 フ ル メ チ ル ス ル ホ リ ム 、 フ ル メ ジ ン 、 フ ル ミ ク ロ ラ ッ ク 、 フ ル ミ オ

30

40

50

キサジン、フルミプロピン、フルモルフ、フルオメツロン、フルオピコリド、フルオピモミド、フルオピラム、フルオルベンシド、フルオリダミド、フルオロアセトアミド、フルオロ酢酸、フルオロクロリドン、フルオロ-DDT、フルオロジフェン、フルオロゲサロール (fluorogesarol)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、フルオロイミド、フルオロミド、フルオロミジン、フルオロニトロフェン、フルロキシピル、フルオチウロン、フルオトリマゾール、フルオキサピプロリン、フルオキサストロピン、フルオキシチオコナゾール、フルペンチオフェノックス、フルポキサム、フルプロパシル、フルプロパジン、フルプロパネート、フルピラジフロン、フルピラゾホス、フルピリミン、フルピルスルフロン、フルキンコナゾール、フルララネル、フルラゾール、フルレコール (flurecol)、フルレノール (flurenol)、フルリドン、フルロクロリドン、フルロミジン、フルロキシピル、フルルプリミドル、フルルスラミド、フルルタモン、フルシラゾール、フルスルファミド、フルテンジン、フルチアセツト (fluthiacet)、フルチアミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルバリネート、タウ-フルバリネート、フルキサメタミド、フルキサピロキサド、フルキシフェニム、ホルベル、ホルベット、ホメサフェン、ホノホス、ホラムスルフロン、ホルクロルフェヌロン、ホルムアルデヒド、ホルメタネート、ホルモチオン、ホルムパラネート、ホサミン、ホセチル、ホスメチラン、ホスピレート、ホスチアゼート、ホスチエタン、フロンタリン、フサライド、フベリダゾール、フカオジン (fucaojing)、フカオミ (fucao mi)、フフェノジド、フジュンマンチ (fujunmanzhi)、フルミ、フマリン、フナイヘカオリング (funaihecaoling)、フフェンチオウレア、フララン、フララキシル、フラメトリン、フラメトピル、フランテブフェノジド (furan tebufenozide)、フラチオカルブ、フルカルバニル、フルコナゾール、フルコナゾール-シス、フレトリン、フルフラール、フリラゾール、フルメシクロックス、フロファネート、フリルオキシフェン、ガンマー-BHC、ガンマー-シハロトリン、ガンマー-HCH、ゲニツト (genit)、ジベレリン酸、ジベレリンA3、ジベレリン類、グリフトル (gliftor)、グリトル (glitor)、グルコクロラロース (glucochloralose)、グルホシネート、グルホシネート-P、L-グルホシネート、グリオジン、グリオキシム、グリホサート (glyphosate)、グリホシン、ゴシブルア (gossyp lure)、グランドルア (grand lure)、グリセオフルビン、グアノクチン、グアザチン、ハラクリネート、ハラウキシフェン、ハルフェンブロックス、ハロフェノジド、ハロサフェン、ハロスルフロン、ハロキシジン、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P、ハロキシホップ-R、HCA、HCB、HCH、ガンマー-HCl、ヘメル (hemel)、ヘムパ (hempa)、HEOD、ヘブタクロル、ヘブタフルトリン、ヘブタマロキシログルカン (heptamaloxyloglucan)、ヘプテノホス、ヘプトパルギル、ハービマイシン、ハービマイシンA、ヘテロホス、ヘキサクロル、ヘキサクロラン (hexachloran)、ヘキサクロロアセトン、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキサフルムロン、ヘキサフルオラミン、ヘキサフルレート、ヘキサルア (hexalure)、ヘキサミド、ヘキサジノン、ヘキシルチオホス、ヘキシチアゾクス、HHDN、ホロスルフ、ホモブラシノライド (homobrassinolide)、フアンビフカオトング (huanbifuc aotong)、フアンカイウオ (huancaiwo)、フアンチョングジン (huan chongjing)、フアングカオリング (huangcaoling)、フアンジュンツオ (huanjunzuo)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、ヒドラルガフェン、消石灰、水素シアナミド、シアン化水素、ヒドロブレン、S-ヒドロブレン、ヒドロキシイソキサゾール、4-ヒドロキシフェネチルアルコール、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩、ヒメキサゾール、ヒキンカルブ (hyquin carb)、IAA、IBA、IBP、イカリジン、イマザリル、イマザメタベンズ (imazame thabenz)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザモックス (imazamox)、イマザピク (imazapic)、イマザピル (imazapyr

10

20

30

40

50

)、イマザキン、イマゼタピル (imazethapyr)、イマゾスルフロン、イミベ
 ンコナゾール、イミシアホス、イミダクロプリド、イミダクロチズ、イミノクタジン、イ
 ミプロトリン、イナベンフィド、インダノファン (indanofan)、インダザピロ
 キサメト (indazapyroxamet)、インダジフラム、インドキサカルブ、イ
 ネジン、滴虫土、インビルフルキサム、ヨードボニル、ヨードカルブ、ヨードフェンホス
 、ヨードメタン、ヨードスルフロン、イオフェンスルフロン、イオキシニル、イパジン、
 IPBC、IPC、イブコナゾール、イブフェンカルバゾン、イブフェントリフルコナゾ
 ール (ipfentrifluconazole)、イブフルフェノキン (ipflufen
 enoquin)、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イプリミダム、
 イブスジェノール、イブセノール、IPSP、IPX、イサミドホス、イサゾホス、イソ
 ベンザン、イソカルバミド、イソカルバミド、イソカルボホス、イソシル、イソシクロセ
 ラム、イソドリン、イソフェンホス、イソフェンホス－メチル、イソフェタミド、イソフ
 ルシプラム (isoflucypram)、イソラン、イソメチオジン、イソノルロン、
 イソパムホス、イソポリネート、イソプロカルブ、イソプロシル、イソプロパリン、イソ
 プロパゾール、イソプロチオラン、イソプロツロン、イソピラザム、イソピリモール、イ
 ソチオエート、イソチアニル、イソウロン、イソバレジオン、イソキサベン、イソキサカ
 ルボール、イソキサクロルトール、イソキサジフェン、イソキサフルトール、イソキサピ
 リホップ (isoxapyrifop)、イソキサチオン、イスロン、イベルメクチン、
 イクソキサベン、イゾパムホス、イゾパムホス、ジャポニルア (japonilure)
 、ジャボトリンズ (japothrins)、ジャスモリンI、ジャスモリンII、ジャ
 スモン酸、ジアフアングcongゾング (jiahuangchongzong)、ジアジ
 ゼングクシアオリン (jiajizengxiaolin)、ジアクシアングジュンチ (jia
 xiangjunzhi)、ジエカオワン (jiecaowan)、ジエカオキシ
 (jiecaoxi)、ジンガンマイシンA、ヨードフェンホス (jodfenphos)
)、幼若ホルモンI、幼若ホルモンII、幼若ホルモンIII、カデトリン、カップービ
 フェントリン、カップーテフルトリン、カルブチレート、カレタザン、カスガマイシン、
 ケジュンリン (kejunlin)、ケレバン、ケトスピラドックス、珪藻土、キネチン
 (kinetin)、キノブレン、S－キノブレン、キララキシル、クレソキシム－メチ
 ル、クイカオキシ、ラクトフェン、ラムダーシハロトリン、ランコトリオン、ラチルア (l
 atilure)、ヒ酸鉛、レナシル、レピメクチン、レプトホス (leptophos)
)、L－グルホシネート、リアンベンジグチ (lianbenjingzhi)、石
 灰硫黄合剤、リンデン (lindane)、リネアチン、リニュロン、リリムホス、リト
 ルア、ルーブルア、ロチラネル (lotilane)、ルフエヌロン、ルフキングcong
 キサナン (luefuqingchongxianan)、ルキシアンカオリン、ルブジ
 ングジュンチ (lvdingjunzhi)、ルブフミジブチ (lvfumijvzhi)
)、ルブキシアンカオリン (lvxiancaolin)、リチダチオン (lythid
 athion)、M－74、M－81、MAA、リン化マグネシウム、マラチオン、マル
 ジソン、マレイン酸ヒドラジド、マロノベン、マルトデキストリン、MAMA、マナム (m
 anam)、マンカップー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)
)、マンドストロビン、マンジプロパミド、マネブ、マトリン、マジドックス、MCA、M
 CC、MCP、1－MCP、MCPA、2，4－MCPA、MCPA－チオエチル、MC
 PB、2，4－MCPB、MCPP、メベニル、メカルバム、メカルビンジド (meca
 rbinzid)、メカルホン、メコプロップ、メコプロップ－P、メジメフォルム、メ
 ジノテルブ、メドルア (medlure)、メフェナセツト (mefenacet)、メ
 フェノキサム、メフェンピル、メフェントリフルコナゾール (mefentriflu
 conazole)、メフルイジド、メガトモ酸、メリシルアルコール、メリトキシ
 ン、MEMC、メナゾン、MEP、メパニピリム、メペルフルトリン、メフェネート、メホスホ
 ラン、メピコート (mepiquat)、メピトリフルフェンピル (mepitriflu
 fenpyr)、メプロニル (mepronil)、メプチルジノカップ (mep
 tyl

10

20

30

40

50

d i n o c a p)、メルカプトジメツル、メルカプトホス、メルカプトホスチオール、メルカプトチオン、塩化第二水銀、酸化第二水銀、塩化第一水銀、メルホス、メルホスオキシド、メソブラジン、メソスルフロソ、メソトリオン、メスルフェン、メスルフェンホス、メスルフェン、メタクレゾール、メタフルミゾン、メタラキシル、メタラキシル-M、R-メチラキシル、メタアルデヒド、メタム (met am)、メタミホップ (met am i f o p)、メタミトロン、メタホス、メタリルピコキサミド (met a r y l p i c o x a m i d)、メタキソン、メタザクロル、メタゾスルフロソ、メタゾキソロン、メタカミフェン、メトコナゾール、メテパ、メトフルラゾン、メタベンズチアズロン、メタクリホス、メタルプロバリン、メタム (met h a m)、メタミドホス、メタスルホカルブ、メタゾール、メトフロキサム (met h f u r o x a m)、メチベンズロン、メチダチオン、メチオベンカルブ、メチオカルブ、メチオピリスルフロソ、メチオテパ、メチオゾリン、メチウロン、メトクロトホス、メトルカルブ、メトメトン、メトミル、メトプレソ、S-メトプレソ、メトプロトリン、メトプロトリン、メトキン-ブチル、メトトリン、メトキシクロル、2-メトキシエチル水銀クロリド、メトキシフェノジド、メトキシフェノン、メチルアホラート (met h y l a p h o l a t e)、臭化メチル、メチルオイゲノール、ヨウ化メチル、メチル-イソフェンホス、メチルイソチオシアネート、メチルパラチオン、メチルアセトホス、メチルクロロホルム、1-メチルシクロプロペン、メチルジチオカルバミン酸、メチルダイムロン (met h y l d y m r o n)、塩化メチレン、メチルメルカプトホス、メチルメルカプトホスオキシド、メチルメルカプトホスチオール、メチル水銀ベンゾエート、メチル水銀ジシアンジアミド、メチル水銀ペンタクロロフェノキシド、メチルネオデカナミド (met h y l n e o d e c a n a m i d e)、メチルニトロホス (met h y l n i t r o p h o s)、メチルトリアゾチオン、メチオゾリン、メチラム、メチラム亜鉛、メトベンズロン、メトプロムロン、メトフルトリン、イブシロン-メトフルトリン、メトラクロール、S-メトラクロール、メトルカルブ、メトメクラン、メトメツロン、メトミノストロピン、メトスラム、メトキサジアゾン、メトクスロン、メトラフェノン、メトリアム、メトリブジン、メトリホナート、メトリホナート、メトスルホバックス (met s u l f o v a x)、メトスルフロソ、メチルテトラプロール、メビンホス、メキサカルバート、ミエシュウェイ (m i e c h u w e i)、ミエシュアン (m i e s h u a n)、ミエウエンジュチ (m i e w e n j u z h i)、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミルネブ、ミマナン、ミパフォックス (m i p a f o x)、MIPC、マイレックス (m i r e x)、MITC、ミボリラネル、MNAF、モドフラネル、モグチュン、モリネート、モロスルタツプ、モンフルオロトリン (m o m f l u o r o t h r i n)、イブシロン-モンフルオロトリン、モナリド、モニソウロン、モニスロン、モノアミトラズ (m o n o a m i t r a z)、モノクロロ酢酸、モノクロトホス、モノリヌロン (m o n o l i n u r o n)、モノメハイポ (m o n o m e h y p o)、モノスルフィラム、モノスルフロソ、モノスルフロソ-エステル、モノスルタツプ (m o n o s u l t a p)、モヌロン、モヌロン-TCA、モルフアムコート (m o r f a m q u a t)、モロキシジン、モルホチオン、モルジド、モキシデクチン、MPMC、MSMA、MTMC、 α -ムルチストリアチン (m u l t i s t r i a t i n)、ムスカリア、ミクロブタニル、ミクロゾリン、ミリシリアルコール、NAA、NAAm、ナバム、ナフタロホス、ナレド、ナフタレン、ナフタレンアセトアミド、 α -ナフタレン酢酸、ナフタル酸無水物、ナフタロホス、1-ナフトール、ナフトキシ酢酸、ナフチル酢酸、ナフチルインダン-1, 3-ジオン類、ナフチルオキシ酢酸、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド-M、ナブタラム、ナタマイシン、NBPOS、ネブレア (n e b u r e a)、ネブロン、ネンドリン、ネオニコチン、ニクロルホス、ニクロフェン、ニクロサミド、ニコビフェン、二個フルプロール、ニコスルフロソ、ニコチン、ニフルリジド (n i f l u r i d i d e)、ニッコマイシン類、ニングナマイシン、ニングナンマイシン、NIP、ニピラクロフェン、ニピラロフェン、ニテンピラム、ニチアジン、ニトラリン、ニトラピリン、ニトリラカルブ、ニトロフェン、ニトロフルオルフェン、ニトロスチレン、ニト

10

20

30

40

50

ロタールーイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、NNM、ノボルミド、ノナノール、ノルボルミド、ノレア、ノルフルラゾン、ノルニコチン、ノルロン、ノバルロン、ノビフルムロン、NPA、ヌアリモル、ヌラノン、OCH、オクタクロロジプロピルエーテル、オクチリノン、2- (オクチルチオ) エタノール、o-ジクロロベンゼン、オフレース、オメトエート、o-フェニルフェノール、オルベンカルブ、オルフラルア (orfralure)、オルソベンカーブ (orthobencarb)、オルト-ジクロロベンゼン、オルトニル (orthonil)、オルトスルファムロン (orthosulfamuron)、オリクタルア (oryctalure)、オリサストロビン、オリザリン、オストール (osthol)、オストール (osthole)、オストラモン、オバトロン、オベックス、オキサベトリニル、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサジキシル、オキサメート、オキサミル、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキサピラゾン (oxapyrazone)、オキサスルフロニ、オキサチアピプロリン、オキサジクロメフォ、オキサゾスルフィル、オキシニン-銅 (oxine-copper)、オキシニン-Cu (oxine-Cu)、オキシソリニン酸、オクスポコナゾール (oxpoconazole)、オキシカルボキシン、オキシデメトン-メチル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、オキシエナデニン、オキシフェンチン (oxyfenenthin)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オキシマトリン (oxymatrine)、オキシテトラサイクリン、オキシチオキノクス (oxythioquinox)、PAC、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パイコングジグ (paichongding)、パレトリン、PAP、パラ-ジクロロベンゼン、パラフルロン、パラコート、パラチオン、パラチオン-メチル、パリノール、パリスグリーン (Paris green)、PCNB、PCP、PCP-Na、p-ジクロロベンゼン、PDJ、ペブレート、ペジネックス、ペフラゾエート、ペラルゴン酸、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンディメタリン、ペンフェナート、ペンフルフェン、ペンフルロン、ペノキサリン、ペノキススラム (penoxsulam)、ペンタクロロフェノール、ペンタクロロフェニルラウレート、ペンタノクロル、ペンチオピラド、ペントメトリン、ペントキサゾン、ペルブチン、ペルクロルデコン、ペルフルイドン、ペルメトリン、ペルタン (perthane)、ペトキサミド、PHC、フェナマクリル、フェナマクリル-エチル、フェナミノスルフ、フェナジンオキシド、フェネタカルブ、フェニソファム、フェンカプトン、フェンメディファム、フェンメディファム-エチル、フェノベンズロン、フェノチオール、フェノトリン、フェンプロキシド、フェントエート、8-フェニルメルクリオキシキノリン (8-phenylmercurioxyquinoline)、尿素フェニル水銀、酢酸フェニル水銀、塩化フェニル水銀、ピロカテコールのフェニル水銀誘導体、硝酸フェニル水銀、サリチル酸フェニル水銀、2-フェニルフェノール、ホレート、ホサセチム、ホサロン、ホサメチン、ホサゼチム、ホサゼチン、ホスシクロチン、ホスジフェン、ホセチル、ホスホラン、ホスホラン-メチル、ホスグリシン、ホスメット (phosmet)、ホスニクロル、ホスファミド、ホスファミドン、ホスフィン、ホスフィノトリシン、ホスホカルブ、リン、ホステブピリム、ホスチン、ホキシム、ホキシム-メチル、フタリド、フタロホス、フタルスリン、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、ピカリジン、ピクロラム、ピコリナフェン、ピコキシストロビン、ピマリシン、ピンドン、ピノキサデン、ピペラリン、ピペラジン、ピペロニルブトキシド、ピペロニルシクロネン、ピペロホス (piperophos)、ピプロクタニル、ピプロクタニル、ピプロタル (piprotal)、ピリメタホス、ピリミカルブ、ピリミニル、ピリミオキシホス、ピリミホス-エチル、ピリミホス-メチル、ピバル (pival)、ピバルジオン、プリフェナート、PMA、PMP、ポリブテン類、ポリカーバメート、ポリクロルカンフェン、ポリエトキシキノリン、ポリオキシ D、ポリオキシ D、ポリオキシソリム、ポリラム、ポリチアラン、亜ヒ酸カリウム、アジ化カリウム、シアノ酸カリウム、エチルキサントゲン酸カリウム、ナフテン酸カリウム、カリウムポリスルフィド、チオシアン酸カリウム、pp'-DDT、プラレトリン、プレコセン I、プレコセン II、プレコセン III、プレチラクロール、プリミドホス (primidophos)

10

20

30

40

50

s)、プリミスルフロ、プロベナゾール、プロクロラズ、プロクロノール (proclonol)、プロシアジン、プロシミドン、プロジアミン、プロフェノホス、プロフルアゾール、プロフルラリン、プロフルトリ、プロホキシジム (profoxydim)、プロフリットーアミニウム (profurite-aminium)、プログリナジン、プロヘキサジオン、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロマシル、プロメカルブ、プロメトン、プロメトリン (prometryn)、プロメトリン (prometryne)、プロムリット (promurit)、プロニトリジン、プロナミド、プロバクロル、プロパホス、プロパミジン、プロパモカルブ、プロパニル、プロパホス、プロパキサホップ (propaquizafofop)、プロパルギット (propargite)、プロパルトリン、プロパジン、プロベタンホス、プロファム (propham)、プロピコナゾール、プロピジン、プロピネブ、プロピソクロール、プロボクスル、プロボキシカルバゾン、プロビルイソム、プロピリスルフロ (propyrisulfuron)、プロピザミド、プロキナジド、プロスレル、プロスルファリン、プロスルフォカルブ、プロスルフロ、プロチダチオン、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブト (protрифенбут)、プロキサン、プリミドホス、プリナクロール (prynachlor)、ソラレン (psoralen)、ソラレン (psoralene)、ピダノン (pydanon)、ピリジフルメトフェン (pydiflumetofen)、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラカルボリド、ピラクロホス、ピラクロニル、ピラクロストロビン、ピラフルフェン、ピラフルプロール、ピラマット、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、ピラスルホトール、ピラジフルミド、ピラゾレート、ピラゾリネート、ピラゾン、ピラゾホス、ピラゾスルフロ、ピラゾチオン、ピラゾキシフェン、ピレスメトリン、ピレトリンI、ピレトリンII、ピレトリン類、ピリバムベンズーイソプロピル、ピリバムベンズープロピル、ピリベンカルブ、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリクロール、ピリダベン、ピリダクロメチル、ピリダフォル、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリダフェンチオン、ピリデート、ピリジニトリル、ピリフェノクス (pyrifenox)、ピリフルキナゾン、ピリフタリド、ピリメタホス、ピリメタニル、ピリミカルブ (pyrimicarbe)、ピリミジフェン、ピリミノバック (pyriminobac)、ピリミノストロビン、ピリミホスーエチル、ピリミホスーメ

10

20

30

チル、ピリミスルファン、ピリミテート、ピリヌロン、ピリオフェノン、ピリプロール (pyriprole)、ピリプロパノール、ピリプロキシフェン、ピリソキサゾール、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピロラン、ピロキロン、ピロキサスルフォン、ピロクススラム (pyroxsulam)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル、キンカオスアン (qincaosuan)、キングクリング (qingkuling)、クワシア、キナセトール、キナルホス、キナルホスーメチル、キナザミド、キンクロラック (quincolorac)、キンコナゾール、キンメラック (quinmerac)、キノクラミン、キノフメリン、キノメチオネート、キノナミド、キノチオン、キノトリオン、キノキシフェン、キンチオホス、キントゼン、キントリオン、キザロホップ (quizafofop)、キザロホップーP、クウエンチ (quwenzhi)、クイグジグ (quyingding)、ラベンザゾール、ラフォキサニド (rafoxanide)、Rージニコナゾール、レベミド、レグロン、レノフルトリ (renofluthrin)、レンリデュロン (renriduron)、レスカルア (rescalure)、レスメトリン、dーートランスーレスメトリン、ロデタニル、ロドジャポニン (rhododjaponin)ーIII、リバビリン、イミソキサフェン、リムスルフロ、リザゾール、Rーメタラキシル、ロデタニル、ロンネル、ロテノン、リアニア、サバジラ、サフルフェナシル (safluafenacil)、サイジュンマオ (saijunmao)、サイセントング (saisentong)、サリチルアニリド、サリフルオフエン (salifluofen)、サンギナリン、サントニン、Sービオアレト

40

50

リン、シュラーダン (schradan)、シリロシド、セボチラミン、セブチラジン、
 セクブメトン、セダキサン、セラメクチン、セミアミトラズ (semiamitraz)
 、セサメックス (sesamex)、セサモリン、セソン (sesone)、セトキシジ
 ム、セビン、S-ヒドロプレン、シュアングジアアンカオリン (shuangjiaan
 caolin)、シュアングジアンナカオリン (shuangjiananacolin)
)、シデュロン (siduron)、シフミジブチ (sifumijvzhi)、シグル
 ア (siglure)、シラフルオフエン (silafluofen)、シラトラン、シ
 リカエアロゲル、シリカゲル、シルチオフアム (silthiofam)、シルチオフア
 ム (silthiopham)、シルチオフアン、シルベックス、シマジン、シメコナゾ
 ール、シメトン、シメトリン (simetryn)、シメトリン (simetryne)
 、シントフェン、S-キノプレン、消石灰、SMA、S-メトプレン、S-メトラクロ
 ール、亜ヒ酸ナトリウム、アジ化ナトリウム、塩素酸ナトリウム、クロロ酢酸ナトリウム、
 シアン化ナトリウム、フッ化ナトリウム、フルオロ酢酸ナトリウム、ヘキサフルオロケイ
 酸ナトリウム、ナフテン酸ナトリウム、ナトリウムオルトフェニルフェノキシド、ナトリ
 ウムペンタクロロフェナート、ナトリウムペンタクロロフェノキシド、ナトリウムオー
 フェニルフェノキシド、ポリ硫化ナトリウム、ケイフッ化ナトリウム、四ホウ酸ナトリウム
 、テトラチオ炭酸ナトリウム、チオシアン酸ナトリウム、ソラン、ソファミド、スピドキ
 サマツ (spidoxamat)、スピネトラム、スピノサド、スピロブジフェン、ス
 ピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロピジン、スピロテトラマト、スピロキサミ
 ン、スチロホス、ストレプトマイシン、ストリキニーネ、スルカトール、スルコフロン、
 スルコトリオン、スルファレート、スルファチアジアズロン (sulfathiadiazuron)、
 スルファチアズロン (sulfathiazuron)、スルフエントラ
 ザン、スルフィラム、スルフルラミド、スルホジアゾール、スルホメツロン、スルホサー
 ト (sulfosate)、スルホスルフロ、スルホテップ (sulfotep)、ス
 ルホテップ (sulfotep)、スルホキサフロ (sulfoxaflor)、ス
 ルホキシド、スルホキシム、硫黄、硫酸、フッ化スルフル、スルグリカピン、スルホサ
 ート (sulphosate)、スルプロホス、スルトロペン、スチアズロン (suthiazuron)、
 スペルメチリン (supermethrin)、スウェップ (sweep)、2, 4, 5-T、吐酒石、タウフルバリネート、タブロン、タジムカル、2, 4
 , 5-TB、2, 3, 6-TBA、TBT O、TBZ、TCA、TCBA、TCMTB、
 TCNB、TDE、テブコナゾール、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブフロキン
 、テブピリムホス、テブタム、テブチウロン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、
 テディオ、テフルベンズロン、テフルトリン、カップーテフルトリン、d-テフルメト
 リン、テフルトリオン、テムボトリオン、テムホス (temefos)、テムホス (temephos)、
 テパ (tepa)、TEPP、テブラロキシジム、テブクロキシジム
 、テラレトリン、テルバシル、テルブカルブ、テルブクロル、テルブコナゾール、テルブ
 ホス、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトール、テルブトラゾール、テルブトリ
 ン (terbutryn)、テルブトリン (terbutryne)、テラクロール (terraclor)、
 テラマイシン (terramycin)、テラマイシン (terramycin)、テトシクラシス (tetcyclacis)、
 テトフルピロリミト (tetflupyrolimet)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、
 テトラクロロエタン、テトラクロルビンホス、テ
 ラコナゾール、テトラジホン、テトラジスル、テトラフルロン、テトラメトリン、テトラ
 メチルフルトリン、テトラミン、テトラナクチン、テトラニリプロール、テトラピオン、
 テトラスル、硫酸タリウム (thallium sulfate)、硫酸タリウム (thallous sulfate)、
 テニルクロール (thenylchlor)、シータ
 ーシペルメトリン、チアベンダゾール、チアクロプリド、チアジジン、チアジフルオル
 、チアメトキサム、チアメツロン、チアプロニル、チアザフルロン (thiazafuror)、
 チアザフルロン (thiazafuror)、チアゾン、チアゾピル、チクロ
 ホス、チシオフエン、チジアジミン、チジアズロン、チエンカルバゾン、チフェンスル

10

20

30

40

50

ロン、チフルザミド、チメロサル、チメット (thimet)、チオベンカルブ、チオカルボキシム (thiocarboxime)、チオクロルフェンフィム (thiochlorfenphim)、チオシアナトジニトロベンゼン類、チオシクラム、チオダン、チオデメトン、チオジアゾール銅、チオジカルブ、チオファノカルブ、チオファノックス、チオフルオキシメート、チオヘンパ (thiohempa)、チオメルサル、チオメトン、チオナジン、チオファネート、チオファネートーエチル、チオファネートーメチル、チオホス、チオキノックス、チオセミカルバジド、チオスルタップ、チオテパ、チオキサミル、チラム、チウラム、ツリングエンシン (thuringiensin)、チアベンダゾール、チアジニル、チアフエナシル、チアオジエアン (tiaojiean)、TIBA、チファトール (tifatol)、チゴラネル (tigolaner)、チオカルバジル、チオクロリム、チオラントラニリプロール (tiorantraniliprole)、チオキサザフェン、チオキシミド、TMTD、チルパート (tirpate)、トルクロホスーメチル (tolclofos-methyl)、トルフェンピラド、トルニファニド、トルプロカルブ、トルピラレート、トリフルアニド (tolylfluaniid)、トリルフルアニド (tolylfluaniid)、トリル水銀アセテート、トマリン、トブラメゾン、トキサフェン、2, 4, 5-TP、2, 3, 3-TPA、TPN、トラルコキシジム、トラロシトリン、トラロメトリン、トラロピリル、d-トランスアレトリン、d-トランススーレスメトリン、トランスフルトリン、トランスペルメトリン、トレタミン、トリアレート、トリアコンタノール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアレート、トリアファモン、トリアザメート、トリアズブチル、トリアジフラム、トリアゾフェナミド、トリアゾホス、トリアゾチオン、トリアゾキシド、三塩基塩化銅、三塩基硫酸銅、トリベヌロン、トリブホス、トリブチルスズオキシド、トリカンバ、トリクラミド、トリクロフェニジン、トリクロピル、トリクロルホン、トリクロルメタホス-3、トリクロロナート (trichloronate)、トリクロロナート (trichloronate)、トリクロロトリニトロベンゼン類、トリクロルホン、トリクロピル、トリクロピリカルブ、トリクレゾール、トリシクラゾール、水酸化トリシクロヘキシルスズ、トリデモルフ、トリジファン、トリエタジン、トリフェンモルフ、トリフェノホス、トリフロキシストロビン、トリフロキシスルフロン、トリフルジモキサジン、トリフルエンフロネート、トリフルメゾピリム、トリフルミゾール、トリフルムロン、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリホップ (trifop)、トリホプシム、トリホリン、トリヒドロキシトリアジン、2, 3, 5-トリヨード安息香酸、2, 3, 5-トリヨード安息香酸、トリメドルア (trimedlure)、トリメフロル (trimefluor)、トリメタカルブ、トリメツロン、トリモルファミド (trimorphamid)、トリモルファミド (trimorphamide)、トリネクサパック (trinexapac)、トリフェニルスズ、トリブレン、トリプロピンダン (tripropindan)、トリプトリド、トリピラスルホン、トリタック (tritac)、トリチアラン、トリチコナゾール、トリトスルフロン、ツオイエリン (tuoyelin)、トリクロピラゾフロル (tyclopypyrazoflor)、ウミホキシラネル (umifoxolaner)、ウニコナゾール、ウニコナゾール-P、ウルバシド、ウレデパ、バレレート、バリダマイシン、バリダマイシンA、バリフェナレート、バロン、バミドチオン、バンガード、バニリプロール、ベルブチン、ベルノレート、ピンクロゾリン、ビニコナゾール、ビタミンD3、ワルファリン (warfarin)、キシアオコングリウリン (xiaochongliulin)、キシングジュナン (xinjunan)、キシウオジュナン (xiwojunan)、キシウオジュンチ (xiwojunzhi)、XMC、キシラクロール (xylachlor) キシレノール類、キシロキサジン、キシリルカルブ、キシミアゾール、イシジグ (yishijing)、ザリラミド、ゼアチン、ゼングキシアオアン (zengxiaoan)、ゼングキシアオリン (zengxiaolin)、ゼーターシペルメトリン、ナフテン酸亜鉛、リン化亜鉛、亜鉛チアゾール、亜鉛チオゾール、亜鉛トリクロロフェネート、亜鉛トリクロロフェノキシド、ジネブ、ジラム、ゾラプロホス、ズークマリン (zoocoumarin)、ゾキサミド、ズオアンジュンチ (

z u o a n j u n z h i)、ズオカオアン (z u o c a o a n)、ズオジュンチ (z u o j u n z h i)、ズオミフアングロング (z u o m i h u a n g l o n g)、1-M C P、1-メチルシクロプロペン、1-ナフトール、1, 2-ジクロロプロパン、1, 3-D、1, 3-ジクロロプロペン、2 i P、2 M-4 C、2 M-4 C M、2-メトキシ水銀クロリド、2-(オクチルチオ)エタノール、2-フェニルフェノール、2, 2, 3-T P A、2, 3, 5-トリヨード安息香酸、2, 3, 6-T B A、2, 4-D、2, 4-D B、2, 4-D E B、2, 4-D E P、2, 4-D E S、2, 4-D P、2, 4-M C P A、2, 4-M C P B、2, 4, 5-T、2, 4, 5-T B、2, 4, 5-T P、2, 5-ジクロロ安息香酸、(3-エトキシプロピル)水銀ブロミド、3, 4-D A、3, 4-D B

10

、3, 4-D P、3, 6-ジクロロピコリン酸、4-アミノピリジン、4-C P A、4-C P B、4-C P P、4-ヒドロキシフェネチルアルコール、8-ヒドロキシキノリンスルフェート、8-フェニルマーキュリオキシキノリン、及び24-エピブラシノリド。

【0018】

本開示で使用される場合、上記のそれぞれは、有効成分である。さらなる情報に関して、<https://pesticidecompendium.bcp.c.org>にある「Compendium of Pesticide Common Names」で列挙されている物質を参照されたい。

【0019】

有効成分の特に好ましい選択は、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、ヘキサフルムロン、メトミル、メトキシフェノジド、ノビフルムロン、オキサミル、スピネトラム、スピノサド、スルホキサフル、及びトリフルメゾピリム（以降、「A I G A-2」）である。

20

【0020】

加えて、有効成分の別の特に好ましい選択は、アセキノシル、アセタミプリド、アセトプロール、アベルメクチン、アジンホス-メチル、ビフェナザート、ビフェントリン、カルバリル、カルボフラン、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロマフェノジド、クロチアニジン、シフルトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、エマメクチン安息香酸塩、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトキサゾール、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリピリム、ガンマーシハロトリン、ハロフェノジド、インドキサカルブ、ラムダーシハロトリン、ルフェヌロン、マラチオン、メトミル、ノバルロン、ペルメトリン、ピリダリル、ピリミジフェン、スピロジクロフェン、テブフェノジド、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、トルフェンピラド、及びゼーターシベルメトリン（以降、「A I G A-3」）である。

30

【0021】

種子処理は、多くの有害生物、病気、栄養不足に対処するために又はこれらを予防するために、及び植物の成長を促進するために、単独で又は組み合わせて使用される。これらの種子処理には、殺真菌剤、殺虫剤、接種剤、植物成長調節剤、肥料、及び肥料強化剤が含まれ得る。現在、下記の殺真菌剤：(R)-フルトリアホール、(R)-ヘキサコナゾール、(S)-フルトリアホール、(S)-ヘキサコナゾール、10, 10'-オキシビスフェノキサルシン、2-(チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、2, 2-ジブromo-3-ニトリロプロピオンアミド、2, 4, 5-トリクロロフェノール、2, 4-ジメチルフェノール、2, 5-ジクロロ安息香酸メチルエステル、2, 6-ジクロロ-N-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)メチル-ベンズアミド、24-エピブラシノリド、2-アリフェノール、2-アミノブタン、2-メトキシエチル水銀アセテート、2-メトキシエチル水銀クロリド、2-フェニルフェノール、8-ヒドロキシキノリン、アシベンゾラル-S-メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、アミスルプロム、酢酸アンモニウム、炭酸アンモニウム、アンプロピルホス、アニラジン、アントラセン油、アソメート、アザコナゾール、アジチラム、アゾキシストロビン、ポリ硫化バリウム、ベナラキ

40

50

シル、ベナラキシール-M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブイソプロピル、ベンザルコニウムクロリド、ベンザマクリル、ベンザマクリルイソブチル、ベンザモルフ、安息香酸、ベンゾビンジフルピル、ベトキサジン、ビナパクリル、ビフェニル、ビス（メチル水銀）硫酸塩、ビスメルチアゾール、ビスートリクロロメチルスルホン、ビテルタノール、ビチオノール、ビキサフェン、ボルドー液、ホウ酸、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブロンポール、ブピリメート、ブチオベート、炭酸カルシウム、塩化カルシウム、カルシウムシアナミド、水酸化カルシウム、リン酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カルベンダジム、カルボキシ、カルプロパミド、キノメチオネート、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルデコン、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロロタロニル、クロロキシレノール、クロルキノックス、クロゾリネート、シス-ブプロピコナゾール、クリンバゾール、酸化銅（Ⅰ）、アビエチン酸銅、ビス（3-フェニルサリチル酸）銅、酢酸銅（ⅠⅠ）、炭酸銅（ⅠⅠ）、塩化銅（ⅠⅠ）、水酸化銅（ⅠⅠ）、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、COS-OGA、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、クフラネブ、キュープロバム、シアゾファミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シペンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、シプロフラム、ダゾメット、D-D、デバカルブ、デカフェンチン、デヒドロ酢酸、ジアンモニウムエチレンビス（ジチオカルバメート）、ジプロモクロロプロパン、ジクロベンチアゾクス、ジクロロフルアニド、ジクロン、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジデシルジメチルアンモニウムクロリド、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチルサルフェート、ジフルメトリム、ジメタクロン、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジメチルジスルフィド、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ジノブトン、ジノキャップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジフェニルアミン、ジピメチトロン、ジピリチオン、八ホウ酸二ナトリウム四水和物、ホスホン酸二ナトリウム、ジタリムホス、ジチアノン、DNOC、ドデモルフ、ドデモルフアセテート、ドジン、ドラゾキソロン、エジフェンホス、エノキサストロビン、エボキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボクサム、エチリモール、エトキシキン、エチレンビスイソチオシアネートサルファイド、エチリシン、エチル水銀ブロミド、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナミノスルフ、フェナミンストロビン、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、フェンチンアセテート、フェンチンクロリド、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フロリルピコキサミド、フルアジナム、フルベネテラム、フルベンズイミン、フルジオキソニル、フルフェノキシストロビン、フルモルフ、フルピコリド、フルオピモミド、フロピラム、フロロイミド、フルオトリマゾール、フルオキサピプロリン、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、ホルムアルデヒド、フォセチル、フォセチル-アルミニウム、フベリダゾール、フララキシール、フララキシール-M、フラメトピル、フルコナゾール、フルコナゾール-シス、フルフラール、フルメシクロックス、フリルオキシフェン、グリオトキシ、グルタルアルデヒド、グリオジン、グリセオフルビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ファンジュンツウオ（Huanjunzuo）、過酸化水素、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジントリアセテート、イミノクタジントリス（アルベシレート）、イネジン、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イブフルフェノキン、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソ酪酸、イソフェタミド、イソフルシプラム、イソパムホス、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、イソパムホス、クレソキシム-メチル、石灰硫黄合剤、マンカップ、マンコゼブ、マンドストロビン、マンジプロパミド、マネブ、メベニル、メカルビンジド、メフェントリフルコナゾール、メパニ

ピリム、メブロニル、メブチルジノカップ、酸化第二水銀、塩化第一水銀、メタラキシル、メタラキシル-M、メタム-カリウム、メタム-ナトリウム、メタゾキシロン、メコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチルイソチオシアネート、硫化メチルヒ素、メチレンビスチオシアネート、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、メトスルホバックス、メチルテトラプロール、ムクロリン酸無水物、ミクロブタニル、ミクロゾリン、N-(3-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(テトラヒドロ-2-オキソ-3-フラニル)アセトアミド、ナバム、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)、ニクロサミド、ニトロタールイソプロピル、ヌアリモール、オクチリノン、オフレース、オリサストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン、オキサゾスルフィル、オキシ-銅、オキシボコナゾールフマレート、オキシカルボキシン、パクロブトラゾール、パラフィン油(C11~C25)(4a)、パラフィン油(C11~C30)(4c)、パラフィン油(C15~C30)(4b)、パリノール、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、ペルオキシ酢酸、酢酸フェニル水銀、塩化フェニル水銀、硝酸フェニル水銀、ホスジフェン、フタリド、ピカルブトラゾクス、ピコキシストロビン、ピペラリン、重炭酸カリウム、ヨウ化カリウム、ホスホン酸カリウム、チオシアン酸カリウム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパミジン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピラプロポイン、ピラジフルミド、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリダクロメチル、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリモルフ、ピリオフェノン、ピリソキサゾール、ピロキロン、キノフメリン、キノキシフェン、キントゼン、サイセントン(Saisentong)、セダキサン、シルチオフアム、シメコナゾール、亜ヒ酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム、四ホウ酸ナトリウム五水和物、スピロピジオン、スピロキサミン、フッ化スルフルル、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チシオフエン、チフルザミド、チオメルサール、チオフアネート、チオフアネート-メチル、チオキノックス、チラム、チアジニル、トルクロホス-メチル、トルフェンピラド、トルプロカルブ、トリルフルアニド、トランス-プロピコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアゾキシド、トリブチルスズオキシド、トリクラミド、トリクロピリカルブ、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリホリン、トリオキシメチレン、トリチコナゾール、尿素、バリフェナレート、ピンクロゾリン、ザリラミド、ホウ酸亜鉛、酸化亜鉛、ジネブ、ジラム、及びゾキサミドを、多形形態A及びBと共に使用し得、この殺真菌剤のグループは以降「FGK-1」である。

【0022】

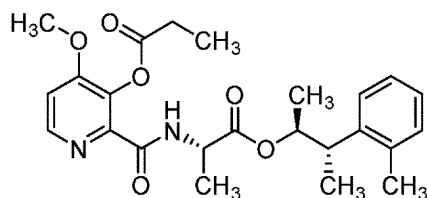
種子処理において化合物1(本明細書で開示されている)の多形形態A及びBと共に使用するための別の好ましい殺真菌剤のグループは、アゾキシストロビン、ベノミル、ベンゾビンジフルビル、ビキサフェン、カルベンダジム、クロロタロニル、シモキサニル、シプロコナゾール、ジクロベンチアゾクス、ジフェノコナゾール、エタボキサム、ファモキサドン、フェンブコナゾール、フルオピラム、フルインダビル、フルジオキシニル、フォルペット、インビルフルキサム、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イソフルシプラム、マンコゼブ、マネブ、メフェントリフルコナゾール、メブチルジノカップ、メタラキシル、及びメタラキシル-M(メフェノキサム)、オキサチアピプロリン、ペンフルフェン、ピコキシストロビン、プロクロラズ、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、キノキシフェン、セダキサン、チアベンダゾール、チラム、トリシクラゾール、及びトリフロキシストロビンであり、この殺真菌剤のグループは以降「FGK-2」である。

【0023】

下記の2種の殺真菌剤分子も、化合物1(本明細書で開示されている)の多形形態A及

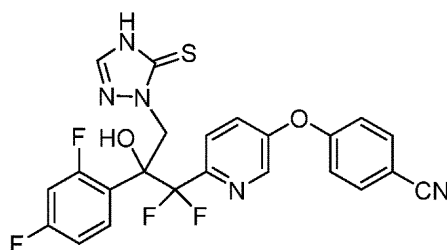
び B と共に使用されることが好ましい。

【化 2】



(2S, 3S) - 3 - (オートリル) ブタン - 2 - イル (4 - メトキシ - 3 - (プロピオニルオキシ) ピコリノイル) - L - アラニネート
(以降「FGK-3」)、及び

【化 3】



4 - ((6 - (2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - チオキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル) ピリジン - 3 - イル) オキシ) ベンゾニトリル
(以降「FGK-4」)。

【0024】

FGK-3 は、国際公開第 2019173665 号パンフレットにおいて化合物番号 278 として説明されており、FGK-4 は、国際公開第 2016187201 号パンフレットの実施例 2 で説明されている。

【0025】

「領域」という用語は、その中で有害生物が増殖中であるか、増殖可能であるか、又は動き回ることが可能である生息地、繁殖場、植物、種子、土壌、物質、又は環境を意味する。例えば、領域は、下記のものであり得るが、これらに限定されない：作物、樹木、果実、穀物、飼料種、蔓植物、芝生、及び／又は観賞用植物が育っている領域；家畜が住んでいる領域；建築物の内表面又は外表面（例えば、穀物が貯蔵されている場所）；建築物において使用される建設材料（例えば、含浸木材）；並びに建築物の周りの土壌。

【0026】

「MoA 物質」という語句は、irac-online.orgにあるIRACのMoA分類 v. 10.3 で示された作用機構（「MoA」）を有する有効成分を意味する。

【0027】

「殺生物有効量」という語句は、有害生物に対する観察可能な効果（例えば、ネクロシス、枯死、抑制、予防、除去、破壊、又はそうでなければある領域における有害生物の発生及び／若しくは活動の削減の効果）を達成するのに必要とされる殺生物剤の量を意味する。この効果がもたらされ得るのは、有害生物の集団がある領域から駆除されるか、有害生物がある領域内若しくはその周辺で無能力にされ、且つ／又は有害生物がある領域内若しくはその周辺で根絶される場合である。当然のことながら、これらの効果が重なって起きることもあり得る。一般に、有害生物の個体数、活動、又はその両方は、望ましくは 50 パーセント超減少し、好ましくは 90 パーセント超減少し、最も好ましくは 99 パーセント超減少する。一般に、農業目的の殺生物有効量は、1 ヘクタール当たり約 0.0001 グラム～1 ヘクタール当たり約 5000 グラムであり、好ましくは 1 ヘクタール当

10

20

30

40

50

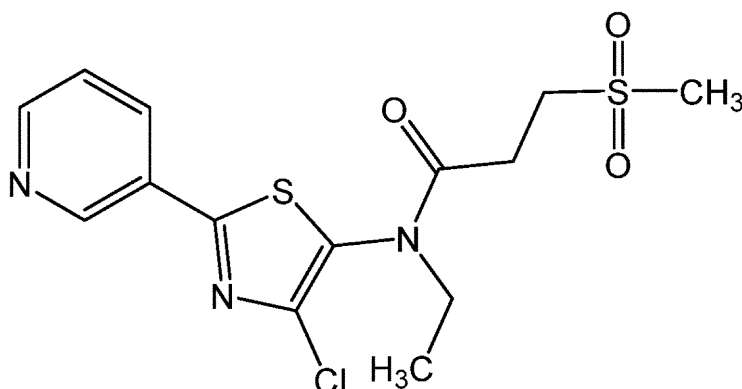
り約 0.0001 グラム～1 ヘクタール当たり約 500 グラムであり、さらにより好ましくは 1 ヘクタール当たり約 0.0001 グラム～1 ヘクタール当たり約 50 グラムである。

【発明の概要】

【0028】

一態様では、本開示は、式

【化 4】



10

で表される N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの 1 種又は複数種の結晶形態を提供する。

20

【0029】

一実施形態では、N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの 1 種又は複数種の結晶形態。

【0030】

別の実施形態では、N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの 1 種又は複数種の結晶形態は、無水であり且つ無溶媒の結晶多形形態である。

30

【0031】

別の実施形態では、1 種又は複数種の結晶形態は、化合物 1 の結晶多形形態 A 及び B (本明細書では、多形形態 A 及び多形形態 B と個々に称される) である。

【0032】

さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 17.4 ± 0.2 及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折

40

50

10

20

30

40

50

θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

【0034】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 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 、及び 28.1 ± 0.2 の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 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 、及び 28.6 ± 0.2 の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 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 、及び 28.6 ± 0.2 の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 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 ± 0.2 、 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 、及び 28.6 ± 0.2 の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 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 、及び 28.6 ± 0.2 の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

10

20

30

【0035】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、図1又は図2で示されているものと本質的に同一の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

【0036】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、約 101.09°C でのピーク温度を有する吸熱ピークを含む示差走査熱量測定(DSC)サーモグラム、及び融解熱 $= 75.707 \text{ J/g}$ 又は図4と実質的に同一を有する。

【0037】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、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} 、及び約 3053 cm^{-1} の波数での1つ又は複数のピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、図6で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する。

40

【0038】

本明細書で説明されている結晶多形形態Aの粉末X線回折パターンの内のいずれかに関連するいくつかの実施形態では、結晶多形形態Aは、約 101.09°C でのピーク温度を

50

有する吸熱ピークを含む（DSC）サーモグラム、並びに／又は約 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} 、及び約 3053 cm^{-1} の波数での1つ又は複数のピークを含む低周波ラマンスペクトルをさらに含む。本明細書で説明されている結晶多形形態Aの粉末X線回折パターンの中のいずれかに関連するいくつかの実施形態では、結晶多形形態Aは、図4と実質的に同一のDSCサーモグラム、及び／又は図6で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルをさらに含む。

【0039】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 15.4 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 及び 15.4 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

【0040】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 15.4 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、及び 15.4 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、及び 24.1 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、及び 24.1 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 20.2 ± 0.2 、 $24.1 \pm$

0.2、及び31.1±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、7.7±0.2、15.4±0.2、16.7±0.2、20.2±0.2、24.1±0.2、26.1±0.2、及び31.1±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び31.1±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び31.1±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

【0041】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

10

20

30

40

50

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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び33.4±0.2の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

10

【0042】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、図3で示されているものと本質的に同一の回折角(2θ)でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する。

【0043】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、約105.24℃でのピーク温度を有する吸熱ピークを含む示差走査熱量測定(DSC)サーモグラム、及び融解熱=92.879 J/g又は図5と実質的に同一を有する。

20

【0044】

さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、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、及び約1308 cm⁻¹、約1518 cm⁻¹、約1573 cm⁻¹、約1592 cm⁻¹、約1673 cm⁻¹、約2919 cm⁻¹、及び約2937 cm⁻¹の波数での1つ又は複数のピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する。さらなる実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、図7で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する。

30

【0045】

本明細書で説明されている結晶多形形態Bの粉末X線回折パターンの内のいずれかに関連するいくつかの実施形態では、結晶多形形態Bは、約105.24℃でのピーク温度を有する吸熱ピークを含む(DSC)サーモグラム、並びに/又は約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、及び約1308 cm⁻¹、約1518 cm⁻¹、約1573 cm⁻¹、約1592 cm⁻¹、約1673 cm⁻¹、約2919 cm⁻¹、及び約2937 cm⁻¹の波数での1つ又は複数のピークを含む低周波ラマンスペクトルをさらに含む。本明細書で説明されている結晶多形形態Bの粉末X線回折パターンの内のいずれかに関連するいくつかの実施形態では、結晶多形形態Bは、図5と実質的に同一のDSCサーモグラム、及び/又は図7で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルをさらに含む。

40

【0046】

本開示は、化合物1の多形形態A及びBの内の1つ又は複数を含む組成物をさらに提供する。

【0047】

別の態様では、本開示は、有害生物を防除する方法であって、本明細書で説明されているN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの多形形態A及びBの内の1つ若しくは複数、又は本明細書で説明されているN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イ

50

ル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] - N - エチル - 3 - (メチルスルホニル) プロパンアミドの多形形態 A 及び B の内の 1 つ若しくは複数を含む組成物の殺生物有効量を領域に施用することを含む方法を提供する。

【0048】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、アリ、アブラムシ、ナンキンムシ、甲虫、シミ、毛虫、ゴキブリ、コオロギ、ハサミムシ、ノミ、ハエ、バッタ、地虫、ヨコバイ、シラミ、イナゴ、ウジ、ダニ、線虫、ウンカ、キジラミ、ハバチ、カイガラムシ、セイヨウシミ、ナメクジ、カタツムリ、クモ、トビムシ、カメムシ、結合類、シロアリ、アザミウマ、マダニ、ジガバチ、コナジラミ、及びハリガネムシからなる群から選択される。いくつかの実施形態では、前記有害生物は、樹液を餌とする有害生物、又は咀嚼有害生物である。

10

【0049】

いくつかの実施形態では、前記有害生物は、カメムシ目 (Hemiptera)、アザミウマ目 (Thysanoptera)、チョウ目 (Lepidoptera)、及び同類のものに由来する。

【0050】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、アデルゲス属 (Adelges) 種、アウラカスピス属 (Aulacaspis) 種、アフロフォラ属 (Aphrophora) 種、アフィス属 (Aphis) 種、ベミシア属 (Bemisia) 種、セロプラステス属 (Ceroplastes) 種、キオナスピス属 (Chionaspis) 種、クリソムファルス属 (Chrysomphalus) 種、コックス属 (Coccus) 種、エンポアスカ属 (Empoasca) 種、ユースキスツス属 (Euschistus) 種、レピドサフェス属 (Lepidosaphes) 種、ラギノトムス属 (Lagynotomus) 種、リグス属 (Lygus) 種、マクロシフム属 (Macrosiphum) 種、ネホテッチキス属 (Nephotettix) 種、ネザラ属 (Nezara) 種、ニラパルバタ属 (Nilaparvata) 種、フィラエヌス属 (Philaenus) 種、フィトコリス属 (Phytocoris) 種、ピエゾドルス属 (Piezodorus) 種、プラノコックス属 (Planococcus) 種、プセウドコックス属 (Pseudococcus) 種、ロパロシフム属 (Rhopalosiphum) 種、サイセチア属 (Saissetia) 種、テリオアフィス属 (Therioaphis) 種、トウメイエラ属 (Toumeyella) 種、トキソプテラ属 (Toxoptera) 種、トリアレウロデス属 (Trialeurodes) 種、トリアトマ属 (Triatoma) 種、及びウナスピス属 (Unaspis) 種からなる群から選択される。

20

30

【0051】

この態様のいくつかの実施形態では、有害生物は、アクロステルヌム・ヒラレ (Acrosternum hilare)、アクリトシフォン・ピスム (Acyrtosiphon pisum)、アレイロデス・プロレテラ (Aleyrodes proletella)、アレウロディクス・ディスペルス (Aleyrodicus dispersus)、アレウロトリクス・フロコス (Aleyrothrixus floccosus)、アムラスカ・ビグツツラ・ビグツツラ (Amrasca biguttula biguttula)、アオニジエラ・アウランチイ (Aonidiella aurantii)、アフィス・ファベエ (Aphis fabae)、アフィス・ゴシピイ (Aphis gossypii)、アフィス・グリシネス (Aphis glycines)、アフィス・ポミ (Aphis pomi)、アウラコルツム・ソラニ (Aulacorthum solani)、バクテリケラ・コケレリ (Bactericera cockerelli)、バグラダ・ヒラリス (Begrada hilaris)、ベミシア・アルゲンチホリイ (Bemisia argentifolii)、ベミシア・タバシ (Bemisia tabaci)、ブリサス・レウコプテルス (Blissus leucopterus)、ボイセタ・トリビタータ (Boisea trivittata)、ブラキコリネラ・アスパラギ (Brachycorynella aspara

40

50

gi)、ブレヴェンニア・レヒ (*Brevennia rehi*)、ブレビコリネ・ブラ
シカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコスイラ・ピリ (*Cacopsylla pyricola*)、カコスイラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カロコリス・ノルヴェギクス (*Calocoris norvegicus*)、セロプラステス・ルベンス (*Ceroplastes rubens*)、シメクス・ヘ
ミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメクス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、コッカス・シュードマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、ダグベルツス・ファシアツス (*Dagbertus fasciatus*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジアホリナ
・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジスデルクス・スツレルス (*Dysdercus suturellus*)、エデッサ・メジタブンダ (*Edessa meditabunda*)、エンポアスカ・ウィティス (*Empoasca vitis*)、エリオソマ
・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリスロネウラ・エレガント
ラ (*Erythroneura elegantula*)、エウリガスター・マウラ (*Eurygaster maura*)、エウチスツス・コンスペルス (*Euschistus conspersus*)、エウチスツス・ヘロス (*Euschistus heros*)、エウチスツス・セルプス (*Euschistus servus*)、ハリヨモル
ファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘロペルチス・アントニイ (*Helopeltis antonii*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、ヘロペルチス・テイボラ (*Helopeltis theivora*)、イセリア・ブルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオスコプス・ニチ
ズルス (*Idioscopus nitidulus*)、ラコビスカ・ホルモサナ (*Jacobiasca formosana*)、ラオデルファクス・ストリアテルス (*Laelaphax striatellus*)、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*)、レプトコリサ・オラトリウス (*Leptocorisa oratorius*)、レプトコリサ・ヴァリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、マコネリコックス・ヒル
スツス (*Macroneuricoccus hirsutus*)、マクロシフム・ユーホル
ビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・グラナリ
ウム (*Macrosiphum granarium*)、マクロシフム・ロザエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・クアドリリネアツス (*Macrostes quadrilineatus*)、マハナルバ・フリムビオラタ (*Mahanarva frimbiolata*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、ミクチス・ロンギコルニス (*Mictis longicornis*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ナソノビア・リビスニグ
リ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cinctipes*)、ノイロコルプス・ロンギロストリス (*Neurocolpus longirostris*)、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、パラコッカス・マルギナツス (*Paracoccus marginatus*)、パラトリオザ・コケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラト
リア・ペルガンジイ (*Parlatoria pergandii*)、パルラトリア・ジ
ジフィ (*Parlatoria ziziphi*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、フィロキセラ・ビチホリアエ (*Phylloxera vitifoliae*)、フィソケルメス・ピセアエ (*Physokermes piceae*)、フィトコリス・カリホルニクス (*Phytocoris californicus*)、フィトコリス・レラチブス (*Phytocoris relativus*)、

10

20

30

40

50

ピエゾドルス・グイルディニイ (*Piezodorus guildinii*)、プラノ
 コッカス。シトリ (*Planococcus citri*)、プラノコッカス・フィクス
 (*Planococcus ficus*)、ポエシロカプスス・リネアツス (*Poecil
 locapsus lineatus*)、プサルス・バッシニコラ (*Psallus v
 accinicola*)、プソイダシスタ・ベルセアエ (*Pseudacysta pe
 rseae*)、プソイドコックス・ブレビペセス (*Pseudococcus brev
 ipes*)、クアドラスピジオツス・ベルニシオスス (*Quadraspidiotus
 perniciosus*)、ロパロシファム・マイデイス (*Rhopalosiphum
 maidis*)、ロパロシファム・パディ (*Rhopalosiphum padi*)、
 サイツセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカプトコリス・カスタ
 ネア (*Scaptocoris castanea*)、シザフィス・グラミヌム (*Sch
 izaphis graminum*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion av
 enae*)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ト
 リアレウロデス・バポラリオルム (*Trialeurodes vaporarioru
 m*)、トリアレウロデス・アブチロネウス (*Trialeurodes abutilo
 neus*)、ウナスピス・ヤノネンシス (*Unaspis yanonensis*)、及
 びズリア・エントレリアナ (*Zulia entrerriana*) からなる群から選択
 される。

10

【0052】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、カリオトリプス属 (*Calio
 thrips*) 種、フランクリニエラ属 (*Frankliniella*) 種、シルトトリ
 プス属 (*Scirtothrips*) 種、及びソリプス属 (*Thrips*) 種からなる群
 から選択される。

20

【0053】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、カリオトリプス・ファセオリ (*Caliothrips phaseoli*)、フランクリニエラ・ビスピノサ (*Frankliniella bispinosa*)、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オクシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・シュルツイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (*Frankliniella williamsi*)、ヘリオトリプス・ヘモルホイダリス (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス・シトリ (*Scirtothrips citri*)、シルトトリプス・ドルサリス (*Scirtothrips dorsalis*)、タエニオトリプス・ローランテンナリス (*Taeniothrips rhopalantennalis*)、ソリプス・ハワイエンシス (*Thrips hawaiiensis*)、ソリプス・ニグロピロス (*Thrips nigropilosus*)、ソリプス・オリエンタリス (*Thrips orientalis*)、ソリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、及びソリプス・タバシ (*Thrips tabaci*) からなる群から選択される。

30

40

【0054】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、アドキソフィエス属 (*Adoxophyes*) 種、アグロチス属 (*Agrotis*) 種、アルギロテニア属 (*Argyrotaenia*) 種、カコエキア属 (*Cacoecia*) 種、カロプチリア属 (*Caloptilia*) 種、キロ属 (*Chilo*) 種、クリソデイキス属 (*Chrysodeixis*) 種、コリアス属 (*Colias*) 種、クラムバス属 (*Crambus*) 種、ジアファニア属 (*Diaphania*) 種、ジアトラエア属 (*Diatraea*) 種、エアリアス属 (*Earias*) 種、エフェスチア属 (*Ephestia*) 種、エピメシス属 (*Epimecis*) 種、フェルチア属 (*Feltia*) 種、ゴルチナ属 (*Gortyna*) 種

50

、ヘリコベルパ属 (*Helicoverpa*) 種、ヘリオチス属 (*Heliothis*) 種、インダルベラ属 (*Indarbella*) 種、リトコレチス属 (*Lithocolletis*) 種、ロキサグロチス属 (*Loxagrotis*) 種、マラコソマ属 (*Malacosoma*) 種、ネマポゴン属 (*Nemapogon*) 種、ペリドローマ属 (*Peridroma*) 種、フィロノリクテル属 (*Phyllonorycter*) 種、プセウダレチア属 (*Pseudaletia*) 種、プルテラ属 (*Plutella*) 種、セサミア属 (*Sesamia*) 種、スポドプテラ属 (*Spodoptera*) 種、シナンテドン属 (*Synanthedon*) 種、及びイポノメウタ属 (*Yponomeuta*) 種からなる群から選択される。

【0055】

この態様のいくつかの実施形態では、前記有害生物は、アカエア・ジャナタ (*Achaea janata*)、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アモルビア・クネアナ (*Amorbia cuneana*)、アミュエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナカンプトデス・デフェクタリア (*Anacamptodes defectaria*)、アナルシア・リネアテラ (*Anarsia lineatella*)、アノミス・サブリフェラ (*Anomis sabulifera*)、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルキプス・アルギロスピラ (*Archips argyrospila*)、アルキプス・ロザナ (*Archips rosana*)、アルギロタエニア・シトラナ (*Argyrotaenia citrana*)、オートグラファ・ガンマ (*Autographa gamma*)、ボナゴタ・クラナオデス (*Bonagota cranaodes*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルボシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、クルメチア・トランスベルサ (*Chlumetia transversa*)、コリストネウラ・ロサセアナ (*Choristoneura rosaceana*)、クナファロクロチス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、コノボモルファ・クラメラ (*Conopomorpha cramerella*)、コルシラ・セファロニカ (*Corcyra cephalonica*)、コスス・コスス (*Cossus cossus*)、シディア・カリアナ (*Cydia caryana*)、シディア・フネブラナ (*Cydia funebrana*)、シディア・モレスタ (*Cydia molesta*)、シディア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シディア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダルナ・ジダクタ (*Darna diducta*)、ジアファニア・ニチダリス (*Diaphania nitidalis*)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、ジアトラエア・グランジオセラ (*Diatraea grandiosella*)、エアリアス・インスラナ (*Earias insulana*)、エアリアス・ビテラ (*Earias vittella*)、エクジトロファ・アウランチアヌム (*Ecdytolopha aurantianum*)、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エフェスチア・カウテラ (*Ephestia cautella*)、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア・アポレマ (*Epinotia aporema*)、エピフィアス・ポストヴィッタナ (*Epiphyas postvittana*)、エリオノタ・スラックス (*Erionota thrax*)、エスティグメン・アクレア (*Estigmene acrea*)、ユーボエシリア・アンビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユーキシオ・アウキシリアリス (*Euxoa auxiliaris*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラホリタ・モレスタ (*Grapholita*

10

20

30

40

50

molesta)、ヘジルエブタ・インジカタ (*Hedylepta indicata*)、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ケイフェリア・リコベルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、ロイシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、ロイコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・マリホリエラ (*Leucoptera malifoliella*)、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア・ジスバル (*Lymantria dispar*)、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マハセナ・コルベッチ (*Mahasena corbeti*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、マンヅカ・セクツタ (*Manduca sexta*)、マルカ・テストラリス (*Maruca testulalis*)、メチサ・プラナ (*Metisa plana*)、ミチムナ・ウニブクタ (*Mythimna unipuncta*)、ネオロイシノデス・エレガンタリス (*Neoleucinodes elegantalis*)、ニンフラ・デブクタリス (*Nymphula depunctalis*)、オペロフテラ・ブルマタ (*Operophtera brumata*)、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、オキシジア・ベスリア (*Oxydia vesulia*)、パンデミス・セラサナ (*Pandemis cerasana*)、パンデミス・ヘパラナ (*Pandemis heparana*)、パピリオ・デモドクス (*Papilio demodocus*)、ペクチノホラ・ゴシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリドロマ・サウシア (*Peridroma saucia*)、ペリロイコプテラ・コフエエラ (*Perileucoptera coffeella*)、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllonectis citrella*)、フィロノルシテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチベナ・スカブラ (*Plathypena scabra*)、プラチノタ・イデウサリス (*Platynota idaeusalis*)、プロジア・インテルブクテラ (*Plodia interpunctella*)、ブルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、ポリクロシス・ビテアナ (*Polychrosis viteana*)、プライス・エンドカルパ (*Prays endocarpa*)、プライス・オレア (*Prays oleae*)、シューダレチア・ウニブクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、シュードブルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スキルポファガ・インセルチュラス (*Scirpophaga incertulas*)、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、セサミナ・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)、セトラ・ニテンス (*Setora nitens*)、シトロガ・セラアレラ (*Sitotroga cerealella*)、スパルガノチス・ピレリアナ (*Sparganotthis pilleriana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・エリダニア (*Spodoptera eridania*)、テクラ・バシリデス (*Thecla basilides*)、チネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トリコブルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ゾイゼラ・コフエア (*Zeuzera coffeae*)、及びゾイゼラ・ピリナ (*Zeuzera pyrina*) からなる群から選択される。

10

20

30

40

50

【0056】

本明細書で説明されている化合物1の結晶多形形態A及びB（本明細書では、多形形態A及び多形形態Bと個々に称される）は、本明細書で既に説明されている弦音器官に影響を及ぼす殺虫剤と一致して、サツマイモコナジラミB．タバシ（B．t a b a c i）の成虫の挙動、神経機能、及び筋肉機能に影響を及ぼすことを、予想外にも発見している。既知の化合物の1の非結晶形態（非晶質油）との直接比較では、化合物1の結晶多形形態A及びB（本明細書では、多形形態A及び多形形態Bと個々に称される）は、驚くべきことに、昆虫の有意に大きいノックダウンを誘発し、このことは、弦音器官に影響を及ぼすこれまでの殺虫剤の先行研究において、死亡率に関連することが示されている。

【0057】

本開示のさらなる実施形態、特徴、及び利点は、下記の詳細な説明から且つ本開示の実施を通じて明らかであるだろう。本開示の化合物は、下記で列挙される箇条の内のいずれかにおいて、実施形態として説明され得る。本明細書で説明されている実施形態はいずれも、実施形態が互いに矛盾しない範囲まで、本明細書で説明されている任意の他の実施形態との関連で使用し得ることが理解されるだろう。

【0058】

1．N－[4－クロロ－2－（ピリジン－3－イル）－1，3－チアゾール－5－イル]－N－エチル－3－（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶形態。

【0059】

2．前記結晶形態は、N－[4－クロロ－2－（ピリジン－3－イル）－1，3－チアゾール－5－イル]－N－エチル－3－（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶多形形態である、実施形態1に記載の結晶形態。

【0060】

3．前記結晶形態は、無水又は無溶媒である、実施形態1又は2に記載の結晶多形。

【0061】

4． 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有するN－[4－クロロ－2－（ピリジン－3－イル）－1，3－チアゾール－5－イル]－N－エチル－3－（メチルスルホニル）プロパンアミドの結晶多形形態A。

【0062】

5．前記結晶多形形態は、 17.4 ± 0.2 及び 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態4に記載の結晶多形形態。

【0063】

6．前記結晶多形形態は、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態4又は5に記載の結晶多形形態。

【0064】

7．前記結晶多形形態は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態4～6のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0065】

8．前記結晶多形形態は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態4～7のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0066】

9．前記結晶多形形態は、 10.6 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2 、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態4～8のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0067】

10．前記結晶多形形態は、 10.6 ± 0.2 、 16.0 ± 0.2 、 17.4 ± 0.2

10

20

30

40

50

、 18.2 ± 0.2 、 18.7 ± 0.7 、 19.9 ± 0.2 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 4～9 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0068】

11. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 4～10 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0069】

12. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 4～11 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

10

【0070】

13. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.3 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 4～12 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

20

【0071】

14. 前記結晶多形形態は、図 1 及び図 2 で示されているものと本質的に同一の 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 4～13 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0072】

15. 前記結晶多形形態は、約 101.09°C でのピーク温度を有する吸熱ピークを含む DSC サーマグラムを有する、実施形態 4～14 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0073】

16. 図 4 と実質的に同一の DSC サーマグラムを有する実施形態 4～15 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

30

【0074】

17. 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} 、及び約 3053 cm^{-1} の波数での 1 つ又は複数のピークを含むラマンスペクトルを有する実施形態 4～16 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0075】

18. 図 6 で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する実施形態 4～17 のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

40

【0076】

19. 15.4 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの結晶多形形態 B。

【0077】

20. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 及び 15.4 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 19 に記載の結晶多形形態。

【0078】

21. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角 (2θ) でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、実施形態 19 又は

50

20に記載の結晶多形形態。

【0079】

22. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～21のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0080】

23. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～22のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0081】

24. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～23のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0082】

25. 前記結晶多形形態は、 7.7 ± 0.2 、 15.4 ± 0.2 、 16.6 ± 0.2 、 16.7 ± 0.2 、 17.5 ± 0.2 、 18.4 ± 0.2 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～24のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0083】

26. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～25のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0084】

27. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～26のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0085】

28. 前記結晶多形形態は、 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 、及び 20.2 ± 0.2 の回折角（ 2θ ）でのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～27のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0086】

29. 前記結晶多形形態は、図3で示されているものと本質的に同一の1つ又は複数のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、実施形態19～28のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0087】

30. 前記結晶多形形態は、約 105.24°C でのピーク温度を有する吸熱ピークを含むDSCサーモグラムを有する、実施形態19～29のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0088】

31. 図5と実質的に同一のDSCサーモグラムを有する実施形態19～30のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0089】

32. 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} 及び約 1308 cm^{-1} 、約 1518 cm^{-1} 、約 1573 cm^{-1} 、約 1592 cm^{-1} 、約 16

10

20

30

40

50

73 cm^{-1} 、約 2919 cm^{-1} 、及び 2937 cm^{-1} の波数での1つ又は複数のピークを含むラマンスペクトルを有する実施形態19～31のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0090】

33. 図7で示されているものと本質的に同一の波数でのピークを含む低周波ラマンスペクトルを有する実施形態19～32のいずれか一つに記載の結晶多形形態。

【0091】

34. 実施形態1に記載の結晶形態、又は実施形態2～33のいずれか一つに記載の結晶多形形態を含む組成物。

【0092】

35. 有害生物を防除する方法であって、実施形態1に記載の結晶形態、実施形態2～23のいずれか一つに記載の結晶多形形態、又は実施形態34に記載の組成物の殺生物有効量を領域に施用することを含む方法。

【図面の簡単な説明】

【0093】

【図1】実施例1で調製されたN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Aの結晶形態の粉末X線回折パターンを示す。

【図2】実施例2で調製されたN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Aの結晶形態の粉末X線回折パターンを示す。

【図3】実施例5で調製されたN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Bの結晶形態の粉末X線回折パターンを示す。

【図4】N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Aの結晶形態の示差走査熱量測定(DSC)サーモグラムを示す。

【図5】N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Bの結晶形態の示差走査熱量測定(DSC)サーモグラムを示す。

【図6】N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Aの結晶形態のラマンスペクトルを示す。

【図7】N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(無溶媒及び無水)多形形態Bの結晶形態のラマンスペクトルを示す。

【図8】ノックダウン実験のコントロール処理を示すグラフであり、この実験では、アセトン溶媒ブランクコントロールバイアル中の2cm線より上のB.タバシ(B. tabaci)の割合を経時的に記録している。

【図9】コナジラミB.タバシ(B. tabaci)の成虫を、それぞれアセトン溶媒から、 25 g/h a の化合物1多形形態B、又は化合物1非結晶性非晶質油で前処理したバイアルに入れたノックダウン実験の結果を示すグラフであり、多形Bバイアル(●)又は非結晶性非晶質油バイアル(黒四角)における、2cm線より上のB.タバシ(B. tabaci)成虫の割合を記録している。

【図10】コナジラミB.タバシ(B. tabaci)の成虫を、それぞれアセトン溶媒から、 2.5 g/h a の化合物1多形形態B、又は化合物1非結晶性非晶質油で前処理したバイアルに入れたノックダウン実験の結果を示すグラフであり、多形Bバイアル(●)又は非結晶性非晶質油バイアル(黒四角)における、2cm線より上のB.タバシ(B. tabaci)成虫の割合を記録している。

【図11】ノックダウン実験のコントロール処理を示すグラフであり、この実験では、へ

10

20

30

40

50

キサン溶媒ブランクコントロールバイアル中の 2 cm 線より上の B. タバシ (B. t a b a c i) 成虫の割合を経時的に記録している。

【図 1 2】コナジラミ B. タバシ (B. t a b a c i) の成虫を、それぞれヘキサン抗溶媒懸濁液から、2.5 g / h a の化合物 1 多形形態 A、化合物 1 多形形態 B、又は化合物 1、非結晶性非晶質油で前処理したバイアルに入れたノックダウン実験の結果を示すグラフであり、多形 A バイアル (黒ダイヤ)、多形 B バイアル (●)、又は非結晶性非晶質油バイアル (黒四角) における、2 cm 線より上の B. タバシ (B. t a b a c i) 成虫の割合を経時的に記録している。

【図 1 3】コナジラミ B. タバシ (B. t a b a c i) の成虫を、それぞれヘキサン抗溶媒懸濁液から、2.5 g / h a の化合物 1 多形形態 A、化合物 1 多形形態 B、又は化合物 1 非結晶性非晶質油で前処理したバイアルに入れたノックダウン実験の結果を示すグラフであり、多形 A バイアル (黒ダイヤ)、多形 B バイアル (●)、又は非結晶性非晶質油バイアル (黒四角) における、2 cm 線より上の B. タバシ (B. t a b a c i) 成虫の割合を経時的に記録している。

【図 1 4】コナジラミ B. タバシ (B. t a b a c i) の成虫を、それぞれヘキサン抗溶媒懸濁液から、0.25 g / h a の化合物 1 多形形態 A、化合物 1 多形形態 B、又は化合物 1 非結晶性非晶質油で前処理したバイアルに入れたノックダウン実験の結果を示すグラフであり、多形 A バイアル (黒ダイヤ)、多形 B バイアル (●)、又は非結晶性非晶質油バイアル (黒四角) における、2 cm 線より上の B. タバシ (B. t a b a c i) 成虫の割合を経時的に記録している。

【発明を実施するための形態】

【0094】

本開示をさらに説明する前に、本開示は、説明されている特定の実施形態に限定されず、それ自体、当然ながら、変動し得ることが理解されるべきである。本明細書において用いられる専門用語は、本開示の範囲が添付の特許請求の範囲によってのみ限定されるであろうことから、特定の実施形態を説明する目的のためにすぎず、限定的であることを意図しないことがまた理解されるべきである。

【0095】

特に定義しない限り、本明細書において用いられる全ての技術用語及び科学用語は、本開示が属する技術分野の当業者によって一般に理解されるものと同じ意味を有する。本明細書で言及される全ての特許、出願、公開された出願、及び他の刊行物は、その全体が参照により組み込まれる。このセクションに記載されている定義が、参照により本明細書に組み込まれる特許、出願、又は他の刊行物に記載されている定義に反するか又は他の点で矛盾する場合には、このセクションに記載されている定義が、参照により本明細書に組み込まれる定義よりも優先する。

【0096】

本明細書及び添付の特許請求の範囲で使用される場合、単数形「a」、「an」、及び「the」は、文脈で明確に指示されない限り、複数の指示対象を含む。特許請求の範囲が任意選択的な要素を排除するように記載され得ることにさらに留意されたい。従って、この記述は、請求項の構成要素の列挙に関連した「唯一 (s o l e l y)」、「ただ～のみ (o n l y)」等の排他的用語を使用するための又は「負」の限定を使用するための先行文として機能することが意図されている。

【0097】

化合物 1 の多形形態、及び化合物 1 を調製する方法を、下記で詳述する。いくつかの実施形態では、化合物 1 の非晶質形態を、国際公開第 2010 / 139497 A 1 号パンフレット及び米国特許第 8,350,044 号明細書 (これらは、その全体が参照により本明細書に組み込まれる) で開示されている、説明されている方法に従って調製し得る。

【0098】

N - [4 - クロロ - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1,3 - チアゾール - 5 - イル] - N - エチル - 3 - (メチルスルホニル) プロパンアミド多形形態 A の独特な物理的形態は

、本明細書で説明されている方法に従って調製されている。多形形態 A の粉末 X 線回折（P X R D）パターンを図 1 に示しており、対応する表形式データを表 1 に示す。

【 0 0 9 9 】
【 表 1 】

表 1

2 シータ(度)	d 間隔(Å)	相対ピーク高さ	定性的強度
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%相対強度), M = 中(20-50%相対強度), W = 弱 (<20%相対強度)

【 0 1 0 0 】

いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、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、及び 33.0 ± 0.2 の回折角（2 θ）での 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、10.2 ± 0.1、10.6 ± 0.1、13.2 ± 0.1、16.0 ± 0.1、16.7 ± 0.1、

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、及び33.0±0.1の回折角(2θ)での1つ又は複数のピークを含む粉末X線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物1の結晶多形形態Aは、上記実施形態で示されている回折角(2θ)での2つ以上のピークの組み合わせを含む粉末X線回折パターンを有する。表1で示されている回折角(2θ)は、上記で示されており且つ本開示でも言及されている値の実験誤差内であることが理解されるだろう。

10

【0101】

いくつかの実施形態では、図1及び表1で示されているN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミドの同一の物理的形態(多形形態A)は、本明細書で説明されている方法に従って調製されており、この物質を、本明細書で説明されているような再結晶技術(例えば、多形形態Aの種結晶の使用、多重結晶化/再結晶化方法、及び同類のもの)を使用して、より高純度に調製し得る。より高純度の結晶物質を提供するためのそのような技術の使用により、粉末X線回折(PXRD)分析での分解能をより高め得ることが、当業者に理解されるだろう。より高純度の物質を得るためにそのような技術を使用する多形形態Aの粉末X線回折(PXRD)パターン、従ってより高品質の粉末X線回折(PXRD)分析を、図2に示しており、対応する表形式データを表2に示す。表2で示されているPXRDデータは、表1で示されているデータの実験誤差内であること、及び図2で示されているより高分解能のPXRDパターンにより、図1で示されているPXRDパターンではこれまで見えなかったPXRDパターンでの密集したピークを識別する能力が増強されることが、当業者に理解されるだろう。

20

【0102】

30

40

50

【表 2】

表 2

2 シータ(度)	d 間隔(Å)	相対ピーク高さ	定性的強度
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% 相対強度), M = 中 (20-50% 相対強度), W = 弱 (<20% 相対強度)

【0103】

いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、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、及び 32.9±0.2。

9 ± 0.2 の回折角 (2θ) の 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、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、及び 32.9 ± 0.1 の回折角 (2θ) の 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 A は、上記実施形態で示されている回折角 (2θ) の 2 つ以上のピークの組み合わせを含む粉末 X 線回折パターンを有する。表 2 で示されている回折角 (2θ) は、上記で示されており且つ本開示でも言及されている値の実験誤差内であることが理解されるだろう。

10

【0104】

結晶多形形態 A の DSC サーモグラムを、図 4 に示す。実施例 10 で説明されている DSC 法の最中に、多形形態 A は、図 4 で示すように、約 101.09 °C で融解し、融解熱 = 75.707 J / g であったと特定している。

【0105】

結晶多形形態 A のラマンスペクトルを、図 6 に示す。

20

【0106】

N - [4 - クロロ - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] - N - エチル - 3 - (メチルスルホニル) プロパンアミド (無溶媒及び無水) 多形形態 B の独特な物理的形態は、本明細書で説明されている方法に従って調製されている。多形形態 B の粉末 X 線回折 (PXRD) パターンを図 3 に示しており、対応する表形式データを表 3 に示す。

【0107】

30

40

50

【表 3】

表 3

2 シータ(度)	d 間隔(Å)	相対ピーク高さ	定性的強度
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

【 0 1 0 8 】

10

20

30

40

50

【表 4】

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

10

20

* S = 強 (>50% 相対強度), M = 中 (20-50% 相対強度), W = 弱
(<20% 相対強度)

30

【0109】

いくつかの実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 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 、及び 39.9 ± 0.2 の回折角(2 θ)での1つ又は複数のピークを含む粉末X線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物1の結晶多形形態Bは、 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

40

50

± 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 、及び 39.9 ± 0.1 の回折角 (2θ) での 1 つ又は複数のピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する。いくつかの実施形態では、化合物 1 の結晶多形形態 B は、上記実施形態で示されている回折角 (2θ) での 2 つ以上のピークの組み合わせを含む粉末 X 線回折パターンを有する。表 3 で示されている回折角 (2θ) は、上記で示されており且つ本開示でも言及されている値の実験誤差内であることが理解されるだろう。

10

【0110】

結晶多形形態 A の DSC サーモグラムを、図 5 に示す。実施例 10 で説明されている DSC 法の最中に、多形形態 A は、図 5 で示すように、約 105.24°C で融解し、融解熱 $= 92.879 \text{ J/g}$ であったと特定している。

【0111】

結晶多形形態 A のラマンスペクトルを、図 7 に示す。

【0112】

組み合わせ

いくつかの実施形態では、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つを、1 種又は複数種の有効成分と組み合わせて（例えば、組成的な混合物で、又は同時若しくは順次適用で）使用し得る。

20

【0113】

いくつかの実施形態では、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数の殺虫作用様式 (M o A) と同一であり、類似しているが異なる可能性が高い M o A をそれぞれ有する 1 種又は複数種の有効成分と組み合わせて（例えば、組成的な混合物で、又は同時若しくは順次適用で）使用し得る。いくつかの実施形態では、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種を、殺ダニ性、殺藻性、殺菌性、防カビ性、除草性、殺虫性、軟体動物駆除性、殺線虫性、殺鼠性、及び／又は殺ウイルス性を有する 1 種又は複数種の分子と組み合わせて（例えば、組成的な混合物で、又は同時若しくは順次適用で）使用し得る。

30

【0114】

いくつかの実施形態では、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種、摂食阻害剤、鳥忌避剤、不妊化剤、除草剤解毒剤、昆虫誘引剤、防虫剤、哺乳類忌避剤、交配破壊剤、植物活性化剤、植物成長調節剤、及び／又は相乗剤である 1 種又は複数種の分子と組み合わせて（例えば、組成的な混合物で、又は同時若しくは順次適用で）使用し得る。

【0115】

いくつかの実施形態では、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種をまた、1 種又は複数種のバイオ農薬とも組み合わせて（例えば、組成的な混合物で、又は同時若しくは順次適用で）使用し得る。

40

【0116】

いくつかの実施形態では、殺生物組成物において、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種と、有効成分との組み合わせを、多様な重量比で使用し得る。例えば、二成分混合物において、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種と、有効成分との重量比を、様々な比で使用し得る。しかしながら、一般的には、約 10 : 1 ~ 約 1 : 10 未満の重量比が好ましい。化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数種と、追加の 2 種以上の有効成分とを含む 3、4、5、6、7 種、又はそれを超える成分混合物を使用することが好ましいこともある。

【0117】

50

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数と、有効成分との重量比をまた、 $X:Y$ としても表し得、ここで、 X は、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数の重量部であり、 Y は、有効成分の重量部である。 X の重量部の数値範囲は、 $0 < X \leq 100$ であり、 Y の重量部は、 $0 < Y < 100$ である。非限定的な例を挙げれば、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数と、有効成分との重量比は、 $20:1$ であり得る。

【0118】

製剤

農薬は、多くの場合、その純粋な形態で施用するのに適していない。通常、他の物質を添加する必要がある、それにより、農薬は、必要とされる濃度及び適切な形態で使用する10
ことが可能となり、施用、取扱い、輸送、貯蔵、及び最大の農薬活性が容易となる。したがって、農薬は、例えば、バイト剤、濃縮乳濁液、ダスト、乳剤、燻蒸剤、ゲル剤、顆粒剤、マイクロカプセル化剤、種子処理剤、懸濁液濃縮物、サスポエマルジョン剤、錠剤、水溶性液体、水分散性顆粒剤、又はドライフロワブル剤、水和剤、及び極少量溶液に配合される。

【0119】

農薬は、そのような農薬の濃縮製剤から調製された水性懸濁液又は乳濁液として施用されることが最も多い。そのような水溶性、水懸濁性、又は乳化性製剤は、水和剤として一般に知られている固体、水分散性顆粒剤、一般に乳剤として知られている液体、又は水性懸濁液である。水和剤は、圧縮されて水分散性顆粒剤を形成し得、農薬、担体、及び界面20
活性剤の均質な混合物を含む。農薬の濃度は、通常、約 10 重量%～約 90 重量%である。担体は、通常、アタパルジャイトクレー、モンモリロナイトクレー、珪藻土、又は精製シリケートから選択される。水和剤の約 0.5 %～約 10 %を占める有効界面活性剤は、スルホン化リグニン、縮合ナフタレンスルホネート、ナフタレンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、アルキル硫酸塩、及び非イオン性界面活性剤、例えば、アルキルフェノールのエチレンオキシド付加物の中から見出される。

【0120】

農薬の乳剤は、水混和性溶媒であるか又は水非混和性有機溶媒と乳化剤との混合物である担体中に溶解した、例えば約 50～約 500 グラム／リットル (g/L) の液体の使用しやす30
い濃度の農薬を含む。有用な有機溶媒として、芳香族、特にキシレン及び石油留分、特に重質芳香族ナフサ等の石油の高沸点ナフタレン及びオレフィン部分が挙げられる。ロジン誘導体等のテルペン系溶媒、シクロヘキサノン等の脂肪族ケトン、及び 2-エトキシエタノール等の複合アルコール等の他の有機溶媒も使用し得る。乳剤に好適な乳化剤は、従来のアニオン性界面活性剤及び非イオン性界面活性剤から選択される。

【0121】

水性懸濁液は、約 5 重量%～約 50 重量%の範囲の濃度で水性担体中に分散された水不溶性農薬の懸濁液を含む。懸濁液は、農薬を微細に摩砕し、それを水及び界面活性剤からなる担体中に激しく混合することにより調製される。また、無機塩及び合成又は天然のゴム等の成分を添加して、水性担体の密度及び粘度を増加させ得る。多くの場合、水性混合物を調製し、それをサンドミル、ボールミル、又はピストン型ホモジナイザー等の器具中40
で均質化することにより、農薬の粉碎及び混合を同時に行うことが最も効果的である。懸濁液中の農薬を、プラスチックポリマー中にマイクロカプセル化させ得る。

【0122】

油分散液 (OD) は、有機溶媒と乳化剤との混合物中に約 2 重量%～約 50 重量%の範囲の濃度で微細に分散された有機溶媒不溶性の農薬の懸濁液を含む。1 種又は複数種の農薬を有機溶媒に溶解させてもよい。有用な有機溶媒として、芳香族、特にキシレン及び石油留分、特に重質芳香族ナフサなどの石油の高沸点ナフタレン及びオレフィン部分が挙げられる。他の溶媒として、植物油、種子油、並びに植物油及び種子油のエステルが挙げられ得る。油分散液に好適な乳化剤は、従来のアニオン性界面活性剤及び非イオン性界面活性剤から選択される。増粘剤又はゲル化剤を油分散液の配合物中に添加して、液体のレオ50

ロジー又は流動性を変化させ、且つ分散させた粒子又は液滴の分離及び沈降を防止する。

【0123】

農薬をまた、顆粒状組成物としても施用し得るが、これは、土壤に施用するのに特に有用である。顆粒状組成物は、通常、クレー又は類似の物質を含む担体中に分散させた約0.5重量%～約10重量%の農薬を含む。そのような組成物は、通常、農薬を好適な溶媒中に溶解させ、それを、約0.5mm～約3mmの範囲の、適切な粒径に予め成形された顆粒状担体に塗布することにより調製される。そのような組成物をまた、担体及び分子の生地又はペーストを作製し、次いで、それを粉碎して乾燥させて所望の顆粒粒径を得ることによって、製剤化し得る。顆粒剤の別の形態は、水乳化性顆粒剤（EG）である。それは、水中で崩壊し溶出させた後、有機溶媒に溶解させるか又は希釈させた、従来の有効成分の水中油型乳濁液として施用される、顆粒からなる製剤である。水乳化性顆粒剤は、水溶性のポリマーのシェル又はいくつかの他のタイプの可溶性若しくは不溶性のマトリックス中に吸収された、好適な有機溶媒中に可溶化されたか又は希釈された1種又は数種の有効成分を含む。

10

【0124】

農薬を含むダストは、粉末形態の農薬を適切な粉末状の農業用担体（例えば、カオリンクレー、及び摩砕した火山岩等）と均質に混合することにより調製される。ダストは、好適には、約1%～約10%の農薬を含み得る。ダストを、種子粉衣として施用し得るか、又はダスト送風機を用いた茎葉散布として施用し得る。

【0125】

農薬を、農業化学において広く使用されている適切な有機溶媒、通常石油を用いて、例えばスプレーオイル等の溶液の形態で施用することも同様に実用的である。

20

【0126】

農薬をまた、エアロゾル組成物の形態でも施用し得る。そのような組成物では、農薬は、圧力発生噴霧剤混合物である担体中に溶解しているか、又は分散されている。エアロゾル組成物は、コンテナにパッケージングされ、それから噴霧弁を介してこの混合物が散布される。

【0127】

農薬ベイト剤は、農薬が食物若しくは誘引剤又はそれらの両方と混合される際に形成される。有害生物がベイト剤を食べると、農薬も摂取することになる。ベイト剤は、顆粒、ゲル、フロアブル粉末、液体、又は固体の形態をとり得る。ベイト剤を、有害生物の潜伏場所で使用し得る。

30

【0128】

燻蒸剤は、比較的高い蒸気圧を有し、従って土壤又は密閉空間において有害生物を死滅させるのに十分な濃度のガスとして存在し得る農薬である。燻蒸剤の毒性は、その濃度及び曝露時間に比例する。それらは、優れた拡散能力を特徴とし、有害生物の呼吸器系への浸透又は有害生物の表皮を介した吸収により作用する。燻蒸剤は、気密室若しくは気密建物で、又は特別なチャンバ内で、気体を通さないシートの下、貯蔵製品の有害生物を防除するために施用される。

【0129】

農薬を、農薬の粒子又は液滴を各種のプラスチックポリマー内に懸濁させることによりマイクロカプセル化させ得る。ポリマーの化学的性質を変えることにより、又は加工における因子を変化させることにより、各種のサイズ、溶解度、壁厚及び浸透度のマイクロカプセルを形成し得る。これらの因子は、その中の有効成分が放出される速度を制御し、ひいては、生成物の残留性能、作用速度、及び臭気に影響を及ぼす。マイクロカプセルは、懸濁液濃縮物又は水分散性顆粒剤として製剤化されてもよい。

40

【0130】

油剤濃縮物は、溶液中に農薬を保持する溶媒に農薬を溶解させることにより作られており、農薬の油溶液は、通常、溶媒自体が殺生物作用を有すること、及び外皮のワックス状被覆を溶解することで農薬の取り込み速度を増加させることから、他の製剤と比べて迅速

50

に有害生物をノックダウンさせて死滅させる。油剤の他の利点としては、より良好な貯蔵安定性、隙間へのより良好な浸透、及び脂っぽい表面に対するより良好な付着性が挙げられる。

【0131】

別の実施形態は、水中油型エマルションであり、このエマルションは、各々が層状液晶被膜を有しており且つ水相に分散されている油性小滴を含み、各油性小滴は、農業的に活性な少なくとも1種の分子を含み、且つ下記を含む単層又はオリゴ層（*oligo-lamellar*）で個々にコーティングされている：（1）少なくとも1種の非イオン性親油性界面活性剤、（2）少なくとも1種の非イオン性親水性界面活性剤、及び（3）小滴が800ナノメートル未満の平均粒径を有する少なくとも1種のイオン性界面活性剤。

10

【0132】

他の製剤成分

一般に、化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数を製剤で使用する場合には、そのような製剤は、他の成分も含み得る。こうした成分として、湿潤剤、展着剤、粘着剤、浸透剤、緩衝剤、金属イオン封鎖剤、ドリフト低減剤、相溶剤、消泡剤、洗浄剤、及び乳化剤が挙げられるが、これらに限定されない（これは、非包括的であり、相互に排他的ではないリストである）。いくつかの成分を、下記で説明する。

【0133】

湿潤剤は、液体に添加されると、液体と、それが拡散する表面との間の界面張力を低減させることにより、その液体の拡散力又は浸透力を増加させる物質である。湿潤剤は、農業製剤において以下の下記の2つの主要な機能のために使用される：可溶性液体の濃縮物又は懸濁液濃縮物を作製するために、加工中及び製造中に粉末を水に湿潤させる速度を増加させること、並びにスプレータンク内で生成物を水と混合する際に水和剤の湿潤時間を低減し、水の水分散性顆粒剤への浸透を向上させること。水和剤、懸濁液濃縮物、及び水分散性顆粒剤に使用される湿潤剤の例は、ラウリル硫酸ナトリウム、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、アルキルフェノールエトキシレート、及び脂肪族アルコールエトキシレートである。

20

【0134】

分散剤は、粒子の表面に吸着し、粒子の分散状態を保持するのを助け、且つ粒子が再凝集するのを阻止する物質である。分散剤は、製造中の分散及び懸濁を促進し、且つ噴霧タンク内で粒子を確実に水中に再分散させるために、農業製剤に添加される。分散剤は、水和剤、懸濁濃縮物、及び水分散性顆粒剤に広く使用されている。分散剤として使用される界面活性剤は、粒子表面に強く吸着する能力を有し、粒子の再凝集に対する電荷障壁又は立体障壁を提供する。最も一般的に使用される界面活性剤は、アニオン性、非イオン性、又はこれら2種の混合物である。水和剤製剤で、最も一般的な分散剤は、ナトリウムリグノスルホネートである。懸濁液濃縮物では、多価電解質（例えば、ナトリウムナフタレンスルホン酸ホルムアルデヒド縮合物）を使用することにより、極めて良好な吸着及び安定化が得られる。トリスチリルフェノールエトキシレートホスフェートエステルも使用される。非イオン性物質（例えば、アルキルアリアルエチレンオキシド縮合物、及びEOPブロックコポリマー）が、懸濁液濃縮物の分散剤としてアニオン性物質と組み合わせられる場合もある。近年、分散剤として、新しい種類の非常に高分子量のポリマー界面活性剤が開発されている。これらは、極めて長い疎水性の「主鎖」と、「」状の界面活性剤の「歯」を形成する多数のエチレンオキシド鎖とを有する。これらの高分子量ポリマーは、疎水性の主鎖が粒子表面上に多くの固定点を有するため、懸濁濃縮物に非常に良好な長期安定性を与え得る。

30

40

【0135】

農業製剤に使用される分散剤の例は、リグノスルホン酸ナトリウム、ナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物、トリスチリルフェノールエトキシレートホスフェートエステル、脂肪族アルコールエトキシレート、アルキルエトキシレート、EOPブロックコポリマー、及びグラフトコポリマーである。

50

【0136】

乳化剤は、ある液相の液滴の懸濁を別の液相において安定化させる物質である。乳化剤がなければ、それらの2つの液体が2つの非混和性の液相に分離することになるであろう。最も一般的に使用される乳化剤ブレンド物は、12以上のエチレンオキシド単位を有するアルキルフェノール又は脂肪族アルコールと、油溶性のドデシルベンゼンスルホン酸のカルシウム塩とを含む。親水性－親油性バランス（「HLB」）値が約8～約18の範囲であれば、通常、良好な安定乳濁液が得られるであろう。エマルジョン安定性は、ときに、少量のEO-Pブロックコポリマー界面活性剤を添加することによって改善されることがある。

【0137】

可溶化剤は、臨界ミセル濃度を超える濃度において水中でミセルを形成する界面活性剤である。続いて、ミセルが、ミセルの疎水性部分の内側で水不溶性物質を溶解し得るか、又は可溶化し得る。可溶化のために通常使用される界面活性剤のタイプは、非イオン性物質、ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノオレエートエトキシレート、及びメチルオレエートエステルである。

【0138】

界面活性剤は、ときに、単独で又は標的に対する農薬の生物学的性能を改善するためにスプレータンク混合物に補助剤として添加される鉱物油若しくは植物油等の他の添加剤と共に使用される。バイオエンハンスメントのために使用される界面活性剤のタイプは、一般的に、農薬の性質及び作用機構に依存する。しかしながら、それらは、多くの場合、アルキルエトキシレート、直鎖状脂肪族アルコールエトキシレート、及び脂肪族アミンエトキシレート等の非イオン性物質である。

【0139】

農業用製剤中の担体又は希釈剤は、必要とされる強度を有する製品を得るために農薬に添加される物質である。担体は、通常、高い吸収能力を有する物質であるのに対し、希釈剤は、通常、低い吸収能力を有する物質である。

【0140】

担体及び希釈剤は、ダスト、水和剤、顆粒、及び水分散性顆粒剤製剤に使用される。

【0141】

有機溶媒は、主に、乳剤、水中油型乳濁液、サスポエマルジョン剤、油分散液及び極少量配合物の製剤、並びに頻度は低いが顆粒製剤に使用される。溶媒の混合物が使用されることもある。溶媒の第1の主な群は、ケロシン又は精製パラフィン等の脂肪族パラフィン系油である。第2の主な群（及び最も一般的なもの）は、キシレン等の芳香族溶媒並びにC₉及びC₁₀芳香族溶媒のより高い分子量画分を含む。塩素化炭化水素類は、製剤を水に乳化する場合、農薬の結晶化を阻止するための共溶媒として有用である。アルコールが、溶媒力を増加させるための共溶媒として使用されることもある。他の溶媒として、植物油、種子油、並びに植物油及び種子油のエステルが挙げられ得る。

【0142】

増粘剤又はゲル化剤は、液体のレオロジー、即ち流動性を変化させ、且つ分散させた粒子又は液滴の分離及び沈降を防止するために、主に懸濁液濃縮物、油分散液、乳濁液、及びサスポエマルジョン剤の製剤で使用される。増粘剤、ゲル化剤、及び沈降防止剤は、一般に、2つのカテゴリー、即ち水不溶性微粒子及び水溶性ポリマーに分類される。クレー及びシリカを使用して懸濁液濃縮物及び油分散液の製剤を作製することが可能である。これらの種類の物質の例として、モンモリロナイト、ベントナイト、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、及びアタパルジャイトが挙げられるが、これらに限定されない。水性懸濁液濃縮液中の水溶性多糖は、長年にわたり増粘ゲル化剤として使用されており、最も一般的に使用されている多糖の種類は、種子及び海藻の天然抽出物、又はセルロースの合成誘導体である。これらの種類の物質の例として、グアーガム、ローカストビーンガム、カラギーナン、アルギン酸塩、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム（SCMC）、及びヒドロキシエチルセルロース（HEC）が挙げられるが、これらに限定され

10

20

30

40

50

ない。他の種類の沈降防止剤は、加工デンプン、ポリアクリレート、ポリビニルアルコール、及びポリエチレンオキシドをベースにしたものである。別の良好な沈降防止剤は、キサンタンガムである。

【0143】

微生物は、製剤化した製品の腐敗を引き起こす可能性がある。従って、それらの影響を排除するか又は低減させる目的で保存剤が使用される。そのような薬剤の例として、プロピオン酸及びそのナトリウム塩、ソルビン酸及びそのナトリウム塩又はカリウム塩、安息香酸及びそのナトリウム塩、p-ヒドロキシ安息香酸ナトリウム塩、p-ヒドロキシ安息香酸メチル、並びに1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン（BIT）が挙げられるが、これらに限定されない。

10

【0144】

界面活性剤の存在は、製造時及び噴霧タンクを介した適用時の混合作業中に水系製剤の発泡をしばしば引き起こす。発泡性向を低減するために、製造段階中又はボトルに充填する前に消泡剤が添加されることが多い。一般に、2種類の消泡剤、即ちシリコン及び非シリコン消泡剤がある。シリコンは、通常、ジメチルポリシロキサンの水性エマルションであり、非シリコン消泡剤は、オクタノール及びノナノール等の水不溶性油、又はシリカである。いずれの場合も、消泡剤の機能は、空気-水界面から界面活性剤を移動させることである。

【0145】

「環境に優しい」薬剤（例えば、補助剤、界面活性剤、溶媒）は、作物保護製剤の総環境フットプリントを低減し得る。環境に優しい薬剤は、生分解性であり、一般的に天然資源及び／又は持続可能な資源由来であり、例えば植物及び動物資源由来である。具体的な例は、植物油、種子油、及びこれらのエステルである。

20

【0146】

施用

化合物1の多形形態A及びBのいずれか1つ又は複数を、任意の領域に施用し得る。そのような分子を施用する特定の領域として、アルファルファ、アーモンド、リンゴ、オオムギ、マメ、カノーラ、トウモロコシ、ワタ、カリフラワ（c r u c i f e r）、花、飼料種（ライグラス、スーダングラス、ヒロハノウシノケグサ、ナガハグサ、及びクローバー）、果実、レタス、カラスムギ、油糧種子作物、オレンジ、ピーナッツ、セイヨウナシ、コショウ、ジャガイモ、イネ、ソルガム、ダイズ、イチゴ、サトウキビ、テンサイ、ヒマワリ、タバコ、トマト、コムギ（例えば、ハードレッドウィンター小麦、ソフトレッドウィンター小麦、ホワイットウィンター小麦、ハードレッドスプリング小麦、及びデュラムスプリング小麦）、並びに他の有価作物が育てられているか又はその種子が植えられる予定の領域が挙げられる。

30

【0147】

化合物1の多形形態A及びBのいずれか1つ又は複数を、作物等の植物が育てられており、且つこうした植物に商業上損害を与える可能性がある有害生物が低水準（実在しない場合も含む）である領域にも施用し得る。そのような領域にそのような分子を施用することにより、そのような領域内で栽培されている植物がメリットを受ける。そのようなメリットとして、下記が挙げられるが、これらに限定されない：植物の良好な根系発達の補助、植物の高負荷生育条件に対する良好な耐性の補助、植物の健康の向上、植物の収率の向上（例えば、バイオマスの増加及び／又は有効成分の含有量の増加）、植物の活力の向上（例えば、植物の成長の向上及び／又はより青々とした葉）、植物の質の向上（例えば、ある特定の成分の含有量又は組成の増大）、並びに植物の非生物ストレス及び／又は生物ストレスに対する耐性の向上。

40

【0148】

化合物1の多形体形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数を、様々な植物を成長させる際に硫酸アンモニウムと共に施用し得、これにより、さなる利益を得ることができる。

【0149】

50

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、固有の形質を発現させるために遺伝子改変されている植物上に、この植物内に、又はこの植物の周囲に施用し得るが、そのような固有の形質は、例えば、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) (例えば、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1)、他の殺虫性毒素であるか、又は除草剤耐性を発現するもの若しくは殺虫性毒素、除草剤耐性、栄養増強、若しくは任意の他の有益な形質を発現する「スタックド」外来遺伝子を有するもの等である。

【0150】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、植物の葉部分及び／又は果実部分に施用して、有害生物を防除し得る。そのような化合物 1 の多形は、有害生物と直接接触することになるか、或いは有害生物が植物を食した際又は植物から樹液若しくは他の栄養分を吸い上げる間に、そのような化合物 1 の多形を摂取することになる。

【0151】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数をまた、土壌にも施用し得、このように施用した場合には、根及び茎を食する有害生物を防除し得る。根がそのような分子を吸収して植物の葉部まで運ぶことにより、地上の咀嚼有害生物及び樹液を餌とする有害生物を防除し得る。

【0152】

植物における農薬の全身性移動を利用して、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を植物のある部分に施用することにより (例えば、ある領域に噴霧することにより)、この植物の別の部分で有害生物を防除し得る。例えば、葉を餌とする昆虫の防除を、細流灌漑若しくは畝間散布により達成し得るか、又は土壌を例えば植え付け前若しくは植え付け後の土壌灌注で処理することにより達成し得るか、又は植え付け前に植物の種子を処理することにより達成し得る。

【0153】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、ベイト剤と共に使用し得る。一般的に、ベイト剤に関して、ベイト剤は、例えば、シロアリがベイト剤と接触し得、且つ／又はベイト剤に誘引され得る地中に置かれる。ベイト剤を、例えば、アリ、シロアリ、ゴキブリ、及びハエがベイト剤と接触し得、且つ／又はベイト剤に誘引され得る建物の表面 (水平面、垂直面、又は斜平面) にも施用し得る。

【0154】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、カプセル剤内に封入してもよいし、カプセル剤の表面上に配置してもよい。カプセル剤のサイズは、ナノメートルサイズ (直径約 100 ~ 900 ナノメートル) ~ マイクロメートルサイズ (直径約 10 ~ 900 ミクロン) の範囲であり得る。

【0155】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、有害生物の卵に施用し得る。いくつかの有害生物の卵は、ある特定の農薬に抵抗する特有の能力があることから、そのような分子を繰り返し施用して、新しく発生する幼虫を防除することが望ましい場合がある。

【0156】

化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数を、種子処理剤として施用し得る。種子処理剤を、固有の形質を発現するように遺伝子改変された植物が発芽する種子を含む全ての種類の種子に施用し得る。代表的な例として、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 又は他の殺虫性毒素等の無脊椎有害生物に対する毒性を有するタンパク質を発現するもの、「ラウンドアップ・レディ」種子等の除草剤耐性を発現するもの、又は殺虫性毒性、除草剤耐性、栄養増強、乾燥耐性、若しくは任意の他の有益な形質を発現する「スタックド」外来遺伝子を有するものが挙げられる。さらに、化合物 1 の多形形態 A 及び B の内のいずれか 1 つ又は複数によるそのよ

10

20

30

40

50

うな種子処理により、高負荷の生育条件によく耐える植物の能力がさらに増強され得る。その結果、より健康でより活力のある植物がもたらされ、これは、収穫時のより高い収率につながる可能性がある。一般的に、種子100,000個当たりそのような多形 約1グラム～約500グラムの量で優れたメリットが得られることが予測され、種子100,000個当たり約10グラム～約100グラムの量でより優れたメリットが得られることが予測され、種子100,000個当たり約25グラム～約75グラムの量でさらに優れたメリットが得られることが予測される。化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数を、土壌改良において、1種又は複数種の有効成分と共に施用し得る。

【0157】

化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数を、獣医学部門又は非ヒト動物飼育の分野において、内部寄生虫及び外部寄生虫を防除するために使用し得る。そのような分子を、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク剤、及び顆粒剤の形態の経口投与により施用し得、例えば、浸漬、噴霧、注入、スポットオン、及び散粉の形態の皮膚適用により施用し得、且つ例えば注射の形態の非経口投与により施用し得る。

10

【0158】

化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数をまた、家畜飼育、例えば、ウシ、ニワトリ、ガチョウ、ヤギ、ブタ、ヒツジ、及びシチメンチョウでも有利に利用し得る。これらをまた、ウマ、イヌ、及びネコ等のペットでも有利に利用し得る。防除すべき特定の有害生物は、そのような動物にとって厄介なハエ、ノミ、及びマダニとなるであろう。好適な製剤を、飲用水又は飼料と共に動物へ経口投与する。好適な用量及び製剤は、種によって異なる。

20

【0159】

化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数をまた、上に列挙した動物における寄生虫（特に腸の寄生虫）を防除するためにも使用し得る。化合物1の多形形態A及びBの内のいずれか1つ又は複数をまた、非ヒトヘルスケアのための治療方法でも利用し得、そのような方法として、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク剤、及び顆粒剤の形態での経口投与、並びに経皮適用が挙げられるが、これらに限定されない。

【0160】

化合物1の多形形態A及びBをまた、侵入性有害生物にも施用し得る。世界各地の有害生物が、（こうした有害生物にとって）新規の環境に移動しており、移動後、こうした新規の環境において新規の侵入種となる。また、そのような多形をこうした新規の侵入種に使用して、このような新規の環境における侵入種を防除し得る。

30

【実施例】

【0161】

本開示の実施形態の特定の態様を、さらに、下記で提供される実施例及び調製物で説明しており、且つ例示している。本開示の範囲は下記の実施例の範囲により決して限定されないことを理解されたい。

【0162】

実施例1

N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(化合物1)の合成、及び形態Aとしての単離

40

COCC(=O)NHBoc $\xrightarrow{70\% \text{ EtNH}_2(\text{水性})(3\text{当量})}$ $\left[\text{S1} \right]$ $\xrightarrow[\text{ジオキサン, RT, 30分}]{\text{ジオキサン中の4M HCl}}$ CCCNC(=O)N HCl **S2**

CCCNC(=O)N HCl **S2** $\xrightarrow[\text{Et}_3\text{N, S, MeCN, 70 }^\circ\text{C; POCl}_3, 70\text{ }^\circ\text{C}]{\text{4-ピリジンカルボアルデヒド}}$ CCCNC(=Nc1cccnc1)S HCl **S3**

S3 $\xrightarrow[\text{NCS(1当量), H}_2\text{O}]{\text{K}_2\text{CO}_3(\text{水性})}$ CCCNC(=Nc1cccnc1)SC1=CC=C(Cl)=C1 HCl **S4**

CC(C)S(=O)(=O)CC(=O)O **S5** $\xrightarrow[75^\circ\text{C, 1時間}]{\text{SOCl}_2(1.5\text{eq}), \text{トルエン}}$ $\left[\text{S6} \right]$

$\left[\text{S6} \right]$ $\xrightarrow{\text{MeCN, RT}}$ CCCNC(=O)CC(C)S(=O)(=O)C **化合物1**

S4 $\xrightarrow{\text{化合物1}}$ **化合物1**

1 L の丸底に、水中の 70 % エチルアミン (347 mL、4360 mmol、3 当量) を入れ、メチル (tert-ブトキシカルボニル) グリシネート (255 mL、1453 mmol) を少量ずつ添加して、温度を 35 °C 未満で維持した。この反応物を室温で攪拌し、CDCl₃ を使用して NMR によりモニタリングした。過剰なエチルアミン及び水を、常圧蒸留により除去した。この混合物を冷却し、シクロペンチルメチルエーテル (CPME) (400 mL) を添加した。常圧蒸留を継続して、残留水を共沸除去した (azeotrope out) (ポット温度: 115 °C、オーバーヘッド温度: 95 °C)。CPME 約 260 mL を、オーバーヘッドで蒸留した。この混合物を室温まで冷却し、CPME (140 mL) を底に添加した。この溶液を、さらに操作することなく次の工程で使用した。¹H NMR (400 MHz, Chloroform-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)。

工程 2 : 2 - アミノ - N - エチルアセトアミド塩酸塩 (S 2) の調製

5 L のジャケット付き反応器に、イソプロパノール中の 6 N HCl (1055 mL、6.3 mol、4 当量) 及び CPME (1055 mL) を入れ、ジャケットを 30℃ に設定した。先の反応からの CPME 中の溶液としての tert-ブチル (2-エチルアミノ) -2-オキソエチル) カルバメート (推定 320 g、1582 mmol) を、30 分かけて、蠕動ポンプにより添加した。この反応物を、6 時間にわたり 30℃ で攪拌し、一晚攪拌しつつ 25℃ まで冷却した。この反応を、DMSO で NMR によりモニタリングした。この反応により、非常に粘性が高いスラリーが形成された。このスラリーを、CPME (650 mL) で希釈し、粗いガラスフリットに通したろ別により固体を単離して、CPME (300 mL) で洗浄した。次いで、湿ったケーキを、1 ケーキ体積のヘキサンで洗浄して CPME を除去して乾燥させた。この物質を、45℃ にて真空オーブン中で乾燥さ

せて、2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸塩 (S2) (184.11 g、1315 mmol、83%収率) を、ふわふわした白色固形物として得た。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 3.49 (s, 2H), 3.14 (qd, J=7.3, 5.4 Hz, 2H), 1.05 (t, J=7.3 Hz, 3H)。

【0164】

工程3: N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (S3) の調製

還流冷却器及び熱電対を備えた125 mLの三口平底フラスコに、2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸塩 (4.99 g、36.0 mmol、1.25当量)、無水アセトニトリル (48 mL) を入れて、白色スラリーを得た。この反応器を、窒素で不活性化した。無水トリエチルアミン (99%、5.60 mL、39.7 mmol、1.38当量) を添加し、この混合物を1時間にわたり攪拌して、粘性が高い白色スラリーを得た。ニコチンアルデヒド (98%、2.70 mL、28.8 mmol、1.0当量) を添加して、より粘性が低いスラリーを得た。硫黄固体粉末 (1.20 g、37.4 mmol、1.30当量) を添加した。この混合物を79℃で攪拌し、徐々に暗い赤橙色溶液となった。この反応を、ニコチンアルデヒドの消失に関してHPLCでモニタリングし、この消失には約5時間かかり、次いで50℃まで冷却した。ポット温度を60℃未満で維持しつつ、この反応混合物に、オキシ塩化リン (POCl₃、99%、6.70 mL、77.8 mmol、2.50当量) を滴下した。暗褐色の粘性が低いスラリー／油状物を、7時間にわたり50℃で攪拌し、その間に黄色スラリーが形成された (HPLCによるモニタリング)。橙黄色スラリーを15℃まで冷却し、トルエン (20 mL) を添加した。この混合物をろ別し、トルエンで洗浄した (3回×10 mL)。湿った黄色ケーキを、16時間にわたり40℃にて真空下で乾燥させて、N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (S3) を黄色固形物 (5.14 g) として得、¹H NMR アッセイにより測定した場合の純度は92重量%であり、このことから、これら2つの工程にわたる収率が57.8%であることが示された。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) 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。ESI-MS m/z 206 [(M+H-2HCl)+]。

【0165】

工程4: 工程4: 4-クロロ-N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (S4) の調製

1 Lの丸底フラスコに、N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (30 g、108 mmol) 及び水 (360 mL) を入れ、得られたオレンジ色／赤色溶液を、氷浴で約5℃まで冷却した。温度を7℃未満に維持しつつ、N-クロロスクシンイミド (14.4 g、108 mmol、1当量) を少量ずつ添加した。得られた褐色溶液を、40分にわたり5℃で攪拌し、HPLCでモニタリングした。この反応物を、20%炭酸カリウム溶液に注ぎ、ゴム状の赤色固形物が形成され、この生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を10%のチオ硫酸ナトリウムで洗浄し、続いて20%の炭酸カリウムで洗浄した。有機層を、硫酸ナトリウムで脱水し、ろ過し、濃縮して、4-クロロ-N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン (S4) (27 g、104%) を赤色油状物として得、これを、さらに精製することなく工程6へと持ち越した。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 (dd

d, 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).

【0166】

工程5：3-（メチルスルホニル）プロパノイルクロリド（S6）の調製

窒素導入口、還流冷却器、1N NaOHベーススクラバーへの通気管、及び攪拌子を備えた500mLの三ツ口丸底フラスコに、3-（メチルスルホニル）プロパン酸（50g、329mmol）及びトルエン（299mL）を投入して、不均一溶液を得た。これに、塩化チオニル（1.5当量）を添加し、この溶液を、70～75℃の内部温度まで加熱した。この反応物を、NMRでモニタリングしつつ、この温度で攪拌した。この反応物を室温まで冷却し、その時点で、顕著な固形物形成を観察した。このスラリーに、ヘプタン 250mLを添加し、この混合物を、10分にわたり攪拌した。この固形物を、ろ別により単離し、ヘプタンで洗浄した（90%収率）。¹H NMR（500MHz, CDCl₃）δ 3.51 – 3.46 (m, 2H), 3.43 – 3.38 (m, 2H), 3.00 (s, 1H); ¹³C NMR（126MHz, CDCl₃）δ 171.8, 49.5, 41.6, 39.3.

10

【0167】

工程6：形態AとしてのN-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミド（化合物1）の調製

粗4-クロロ-N-エチル-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-アミン（27g）が入ったLの丸底フラスコに、アセトニトリル（300mL）を入れて、赤色溶液を得た。3-（メチルスルホニル）プロパノイルクロリド（27.6g、162mmol、1.5当量）を、5分かけて少量ずつ添加し、98%超の変換率が達成されるまで、この反応をHPLCでモニタリングした。この反応の経過中に、生成物のHCl塩が、黄色／褐色の固形物として形成された。この固形物を、ろ別により単離し、次いで20%の炭酸カリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を、硫酸ナトリウムで脱水し、ろ過し、濃縮して、粗油状物 52.3gを得た。この粗物質を、イソプロパノール-ヘプタンから結晶化させて、化合物1（35.2g、80%）を結晶性固形物として得た。¹H NMR（300MHz, Chloroform-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（75MHz, 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; HRMS-ESI (m/z) [M+H]⁺ C₁₄H₁₆ClN₃O₃S₂の計算値 373.0322; 実測値 374.0397。この結晶性固形物を、図1に示すように、実施例8に従ってPXRDで分析し、形態Aという名称を割り当てた。

20

30

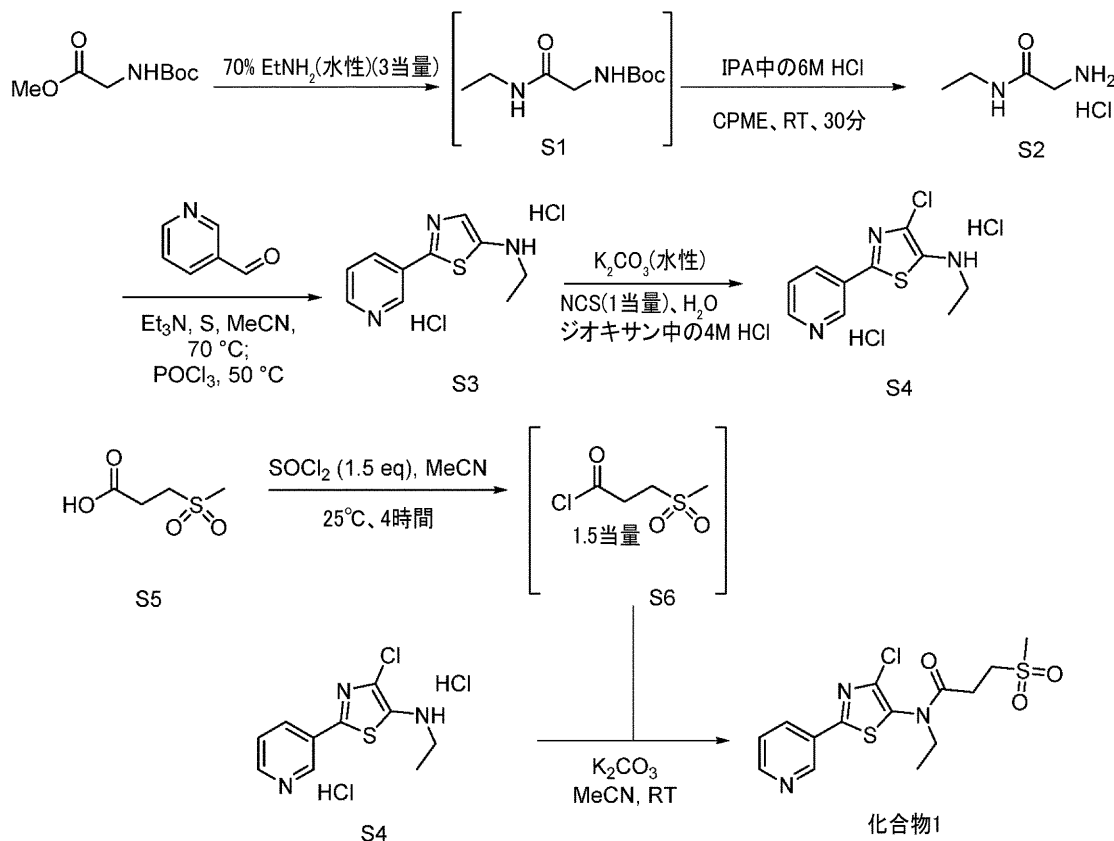
【0168】

実施例2

N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミド（化合物1）の合成、及び形態Aとしての再結晶化

40

【化 6】



10

20

工程 1：tert-ブチル（2-（エチルアミノ）-2-オキソエチル）カルバメート（S1）の調製

温度ロガー、機械式攪拌機、低流量／高流量窒素セットアップを備えた3 Lのジャケット付き反応器に、エチルアミン水溶液（70％）（599 mL、7.53 mol）を入れた。この反応槽を、23 °C（内部温度＝22 °C）に設定した。35 °C未満の内部温度を維持しつつ、この攪拌溶液に、蠕動ポンプを使用して、メチル（tert-ブトキシカルボニル）グリシネート（500 g、2510 mmol）を緩やかに添加した。この反応物を、一晩23 °C（内部温度）で攪拌した。工程内管理（¹H NMR）により、出発物質の生成物tert-ブチル（2-（エチルアミノ）-2-オキソエチル）カルバメート（S1）への完全な変換が示された。この反応器を、短経路の蒸留ヘッドと共にセットアップし、反応槽を127 °C（内部温度 約115 °C、蒸留ヘッド温度は、70～85 °Cを変動した）まで加熱した。受器フラスコを、氷浴中で冷却し、エチルアミン／水／MeOH 約240 mLを除去した。この反応物を、内部温度60 °Cまで冷却し、CPME 約350 mLを添加し、続いて2回蒸留して、残存するエチルアミンを除去した（槽温度を117 °Cに設定し、内部温度は約98 °Cであり、蒸留ヘッド温度は約80 °Cであった）。蒸留完了時（蒸留物の欠如を示すヘッド温度の低下により判断した）に、反応槽を23 °C（内部温度＝22 °C）に設定し、一晩攪拌した。生成物tert-ブチル（2-（エチルアミノ）-2-オキソエチル）カルバメートを、さらに精製することなく次の工程で使用した。

30

40

【0169】

工程 2：2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸塩（S2）の調製

窒素注入口、蠕動ポンプ、機械式攪拌機、及びベーススクラバー（10％ NaOH 溶液が入ったワニ口トラップ（alligator trap））を通る排気口を備えた5 Lのジャケット付き反応器に、HCl（イソプロピルアルコール中に6 M）（1.67 L、10.0 mol）を入れた。工程1のアミドを、3 Lのジャケット付き反応器から5 Lのジャケット付き反応器へと、蠕動ポンプを使用して酸滴下した。この滴下が完了した後

50

、CPME 400 mLを3 L反応器に入れてこの反応器を洗浄し、このCPME液を蠕動ポンプで5 L反応器に入れた。この反応物を一晩攪拌し、その間に、白色沈殿物が形成された。この反応器の内容物をろ別して2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸塩 (S2) 約100 gを得、これを、乾燥のために取っておいた。ろ液を、1.3 L (約50 %体積) まで濃縮し、続いてCPME 600 mL及びイソプロピルアルコール 100 mLを添加して、S2のさらなる沈殿を誘導した。この混合物を、60分にわたり攪拌した。得られたスラリーをろ別し、固形物を、最初に得られた固形物と組み合わせ、一晩真空オーブン (50 °C、500 mmHg未満) 中で乾燥させて、2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸得を白色固形物 (300.5 g、2168 mmol、86 %収率) として得た：¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) 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)⁺]。 [0170]

工程3：N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-トリアゾール-5-アミン二塩酸塩 (S3) の調製

2-還流冷却器 (ドライアイス)、機械式攪拌機、N₂注入口、及び熱電対を備えた5 Lのジャケット付き反応器に、2-アミノ-N-エチルアセトアミド塩酸塩 (S2) (238 g、1.72 mol) 及び無水アセトニトリル (2.00 L) を入れて、白色スラリーを得た。この反応器を、窒素で不活性化した。無水トリエチルアミン (264 mL、1.89 mmol) を添加し、この混合物を1時間にわたり攪拌して、粘性が高い白色スラリーを得た。ニコチナルデヒド (131 mL、1.37 mol) を添加して、より粘性が低いスラリーを得た。次いで、硫黄 (57.2 g、1.78 mol) を添加した。ジャケット温度を72 °C (内部温度=70 °C) に設定し、徐々 (30分以内) に暗い赤橙色溶液となり、沈殿物が形成された。この反応を、ニコチナルデヒドの消失に関してHPLCでモニタリングし、この消失には、72 °Cでの加熱にて約5時間かかり、次いで室温まで冷却し、一晩攪拌した。この不均一反応物を、内部温度50 °Cまで再加熱した (ここで、再び暗い赤色/褐色の透明溶液となった)。内部温度50 °Cの反応物に、三塩化ホスホリル (321 mL、3431 mmol) を、内部温度が65.5 °Cを超えないように滴下した。この反応を、チオアミド中間体が消費されるまで (6時間かかった)、HPLCでモニタリングした。ジャケット温度を20 °C (内部温度=20 °C) まで低下させ、固形物をろ別により単離し、アセトニトリルで洗浄した。反応器を、アセトニトリル 100 mLで洗浄した。ろ液を取り出してクエンチした。固形物を、DCM 300 mLでさらに洗浄した。湿った黄色/緑色ケーキを、16時間にわたり (40 °C、50 mmHg未満) にて真空下で乾燥させて、N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-トリアゾール-5-アミン二塩酸塩を緑色固形物 (200 g、703 mmol、51 %収率) として得た：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)⁺]。 [0171]

工程4：4-クロロ-N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (S4) の調製

機械式攪拌機、N₂注入口、及び温度プローブを備えた5 Lの反応器に、N-エチル-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-アミン二塩酸塩 (210 g、755 mmol) 及び水 (630 mL) を入れ、続いて酢酸エチル (2.10 L) を入れた。この暗い赤色の攪拌溶液に、水 (209 mL) 中の炭酸カリウム (209 g、1.51 mol) の溶液を、10分かけて蠕動ポンプで滴下した。完了時に、ジャケット温度を45 °C (内部温度=44 °C) に設定し、この反応物を2時間にわたり攪拌した。次いで、こ

10

20

30

40

50

の反応物を分液漏斗に移し、底部の水層を取り出した。この水層は、薄い透明なオレンジ色であった。この水層を廃棄した（HPLCにより所望の生成物が示されなかった）。有機層を、磁気攪拌機を備えており且つMgSO₄（210g）が入っているErlenmeyerフラスコに注いだ。このフラスコを、Karl Fischer滴定により測定された有機溶液の水レベルが0.5重量%未満となるまで、3時間にわたり攪拌した。この混合物をろ過し、無機固体をEtOAc（100mL）で洗浄した。ろ液を、5Lの反応器に注いで戻し、内部温度0℃まで冷却し、その間に、暗いオレンジ色の溶液は不均一になった。この不均一なスラリーに、1-クロロピロリジン-2,5-ジオン（101g、755mmol）を固形物として添加し、内部温度を12℃未満に維持した。添加を完了した後、この反応物は不均一となり、この反応をHPLCでモニタリングした。添加の完了後10分で、この反応が完了したことをHPLCで決定した。次いで、ジオキサン中の4M HCl（566mL、2.27mol）を、90かけて蠕動ポンプで滴下した。ジャケット温度を23℃（内部温度=22℃）に設定し、この反応物を、一晚室温で攪拌した。一晚の攪拌後、不均一なスラリーをろ過して、黄色／褐色の固形物を得、この固形物を、真空オーブン（30℃、50mmHg未満）中で乾燥させて、4-クロロ-N-エチル-2-（ピリジン-3-イル）チアゾール-5-アミン二塩酸塩（S4）を黄色／褐色の固形物（195g、629mmol、83%収率）を得た：¹H NMR（400MHz, DMSO-d₆）δ 9.05（d, J=2.2Hz, 1H）, 8.66（dd, J=5.3, 1.4Hz, 1H）, 8.45（dt, J=8.4, 1.8Hz, 1H）, 7.78（dd, J=8.2, 5.2Hz, 1H）, 3.19（q, J=7.2Hz, 2H）, 1.23（t, J=7.1Hz, 3H）。ESIMS m/z 240 [(M+H)⁺].

10

20

【0172】

工程5：3-（メチルスルホニル）プロパノイルクロリド（S6）の調製

3-（メチルスルホニル）プロパン酸（S5）（101g、663mmol、Orch evから購入）を、1Lのジャケット付き反応器に投入し、続いてアセトニトリル（304g）を投入し、次いで攪拌して酸を溶解させた。塩化チオニル（83.7g、697mmol）を、5分かけて滴下した。この溶液を、3時間にわたり25℃で保持し、酸（S5）を酸塩化物である3-（メチルスルホニル）プロパノイルクロリド（S6）に変換させた。この酸塩化物生成物を、さらに精製することなく次の工程で使用した。

30

【0173】

工程6：N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミド（化合物1）の調製

別の5Lの反応器に、4-クロロ-N-エチル-2-（ピリジン-3-イル）チアゾール-5-アミン二塩酸塩（164g、純度84重量%、442mmol、1.0当量）を投入し、続いてMeCN（415g、22.9当量）及び炭酸カリウム（156g、1.11mol）を投入した。このオレンジ色のスラリーを攪拌した後、この酸塩化物溶液を1Lの反応器から移した。工程5で調製された3-（メチルスルホニル）プロパノイルクロリドの溶液を、蠕動ポンプにより15分かけて移し、+3℃の発熱を観察した。この反応物を、室温で一晩攪拌した。

40

【0174】

一晚の攪拌後、このスラリーを、8℃の内部温度まで冷却し、その後、水（554g）を、3時間かけて蠕動ポンプにより5Lの反応器に移した。固形物が溶解した後、攪拌を停止させて、二相混合物を分離させた。下方の水相を廃棄し、次いで、有機相を、50℃でロータリーエバポレータにより濃縮して、N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミド（化合物1）を粗褐色油状物として得た。

【0175】

工程7：N-〔4-クロロ-2-（ピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル〕-N-エチル-3-（メチルスルホニル）プロパンアミド（化合物1）の単離

50

工程 6 からの油状物を、1-ブタノール (497 g) に溶解させ、この溶液を、1 L の反応器に再充填した。この反応器を、30℃まで温め、N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (化合物 1、形態 A) (8.18 g、21.9 mmol) を播種した。このスラリーを、8 時間にわたり 30℃で保持した後、12 時間かけて 18℃まで冷却した。このスラリーを、4 時間にわたり 18℃で保持し、次いで 8 時間かけて 10℃まで冷却した。このスラリーをろ別し、湿ったケーキをヘプタンで洗浄した。この湿ったケーキを、50℃で 50 mmHg 未満にてオープン中で乾燥させた。この例では、オープン内では制御されていない加熱が行なわれ、その結果、湿ったケーキの一部が融解した。得られた固形物 (150 g、90%) を、さらに精製することなく次の工程で使用した。

10

【0176】

工程 8：形態 A としての N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (化合物 1) の再結晶化

工程 7 からの N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (150 g、401 mmol) を、1 L の反応器に充填し、続いて MeOH (176 g) を充填した。この反応器に窒素を充填し、攪拌を開始した。内容物を 55℃まで加熱して、固形物を溶液へと溶解させた。この暗褐色溶液を 25℃まで冷却し、N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (化合物 1、形態 A) (1.50 g、4.01 mmol) を播種した。このスラリーを 5 時間にわたり保持した後、この反応器に、水 (253 g) を、3 時間かけて蠕動ポンプにより添加した。このスラリーを、一晩 25℃で保持した。翌日、このスラリーを、4 時間かけて内部温度 4℃まで冷却した後、ろ別した。湿ったケーキを、水中の 10% MeOH (100 g) で洗浄し、次いで 55℃にて真空オープン中で乾燥させて、化合物 1 (92.15 g、61%、純度 99.3 重量%) を結晶性固形物として得た。この固形物を、図 2 に示すように、実施例 8 に従って PXRD で分析し、形態 A という名称を割り当てた。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). ESI-MS m/z 374 [(M+H)⁺].

20

30

【0177】

実施例 3

1,4-ジオキサンからの、形態 A としての N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (化合物 1) の結晶化

1 ドラムバイアル中において、実施例 2 で調製された化合物 1 形態 A 25.2 mg を、1,4-ジオキサン 500 μL に溶解させた。このバイアルを、ピンホールが空いているアルミニウムホイルで覆い、バイアルをドラフトに置いて 3 日にわたり溶媒を蒸発させて、結晶性固形物を得た。試料を、実施例 9 に従って PXRD で分析し、形態 A という名称を割り当てた。

40

【0178】

実施例 4

MeOH からの、形態 A としての N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド (化合物 1) の代替結晶化

1 ドラムバイアル中において、実施例 2 で調製された化合物 1 形態 A 24.9 mg を、MeOH 1 mL に溶解させた。このバイアルを、ピンホールが空いているアルミニウ

50

ムホイルで覆い、ドラフトに置いて3日にわたり溶媒を蒸発させて、結晶性固形物を得た。試料を、実施例9に従ってPXRDで分析し、形態Aという名称を割り当てた。

【0179】

実施例5

アセトニトリルからの、形態BとしてのN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(化合物1)の結晶化

1ドラムバイアル中において、実施例2で調製された化合物1形態A 24.6mgを、アセトニトリル 500μLに溶解させた。このバイアルを、ピンホールが空いているアルミニウムホイルで覆い、ドラフトに置いて3日にわたり溶媒を蒸発させて、結晶性固形物を得た。試料を、図3に示すように実施例9に従ってPXRDで分析し、形態Bという名称を割り当てた。

10

【0180】

実施例6

EtOHからの、形態BとしてのN-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(化合物1)の代替結晶化

1ドラムバイアル中において、実施例2で調製された化合物1形態A 25.2mgを、EtOH 2mLに溶解させた。このバイアルを、ピンホールが空いているアルミニウムホイルで覆い、ドラフトに置いて3日にわたり溶媒を蒸発させて、結晶性固形物を得た。試料を、実施例9に従ってPXRDで分析し、形態Bという名称を割り当てた。

20

【0181】

実施例7

N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-(メチルスルホニル)プロパンアミド(化合物1)の蒸発結晶化溶媒スクリーニング

実施例3～6で説明されているのと同じ基本手順に従って、実施例2で調製された化合物1形態Aを、様々な溶媒に溶解させ、蒸発結晶化手順を実行した。結果の概要を表4にまとめ、PXRDパターンを、実施例9に従って確認した。

【0182】

30

40

50

【表 5】

表 4

溶媒	条件	多形形態
アセトン	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	A
ジクロロメタン	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	A
酢酸エチル	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	B
<i>iso</i> -プロピルアルコール	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	B
<i>iso</i> -プロピルアセテート	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	B
2-メチル-テトラヒドロフラン	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	B
テトラヒドロフラン	ホイルで覆われたバイアル, 1 つのピンホール, 室温	B

【0183】

実施例 8

化合物 1 の結晶多形形態 A 及び B の粉末 X 線回折 (P X R D)

試料を、R i g a k u M i n i f l e x I I B e n c h t o p X 線回折計を使用して分析した。X 線源は、3 0 k V 及び 1 5 m A で作動する C u N o r m a l F o c u s 管である。さらなる作動パラメータを、下記の表に記載する。

【0184】

【表 6】

X 線	30 kV, 15 mA	走査速度 / 継続 時間	0.2000 度/分
角度計		ステップ幅	0.0100 度
アタッチメント	-	走査軸	2 シータ/シート
フィルタ		走査範囲	3.0000 - 40.0000 度
CBO 選択スリット	-	入射スリット	1.25 度
回折ビーム単一 (Diffracted beam mono.)	固定モノクロメータ	長手制限スリット (Length limiting slit)	-
検出器	MiniFlex2 カウンタ	受信スリット#1	1.25 度
走査モード	CONTINUOUS	受信スリット#2	0.3mm

10

【0185】

粉末試料を、ガラス製試料ホルダに少なくとも20mgを入れて、軽い指圧を使用して、試料表面を平坦に保ち、且つ試料ホルダの基準面と同じ高さに保つことにより調製した。このガラス製ホルダを、アルミニウム支持体の上に置いた。各試料を、有効ステップサイズ $0.02^\circ 2\theta$ にて毎分 $5^\circ 2\theta$ の連続走査を使用して、 $3\sim 40^\circ 2\theta$ で分析した。高分解能試料を、毎分 $0.2^\circ 2\theta$ の連続走査及び有効ステップサイズ $0.01^\circ 2\theta$ を使用して分析した。

20

【0186】

実施例 9

化合物 1 の結晶多形形態 A 及び B の代替粉末 X 線回折 (PXRD)

試料を、線源 X 線ビームを使用する反射 Bragg Brentano ジオメトリ (reflection Bragg Brentano geometry) 用に設定された Rigaku Smart-Lab X 線回折システムを使用して分析した。X 線源は、40 kV 及び 44 mA で作動する Cu Long Fine Focus 管であった。この源は、高角度での細い線から低角度での広い矩形へと変化する入射ビームプロファイルを試料に与えた。ビーム調整スリットを、線 X 線源でを使用して、最大ビームサイズが、この線に沿って及びこの線に対して垂直に 10 mm 未満となるようにした。Bragg-Brentano ジオメトリは、受動的発散及び受光スリットにより制御されるパラ集光ジオメトリであり、試料自体が、光学系の集光コンポーネントとして機能した。Bragg-Brentano ジオメトリの固有の分解能は、回折計の半径と、使用される受光スリットの幅とにより部分的に支配される。典型的には、Rigaku Smart-Lab を、ピーク幅が $0.1^\circ 2\theta$ 以下となるように作動させた。X 線ビームの軸方向発散を、入射ビーム経路と回折ビーム経路との両方における 5.0° の Soller スリットにより制御した。粉末試料を、低バックグラウンド Si ホルダで調製し、軽い指圧を使用して、試料表面を平坦に保ち、且つ試料ホルダの基準面と同じ高さに保った。各試料を、有効ステップサイズ $0.02^\circ 2\theta$ にて毎分 $6^\circ 2\theta$ の連続走査を使用して、 $2\sim 40^\circ 2\theta$ で分析した。

30

40

【0187】

実施例 10：化合物 1 の多形形態 A 及び B の示差走査熱量測定 (DSC)

DSC 分析を、TA Instruments Q2500 DSC を使用して実行した。インジウムによる校正及び検証を、試料を測定する前に完了した。多形形態 A 又は B の試料 約 $3\sim 5$ mg を、空気下において密封したアルミニウムパンに充填した。TA Q2500 DSC において、試料を、 $0^\circ\text{C}\sim 120^\circ\text{C}$ まで $10^\circ\text{C}/\text{分}$ の速度で加熱した

50

。得られたサーモグラムを、T R I O Sソフトウェアを使用して解析し、融点及び溶解熱を算出した。結果を、図4（多形形態A）及び図5（多形形態B）に示す。

【0188】

実施例11：化合物1の多形形態A及びBの低周波ラマンスペクトル

ラマンスペクトルを、785nmのInvictusレーザー（15mW）を備えたKaiser RXN2分光計を使用して取得した。スペクトルは、Kaiser宇宙線抑制を備えた平行ビームプローブ、及び1つのスペクトル当たり4分の収集時間を使用して収集した。結果を、図6（多形形態A）及び図7（多形形態B）に示す。

【0189】

実施例12：多形A物質及び多形B物質の空気粉碎（air milling）

化合物1多形A試料及び化合物1多形B試料を、 $d(0.5) < 6\mu\text{m}$ 及び $d(0.9) < 15\mu\text{m}$ の粒径まで、Jet Millで別々に空気粉碎した。空気粉碎プロセスの前後に、試料に粉末X線回折（PXRD）を行なった。PXRDデータは、試料の多形形態が粉碎プロセスにより変化しなかったことを示す。粉碎後、PXRDデータは、粉碎された化合物1多形Aが本明細書で説明されている化合物1多形AのPXRDデータと一致することを示した。粉碎後、PXRDデータは、粉碎された化合物1多形Bが本明細書で説明されている化合物1多形BのPXRDデータと一致することを示した。

【0190】

実施例13：直接的なサツマイモコナジラミB．タバシ（B．tabaci）成虫のノックダウン試験における結晶性化合物1多形A及び化合物1多形Bと非結晶性化合物（非晶質油）との比較

この試験では、サツマイモコナジラミB．タバシ（B．tabaci）成虫の挙動への化合物1の効果を評価した。概して、化合物1の様々な形態（本発明の多形形態A、本発明の多形形態B、又は非結晶性化合物、非晶質油のいずれか）を、ガラスバイアルの内側に塗布し、処理済バイアル中にB．タバシ（B．tabaci）成虫を移し、処理済ガラス表面との接触により化合物1に暴露させた。既に報告されているノックダウン効果を定量するために（Lee et al. 2013）、処理済バイアルの底部から2cm上に線を刻み付け、初回暴露から最初の3時間後に、2cm線より上のB．タバシ（B．tabaci）の数を記録した。ノックダウンされたコナジラミは、すぐには死滅しなかったが、圃場での模擬試験、及び処理した植物での圃場試験では、この効果は、飢餓及び乾燥による死亡につながることを示されている。

【0191】

この試験により、直接接触により試験昆虫を暴露するために一般的な処理済ガラスバイアルバイオアッセイを使用して（Busvine 1971）、B．タバシ（B．tabaci）コナジラミ成虫の挙動への化合物1多形A及び化合物1多形Bの効果が特徴付けられており、これらの効果を、非結晶性化合物1との直接比較で比較した。試験化合物を、アセトンに溶解させたか（実施例11A）、又は揮発性の抗溶媒（ヘキサン）に懸濁させ（実施例11B）、次いで、実験用ローラーを使用して、ガラスバイアルの内側に均一にコーティングした。

【0192】

実施例13A：アセトン実験

この実験では、化合物1の2種の形態（多形形態B及び非晶質油）を、B．タバシ（B．tabaci）挙動への効果に関して評価した。溶媒ブランクコントロールに加えて、化合物1の各形態に関して、3種の施用量（25g/ha、2.5g/ha、及び0.25g/ha）を評価した。各処理及びコントロールを、3回反復した。化合物1試料を、アセトンに溶解させ、11ドラムスクリュートップガラスバイアル（Fisherbrand 03-339-21N）（Fisher Scientific, Hampton, NH）の内側にコーティングした。各バイアルは、内寸が2.5×9cmであり、その結果、処理面積は75.6cm²であった。バイアルを処理するために、最初に、化合物1試料（多形形態B又は非晶質油のいずれか）1mgをアセトン2mlに溶解させる

ことにより、各試料のストック溶液を調製した。このストック溶液を、実験用ボルテックスミキサーを使用して攪拌し、この溶液を完全に混合した。各ストック溶液 151 μ L を、アセトン 11.85 mL に添加して、25 g/h a 割合 (0.25 μ g/m²) の処理溶液を作製した。25 g/h a の処理溶液を、2 回 10 倍に連続希釈し、2.5 g/h a 及び 0.25 g/h a 割合の処理溶液を生成した。各処理溶液 3 mL を、11 ドラムバイアルに移し、このバイアルを、実験用チューブローラー上に置き、アセトンが完全に蒸発してバイアルの内側上に化合物 1 のコーティングが残るまで、室温で回転させた。溶媒ブランクバイアルを、アセトン 3 mL で処理した。処理後、バイアルを、開いたまま、室温にて一晚ドラフト内で放置して、翌日の試験に備えた。混合性の B. タバシ (B. tabaci) コナジラミ成虫 (中東アジアマイナー 1 (MEAM1) 生物型) を、C o r t e v a A g r i s c i e n c e (I n d i a n a p o l i s , I N) で維持されている感受性コロニーから捕集した。B. タバシ (B. tabaci) 成虫を、CO₂ で麻酔し、処理済バイアルのそれぞれに約 66.5 匹、32~102 匹 (平均、最小~最大) を導入し、これらの挙動を記録した。B. タバシ (B. tabaci) の挙動を評価するために、バイアルの底部から 2 cm 上に線を刻み付け、この線より上の個体の数を、導入後 15、30、45、60、90、120、150、及び 180 分で記録した。実験の完了後、昆虫を、72 時間にわたり -30℃ で凍結させることにより失活させ、その後、各バイアル中の昆虫の総数を記録した。2 cm より上の B. タバシ (B. tabaci) の割合を、各割合に関して算出し、経時的なコナジラミへの化合物 1 の効果をグラフ化するために使用した。

10

20

【0193】

統計解析

各試験及び割合に関して、2 cm 線より上の昆虫の割合を、二項反応及びロジットリンク関数による反復測定的一般化線形混合モデル (GLMM) で解析した (Stroup, 2012)。正規分布による線形モデル (ANOVA) の代わりに、反応に関する二項分布による一般化線形モデルを使用することにより、実験で使用される分布の仮定と実際の試料サイズ (昆虫の数) の正確な使用が可能となる。

【0194】

このモデルには、処理、時点、及び交互作用の処理×時点が固定効果として含まれており、反復 (実験単位) がランダム効果として含まれていた。反復測定間の相関関係を、複

30

【0195】

一般化線形混合モデルを残差擬似尤度法で推定し、処理割合の平均を Tukey の検定 ($\alpha = 0.05$) で比較した (Stroup 2012)。統計解析を、SAS Proc GLIMMIX (SAS ソフトウェア、バージョン 9.4, SAS Institute Inc., Cary, NC) で実施した。

【0196】

結果

溶媒ブランクコントロールでは、約 20~30% の昆虫が、常に、2 cm 線より上にいた (34.1% $\pm$ 2.18、平均 $\pm$ SEM) (図 8)。最高割合である 25 g/h a では、経時的な化合物 1 暴露による有意な効果が見られ、これにより、化合物 1 への暴露が昆虫の挙動に悪影響を及ぼし始めるにつれて 2 cm 線を超える昆虫の数の経時的な減少が実証された (図 9、表 5)。しかしながら、処理の有意な効果は見られず、且つ処理と時点との間に相互作用は見られず、このことから、25 g/h a 割合での多形 B 及び非晶質油の効果に差はないことが示された (表 5)。中間割合である 2.5 g/h a では、多形 B 及び非晶質油の効果の間に有意差が見られ、多形 B への暴露の方が 2 cm 線より上にいた昆虫が少なく、なぜならば、これらの昆虫の挙動は、同一割合で非晶質油に暴露された昆虫と比べて影響を受けたからであった (図 10、表 6)。2.5 g/h a 割合では、時間による影響、又は処理と時間との間の相互作用は見られなかった (表 6)。最後に、最低割合である 0.25 g/h a では、いかなるモデル効果でも有意な効果は見られず、こ

40

50

とから、この割合では、多形 B 及び非晶質油の効果に差違はないことが示された（表 7）。

【 0 1 9 7 】
【 表 7 】

表 5

固定効果の Type III 検定				
効果	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	1	4.127	1.06	0.359
時点	7	30.11	18.57	<.0001
Trt x 時点	7	30.11	1.55	0.1883
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平均 に関する Tukey- Kramer グループ ング(Tukey- Kramer Grouping for Trt Least Squares Means)(アルファ =0.05)	
非晶質油	0.167	0.042	a	
多形 B	0.115	0.030	a	

【 0 1 9 8 】
【 表 8 】

表 6

固定効果の Type III 検定				
効果	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	1	4.278	17.31	0.0123
時点	7	26.5	0.65	0.7085
Trt x 時点	7	26.5	0.52	0.81
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平 均に関する Tukey-Kramer グルーピング(アル ファ=0.05)	
非晶質油	0.326	0.035	a	
多形 B	0.156	0.022	b	

【 0 1 9 9 】

【表 9】

表 7

固定効果の Type III 検定				
効果	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	1	3.976	4.36	0.1054
時点	7	25.51	0.53	0.8014
Trt x 時点	7	25.51	0.28	0.9554
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平均 に関する Tukey- Kramer グループ ング(アルファ =0.05)	
非晶質油	0.295	0.062	a	
多形 B	0.502	0.074	a	

【0200】

実施例 13B：ヘキサン実験

この実験では、化合物 1 の 3 種の形態（多形形態 A、多形形態 B、及び非結晶性非晶質油）を、B．タバシ（B．t a b a c i）拳動、多形 A、多形 B、及び非晶質油への効果に関して評価した。多形形態 A 及び多形形態 B の試料を、実施例 12 で説明されているように細かく粉碎した。ヘキサン実験の実験デザイン（例えば、割合（25、2.5，及び 0.25 g／ha）、反復（1 つの処理当たり 3 回の反復）、並びに処理懸濁液の調製）は、実施例 13 A で説明されているプロセスと同様であった。しかしながら、アセトンの代わりにヘキサンを使用した。化合物 1 は、ヘキサンに容易に溶解しないことから、多形構造を保持しつつガラスバイアルの内面に塗布するために、ヘキサンを、化合物 1 のそれぞれの多形形態の粒子、及び化合物 1 の非結晶非晶質油の懸濁させるための抗溶媒として使用した。化合物 1 はヘキサンに容易に溶解しないことから、各バイアル中で粒子を可能な限り均一に分散させるために、ストック懸濁液を、30 秒にわたり実験用ボルテックスミキサを使用して混合し、続いて超音波浴中で 5 分にわたり攪拌した（Branson 2800，Branson Ultrasonics Corp.，Danbury，CT）。超音波処理後、試料をボルテックスミキサを使用して再度混合した直後に、各ストック懸濁液 151 μl をヘキサン 11.85 mL に移して、25 g／ha 割合（0.25 μg／cm²）の処理懸濁液を作製した 25 g／ha の処理懸濁液を、2 回 10 倍に連続希釈し、2.5 g／ha 及び 0.25 g／ha 割合の処理懸濁液を生成した。各処理懸濁液 3 mL を、11 ドラムバイアルに移し、このバイアルを、実験用チューブローラー上に置き、ヘキサンが完全に蒸発してバイアルの内側上に化合物 1 粒子の均一なコーティングが残るまで、室温で回転させた。溶媒ブランクバイアルを、ヘキサン 3 mL で処理した。処理後、バイアルを保管し、約 117.4 匹、47～219 匹（平均、最小～最大）の B．タバシ（B．t a b a c i）成虫を入れ、アセトン実験で説明されているように評価した。

【0201】

統計解析

各試験及び割合に関して、2 cm 線より上の昆虫の割合を、二項反応及びロジットリンク関数による反復測定的一般化線形混合モデル（GLMM）で解析した（Stroup，2012）。正規分布による線形モデル（ANOVA）の代わりに、反応に関する二項分

布による一般化線形モデルを使用することにより、実験で使用される分布の仮定と実際の試料サイズ（昆虫の数）の正確な使用が可能となる。

【0202】

このモデルには、処理、時点、及び交互作用の処理×時点が固定効果として含まれており、反復（実験単位）がランダム効果として含まれていた。反復測定間の相関関係を、複合対称共分散行列でモデル化した。

【0203】

一般化線形混合モデルを残差擬似尤度法で推定し、処理割合の平均をTukeyの検定（ $\alpha = 0.05$ ）で比較した（Stroup 2012）。統計解析を、SAS Proc GLIMMIX（SASソフトウェア、バージョン9.4, SAS Institute Inc., Cary, NC）で実施した。

【0204】

結果

溶媒ブランクコントロールでは、約30～50%の昆虫が、常に、2cm線より上にいた（ $42.1\% \pm 3.31$ 、平均 $\pm$ SEM）（図11）。アセトン実験と同様に、最高割合（ 25 g/h a ）では、

多形形態及び非晶質油の両方に関して経時的な化合物1暴露の有意な効果が見られ、このことから、殺虫剤が昆虫の挙動に悪影響を及ぼし始めるにつれて2cm線を超える昆虫の数が経時的に減少することが実証された（図12、表8）。しかしながら、処理の有意な効果は見られず、このことから、この割合での多形A、B、及び非晶質油の効果に差はないことが示された（表8）。中間割合である 2.5 g/h a では、処理の有意な効果が見られ、多形形態A又は多形形態Bのいずれかに暴露されたコナジラミは、非晶質油と直接比較した場合に有意に影響を受けた（図13、表9）。加えて、 2.5 g/h a 割合では、経時的な化合物1暴露の有意な効果が見られ、これは、多形形態A処理及び多形形態B処理の両方で非常に顕著であった（図13、表9）。最後に、 2.5 g/h a 割合では処理と時間の有意な相互作用が見られ、このことから、非晶質油と比較した多形形態A処理と多形形態B処理との間の経時的な反応曲線の形状の違いから明らかなように、各処理における昆虫の経時的な反応の仕方に差があることが示された（図13、表9）。最低割合（ 0.25 g/h a ）では、 2.5 g/h a 割合で観察されたものと同様の結果が得られた。 0.25 g/h a では、処理、時間、及び処理と時間との間の相互作用の有意な効果が見られた（図14、表10）。 2.5 g/h a 割合と同様に、多形形態A処理及び多形形態B処理による 0.25 g/h a 割合で暴露された昆虫は、 0.25 g/h a 割合で非晶質油に暴露された昆虫（図14、表10）と比べて悪影響を受けた。

【0205】

10

20

30

40

50

【表 1 0】

表 8

固定効果の Type III 検定				
効果*	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	2	5.737	1.32	0.3366
時点	7	62	40.81	<.0001
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平均 に関する Tukey- Kramer グループ ング(アルファ =0.05)	
非晶質油	0.029	0.011	a	
多形 B	0.013	0.005	a	
多形 A	0.015	0.006	a	

*有意ではない効果である相互作用 Trt x 時点を、収束に達しルためにモデルから除外した。

【 0 2 0 6 】
【表 1 1】

表 9

固定効果の Type III 検定				
効果	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	2	6.859	35.45	0.0002
時点	7	48	50.19	<.0001
Trt x 時点	14	48	13.84	<.0001
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平均 に関する Tukey- Kramer グループ ング(アルファ =0.05)	
非晶質油	0.453	0.053	a	
多形 B	0.079	0.017	b	
多形 A	0.080	0.017	b	

【 0 2 0 7 】

10

20

30

40

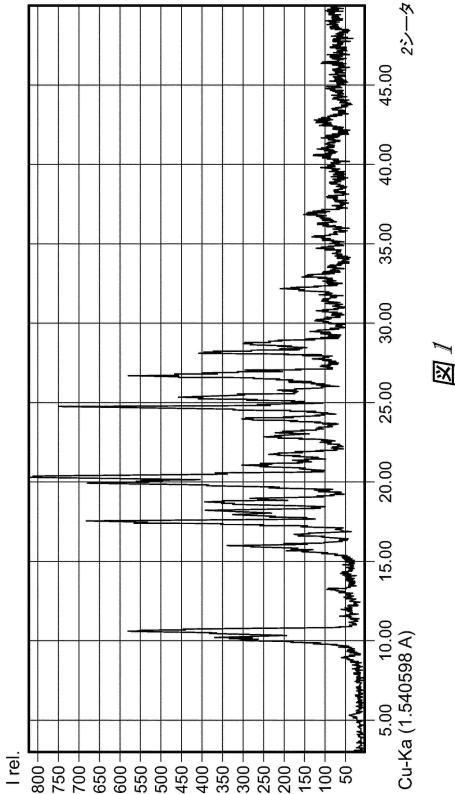
50

【表 1 2】

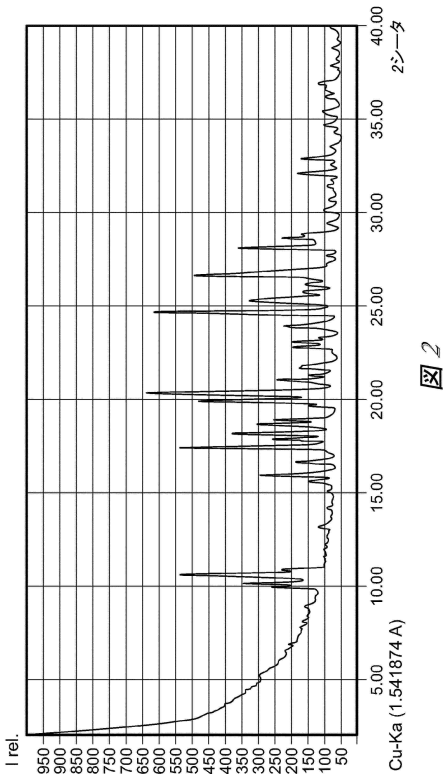
表 10

固定効果の Type III 検定				
効果	Num DF	Den DF	F 値	Pr > F
Trt	2	5.764	23.38	0.0017
時点	7	40.95	10.47	<.0001
Trt x 時点	14	40.42	4.1	0.0002
Trt 最小二乗平均(比例スケール)				
Trt	平均	標準誤差 平均	Trt 最小二乗平均 に関する Tukey- Kramer グループ ング(アルファ =0.05)	
非晶質油	0.601	0.030	a	
多形 B	0.345	0.028	b	
多形 A	0.342	0.028	b	

【図面】
【図 1】



【図 2】



10

20

30

40

50

【図 3】

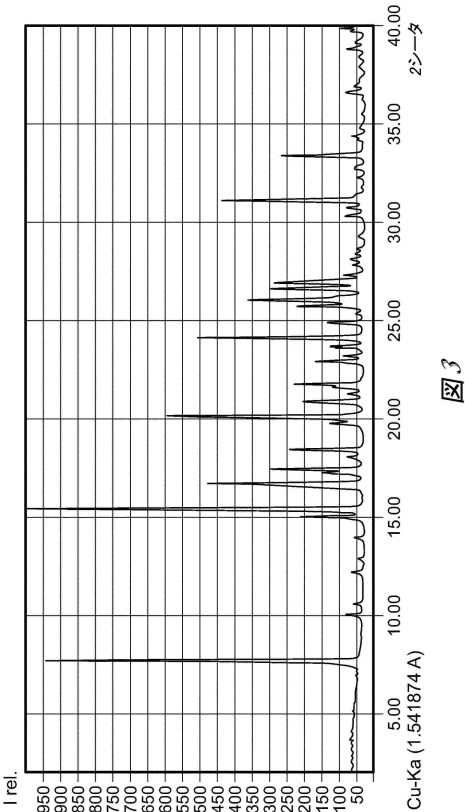


図 3

【図 4】

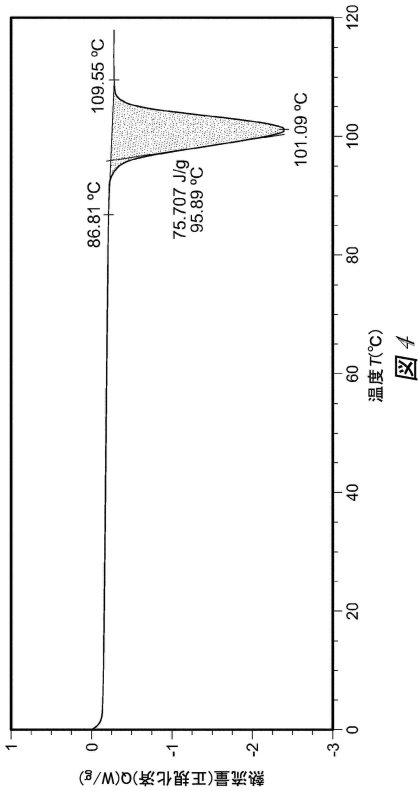


図 4

【図 5】

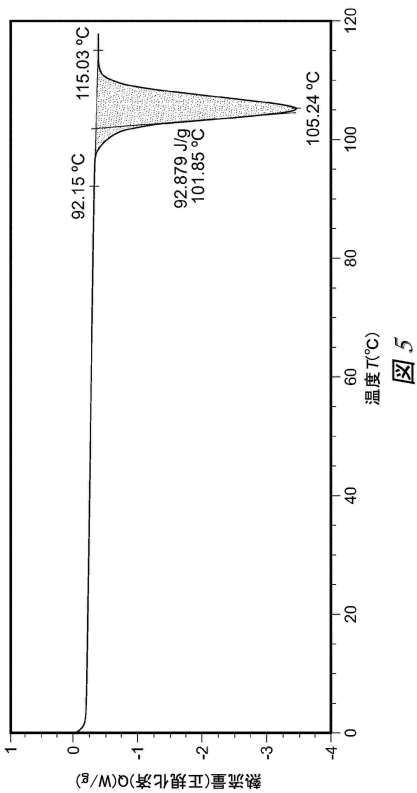


図 5

【図 6】

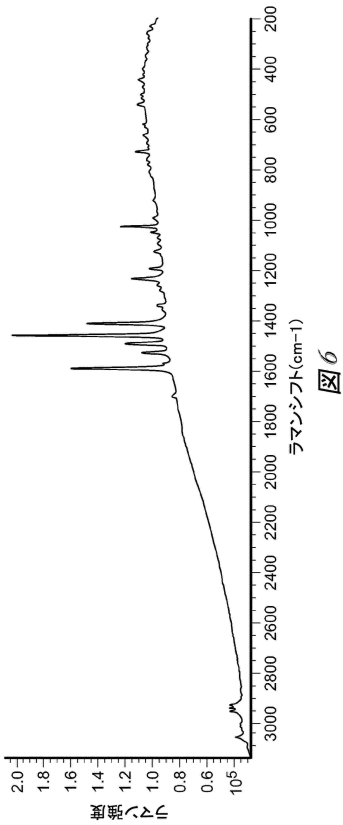


図 6

10

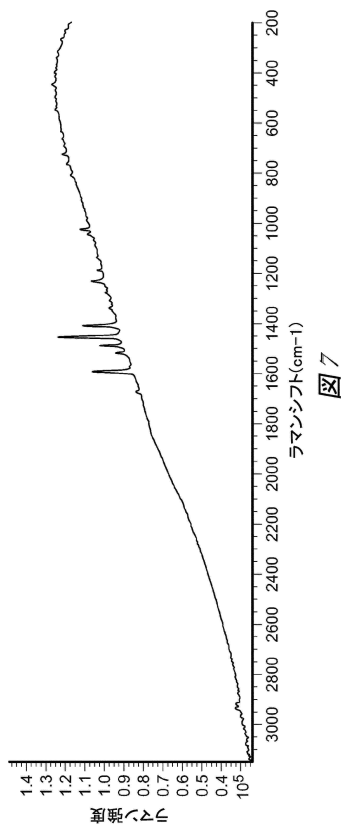
20

30

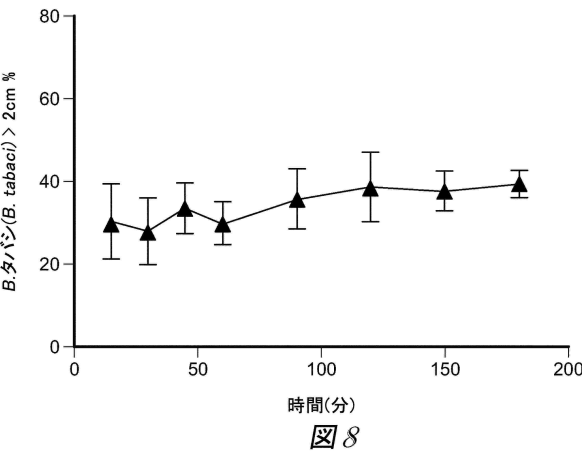
40

50

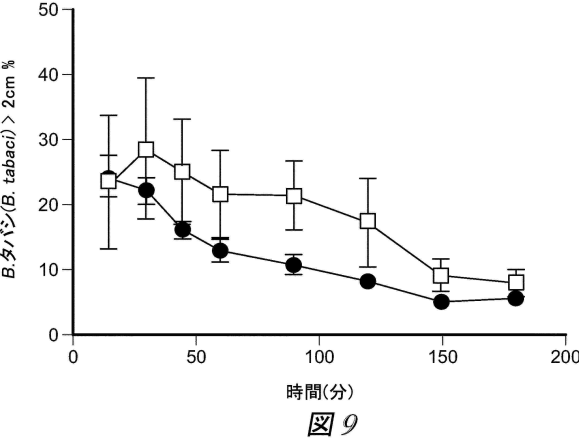
【図 7】



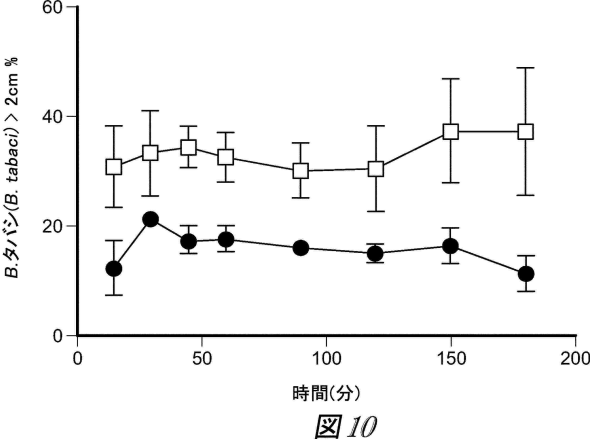
【図 8】



【図 9】



【図 10】



10

20

30

40

50

【図 1 1】

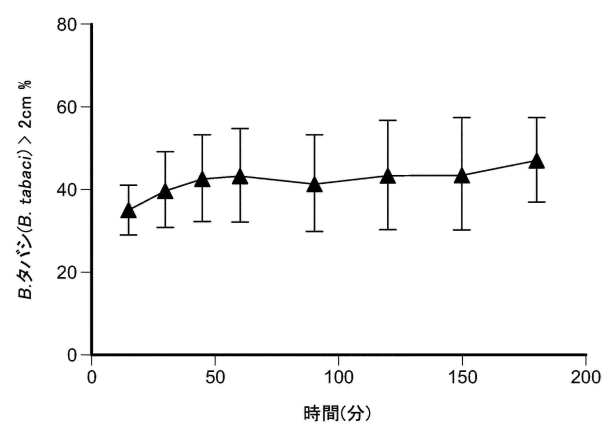


図 11

【図 1 2】

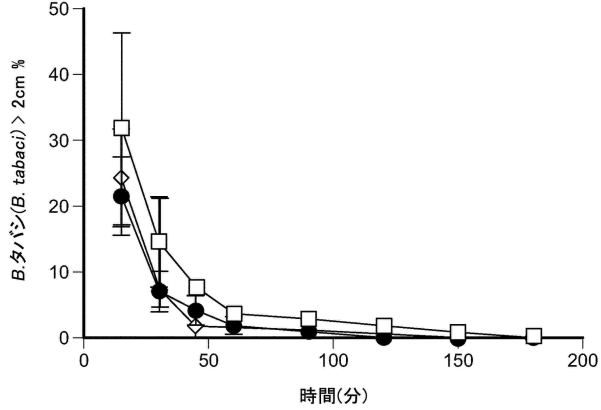


図 12

【図 1 3】

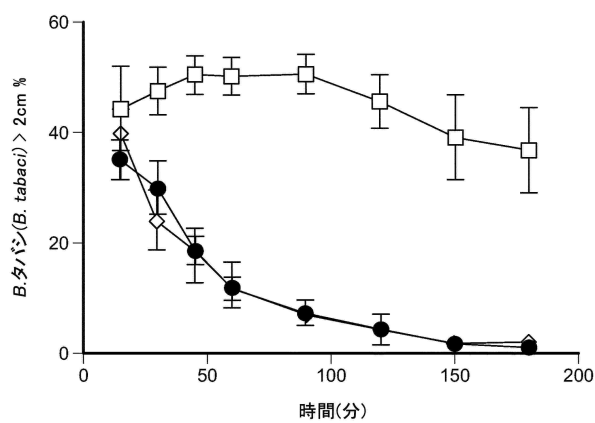


図 13

【図 1 4】

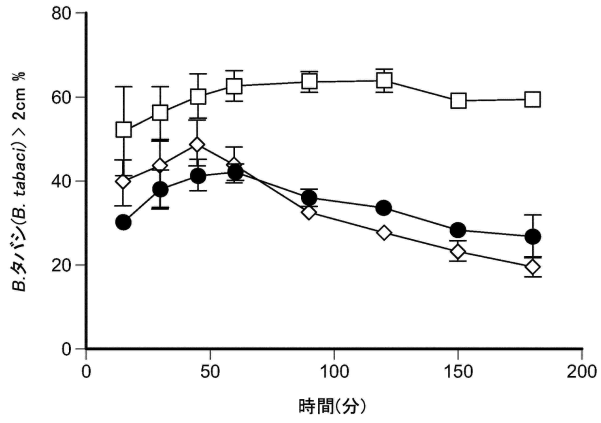


図 14

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2022/074322

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D417/04 A01N43/78 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 2 604 268 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 19 June 2013 (2013-06-19) claims; compound 315 -----	1-35
A	EP 3 060 043 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 31 August 2016 (2016-08-31) page 53, compound F3 -----	1-35
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 2 November 2022		Date of mailing of the international search report 10/11/2022
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Beyss-Kahana, Ellen

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2022/074322

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 2604268	A1	19-06-2013	AR 078040 A1 12-10-2011
			AU 2010246102 A1 27-10-2011
			BR PI1014543 A2 05-04-2016
			BR 122014007041 A2 19-04-2016
			CA 2759190 A1 11-11-2010
			CN 102458403 A 16-05-2012
			CN 105017240 A 04-11-2015
			CO 6450634 A2 31-05-2012
			DK 2427191 T3 20-06-2016
			DK 2604267 T3 25-04-2016
			DK 2604268 T3 21-12-2015
			DK 2614825 T3 20-06-2016
			EP 2427191 A1 14-03-2012
			EP 2604267 A1 19-06-2013
			EP 2604268 A1 19-06-2013
			EP 2614825 A1 17-07-2013
			EP 2614826 A1 17-07-2013
			ES 2551432 T3 19-11-2015
			ES 2562907 T3 09-03-2016
			ES 2568939 T3 05-05-2016
			ES 2573630 T3 09-06-2016
			ES 2625305 T3 19-07-2017
			HK 1170689 A1 08-03-2013
			IL 215723 A 29-01-2015
			JP 5990614 B2 14-09-2016
			JP 2012526123 A 25-10-2012
			JP 2015164921 A 17-09-2015
			KR 20120034636 A 12-04-2012
			MX 343625 B 14-11-2016
			NZ 595481 A 29-11-2013
			PL 2427191 T3 30-09-2016
			PL 2604267 T3 30-09-2016
			PL 2604268 T3 31-03-2016
			PL 2614825 T3 31-08-2017
			PL 2614826 T3 31-07-2017
			RU 2011149256 A 10-06-2013
			UA 107791 C2 25-02-2015
			US 2010292253 A1 18-11-2010
			US 2013072382 A1 21-03-2013
			US 2013089622 A1 11-04-2013
			US 2014348947 A1 27-11-2014
			US 2015045218 A1 12-02-2015
			WO 2010129497 A1 11-11-2010
			ZA 201107366 B 27-12-2012
EP 3060043	A1	31-08-2016	AR 098101 A1 04-05-2016
			AU 2014340422 A1 26-05-2016
			BR 112016008045 B1 24-12-2019
			CA 2926101 A1 30-04-2015
			CN 105658059 A 08-06-2016
			EP 3060043 A1 31-08-2016
			JP 6490681 B2 27-03-2019
			JP 2017501112 A 12-01-2017
			KR 20160074639 A 28-06-2016
			NZ 719688 A 30-06-2017
			RU 2016119357 A 28-11-2017
			TW 201519786 A 01-06-2015
			US 2015111731 A1 23-04-2015

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT			International application No
Information on patent family members			PCT/US2022/074322
Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2015061155 A1 30-04-2015			

フロントページの続き

,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,D
K,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),O
A(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,B
B,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB
,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,
LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,
QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,W
S,ZA,ZM,ZW

6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0

- (72)発明者 ガリジ, ネガー
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 ラーセン, ポール
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 リュウ, ジンリン
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 トルリンガー, トニー
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 ウェップ, ニコラ
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 ウェッセルズ, フランク
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 セイン, ニラジ
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- (72)発明者 スケルトン, ジェニファー
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード 9 3 3 0
- F ターム (参考) 4H011 AC01 BB10 DA02