

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2022-549794

(P2022-549794A)

(43)公表日 令和4年11月29日(2022.11.29)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 43/56 (2006.01)	A 0 1 N 43/56	D 4 H 0 1 1
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
A 0 1 P 7/00 (2006.01)	A 0 1 P 7/00	
A 0 1 N 25/34 (2006.01)	A 0 1 N 25/34	C

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全47頁)

(21)出願番号	特願2022-517766(P2022-517766)	(71)出願人	391022452
(86)(22)出願日	令和2年9月26日(2020.9.26)		エフ エム シー コーポレーション
(85)翻訳文提出日	令和4年3月29日(2022.3.29)		F M C CORPORATION
(86)国際出願番号	PCT/US2020/052971		アメリカ合衆国 1 9 1 0 4 ペンシルベ
(87)国際公開番号	WO2021/062338		ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ
(87)国際公開日	令和3年4月1日(2021.4.1)		トストリート2929
(31)優先権主張番号	62/906,801	(71)出願人	518259165
(32)優先日	令和1年9月27日(2019.9.27)		エフエムシー アグロ シンガポール プ
(33)優先権主張国・地域又は機関	米国(US)		ライベート リミテッド
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA ,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA( AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		シンガポール国 0 1 8 9 8 3 .シンガポ ール . マリーナ・ベイ・ファイナンシャ ル・センター . マリーナ・ブルバード 1 0 . ナンバー 4 0 - 0 1
		(74)代理人	100127926 弁理士 結田 純次 最終頁に続く

(54)【発明の名称】 アントラニルアミド組成物

(57)【要約】

本開示は、農薬活性成分と、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含むエンハンサーと、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン - ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む分散剤とを含む農薬組成物を提供する。本発明は、また、農学的に有効な量の前記組成物を、それを必要としている作物又はその環境に施用する工程を含む、作物における有害生物の防除方法を提供する。

**【特許請求の範囲】****【請求項 1】**

(a) 農薬活性成分と；

(b) エンハンサー（ここで、前記エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

(c) 分散剤（ここで、前記分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン - ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

(d) バインダーと；

(e) 任意選択的に充填材と

を含む組成物を含む製剤。

10

**【請求項 2】**

前記組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 0.1% ~ 約 20% の農薬活性成分と；

(b) 約 0.1% ~ 約 5% の少なくとも 1 種のエンハンサー（ここで、前記エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

(c) 約 0.1% ~ 約 10% の少なくとも 1 種の分散剤（ここで、前記分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン - ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

(d) 約 0.1% ~ 約 20% の少なくとも 1 種のバインダーと；

(e) 約 0.1% ~ 約 50% の少なくとも 1 種の充填材と

を含む組成物を含む製剤。

20

**【請求項 3】**

請求項 1 又は 2 に記載の製剤を含む錠剤組成物。

**【請求項 4】**

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 0.1% ~ 約 20% の農薬活性成分と；

(b) 約 0.1% ~ 約 5% の少なくとも 1 種のエンハンサー（ここで、前記エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

(c) 約 0.1% ~ 約 10% の少なくとも 1 種の分散剤（ここで、前記分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン - ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

(d) 約 0.1% ~ 約 20% の少なくとも 1 種のバインダーと；

(e) 約 0.1% ~ 約 50% の少なくとも 1 種の充填材と

を含む錠剤組成物。

40

**【請求項 5】**

前記農薬活性成分は、除草剤若しくは殺虫剤、又はそれらの混合物である、請求項 1 若しくは 2 に記載の製剤又は請求項 3 ~ 4 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

**【請求項 6】**

前記農薬活性成分は、ジアミド、ネオニコチノイド、若しくはネライストキシン類似体殺虫剤、又はそれらの混合物である、請求項 1 若しくは 2 に記載の製剤又は請求項 3 ~ 4 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

50

## 【請求項 7】

前記構成要素 (a) は、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、テトラニリプロール、シクラニリプロール、シハロジアミド、テトラ - クロラントラニリプロール、プロモアントラニリプロール、ジクロラントラニリプロール、チアメトキサム、クロチアニジン、チアクロブリド、モノスルタップ、若しくはビスルタップ、又はそれらの混合物を含み、任意選択的に、前記構成要素 (a) はクロラントラニリプロールを含む、請求項 1、2、5 及び 6 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 6 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

## 【請求項 8】

前記構成要素 (b) は、Geropon (登録商標) SDS、Aerosol (登録商標) OT - B、若しくは Aerosol (登録商標) OT - 75、又はそれらの混合物を含み、任意選択的に、前記構成要素 (b) は Geropon (登録商標) SDS を含む、請求項 1、2 及び 5 ~ 7 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 7 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

10

## 【請求項 9】

前記構成要素 (c) は、Tersperse (登録商標) 2700、Atlaxmetasperse<sup>TM</sup> 550S、Geropon (登録商標) Ultrasperse、Duramax (登録商標) D - 205、若しくは Geropon (登録商標) T / 36、又はそれらの混合物を含み、任意選択的に前記構成要素 (c) は Tersperse (登録商標) 2700 を含む、請求項 1、2 及び 5 ~ 8 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 8 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

20

## 【請求項 10】

前記構成要素 (d) は、ポリエチレングリコール (PEG)、マルトース、トレハロース、ソルビトール、マルチトール、ポリビニルピロリドン、二塩基性リン酸カルシウム、スクロース、グルコース、コーン (トウモロコシ) スターチ、変性セルロース、アルギン酸、カルボキシメチルセルロースナトリウム、及びコポビドンからなる群から選択される少なくとも 1 種の物質を含み、任意選択的に、前記構成要素 (d) は PEG を含む、任意選択的に、前記構成要素 (d) は、PEG 2000、PEG 4000、PEG 6000、PEG 8000 及び PEG 10000 からなる群から選択される少なくとも 1 種の PEG を含む、任意選択的に、前記構成要素 (d) は PEG 6000 を含む、請求項 1、2 及び 5 ~ 9 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 9 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

30

## 【請求項 11】

前記構成要素 (e) は、ラクトース、ラクトース - 水和物、マンニトール、スクロース、タルカム、マルトデキストリン、デキストリン、マルチトール、ソルビトール、キシリトール、粉末セルロース、セルロースガム、微晶質セルロース、デンプン、及びリン酸カルシウムからなる群から選択される少なくとも 1 種の物質を含み；任意選択的に、前記構成要素 (e) は、タルカム若しくはマルトデキストリン、又はそれらの混合物を含み；任意選択的に、前記構成要素 (e) は、タルカムとマルトデキストリンとの混合物を含み、任意選択的に、ここで、前記タルカムは、使用される場合、重量で前記組成物の約 1% ~ 約 15%、約 1% ~ 約 10%、約 1% ~ 約 8%、約 2% ~ 約 8%、約 3% ~ 約 8%、約 4% ~ 約 8%、約 5% ~ 約 8%、約 6% ~ 約 8%、又は約 6% であり、前記マルトデキストリンは、使用される場合、重量で前記組成物の約 1% ~ 約 40%、約 1% ~ 約 30%、約 5% ~ 約 30%、約 8% ~ 約 30%、約 10% ~ 約 30%、約 15% ~ 約 30%、約 18% ~ 約 30%、約 18% ~ 約 27%、又は約 20% ~ 約 27% である、請求項 1、2 及び 5 ~ 10 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 10 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

40

## 【請求項 12】

組成物の総重量を基準として重量で：構成要素 (f) 約 0.1% ~ 約 40% の少なくとも 1 種の酸及び (g) 約 0.1% ~ 約 40% の少なくとも 1 種のアルカリを更に含む、請

50

求項 1、2 及び 5 ~ 11 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 11 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

【請求項 13】

組成物の総重量を基準として重量で：構成要素 (h) 約 0.1% ~ 約 5% の少なくとも 1 種の潤滑剤を前記組成物が更に含む、請求項 1、2 及び 5 ~ 12 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 12 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

【請求項 14】

組成物の総重量を基準として重量で：構成要素 (i) 約 0.01% ~ 約 5% の少なくとも 1 種のビターを前記組成物が更に含む、請求項 1、2 及び 5 ~ 13 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3 ~ 13 のいずれか一項に記載の錠剤組成物。

10

【請求項 15】

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 0.1% ~ 約 20% のクロラントラニリプロール、若しくはシアントラニリプロール、又はそれらの混合物と；

(b) 約 0.1% ~ 約 5% の Geropon (登録商標) SDS と；

(c) 約 0.1% ~ 約 10% の Tersperse (登録商標) 2700 と；

(d) 約 0.1% ~ 約 20% の PEG-6000 と；

(e) 約 0.1% ~ 約 50% のタルカム及びマルトデキストリンを含む混合物と；

(f) 約 0.1% ~ 40% の D, L - 酒石酸と；

(g) 約 0.1% ~ 約 40% の重炭酸ナトリウム及び炭酸ナトリウムを含む混合物とを含む錠剤組成物。

20

【請求項 16】

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 1% ~ 5.5% のクロラントラニリプロール、若しくはシアントラニリプロール、又はそれらの混合物と；

(b) 約 0.5% ~ 1.8% の Geropon (登録商標) SDS と；

(c) 約 1.5% ~ 3.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；

(d) 約 1% ~ 8% の PEG-6000 と；

(e) 約 3% ~ 8% のタルカム及び約 20 ~ 30% のマルトデキストリンと；

(f) 約 15% ~ 25% の D, L - 酒石酸と；

(g) 約 20% ~ 40% の重炭酸ナトリウム及び約 5 ~ 10% の炭酸ナトリウムとを含む錠剤組成物。

30

【請求項 17】

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 1.05% のクロラントラニリプロールと；

(b) 約 0.8% の Geropon (登録商標) SDS と；

(c) 約 2.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；

(d) 約 3.0% の PEG-6000 と；

(e) 約 6.0% のタルカム及び約 27.1% のマルトデキストリンと；

(f) 約 2.1% の D, L - 酒石酸と；

(g) 約 3.0% の重炭酸ナトリウム及び約 8% の炭酸ナトリウムとを含む錠剤組成物。

40

【請求項 18】

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約 2.6% のクロラントラニリプロールと；

(b) 約 0.8% の Geropon (登録商標) SDS と；

(c) 約 2.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；

(d) 約 5.5% の PEG-6000 と；

(e) 約 6.0% のタルカム及び約 22.85% のマルトデキストリンと；

(f) 約 2.1% の D, L - 酒石酸と；

50

(g) 約 30% の重炭酸ナトリウム及び約 8% の炭酸ナトリウムとを含む錠剤組成物。

【請求項 19】

錠剤組成物の総重量を基準として重量で：

- (a) 約 5.1% のクロラントラニリプロールと；
- (b) 約 0.8% の Geropon (登録商標) SDS と；
- (c) 約 2.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；
- (d) 約 5.5% の PEG-6000 と；
- (e) 約 6.0% のタルカム及び約 20.35% のマルトデキストリンと；
- (f) 約 21% の D, L-酒石酸と；
- (g) 約 30% の重炭酸ナトリウム及び約 8% の炭酸ナトリウムと

を含む錠剤組成物。

10

【請求項 20】

農学的に有効な量の請求項 1、2 及び 5～14 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 3～19 のいずれか一項に記載の錠剤組成物を、それを必要している作物又はその環境に施用する工程を含む、作物における有害生物の防除方法。

【請求項 21】

前記作物はイネであり、前記製剤又は組成物は水田に施用される、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

前記作物は、イネ、野菜及びトウモロコシからなる群から選択され、任意選択的に、前記作物はイネである、請求項 20 に記載の方法。

20

【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、2019年9月27日出願の米国仮特許出願第62/906801号の優先権を主張するものである。

【0002】

本開示は、アントラニルアミドを含む新規組成物及び有害生物を防除するために前記組成物を施用することを含む方法に関する。

30

【背景技術】

【0003】

アントラニルアミド類(アントラニル酸ジアミドとしても知られる)は、哺乳類受容体を上回って昆虫リアノジン受容体に対して高い選択性でカルシウム恒常性に影響を及ぼす重要な合成クラスの殺虫剤である。とりわけ、クロラントラニリプロールは、そのクラスの最も広く使用される殺虫剤である。それは、鱗翅目(Order Lepidoptera)及びいくつかの鞘翅目(Coleoptera)、双翅目(Diptera)及び等翅目(Isoptera)種に属する有害生物に対して高い生物活性、並びに非標的節足動物への非常に低い毒性を有する。クロラントラニリプロールは、第一に摂取によって及び第二に接触によってそしゃく害虫に対して活性がある。

40

【0004】

クロラントラニリプロールの一般的に開発された製剤タイプには、SC剤(SC)、水和性顆粒剤(WDG)、種子粉衣用のフロアブル濃縮物(FS)、及び粒剤(GR)が含まれる。これらの農薬製剤は、多くの場合、散布によって施用される。水溶液又は懸濁液としての農薬の手動散布は、労働集約的であり、時間がかかる。超微量(ULV)散布及び航空機散布などの、現行の省力化技術は、より高い技術的熟練及び設備の費用の必要条件によって制限され、したがって、標準的な栽培者利用のためには必ずしも実行可能ではない。ULV及び航空機散布は、また、農薬が潜在的に環境へ入る可能性がある、散布の時間における気候条件に依存する風偏流の問題と関係があり得る。それ故、栽培者及び農

50

夫によって施用するのが容易であり、且つ、低減した環境負荷で高レベルの有害生物防除効果を実証する新規な農薬製剤を開発することが非常に望ましい。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0005】

本開示の発明者らは、活性成分としてのアントラニルアミドが1種以上の分散剤及び1種以上のエンハンサーの好適な組合で配合される場合に、製剤は、設備を用いることなく所望の均一分散効果を達成し、それによって時間のかかる及び労働力を要する手動散布から農夫を解放することを見出した。例えば、イネ水田へ直接投入された場合に均一分散する、及び推奨される用量下でより高い効能の有害生物防除を得る、例えば、錠剤形態での、新規な組成物が本明細書で提供される。

10

【0006】

一態様において、本開示は、本明細書において、

(a) 農薬活性成分と；

(b) ハンサー（ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

(c) 分散剤（ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

20

(d) バインダーと；

(e) 任意選択的に充填材と

を含む組成物を含む製剤を提供する。

【0007】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約0.1%～約20%の農薬活性成分と；

(b) 約0.1%～約5%の少なくとも1種のエンハンサー（ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

30

(c) 約0.1%～約10%の少なくとも1種の分散剤（ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

(d) 約0.1%～約20%の少なくとも1種のバインダーと；

(e) 約0.1%～約50%の少なくとも1種の充填材と

を含む組成物を含む製剤を提供する。

【0008】

特定の実施形態において、組成物は、錠剤の形態にある。

40

【0009】

特定の実施形態において、農薬活性成分は、除草剤又は殺虫剤である。特定の実施形態において、農薬活性成分は、ジアミド、ネオニコチノイド、若しくはネライストキシン類似体殺虫剤、又はそれらの混合物である。特定の実施形態において、農薬活性成分はジアミドである。

【0010】

特定の実施形態において、組成物は、組成物の総重量を基準として重量で、構成要素(f) 約0.1%～約40%の少なくとも1種の酸及び/又は(g) 約0.1%～約40%の少なくとも1種のアルカリを更に含む。

【0011】

50

特定の実施形態において、エンハンサーは、ナトリウムジアルキルスルホスクシネート、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルベンゼンスルホン酸ナトリウム、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホン酸ナトリウム、スルホコハク酸ジオクチルナトリウム、若しくはアルキルナフチル硫酸ナトリウム、又はそれらの混合物を含む。

【0012】

一態様において、本開示は、組成物の総重量を基準として重量で：

(a) 約0.1%～約20%の、1種以上のアントラニルアミドを含む農薬活性成分と

；  
(b) 約0.1%～約5%の少なくとも1種のエンハンサー（ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む）と；

(c) 約0.1%～約10%の少なくとも1種の分散剤（ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む）と；

(d) 約0.1%～約20%の少なくとも1種のバインダーと；

(e) 約0.1%～約50%の少なくとも1種の充填材と  
を含む錠剤組成物を提供する。

【0013】

特定の実施形態において、農薬活性成分は、除草剤又は殺虫剤である。特定の実施形態において、農薬活性成分は、ジアミド、ネオニコチノイド、若しくはネライストキシン類似体殺虫剤、又はそれらの混合物である。

【0014】

特定の実施形態において、構成要素(a)は、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、テトラニリプロール、シクラニリプロール、シハロジアミド、テトラクロラントラニリプロール、チアメトキサム、クロチアニジン、チアクロプリド、モノスルタップ、若しくはビスルタップ、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素(a)はクロラントラニリプロールを含む。

【0015】

特定の実施形態において、構成要素(a)は、重量で組成物の約1%～約10%、約1%～約8%、約1%～約7%、約1%～約6%、約1%～約5.5%、約1%、約2.5%又は約5%である。

【0016】

特定の実施形態において、エンハンサーは、ナトリウムジアルキルスルホスクシネート、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルベンゼンスルホン酸ナトリウム、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホン酸ナトリウム、スルホコハク酸ジオクチルナトリウム、若しくはアルキルナフチル硫酸ナトリウム、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、エンハンサーは、ジオクチルスルホスクシネートの塩を含む。

【0017】

特定の実施形態において、構成要素(b)は、Geropon（登録商標）SDS、Aerosol（登録商標）OT-B、若しくはAerosol（登録商標）OT-75、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素(b)は、Geropon（登録商標）SDS、Aerosol（登録商標）OT-B、及びAerosol（登録商標）OT-75からなる群から選択される1つの物質である。特定の実施形態において、構成要素(b)はGeropon SDSを含む。特定の実施形態において、構成要素(b)はGeropon（登録商標）SDSである。

【0018】

特定の実施形態において、構成要素(b)は、重量で組成物の約0.1%～約4%、約0.1%～約3%、約0.1%～約2%、約0.2%～約2%、約0.3%～約2%、約

10

20

30

40

50

0.3%～約1.8%、約0.3%～約1.5%、約0.3%～約1.2%、約0.3%～約1%、約0.5%～約1%、約0.6%～約1%、約0.7%～約1%、又は約0.8%である。

【0019】

特定の実施形態において、構成要素(c)は、Tersperse(登録商標)2700、Atllox metasperse<sup>TM</sup> 550S、Geropon(登録商標)Ultrasperse、Duramax(登録商標)D-205、若しくはGeropon(登録商標)T/36、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素(c)は、Tersperse(登録商標)2700、Atllox metasperse<sup>TM</sup> 550S、Geropon(登録商標)Ultrasperse、Duramax(登録商標)D-205、及びGeropon(登録商標)T/36からなる群から選択される1つの物質である。特定の実施形態において、構成要素(c)はTersperse(登録商標)2700を含む。特定の実施形態において、構成要素(c)はTersperse(登録商標)2700である。

10

【0020】

特定の実施形態において、構成要素(c)は、重量で組成物の約0.5%～約10%、約0.5%～約8%、約0.5%～約7%、約0.5%～約6%、約0.5%～約5%、約0.8%～約5%、約1%～約5%、約1.2%～約5%、約1.5%～約5%、約1.7%～約5%、約2%～約5%、約2%～約4.5%、約2%～約4%、約2%～約3.5%、約2%～約3%、約2.2%～約2.8%、約2.4%～約2.6%、又は約2.5%である。

20

【0021】

特定の実施形態において、組成物は、構成要素(f)約0.1%～約40%の少なくとも1種の酸及び/又は(g)約0.1%～約40%の少なくとも1種のアルカリを更に含む。

【0022】

特定の実施形態において、構成要素(f)は、クエン酸、マロネート、アジピン酸、マレイン酸及びD, L-酒石酸からなる群から選択される少なくとも1種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素(f)はD, L酒石酸を含む。特定の実施形態において、構成要素(f)はD, L酒石酸である。

30

【0023】

特定の実施形態において、構成要素(f)は、重量で組成物の約0.5%～約25%、約1%～約25%、約5%～約25%、約10%～約25%、約15%～約25%、約16%～約25%、約17%～約25%、約18%～約25%、約19%～約25%、約20%～約25%、約20%～約24%、約20%～約23%、約20%～約22%、又は約21%である。

【0024】

特定の実施形態において、構成要素(g)は、重炭酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される少なくとも1種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素(g)は、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、及び炭酸カリウムからなる群から選択される少なくとも1種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素(g)は、重炭酸ナトリウムと炭酸ナトリウムとの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素(g)は、重炭酸ナトリウムと炭酸ナトリウムとの混合物である。

40

【0025】

特定の実施形態において、重炭酸ナトリウムと炭酸ナトリウムとの比、又は重炭酸カリウムと炭酸カリウムとの比は、重量で約1:10～10:1、約1:5～10:1、約1:3～10:1、約1:2～10:1、約1:1～10:1、約2:1～10:1、約3:1～10:1、約3:1～9:1、約3:1～8:1、約3:1～7:1、約3:1～6:1、約3:1～5:1、約3:1～4:1、約3.5:1～4:1、又は約3.7:1である。

50

## 【 0 0 2 6 】

特定の実施形態において、構成要素（g）は、重炭酸ナトリウムと炭酸ナトリウムとの混合物を含み、ここで、重炭酸ナトリウムは、重量で組成物の約0.5%～約40%、約1%～約40%、約5%～約40%、約10%～約40%、約15%～約40%、約20%～約40%、約25%～約40%、約25%～約35%、約27%～約33%、又は約30%であり、炭酸ナトリウムは、重量で組成物の約1%～約40%、約1%～約30%、約1%～約20%、約2%～約20%、約3%～約20%、約3%～約18%、約3%～約15%、約3%～約12%、約3%～約10%、約5%～約10%、約6%～約10%、約7%～約10%、又は約8%である。

## 【 0 0 2 7 】

特定の実施形態において、構成要素（g）は、重炭酸カリウムと炭酸カリウムとの混合物を含み、ここで、重炭酸カリウムは、重量で組成物の約0.5%～約40%、約1%～約40%、約5%～約40%、約10%～約40%、約15%～約40%、約20%～約40%、約25%～約40%、約25%～約35%、約27%～約33%、又は約30%であり、炭酸カリウムは、重量で組成物の約1%～約40%、約1%～約30%、約1%～約20%、約2%～約20%、約3%～約20%、約3%～約18%、約3%～約15%、約3%～約12%、約3%～約10%、約5%～約10%、約6%～約10%、約7%～約10%、又は約8%である。

10

## 【 0 0 2 8 】

特定の実施形態において、構成要素（g）は、重量で組成物の約0.5%～約40%、約1%～約40%、約5%～約40%、約10%～約40%、約15%～約40%、約20%～約40%、約25%～約40%、約30%～約40%、約35%～約40%、又は約38%である。

20

## 【 0 0 2 9 】

特定の実施形態において、構成要素（d）は、ポリエチレングリコール（PEG）、マルチース、トレハロース、ソルビトール、マルチトール、ポリビニルピロリドン、二塩基性リン酸カルシウム、スクロース、グルコース、コーン（トウモロコシ）スターチ、変性セルロース、アルギン酸、カルボキシメチルセルロースナトリウム、及びコポリドンからなる群から選択される少なくとも1種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素（d）はPEGを含む。特定の実施形態において、構成要素（d）はPEGである、特定の実施形態において、PEGは、PEG2000、PEG4000、PEG6000、PEG8000及びPEG10000からなる群から選択されるものである。特定の実施形態において、PEGはPEG6000である。

30

## 【 0 0 3 0 】

特定の実施形態において、構成要素（d）は、重量で組成物の約1%～約15%、約1%～約10%、約1%～約8%、約1%～約7%、約1%～約6%、約1%～約5.5%、約2%～約5.5%、約3%～約5.5%、約3%、又は約5.5%である。

## 【 0 0 3 1 】

特定の実施形態において、構成要素（e）は、ラクトース、ラクトースー水和物、マンニトール、スクロース、タルカム、マルトデキストリン、デキストリン、マルチトール、ソルビトール、キシリトール、粉末セルロース、セルロースガム、微晶質セルロース、デンプン、又はリン酸カルシウムからなる群から選択される少なくとも1種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素（e）は、タルカム、若しくはマルトデキストリン、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素（e）は、タルカムとマルトデキストリンとの混合物を含む。特定の実施形態において、構成要素（e）は、重量で組成物の約1%～約15%、約1%～約10%、約1%～約8%、約2%～約8%、約3%～約8%、約4%～約8%、約5%～約8%、約6%～約8%、又は約6%のタルカムと、重量で組成物の約1%～約40%、約1%～約30%、約5%～約30%、約8%～約30%、約10%～約30%、約15%～約30%、約18%～約30%、約18%～約27%、又は約20%～約27%のマルトデキストリンとを含む。

40

50

【 0 0 3 2 】

特定の実施形態において、構成要素 ( e ) は、重量で組成物の約 0 . 5 % ~ 約 5 0 % 、約 1 % ~ 約 5 0 % 、約 5 % ~ 約 5 0 % 、約 1 0 % ~ 約 5 0 % 、約 1 5 % ~ 約 5 0 % 、約 2 0 % ~ 約 5 0 % 、約 2 0 % ~ 約 4 5 % 、約 2 0 % ~ 約 4 0 % 、約 2 0 % ~ 約 3 5 % 、約 2 5 % ~ 約 3 5 % 、約 2 6 % ~ 約 3 3 % 、約 2 6 % 、約 2 9 % 又は約 3 3 % である。

【 0 0 3 3 】

特定の実施形態において、組成物は、重量で組成物の約 0 . 1 % ~ 約 5 % の少なくとも 1 種の潤滑剤の構成要素 ( h ) を更に含む。

【 0 0 3 4 】

特定の実施形態において、構成要素 ( h ) は、ホワイトカーボン、タルカム粉末、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸ナトリウム、ステアリン酸亜鉛、ステアリン酸、金属ステアレート、ステアリルフマル酸ナトリウム、脂肪酸、脂肪アルコール、脂肪酸エステル、グリセリルベヘネート、キャノーラ油、鉱油、植物油、グリセリルパルミトステアレート、水素化植物油、水素化植物油、酸化マグネシウム、ポロクサマー、パラフィン、ロイシン、プロピレングリコール脂肪酸エステル、ポリビニルアルコールナトリウムベンゾエート、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリルフマル酸ナトリウム、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、及びポリアルキレングリコールからなる群から選択される少なくとも 1 種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素 ( h ) はステアレートを含む。特定の実施形態において、構成要素 ( h ) はステアレートである。特定の実施形態において、構成要素 ( h ) はステアリン酸マグネシウムを含む。特定の実施形態において、構成要素 ( h ) はステアリン酸マグネシウムである。

10

20

【 0 0 3 5 】

特定の実施形態において、構成要素 ( h ) は、重量で組成物の約 0 . 1 % ~ 約 4 . 5 % 、約 0 . 1 % ~ 約 4 . 0 % 、約 0 . 1 % ~ 約 3 . 5 % 、約 0 . 1 % ~ 約 3 . 0 % 、約 0 . 1 % ~ 約 2 . 5 % 、約 0 . 1 % ~ 約 2 . 0 % 、約 0 . 1 % ~ 約 1 . 5 % 、約 0 . 1 % ~ 約 1 . 0 % 、約 0 . 5 % ~ 約 1 . 0 % 、約 0 . 5 % ~ 約 0 . 7 % 、約 0 . 5 % 、又は約 0 . 7 % である。

【 0 0 3 6 】

特定の実施形態において、組成物は、重量で組成物の約 0 . 0 1 % ~ 約 5 % の少なくとも 1 種のビターの構成要素 ( i ) を更に含む。

30

【 0 0 3 7 】

特定の実施形態において、構成要素 ( i ) は、ベンゾジアゼピン、デナトニウム、スクロースオクタアセテート、ケルセチン、プルシン及びクアシンからなる群から選択される少なくとも 1 種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素 ( i ) は安息香酸デナトニウムを含む。

【 0 0 3 8 】

特定の実施形態において、構成要素 ( i ) は、重量で組成物の約 0 . 0 1 % ~ 約 4 . 5 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 4 . 0 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 3 . 5 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 3 . 0 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 2 . 5 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 2 . 0 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 . 5 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 . 0 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 5 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 4 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 3 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 2 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 1 % 、約 0 . 0 1 % ~ 約 0 . 0 5 % 、約 0 . 0 5 % 、約 0 . 1 % である。

40

【 0 0 3 9 】

特定の実施形態において、組成物は、重量で組成物の約 0 . 1 % ~ 約 1 . 5 % の少なくとも 1 種の分散剤の構成要素 ( j ) を更に含む。

【 0 0 4 0 】

特定の実施形態において、構成要素 ( j ) は、 d y s p e r s e 1 3 1 、 p o l y f o n H 、 d i s p e r s e 1 3 2 、 及び d i s p e r s e 1 4 0 からなる群から選択される少なくとも 1 種の物質を含む。特定の実施形態において、構成要素 ( i ) は p o

50

l y f o n Hを含む。

【0041】

特定の実施形態において、構成要素(j)は、重量で組成物の約0.1%~約~約4.0%、約0.1%~約3.5%、約0.1%~約3.0%、約0.1%~約2.5%、約0.1%~約2.0%、約0.1%~約1.5%、約0.1%~約1.0%、約0.1%~約0.5%、約0.1%~約0.4%、約0.1%~約0.3%、約0.1%~約0.2%、約0.1%~約0.1%、約0.1%~約0.5%、約0.5%、約1.0%である。

【0042】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：  
 (a) 約0.1%~約20%のクロラントラニリプロール、若しくはシアントラニリプロール、又はそれらの混合物と；  
 (b) 約0.1%~約5%のGeropon(登録商標)SDSと；  
 (c) 約0.1%~約10%のTersperse(登録商標)2700と；  
 (d) 約0.1%~約20%のPEG-6000と；  
 (e) 約0.1%~50%のタルカム及びマルトデキストリンを含む混合物と；  
 (f) 約0.1%~40%のD,L-酒石酸と；  
 (g) 約0.1%~約40%の重炭酸ナトリウム及び炭酸ナトリウムを含む混合物とを含む錠剤組成物を提供する。

【0043】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：  
 (a) 約1%~5.5%のクロラントラニリプロール、若しくはシアントラニリプロール、又はそれらの混合物と；  
 (b) 約0.5%~1.8%のGeropon(登録商標)SDSと；  
 (c) 約1.5%~3.5%のTersperse(登録商標)2700と；  
 (d) 約1%~8%のPEG-6000と；  
 (e) 約3%~8%のタルカム及び約20~30%のマルトデキストリンと；  
 (f) 約15%~25%のD,L-酒石酸と；  
 (g) 約20%~40%の重炭酸ナトリウム及び約5~10%の炭酸ナトリウムとを含む錠剤組成物を提供する。

【0044】

特定の実施形態において、組成物は、(h)約0.5%~約0.7%のステアリン酸マグネシウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i)約0.04%~約0.06%の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i)約0.06%~約0.12%の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、重量で組成物の約0.1%~約1.5%の少なくとも1種の分散剤の構成要素(j)を更に含む。

【0045】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：  
 (a) 約1.05%のクロラントラニリプロールと；  
 (b) 約0.8%のGeropon(登録商標)SDSと；  
 (c) 約2.5%のTersperse(登録商標)2700と；  
 (d) 約3.0%のPEG-6000と；  
 (e) 約6.0%のタルカム及び約27.1%のマルトデキストリンと；  
 (f) 約21%のD,L-酒石酸と；  
 (g) 約30%の重炭酸ナトリウム及び約8%の炭酸ナトリウムとを含む錠剤組成物を提供する。

【0046】

特定の実施形態において、組成物は、(h)約0.5%のステアリン酸マグネシウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i)約0.05%の安息香酸デナトニ

ウムを更に含む。いくつかの実施形態において、組成物は、(i) 約 0.1% の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、約 1.0% の polyfon H の構成要素 (j) を更に含む。

【0047】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：

- (a) 約 2.6% のクロラントラニプロールと；
- (b) 約 0.8% の Geropon (登録商標) SDS と；
- (c) 約 2.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；
- (d) 約 5.5% の PEG-6000 と；
- (e) 約 6.0% のタルカム及び約 22.85% のマルトデキストリンと；
- (f) 約 21% の D, L-酒石酸と；
- (g) 約 30% の重炭酸ナトリウム及び約 8% の炭酸ナトリウムと

を含む錠剤組成物を提供する。

10

【0048】

特定の実施形態において、組成物は、(h) 約 0.7% のステアリン酸マグネシウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i) 約 0.05% の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i) 約 0.1% の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、約 1.0% の polyfon H の構成要素 (j) を更に含む。

【0049】

一態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量基準として重量で：

- (a) 約 5.1% のクロラントラニプロールと；
- (b) 約 0.8% の Geropon (登録商標) SDS と；
- (c) 約 2.5% の Tersperse (登録商標) 2700 と；
- (d) 約 5.5% の PEG-6000 と；
- (e) 約 6.0% のタルカム及び約 20.35% のマルトデキストリンと；
- (f) 約 21% の D, L-酒石酸と；
- (g) 約 30% の重炭酸ナトリウム及び約 8% の炭酸ナトリウムと

を含む錠剤組成物を提供する。

20

【0050】

特定の実施形態において、組成物は、(h) 約 0.7% のステアリン酸マグネシウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i) 約 0.05% の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、(i) 約 0.1% の安息香酸デナトニウムを更に含む。特定の実施形態において、組成物は、約 1.0% の polyfon H の構成要素 (j) を更に含む。

【0051】

別の態様において、本開示は、本明細書において、農学的に有効な量の本明細書で提供される製剤又は組成物を、それを必要としている作物又はその環境に施用する工程を含む、作物における有害生物の防除用法を提供する。

【0052】

特定の実施形態において、製剤又は組成物は、1ヘクタール当たり10グラムの活性成分 (gai/ha) ~ 約 10,000 gai/ha、約 10 ~ 約 5,000 gai/ha、約 10 ~ 約 1,000 gai/ha、約 10 ~ 約 500 gai/ha、約 10 ~ 約 200 gai/ha、約 10 ~ 約 100 gai/ha、約 10 ~ 約 90 gai/ha、約 10 ~ 約 80 gai/ha、約 10 ~ 約 70 gai/ha、約 10 ~ 約 60 gai/ha、約 10 ~ 約 50 gai/ha、約 20 ~ 約 50 gai/ha、約 30 ~ 約 50 gai/ha、又は約 40 gai/ha の率で施用される。

【0053】

特定の実施形態において、本開示の単一の錠剤は、約 0.0004 g ~ 約 1 g、約 0.001 g ~ 約 0.5 g、約 0.002 g ~ 約 0.4 g、約 0.003 g ~ 約 0.3 g、約

30

40

50

0.004 g ~ 約 0.2 g、約 0.005 g ~ 約 0.2 g、約 0.01 g ~ 約 0.3 g、約 0.05 g ~ 約 0.3 g、約 0.07 g ~ 約 0.3 g、約 0.1 g ~ 約 0.3 g、約 0.1 g ~ 約 0.25 g、約 0.1 g ~ 約 0.2 g、約 0.0034 g、約 0.0775 g、又は約 0.15 g の構成要素 (a) を含む。

【0054】

特定の実施形態において、作物は、イネ、野菜及びトウモロコシからなる群から選択される。特定の実施形態において、作物はイネである。特定の実施形態において、作物はイネであり、製剤又は組成物は水田に施用される。

【図面の簡単な説明】

【0055】

【図1】錠剤の分布プロファイルを調べるために活性成分が集められたサンプリング場所を示す。

【図2】サンプリング場所における活性成分の含量を示す。

【図3】農薬施用の3日後及び20日後のイネ茎中に吸収されたクロラントラニリプロールの濃度を示す。

【図4】施用の場所からの異なる距離で集められたイネ茎中に吸収されたクロラントラニリプロールの濃度を示す。

【発明を実施するための形態】

【0056】

本明細書で用いるところでは、用語「含む (comprises)」、「含む (comprising)」、「含む (includes)」、「含む (including)」、「有する (has)」、「有する (having)」又はそれらの任意の他の変形は、非排他的な包含に該当することを意図する。例えば、要素のリストを含む組成物、混合物、プロセス、方法、物品、又は装置は、それらの要素のみに必ずしも限定されず、明確にリストアップされていない又はそのような組成物、混合物、プロセス、方法、物品、又は装置に固有の他の要素を包含し得る。更に、それとは反対を明記されない限り、「又は」は包括的な又はを意味し、排他的な又はを意味しない。例えば、条件 A 又は B は、下記のいずれか 1 つによって満たされる：A は真実であり (存在し)、B は偽である (又は存在しない)、A は偽であり (又は存在せず)、B は真実である (又は存在する)、並びに A 及び B は両方とも真実である (又は存在する)。

【0057】

また、「a」又は「an」の使用は、本発明の要素及び構成要素を記載するために用いられる。これは、便宜上及び本発明の一般的な意味を与えるために行われるにすぎない。この記載は、1 つ又は少なくとも 1 つを包含すると読まれるべきであり、単数形は、また、特にはっきりと明記しない限り、複数形を包含する。

【0058】

値の範囲が列挙される場合、全体範囲は、表示される末端値を含むと見なされるべきである。また、本明細書で列挙されるいかなる数値範囲も、下限値から上限値までの全ての値を含むと理解される。例えば、重量比範囲が 1 : 50 と提示される場合、2 : 40、10 : 30、又は 1 : 3 等などの値が本明細書で明らかに列挙されることが意図されている。これらは、具体的に意図されるものの例にすぎず、列挙される最低値及び最高値の間の及びそれらを含む数値の全ての可能な組合せが、本出願では明記されていると考えられるべきである。

【0059】

本明細書で用いるところでは、用語「約」は、その値のプラス又はマイナス 10 % を意味する。

【0060】

一態様において、本開示は、本明細書において、農薬活性成分と；エンハンサー（ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネ

10

20

30

40

50

ートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む)と；分散剤(ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む)と；バインダーと；任意選択的に充填材とを含む組成物を含む製剤を提供する。

【0061】

別の態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：約0.1%~約20%の農薬活性成分と；約0.1%~約5%の少なくとも1種のエンハンサー(ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む)と；約0.1%~約10%の少なくとも1種の分散剤(ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む)と；約0.1%~約20%の少なくとも1種のバインダーと；約0.1%~約50%の少なくとも1種の充填材とを含む組成物を含む製剤を提供する。

10

【0062】

別の態様において、本開示は、本明細書において、組成物の総重量を基準として重量で：約0.1%~約20%の農薬活性成分と；約0.1%~約5%の少なくとも1種のエンハンサー(ここで、エンハンサーは、ジアルキルスルホスクシネートの塩、ラウリルスルフェートの塩、ラウリルベンゼンスルホネートの塩、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホネートの塩、若しくはアルキルナフチルスルフェートの塩、又はそれらの混合物を含む)と；約0.1%~約10%の少なくとも1種の分散剤(ここで、分散剤は、ポリカルボキシレート、フェノールスルホン酸縮合物、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマー、若しくはナフタレンスルホン酸縮合物、又はそれらの混合物を含む)と；約0.1%~約20%の少なくとも1種のバインダーと；約0.1%~約50%の少なくとも1種の充填材とを含む錠剤製剤を提供する。

20

【0063】

田畑を化学製品で処理するためのなどの、農学的用途におけるドローン又は無人航空機(UAV)の使用は、急速に拡大しつつある。

30

【0064】

本発明の一態様において、本明細書で開示される組成物及び製剤は、ドローン又は無人航空機(UAV)による配送のために有用である。

【0065】

用語「農薬活性成分」は、本明細書で用いるところでは、それらの混合物を含む、以下のクラス：除草剤、殺真菌剤、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、及び成長調整剤から選択されるものを包含する。

【0066】

本発明において有用な殺虫剤は、アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミピリド、アクリナトリン、アシノナピル、アフイドピロペン([ (3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル)オキシ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11H - ナフト[2, 1 - b]ピラノ[3, 4 - e]ピラン - 4 - イル]メチルシクロプロパンカルボキシレート)、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホスメチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンズピリモキサン、ピフェントリン、カップ - ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、ハウ酸塩、プロフラニリド、プロロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾール、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロロプラレトリン、クロルピリホス、クロルピリホス - e、クロルピリホ

40

50

ス - メチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロロプラレトリン、クロチアニジン、シアントラニリプロール、(3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - [(メチルアミノ)カルボニル]フェニル] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シクラニリプロール(3 - プロモ - N - [2 - プロモ - 4 - クロロ - 6 - [[(1 - シクロプロピルエチル)アミノ]カルボニル]フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シクロプロトリン、シクロキサプリド((5S, 8R) - 1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 2, 3, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - 9 - ニトロ - 5, 8 - エポキシ - 1H - イミダゾ[1, 2 - a]アゼピン)、シエノピラフェン、シフルメトフェン、シフルトリン、ベータシフルトリン、シハロジアミド、シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロロメソチアズ、ディルドリン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメハイポ、ジメトエート、ジンプロピリダズ、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、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、エトフェンブックス、イプシロン - メトフルトリン、エトキサゾール、酸化フェンブタズ、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン(2 - エチル - 3, 7 - ジメチル - 6 - [4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] - 4 - キノリニルメチルカーボネート)、フロニカミド、フルアザインドリジン、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロピン((E) - 2 - [[2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル] - (メトキシメチレン)ベンゼン酢酸メチル)、フルエンスルホン(5 - クロロ - 2 - [(3, 4, 4 - トリフルオロ - 3 - プテン - 1 - イル)スルホニル]チアゾール)、フルヘキサホン、フルオピラム、フルピプロール(1 - [2, 6 - ジクロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 5 - [(2 - メチル - 2 - プロペン - 1 - イル)アミノ] - 4 - [(トリフルオロメチル)スルフィニル] - 1H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル)、フルピラジフロン(4 - [[(6 - クロロ - 3 - ピリジニル)メチル](2, 2 - ジフルオロエチル)アミノ] - 2(5H) - フラノン)、フルピリミン、フルバリネート、タウフルバリネート、フルキサメタミド、ホノホス、ホルメタネート、ホスチアゼート、ガンマ - シハロトリン、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン([2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル)フェニル]メチル 2, 2 - ジメチル - 3 - [(1Z) - 3, 3, 3 - トリフルオロ - 1 - プロペン - 1 - イル]シクロプロパンカルボキシレート)、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドロメチルノン、イミダクロブリド、インドキサカルブ、殺虫石鹸、イソフェンホス、イソシクロセラム、カップ - テフルトリン、ラムダ - シハロトリン、ルフェヌロン、マラチオン、メペルフルトリン([2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル)フェニル]メチル(1R, 3S) - 3 - (2, 2 - ジクロロエテニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート)、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトブレン、メトキシクロル、メトフルトリン、メトキシフェノジド、イプシロン - メトフルトリン、イプシロン - モンフルオロトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン([2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル)フェニル]メチル 3 - (2 - シアノ - 1 - プロペン - 1 - イル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート)、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノピフルムロン、オキサミル、オキサゾスルフィル、パラチオン、パラチオンメチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホスファミドン、ピリミカルブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリフェンブート、ピフルブミド(1, 3, 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル)エチル]フェニル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル

10

20

30

40

50

、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン（（ E ） - 2 - [ [ [ 2 - [ （ 2 ， 4 - ジクロロフェニル ） アミノ ] - 6 - （ トリフルオロメチル ） - 4 - ピリミジニル ] オキシ ] メチル ] - （ メトキシメチレン ） ベンゼン酢酸メチル）、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロピジオン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフロル（ N - [ メチルオキシド [ 1 - [ 6 - （ トリフルオロメチル ） - 3 - ピリジニル ] エチル ] - 4 - スルファニリデン ] シアナミド）、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、カップ - テフルトリン、テルブホス、テトラクロラントラニリプロール、テトラクロルピンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン（ [ 2 ， 3 ， 5 ， 6 - テトラフルオロ - 4 - （ メトキシメチル ） フェニル ] メチル 2 ， 2 ， 3 ， 3 - テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート）、テトラニリプロール、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルトップ - ナトリウム、チオキサザフェン（ 3 - フェニル - 5 - （ 2 - チエニル ） - 1 ， 2 ， 4 - オキサジアゾール）、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム（ 2 ， 4 - ジオキソ - 1 - （ 5 - ピリミジニルメチル ） - 3 - [ 3 - （ トリフルオロメチル ） フェニル ] - 2 H - ピリド [ 1 ， 2 - a ] ピリミジニウム内塩）、トリフルムロン、チクロピラゾフロル、ゼータ - シベルメトリン、パチルス・チューリングシス（ *Bacillus thuringiensis* ）デルタ - エンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス又は昆虫病原性真菌などの殺虫剤である。

10

【 0 0 6 7 】

20

本発明において有用な除草剤は、（ b 1 ）光化学系 I I 阻害剤、（ b 2 ）アセトヒドロキシ酸合成酵素（ A H A S ）阻害剤、（ b 3 ）アセチル - C o A カルボキシラーゼ（ A C C a s e ）阻害剤、（ b 4 ）オーキシン模倣体、（ b 5 ） 5 - エノールピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸（ E P S P ）合成酵素阻害剤、（ b 6 ）光化学系 I 電子ダイパータ、（ b 7 ）プロトボルフィリノーゲンオキシダーゼ（ P P O ）阻害剤、（ b 8 ）グルタミン合成酵素（ G S ）阻害剤、（ b 9 ）非常に長い鎖の脂肪酸（ V L C F A ）エロンガーゼ阻害剤、（ b 1 0 ）オーキシン輸送阻害剤、（ b 1 1 ）フィトエンデサチュラーゼ（ P D S ）阻害剤、（ b 1 2 ） 4 - ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ（ H P P D ）阻害剤、（ b 1 3 ）ホモゲンチシン酸ソレネシルトランスフェラーゼ（ H S T ）阻害剤、（ b 1 4 ）セルロース生合成阻害剤、（ b 1 5 ）有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素化合物、アスラム、プロモブチド、シンメチリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミンアンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸及びピリブチカルブなどの他の除草剤、並びに（ b 1 6 ）除草剤薬害軽減剤；並びに（ b 1 ） ~ （ b 1 6 ）の化合物の塩から選択される除草剤である。

30

【 0 0 6 8 】

「光化学系 I I 阻害剤（ b 1 ）」は、Q B 結合ニッチで D 1 タンパク質に結合し、こうして葉緑体チラコイド膜における Q A から Q B への電子伝達をブロックする化合物である。光化学系 I I を通過するのをブロックされた電子は、一連の反応によって移行して、細胞膜を破壊する毒性化合物を形成し、葉緑体膨潤、膜漏洩、及び最終的に細胞破壊を引き起こす。Q B 結合ニッチは、3つの異なる結合部位を有する：結合部位 A は、アトラジンなどのトリアジン、ヘキサジノンなどのトリアジノン、及びプロマシルなどのウラシルと結合し、結合部位 B は、ジウロンなどのフェニル尿素と結合し、結合部位 C は、ベンタゾンなどのベンゾチアジアゾール、プロモキシニルなどのニトリル、及びピリデートなどのフェニルピリダジンと結合する。光化学系 I I 阻害剤の例としては、アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニル、クロルプロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスメディファム、デスメトリン、ジメフロム、ジメタメトリン、ジウロン、エチジムロン、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、アイオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニュロン、メタミトロン、メタベンズチ

40

50

アズロン、メトブロムロン、メトクスロン、メトリブジン、モノリニュロン、ネブロン、ペンタノクロル、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロパジン、ピリダフォル、ピリデート、シデュロン、シマジン、シメトリン、テブチウロン、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルプトリン及びトリエタジンが挙げられる。

【 0 0 6 9 】

「 A H A S 阻害剤 ( b 2 ) 」は、アセトラクテート合成酵素 ( A L S ) としても知られる、アセトヒドロキシ酸合成酵素 ( A H A S ) を阻害し、こうして、タンパク質合成及び細胞成長のために必要とされる、バリン、ロイシン及びイソロイシンなどの分岐鎖脂肪族アミノ酸の生成を阻害することによって植物を枯らす化合物である。 A H A S 阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロンメチル、ビスピリバックナトリウム、クロランスラムメチル、クロリムロンエチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファミロン、ジクロスラム、エタメトスルフロンメチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾンナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロンメチル、フルピルスルフロンナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロンメチル、イマザメタブンズメチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードフルフロンメチル ( ナトリウム塩を含む )、イオフェンスルフロン ( 2 - ヨード - N - [ [ ( 4 - メトキシ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル ) アミノ ] カルボニル ] ベンゼンスルホンアミド )、メソスルフロンメチル、メタゾスルフロン ( 3 - クロロ - 4 - ( 5 , 6 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1 , 4 , 2 - ジオキサジン - 3 - イル ) - N - [ [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル ) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド )、メトスラム、メトスルフロンメチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、ペノキスラム、プリミスルフロンメチル、プロポキシカルバゾンナトリウム、プロピリスルフロン ( 2 - クロロ - N - [ [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル ) アミノ ] カルボニル ] - 6 - プロピルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン - 3 - スルホンアミド )、プロスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバックメチル、ピリチオバックナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロンメチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロンメチル、トリアファモン ( N - [ 2 - [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル ) カルボニル ] - 6 - フルオロフェニル ] - 1 , 1 - ジフルオロ - N - メチルメタンスルホンアミド )、トリアスルフロン、トリベヌロンメチル、トリフロキシスルフロン ( ナトリウム塩を含む )、トリフルスルフロンメチル及びトリトスルフロンが挙げられる。

【 0 0 7 0 】

「 A C C a s e 阻害剤 ( b 3 ) 」は、植物における脂質及び脂肪酸合成の早期段階を触媒するのに関与している、アセチル C o A カルボキシラーゼ酵素を阻害する化合物である。脂質は、細胞膜の必須の構成要素であり、それらなしで、新しい細胞は生成することができない。アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害及びその後の脂質生成の欠如は、とりわけ、分裂組織などの活発な成長の領域において、細胞膜完全性の喪失をもたらす。最終的に、芽及び根茎成長が止まり、芽分裂組織及び根茎つぼみは枝枯し始める。 A C C a s e 阻害剤の例としては、アロキシジム、プトロキシジム、クレトジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキサホップ、キサロホップ、セトキシジム、テブラロキシジム及びトラルコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ P、フルアジホップ P、ハロキシホップ P 及びキサロホップ P などの分割形態並びにクロジナホッププロバルギル、シハロホップブチル、ジクロホップメチル及びフェノキサプロップ P エチルなどのエステル形態を含む。

【 0 0 7 1 】

オーキシンは、多くの植物組織における成長を調節する植物ホルモンである。「オーキシン模倣体 ( b 4 ) 」は、植物成長ホルモンオーキシンを模倣し、こうして無制御の及び

10

20

30

40

50

無秩序な成長を引き起こし、感受性種において植物枯死をもたらす化合物である。オーキシシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル(6-アミノ-5-クロロ-2-シクロプロピル-4-ピリジンカルボン酸)並びにそのメチル及びエチルエステル並びにそのナトリウム及びカリウム塩、アミノピラリド、ペナゾリンエチル、クロランベン、クラシホス、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2,4D、2,4DB、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハロウキシフェン(4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-2-ピリジンカルボン酸)、ハロウキシフェンメチル(4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-2-ピリジンカルボン酸メチル)、MCPA、MCPB、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2,3,6TBA、トリクロピル、及び4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-5-フルオロ-2-ピリジンカルボン酸メチルが挙げられる。

10

## 【0072】

「EPSP合成酵素阻害剤(b5)」は、チロシン、トリプトファン及びフェニルアラニンなどの芳香族アミノ酸の合成に関係している、酵素、5-エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸合成酵素を阻害する化合物である。EPSP阻害剤除草剤は、植物枝葉を通して容易に吸収され、成長点への師部に転流する。グリホサートは、この群に属する比較的非選択的な発芽後除草剤である。グリホサートには、エステル並びにアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム(セスキナトリウムを含む)及びトリメシウム(或いはまたスルホサートと命名される)などの塩が含まれる。

20

## 【0073】

「光化学系I電子ダイバータ(b6)」は、光化学系Iから電子を受け取り、数サイクル後に、ヒドロキシルラジカルを発生させる化合物である。これらのラジカルは、極めて反応性が高く、膜脂肪酸及びクロロフィルなどの、不飽和脂質を容易に破壊する。これは、細胞膜完全性を破壊し、その結果細胞及び細胞小器官は、「漏洩し」、迅速な葉のしおれ及び乾燥を、そして最終的に植物枯死をもたらす。この第2タイプの光合成阻害剤の例としては、ジクワット及びパラコートが挙げられる。

## 【0074】

「PPO阻害剤(b7)」は、プロトポルフィリノーゲン酸化酵素を阻害し、細胞膜を破裂させ、細胞液を漏出させる、高反応性の化合物の形成を急速に植物中にもたらし化合物である。PPO阻害剤の例としては、アシフルオルフェンナトリウム、アザフェニジン、ベンズフェンジゾン、ピフェノックス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾンエチル、クロメトキシフェン、シニドンエチル、フルアゾレート、フルフェンピルエチル、フルミクロラックベンチル、フルミオキサジン、フルオログリコフェンエチル、フルチアセットメチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアールギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾル、ピラクロニル、ピラフルフェンエチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、トリフルジモキサジン(ジヒドロ-1,5-ジメチル-6-チオキソ-3-[2,2,7-トリフルオロ-3,4-ジヒドロ-3-オキソ-4-(2-プロピン-1-イル)-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル]-1,3,5-トリアジン-2,4(1H,3H)-ジオン)及びチアフェナシル(N-[2-[2-クロロ-5-[3,6-ジヒドロ-3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)-1(2H)-ピリジニル]-4-フルオロフェニル]チオ]-1-オキソプロピル]-アラニン酸メチル)が挙げられる。

30

40

## 【0075】

「GS阻害剤(b8)」は、植物がアンモニアをグルタミンへ変換するために利用する、グルタミンシンセターゼ酵素の活性を阻害する化合物である。結果として、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物損傷は、たぶん、アンモニア毒性と、他の代謝プロセスにとって必要とされるアミノ酸の不足との複合効果のために起こる。GS阻害剤には、グルホシネート並びにそのエステル及びグルホシネートアンモニウムなどの塩

50

並びに他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート P ( ( 2 S ) - 2 - アミノ - 4 - ( ヒドロキシメチルホスフィニル ) ブタン酸 ) 及びピラナホスが含まれる。

【 0 0 7 6 】

「 V L C F A エロンガーゼ阻害剤 ( b 9 ) 」は、エロンガーゼを阻害する、多種多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、V L C F A の生合成に関係している葉緑体中に又は葉緑体の近くに位置する酵素の 1 つである。植物において、非常に長い鎖の脂肪酸は、葉の表面での乾燥を防ぎ、花粉粒に安定性を提供する疎水性ポリマーの主要な構成要素である。そのような除草剤には、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド、フェノキサスルホン ( 3 - [ [ ( 2 , 5 - ジクロロ - 4 - エトキシフェニル ) メチル ] スルホニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 , 5 - ジメチルイソオキサゾール ) 、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド - M ( ( 2 R ) - N , N - ジエチル - 2 - ( 1 - ナフタレニルオキシ ) プロパンアミド ) 、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロバクロール、プロピソクロール、ピロキサスルホン、及びテニルクロールが含まれ、S メトラクロール及びクロロアセトアミド及びオキシアセトアミドなどの分割形態を含む。

10

【 0 0 7 7 】

「オーキシン輸送阻害剤 ( b 1 0 ) 」は、オーキシンキャリアタンパク質と結合することによってなどの、植物におけるオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナプタラム ( N - ( 1 - ナフチル ) フタルアミド酸及び 2 - [ ( 1 - ナフタレニルアミノ ) カルボニル ] 安息香酸としても知られる ) が挙げられる。

20

【 0 0 7 8 】

「 P D S 阻害剤 ( b 1 1 ) 」は、フィトエンデサチュラーゼ段階においてカロテノイド生合成進路を阻害する化合物である。P D S 阻害剤の例としては、m - ベフルブタミド、ベフルブタミド、ジフルフェニカン、フルリドン、フルロクロリドン、フルルタモンノルフルルゾン ( f l u r t a m o n e n o r f l u r z o n ) 及びピコリナフェンが挙げられる。

【 0 0 7 9 】

「 H P P D 阻害剤 ( b 1 2 ) 」は、また、4 - ヒドロキシ - フェニル - ピルベートジオキシゲナーゼの合成の生合成を阻害する化学物質である。H P P D 阻害剤の例としては、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピシクロピロン ( 4 - ヒドロキシ - 3 - [ [ 2 - [ ( 2 - メトキシエトキシ ) メチル ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジニル ] カルボニル ] ピシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 3 - エン - 2 - オン ) 、フェンキノトリオン ( 2 - [ [ 8 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 4 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 3 - オキソ - 2 - キノキサリニル ] カルボニル ] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン ) 、イソキサクワルトール、イソキサフルトール、メソトリオン、ピラスルホトール、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、スルコトリオン、テフリルトリオン、テンボトリオン、トルピラレート ( 1 - [ [ 1 - エチル - 4 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 2 - メチル - 4 - ( メチルスルホニル ) ベンゾイル ] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ] オキシ ] エチルメチルカーボネート ) 、トブラメゾン、5 - クロロ - 3 - [ ( 2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル ) カルボニル ] - 1 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 2 ( 1 H ) - キノキサリノン、4 - ( 2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン、4 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 6 - [ ( 2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル ) カルボニル ] - 2 - メチル - 1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 , 5 ( 2 H , 4 H ) - ジオン、5 - [ ( 2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル ) カルボニル ] - 2 - ( 3 - メトキシフェニル ) - 3 - ( 3 - メトキシプロピル ) - 4 ( 3 H ) - ピリミジノン、2 - メチル - N - ( 4 - メチル - 1 , 2 , 5 - オキサジアゾール - 3 - イル ) - 3 - ( メチルスルフィニ

30

40

50

ル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド及び2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドが挙げられる。

【0080】

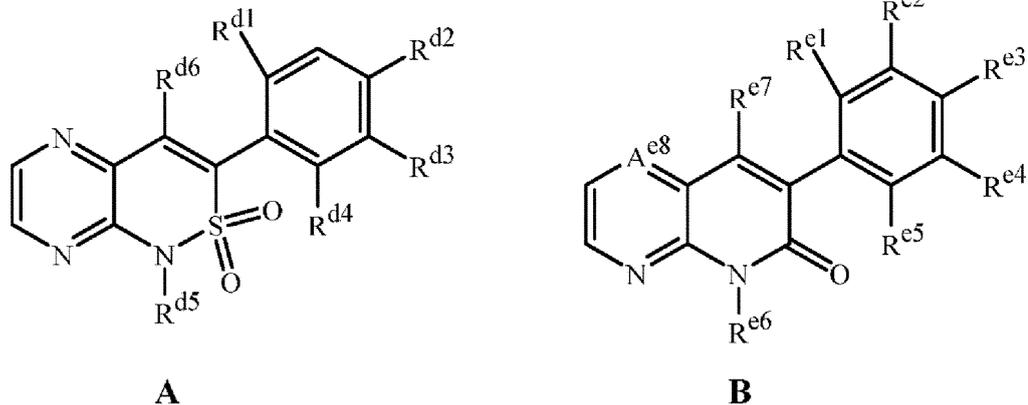
「HST阻害剤(b13)」は、ホモゲンチシン酸塩を2 - メチル - 6 - ソラニル - 1, 4 - ベンゾキノンに変換する植物の能力を攪乱し、それによってカロテノイド生合成を攪乱する。HST阻害剤の例としては、ハロキシジン、ピリクロル、3 - (2 - クロロ - 3, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1, 5 - ナフチリジン - 2 (1H) - オン、7 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド[2, 3 - b]ピラジン - 6 (5H) - オン及び4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノンが挙げられる。

10

【0081】

HST阻害剤には、また、式A及びBの化合物が含まれる。

【化1】



20

式中、 $R^{d1}$  は、H、Cl又は $CF_3$ であり； $R^{d2}$  は、H、Cl又はBrであり； $R^{d3}$  は、H又はClであり； $R^{d4}$  は、H、Cl又は $CF_3$ であり； $R^{d5}$  は、 $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 又は $CH_2CHF_2$ であり； $R^{d6}$  は、OH、又は $-OC(=O)-i-Pr$ であり； $R^{e1}$  は、H、F、Cl、 $CH_3$ 又は $CH_2CH_3$ であり； $R^{e2}$  は、H又は $CF_3$ であり； $R^{e3}$  は、H、 $CH_3$ 又は $CH_2CH_3$ であり； $R^{e4}$  は、H、F又はBrであり； $R^{e5}$  は、Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 又は $CH_2CH_3$ であり； $R^{e6}$  は、H、 $CH_3$ 、 $CH_2CHF_2$ 又は $C(CH_3)_2$ であり； $R^{e7}$  は、OH、 $-OC(=O)Et$ 、 $-OC(=O)-i-Pr$ 又は $-OC(=O)-t-Bu$ であり； $A^{e8}$  は、N又はCHである。

30

【0082】

「セルロース生合成阻害剤(b14)」は、ある種の植物においてセルロースの生合成を阻害する。それらは、若い又は急速に成長中の植物に発芽前又は発芽後早期に施用される場合に最も有効である。セルロース生合成阻害剤の例としては、クロルチアミド、ジクロロベニル、フルボキサム、インダジフラム(N2 - [(1R, 2S) - 2, 3 - ジヒドロ - 2, 6 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル] - 6 - (1 - フルオロエチル) - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 - ジアミン)、イソキサベン及びトリアジフラムが挙げられる。

40

【0083】

「他の除草剤(b15)」には、有糸分裂攪乱物質(例えば、フラムプロップMメチル及びフラムプロップMイソプロピル)、有機ヒ素化合物(例えば、DSMA、及びMSMA)、7, 8 - ジヒドロプテロイン酸合成酵素阻害剤、葉緑体イソプレノイド合成阻害剤及び細胞壁生合成阻害剤などの、様々な異なる作用モードによって動作する除草剤が含ま

50

れる。他の除草剤には、未知の作用モードを有する、又は ( b 1 ) ~ ( b 1 4 ) にリストアップされた特定の 카테고리に入らない、又は上でリストアップされた作用モードの組合せによって動作するそれらの除草剤が含まれる。他の除草剤の例としては、アクロニフェン、アスラム、アミトロール、ピクスロゾン、プロモブチド、シンメチリン、クロマゾン、クミルロン、シクロピリモレート ( 6 - クロロ - 3 - ( 2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ ) - 4 - ピリダジニル - 4 - モルホリンカルボキシレート )、ダイムロン、ジフェンゾコート、エトベンザニド、フルオメツロン、フルレノール、ホサミン、ホサミンアンモニウム、ダゾメット、ダイムロン、イプフェンカルバゾン ( 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - N - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - N - ( 1 - メチルエチル ) - 5 - オキソ - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - カルボキサミド )、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブ及び 5 - [ [ ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) メトキシ ] メチル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - ( 3 - メチル - 2 - チエニル ) イソオキサゾール並びにテトフルピロリメットが挙げられる。

10

#### 【 0 0 8 4 】

本発明において有用な殺真菌剤は、アシベンゾラル - S - メチル、アルジモルフ、アマトクトラジン、アミノピリフェン、アミスルプロム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル ( ベナラキシル - M を含む )、ベノダニル、ベノミル、ベンチアパリカルブ ( ベンチアパリカルブ - イソプロピルを含む )、ベンゾピンジフルピル、ベトキサジン、ピナバクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピキサフェン、プラストサイジン - S、ボスカリド、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルボキシシン、カルプロバミド、カプタホール、キャプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、クモキシストロビン、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジクロベンチアゾクス、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール ( ジニコナゾール M を含む )、ジノカップ、ジピメチトロン、ジチアノン、ジチオラン、ドデモルフ、ドジン、エコナゾール、エタコナゾール、エジフェンホス、エノキサストロビン ( エネストロブリンとしても知られる )、エポキシコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、ファミキサドン、フェナミドン、フェナミンストロビン、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、酢酸フェンチン、水酸化フェンチン、フェルバム、フェリムゾン、フロメトキン、フロリルピコキサミド、フルオピモミド、フルアジナム、フルジオキサニル、フルフェノキシストロビン、フルインダピル、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、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、フサライド ( フタリドとしても知られる )、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、グアザチン、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、インピルフルキサム、イオジカルブ、イブコナゾール、イプフェントリフルコナゾール、イプフルフェノキン、イソフェタミド、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソフルシプラム、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシム - メチル、ランコトリオン、マンコゼブ、マンジプロバミド、マンデストロビン、マネブ、マパニピリン、メフェントリフルコナゾール、メプロニル、メブチルジノカップ、メタラキシル ( メタラキシル - M / メフェノキサムを含む )、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メチラム、メトミノストロビン、メチルテトラプロール、メトラフェノン、マイクロブタニル、ナフチチン、ネオ - アソジン ( メタンアルソン酸第二鉄 )、ヌアリモル、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、オキソリン酸、オキスポコナゾ

20

30

40

50

ール、オキシカルボキシン、オキシテトラサイクリン、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、ペルフラゾエート、亜リン酸（その塩、例えば、ホセチル - アルミニウムを含む）、ピコキシストロピン、ピベラリン、ポリオキシン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、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（A d e p i d y n（登録商標））、ピラクロストロピン、ピラメトストロピン、ピラプロポイン、ピラオキシストロピン、ピラジフルミド、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブタカルブ、ピリダクロメチル、ピリフェノックス、ピリオフェノン、ベリソキサゾール、ピリメタニル、ピリフェノックス、ピロールニトリン、ピロキロン、キンコナゾール、キンメチオネート、キノフメリン、キノキシフェン、キントゼン、シルチオファム、セダキサン、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフサラム、テクロフタラム、テクナゼン、テルピナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネート、チオファネート - メチル、チラム、チアジニル、トルクロホス - メチル、トルプロカルブ、トリフルアニド、トリアジメフォン、トリアジメノール、トリアリモル、トリアゾキシド、三塩基性硫酸銅、トリクロピリカルブ、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルミゾール、トリモプルハミド（t r i m o p r h a m i d e）トリシクラゾール、トリフロキシストロピン、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート（バリフェナルとしても知られる）、ピンクロゾリン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド及び 1 - [ 4 - [ 4 - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル ] - 2 - チアゾリル ] - 1 - ピペリジニル ] - 2 - [ 5 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] エタノンなどの殺真菌剤；フルオピラム、スピロテトラマト、チオジカルブ、ホスチアゼート、アバメクチン、イプロジオン、フルエンシルホン、ジメチルジスルフィド、チオキサザフェン、1 , 3 - ジクロロプロペン（1 , 3 - D）、メタム（ナトリウム及びカリウム）、ダゾメット、クロロピクリン、フェナミホス、エトプロホス、カズサホス、テルブホス、イミシアホス、オキサミル、カルボフラン、チオキサザフェン、パチルス・フィルムス（B a c i l l u s f i r m u s）及びパステウリア・ニシザワエ（P a s t e u r i a n i s h i z a w a e）などの殺線虫剤；ストレプトマイシンなどに殺菌剤；アミトラズ、キノメチオネート、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホル、ジエノクロール、エトキサゾール、フェナザキン、酸化フェンブタズ、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾックス、プロバルギット、ピリダベン及びテブフェンピラドなどのダニ駆除剤である。

## 【0085】

特定の実施形態において、農薬活性成分は殺虫剤である。

## 【0086】

用語「殺虫剤」は、本明細書で用いるところでは、殺生、損傷、遅延、成長の阻害、方向感覚の喪失、生殖の阻害等を含むが、それらに限定されない、昆虫成長への防除効果又は修正効果を有する全ての試剤を包含する。

## 【0087】

特定の実施形態において、農薬活性成分は、ジアミド、ネオニコチノイド、若しくはネライストキシン類似体殺虫剤、又はそれらの混合物である。いくつかの実施形態において、農薬活性成分は、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、テトラニリプロール、シクラニリプロール、シハロジアミド、テトラ - クロラントラニリプロール、プロモアントラニリプロール、ジクロラントラニリプロール、チアメトキサム、クロチアニジン、チアクロプリド、モノスルタップ、若しくはビスルタップ、又はそれらの混合物である。

## 【0088】

特定の実施形態において、農薬活性成分はアントラニルアミドである。

## 【0089】

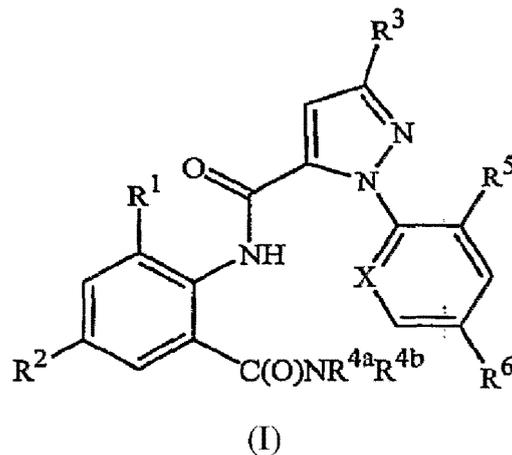
用語「アントラニルアミド」は、本明細書で用いるところでは、多数の経済的に重要な

農業及び非農業無脊椎有害生物に対して殺虫剤活性を有するクラスのカルボキサミド殺節足動物剤を意味する。アントラニルアミドは、リアノジン受容体、細胞内カルシウムチャンネルのクラスに結合することによってカルシウム恒常性に影響を及ぼす。その結合時に、カルシウムチャンネルは開いており、カルシウムイオンを細胞質中へ放出する。カルシウムイオン蓄えの枯渇は、昆虫のまひ症及び死をもたらす。アントラニルアミドは、アール環、典型的にはフェニルの炭素原子に結合したピシナルカルボキサミド置換基を含む分子構造で化学的に特徴付けられ、ここで、1つのカルボキサミド部分は、カルボニル炭素を介して結合し、他のカルボキサミド部分は、窒素原子を介して結合している。

【0090】

いくつかの実施形態において、アントラニルアミドは、式 I の化合物、それらの N - オキシド及び塩から選択される。

【化 2】



式中、X は、N、CF、CCl、CBr 又は Cl であり；R<sup>1</sup> は、H、CH<sub>3</sub>、Cl、Br 又は F であり；R<sup>2</sup> は、H、F、Cl、Br 又は -CN であり；R<sup>3</sup> は、F、Cl、Br、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル 又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルコキシであり；R<sup>4a</sup> は、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、シクロプロピルメチル 又は 1 - シクロプロピルエチルであり；R<sup>4b</sup> は、H 又は CH<sub>3</sub> であり；R<sup>5</sup> は、H、F、Cl 又は Br であり；R<sup>6</sup> は、H、F、Cl 又は Br である。

【0091】

いくつかの実施形態において、アントラニルアミドは、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、テトラニリプロール、シクラニリプロール、シハロジアミド、プロモアントラニリプロール、ジクロラントラニリプロール、若しくはテトラ - クロラントラニリプロール、又はそれらの混合物である。他のアントラニルアミド及びそれらの調製方法は、米国特許第 6,747,047 号明細書、国際公開第 2003/015519 号パンフレット、国際公開第 2004/067528 号パンフレット、国際公開第 2006/062978 号パンフレット及び国際公開第 2008/069990 号パンフレットに詳細に記載されており、それらは、参照により本明細書に援用される。

【0092】

いくつかの実施形態において、アントラニルアミドは、クロラントラニリプロール、若しくはシアントラニリプロール、又はそれらの混合物である。

【0093】

クロラントラニリプロールは、アントラニル酸ジアミドクラスの殺虫剤であり、化学名 5 - プロモ - N - [ 4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル)フェニル ] - 2 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル)ピラゾール - 3 - カルボキサミドを有し、Rynaxypr (登録商標)として FMC Corporation によって商標登録されている。クロラントラニリプロールは、リアノジン受容体アゴニストであり、トウモロコシ、棉、ブドウ、イネ及びジャガイモなどの、多種多様な作物を保護するために使用され

ている。クロラントラニリプロールに曝された昆虫は、一般的な昏睡及び筋まひを示し、これに最終的に死が続く。研究結果は、クロラントラニリプロールが哺乳類リアノジン受容体よりも昆虫リアノジン受容体に対して優れた差別的選択性を示すことを示している。この選択性は、クロラントラニリプロールで観察される哺乳類安全性の主要因であるように思われる。

【0094】

シアントラニリプロールは、化学名3 - プロモ - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - N - [ 4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - [ ( メチルアミノ ) カルボニル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドを有し、C y a z y p y r ( 登録商標 ) として F M C C o r p o r a t i o n によって商標登録されている。シアントラニリプロールは、フェニル環に結合した塩素原子がシアノ基で置き換えられているクロラントラニリプロールであるカルボキサミドである。シアントラニリプロールは、タマネギ、ジャガイモ及びトマトなどの作物におけるコナジラミ、アザミウマ、アブラムシ、ミバエ、及びフルーツワームの防除用の殺虫剤として使用することができる。それは、リアノジン受容体アゴニストとしての役割を有する。

10

【0095】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、重量で組成物の約1%～約10%、約1%～約8%、約1%～約7%、約1%～約6%、約1%～約5.5%、約1%、約2.5%又は約5%でアントラニルアミドを含む。特定の実施形態において、アントラニルアミドはクロラントラニリプロールである。

20

【0096】

活性成分の効能及び化学的安定性並びに配合組成物の物理的安定性は、製剤中の不活性成分によって影響され得、好適な不活性成分は、活性成分の分解を引き起こさず、施用時にその活性を実質的に減少させない、又は長期貯蔵時に感知できる沈澱若しくは結晶形成を引き起こさないものであるべきである。さらに、不活性成分は、植物毒性がなく、且つ、環境上安全であるべきである。ある特定の製剤において、不活性成分は、植物若しくは節足動物有害生物中への浸透若しくは吸収を容易にすることによって、又は洗い流しへの抵抗を増加させることによって活性成分の生物学的性能を高めることさえできる。

【0097】

特定の実施形態において、エンハンサーは、ナトリウムジアルキルスルホスクシネート、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルベンゼンスルホン酸ナトリウム、脂肪アルコール誘導体、アルキルナフチルスルホン酸ナトリウム、スルホコハク酸ジオクチルナトリウム、アルキルナフチル硫酸ナトリウム、又はそれらの混合物を含む。

30

【0098】

特定の実施形態において、エンハンサーは、Geropon ( 登録商標 ) S D S、A e r o s o l ( 登録商標 ) M A - 8 0 I、A e r o s o l ( 登録商標 ) O T シリーズ、M U L T I W E T <sup>T M</sup> M O - 8 5 P、M O R W E T ( 登録商標 ) E F W、B E R O L <sup>T M</sup> 7 9 0 A、R H O D A C A L ( 登録商標 ) D S 1 0、S T E P W E T ( 登録商標 ) D F - 9 0、T e r g i t o l <sup>T M</sup> W - 6 1 0、G E R O P O N ( 登録商標 ) L W E T F、G E R O P O N ( 登録商標 ) L W E T P、T e r w e t ( 登録商標 ) 1 0 0 4、T e r w e t ( 登録商標 ) 1 0 1 0、P E T R O ( 登録商標 ) A A、M O R W E T ( 登録商標 ) I P、S U P R A G I L ( 登録商標 ) W P、若しくはS U R F O M ( 登録商標 ) H R B、又はそれらの混合物を含む。

40

【0099】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、総重量で、約0.1%～約5%の、ナトリウムジアルキルスルホスクシネートを含む少なくとも1種のエンハンサーを含む。

【0100】

用語「ナトリウムジアルキルスルホスクシネートを含むエンハンサー」は、本明細書で用いるところでは、エンハンサーが、有害生物を防除するのに有効であるレベルまで作物

50

又は牧草による活性成分の効果的な吸収を容易にすることができる限り、ナトリウムジアルキルスルホスクシネートがエンハンサーの主構成要素であるかどうかに関係なく、ナトリウムジアルキルスルホスクシネートと任意選択的に1種以上の他の物質とを含有する任意のエンハンサーを意味する。特定の実施形態において、ナトリウムジアルキルスルホスクシネートは、エンハンサーの主構成要素である。特定の実施形態において、エンハンサーは、重量で、約50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%又は98%超のナトリウムジアルキルスルホスクシネートを含む。特定の実施形態において、エンハンサーは、組成物の他の構成要素と混合した後に固体形態にある。特定の実施形態において、エンハンサーは、組成物の任意の構成要素と混合する前に固体形態にある。

10

## 【0101】

ナトリウムジアルキルスルホスクシネートを含む好適なエンハンサーは、公知であり、Geropon (登録商標) SDS、Aerosol (登録商標) MA-80I、Aerosol (登録商標) OTシリーズ、MULTIWET™ MO-85P、及びMORWET (登録商標) EFWを含むが、それらに限定されない。

## 【0102】

特定の実施形態において、エンハンサーはGeropon (登録商標) SDSである。Geropon (登録商標) SDSは、乾燥製剤用の低使用率、高性能湿潤剤である。

## 【0103】

特定の実施形態において、エンハンサーは、Aerosol (登録商標) OT-B又はAerosol (登録商標) OT-75である。Aerosol (登録商標) OT-B及びAerosol (登録商標) OT-75は、表面張力を低下させるために並びに吸収性及び浸透を増加させるために利用することができる、且つ、界面への非常に迅速な移行を提供する湿潤剤、乳化剤、帯電防止剤/軟化剤などの、多目的アニオン界面活性剤である。

20

## 【0104】

特定の実施形態において、エンハンサーは、重量で組成物の約0.1%~約4%、約0.1%~約3%、約0.1%~約2%、約0.2%~約2%、約0.3%~約2%、約0.3%~約1.8%、約0.3%~約1.5%、約0.3%~約1.2%、約0.3%~約1%、約0.5%~約1%、約0.6%~約1%、約0.7%~約1%、又は約0.8%である。

30

## 【0105】

特定の実施形態において、分散剤は、Geropon (登録商標) T/36、Geropon (登録商標) TA-72、Geropon (登録商標) SC-213、Geropon (登録商標) Ultrasperse、Duramax (登録商標) D-205、Duramax (登録商標) D-305、Duramax (登録商標) D-518、Tersperse (登録商標) 2500、Tersperse (登録商標) 2700、Atlometasperse™ 550S、Tamol™ 731 SD、Tamol™ DN、YUS-TXC、Pluronic (登録商標) PE 10400、MORWET™ D-360、MORWET™ D-110、Morwet (登録商標) D-425、Tamol™ FB P1、又はTamol™ NN8906を含む。

40

## 【0106】

特定の実施形態において、本明細書で開示される組成物は、総重量で、約0.1%~約10%の、ポリカルボキシレートを含有少なくとも1種の分散剤を含む。

## 【0107】

用語「ポリカルボキシレートを含有分散剤」は、本明細書で用いるところでは、分散剤が、液体本体における活性成分の拡散及び均等分布を容易にすることができる限り、ポリカルボキシレートが分散剤の主構成要素であるかどうかに関係なく、ポリカルボキシレートと任意選択的に1種以上の他の物質とを含有する任意の分散剤を意味する。特定の実施形態において、ポリカルボキシレートは、分散剤の主構成要素である。特定の実施形態に

50

において、分散剤は、重量で、約50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%又は98%超のポリカルボキシレートを含む。特定の実施形態において、分散剤は、組成物の他の構成要素と混合した後に固体形態にある。特定の実施形態において、分散剤は、組成物の任意の構成要素と混合する前に固体形態にある。

【0108】

分散剤は、本明細書で用いるところでは、冷たい、硬水（例えば、約300ppm超の炭酸カルシウムを含有する、特に、組成物が不均等にまき散らされる場合に、それに組成物が適用される）などの、液体本体における活性成分の拡散及び均等分布を容易にすることができる。

【0109】

ポリカルボキシレートを含む好適な分散剤は、公知であり、Geropon（登録商標）T/36、Geropon（登録商標）TA-72、Geropon（登録商標）SC-213、Geropon（登録商標）Ultrasperse、Duramax（登録商標）D-205、Duramax（登録商標）D-305、Duramax（登録商標）D-518、Tersperse（登録商標）2500、Tersperse（登録商標）2700、Atllox metaspense<sup>TM</sup> 550S、及びTamol<sup>TM</sup> 731 SDを含むが、それらに限定されない。

【0110】

特定の実施形態において、分散剤はTersperse（登録商標）2700である。Tersperse（登録商標）2700は、水和性顆粒剤製剤での使用のために主に開発された酸樹脂コポリマーベースの分散剤（界面活性剤）である。

【0111】

特定の実施形態において、分散剤はGeropon（登録商標）T/36である。Geropon（登録商標）T/36は、多目的のナトリウムポリカルボキシレート、非常に高い性能の分散性、相溶性キレート剤である。

【0112】

特定の実施形態において、分散剤はDuramax（登録商標）D-205である。

【0113】

特定の実施形態において、分散剤は、重量で組成物の約0.5%～約10%、約0.5%～約8%、約0.5%～約7%、約0.5%～約6%、約0.5%～約5%、約0.8%～約5%、約1%～約5%、約1.2%～約5%、約1.5%～約5%、約1.7%～約5%、約2%～約5%、約2%～約4.5%、約2%～約4%、約2%～約3.5%、約2%～約3%、約2.2%～約2.8%、約2.4%～約2.6%、又は約2.5%である。

【0114】

特定の実施形態において、エンハンサーはGeropon（登録商標）SDSであり、分散剤はTersperse（登録商標）2700である。特定の実施形態において、エンハンサーはAerosol（登録商標）OT-Bであり、分散剤はDuramax（登録商標）D-205である。特定の実施形態において、エンハンサーはAerosol（登録商標）OT-75であり、分散剤はGeropon（登録商標）T/36である。

【0115】

エンハンサー及び分散剤の好ましい範囲は、拡散性又は浸透の観点からクロラントラニリプロール含有錠剤組成物の効能を向上させることができる。特定の実施形態において、エンハンサーと分散剤との間の比は、重量で約1:1～1:5、1:1～1:4、1:2～1:4又は1:3～1:4の範囲にあり得る。特定の実施形態において、比は重量で8:25である。特定の実施形態において、比は重量で約1:3である。

【0116】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、約0.1%～約40%の少なくとも1種の酸；及び約0.1%～約40%の少なくとも1種のアルカリを更に含む。

【0117】

10

20

30

40

50

酸及びアルカリは、本明細書で使用するところでは、一般に一緒に行動して水との接触時に組成物の解体及び活性成分の拡散を容易にするガスを発生させる。特定の実施形態において、組成物は、組成物の炭酸塩構成要素と反応して二酸化炭素を遊離させることができる固体酸を含む。酸は、コハク酸、D, L-酒石酸、L-酒石酸、酒石酸、アルカリ金属硫酸塩、乳酸、アジピン酸、クエン酸、アルカリ金属クエン酸塩、アルカリ金属リン酸塩、アルカリ金属フタル酸塩及びp-トルエンスルホン酸、リンゴ酸、マレイン酸、マロン酸及びシュウ酸等などの、とりわけ多価有機酸である水溶性の酸性物質であることができる。特定の実施形態において、酸はD, L-酒石酸である。

【0118】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、重量で組成物の約0.5% ~ 約25%、約1% ~ 約25%、約5% ~ 約25%、約10% ~ 約25%、約15% ~ 約25%、約16% ~ 約25%、約17% ~ 約25%、約18% ~ 約25%、約19% ~ 約25%、約20% ~ 約25%、約20% ~ 約24%、約20% ~ 約23%、約20% ~ 約22%、又は約21%で酸を含む。 10

【0119】

アルカリは、酸と反応して二酸化炭素源を提供する無機塩基である。これらの塩の中で、ナトリウム及びカリウムのものが、良好な溶解性及び低い費用のために好ましい。アルカリは、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム、炭酸カルシウム及び重炭酸カルシウムなどの、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩であることができる。 20

【0120】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、重量で組成物の約0.5% ~ 約40%、約1% ~ 約40%、約5% ~ 約40%、約10% ~ 約40%、約15% ~ 約40%、約20% ~ 約40%、約25% ~ 約40%、約30% ~ 約40%、約35% ~ 約40%、約38%でアルカリを含む。

【0121】

特定の実施形態において、アルカリは、重炭酸塩及び炭酸塩、例えば、重炭酸ナトリウム及び炭酸ナトリウム、又は重炭酸カリウム及び炭酸カリウムの混合物である。重炭酸塩と炭酸塩との間の比は、重量で約1:10 ~ 10:1、約1:5 ~ 10:1、約1:3 ~ 10:1、約1:2 ~ 10:1、約1:1 ~ 10:1、約2:1 ~ 10:1、約3:1 ~ 10:1、約3:1 ~ 9:1、約3:1 ~ 8:1、約3:1 ~ 7:1、約3:1 ~ 6:1、約3:1 ~ 5:1、約3:1 ~ 4:1、約3.5:1 ~ 4:1、又は約3.7:1の範囲にあり得る。 30

【0122】

特定の実施形態において、重炭酸塩及び炭酸塩は、それぞれ、重炭酸ナトリウム及び炭酸ナトリウムであり、ここで、重炭酸ナトリウムは、重量で組成物の約0.5% ~ 約40%、約1% ~ 約40%、約5% ~ 約40%、約10% ~ 約40%、約15% ~ 約40%、約20% ~ 約40%、約25% ~ 約40%、約25% ~ 約35%、約27% ~ 約33%、約30%であり、炭酸ナトリウムは、重量で組成物の約1% ~ 約40%、約1% ~ 約30%、約1% ~ 約20%、約2% ~ 約20%、約3% ~ 約20%、約3% ~ 約18%、約3% ~ 約15%、約3% ~ 約12%、約3% ~ 約10%、約5% ~ 約10%、約6% ~ 約10%、約7% ~ 約10%、又は約8%である。特定の実施形態において、重炭酸塩及び炭酸塩は、それぞれ、重炭酸カリウム及び炭酸カリウムであり、ここで、重炭酸カリウムは、重量で組成物の約0.5% ~ 約40%、約1% ~ 約40%、約5% ~ 約40%、約10% ~ 約40%、約15% ~ 約40%、約20% ~ 約40%、約25% ~ 約40%、約25% ~ 約35%、約27% ~ 約33%、約30%であり、炭酸カリウムは、重量で組成物の約1% ~ 約40%、約1% ~ 約30%、約1% ~ 約20%、約2% ~ 約20%、約3% ~ 約20%、約3% ~ 約18%、約3% ~ 約15%、約3% ~ 約12%、約3% ~ 約10%、約5% ~ 約10%、約6% ~ 約10%、約7% ~ 約10%、又は約8%である。 40

【0123】

重炭酸塩及び/又は炭酸塩対酸の比は、広い限界内で変わることができる。例えば、本明細書で記載される組成物は、重炭酸塩及び/又は炭酸塩の1当量当たり0.05~2(例えば、0.1、0.2、0.3、0.4、0.5、0.55、0.6、0.7、0.8、0.9、1、1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、又は1.9)当量の水溶性酸性物質を含有し得る。

【0124】

用語「当量」は、酸-塩基センスで本明細書では用いられ、固体酸の1グラム分子量は、 $\text{NaHCO}_3$ の1グラム分子量の、又は $\text{Na}_2\text{CO}_3$ の0.5グラム分子量の当量と見なされる。しかしながら、より少ない量が用いられてもよく、量は、決定的に重要であるわけではない。重炭酸塩の各当量に対して約0.05当量超の酸が存在することだけが必

10

【0125】

本明細書で開示される組成物は、総重量で、約0.1%~約20%(例えば、約1%~約15%、約1%~約10%、約1%~約8%、約1%~約7%、約1%~約6%、約1%~約5.5%、約2%~約5.5%、約3%~約5.5%、約3%、又は約5.5%)の少なくとも1種のバインダーを含む。バインダーは、組成物の様々な構成要素と一緒に結合して組成物の完全性を支援し、組成物の製造、パッケージング、輸送及び配送中の微粒子の生成を減らす。好適なバインダーには、ポリエチレングリコール(PEG)、マルトース、トレハロース、ソルビトール、マルチトール、ポリビニルピロリドン(PVP)、ポリビニルピロリドン架橋剤(PVPP)、二塩基性リン酸カルシウム、スクロース、グルコース、コーン(トウモロコシ)スターチ、変性セルロース、アルギン酸、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシルナトリウムメチルセルロース、若しくはコポリドン、又はそれらの混合物が含まれる。特定の実施形態において、バインダーはPEGを含む。特定の実施形態において、バインダーは、PEG200、PEG1000、PEG2000、PEG4000、PEG6000、PEG8000、及びPEG10000からなる群から選択される少なくとも1つを含む。特定の実施形態において、バインダーはPEG6000を含む。

20

【0126】

本明細書で開示される組成物は、総重量で、約0.1%~約50%(例えば、約0.1%~約45%、約0.5%~約45%、約1%~約45%、1%~約40%、約1%~約35%、約1%~約30%、約5%~約30%、約8%~約30%、約10%~約30%、約15%~約30%、約20%~約30%、約25%~約30%、約5%~約25%、約5%~約20%、約5%~約15%、又は約5%~約10%)の少なくとも1種の充填材を含む。

30

【0127】

本明細書で用いるところでは、用語「充填材」は、組成物の重量及び/又はサイズを増やすために組成物に添加される物質を意味する。幾つかの好適な充填材は、公知であり、硫酸ナトリウム、硫酸アンモニウム、デンプン、ベントナイト、珪藻土、カオリン、デキストリン、マルトデキストリン、グルコース、セルロース、微晶質セルロース、キトサン、ラクトース、ラクトース-水和物、マンニトール、スクロース、タルカム、マルチトール、ソルビトール、キシリトール、粉末セルロース、セルロースガム、デンプン、又はリン酸カルシウムを含むが、それらに限定されない。

40

【0128】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、少なくとも2種の充填材を含む。特定の実施形態において、第1充填材と第2充填材との間の比は、重量で、約1:10~10:1(例えば、1:9、1:8、1:7、1:6、1:5、1:4.5、1:4、1:3.5、1:3、1:2、1:1、2:1、3:1、3.5:1、4:1、4.5:1、5:1、6:1、7:1、7:1、8:1、又は9:1)の範囲で変えることが

50

できる。

【0129】

特定の実施形態において、充填材は、タルカム若しくはマルトデキストリン、又はそれらの混合物を含む。特定の実施形態において、充填材は、タルカムとマルトデキストリンとの混合物を含む。特定の実施形態において、タルカムとマルトデキストリンとの間の比は、重量で約1:1~1:10、1:1~1:9、1:1~1:8、1:1~1:7、1:2~1:7、1:2~1:6、1:3~1:6、1:3~1:5、1:3~1:4、1:4~1:5の範囲、1:5、1:4.5、1:4、1:3.5、1:3、又は1:2にある。いくつかの実施形態において、タルカムとマルトデキストリンとの間の比は、重量で約1:3.3である。いくつかの実施形態において、タルカムとマルトデキストリンとの間の比は、重量で約1:4.5である。

10

【0130】

様々な少ない構成要素は、本開示の組成物に添加することができるが、必要ではない。そのような少ない構成要素の例は、ステアリン酸マグネシウムなどの潤滑剤；ビター；香料；蛍光増白剤；染料；ナトリウムカルボキシメチルセルロースである。組成物は、また、必要ならば、ポリビニルアルコールフィルムなどの、水溶性フィルムでコートすることができる。

【0131】

潤滑剤は、例えば上方パンチの面への付着（「ピッキング」）又は下方パンチの面への付着（「スティッキング」）を防ぐにことによって、錠剤が形成されている装置からの錠剤の剥離を向上させるために使用することができる。好適な潤滑剤には、例えば、ホワイトカーボン、タルカム粉末、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸ナトリウム、ステアリン酸亜鉛、ステアリン酸、ホウ酸、金属ステアレート、ステアリルフマル酸ナトリウム、脂肪酸、脂肪アルコール、脂肪酸エステル、グリセリルベヘネート、キャノーラ油、鉱油、植物油、グリセリルパルミトステアレート、水素化植物油、水素化植物油、酸化マグネシウム、ポロクサマー、パラフィン、ロイシン、プロピレングリコール脂肪酸エステル、ポリビニルアルコールナトリウムベンゾエート、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリルフマル酸ナトリウム、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、及びポリアルキレングリコールが含まれる。好ましくは、潤滑剤は、ステアリン酸並びにステアリン酸カルシウム、マグネシウム及びアルミニウムなどの、その塩を含む。特定の実施形態において、潤滑剤はステアリン酸マグネシウムを含む。一実施形態において、ステアリン酸マグネシウムは、重量で組成物の約0.1%~約5%（例えば、約0.1%~約4.5%、約0.1%~約4.0%、約0.1%~約3.5%、約0.1%~約3.0%、約0.1%~約2.5%、約0.1%~約2.0%、約0.1%~約1.5%、約0.1%~約1.0%、約0.5%~約1.0%、約0.5%~約0.7%、約0.5%、又は約0.7%）の量で潤滑剤として含まれる。

20

30

【0132】

ビターは、また、ヒト又は非標的動物による不適切な摂取を阻止するために本明細書で提供される組成物において嫌悪剤として使用することができる。好適なビターには、ベンゾジアゼピン、デナトニウム、スクロースオクタアセテート、ケルセチン、ブルシン及びクアシンが含まれるが、それらに限定されない。特定の実施形態において、ビターは安息香酸デナトニウムを含む。特定の実施形態において、ビターは安息香酸デナトニウムである。一実施形態において、安息香酸デナトニウムは、重量で組成物の約0.01%~約5%（約0.01%~約4.5%、約0.01%~約4.0%、約0.01%~約3.5%、約0.01%~約3.0%、約0.01%~約2.5%、約0.01%~約2.0%、約0.01%~約1.5%、約0.01%~約1.0%、約0.01%~約0.5%、約0.01%~約0.4%、約0.01%~約0.3%、約0.01%~約0.2%、約0.01%~約0.1%、約0.01%~約0.05%、約0.05%、約0.1%）の量でビターとして含まれる。

40

【0133】

50

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、例えば、重量で組成物の10%、5%、3%、1%、0.5%、0.2%、0.1%、0.05%、0.01%、0.001%、0.0001%、0.00001%、又は0.000001%未満の量で、いかなる有機溶媒も実質的に含有しない。

**【0134】**

特定の実施形態において、組成物は、例えば、重量で組成物の10%、5%、3%、1%、0.5%、0.2%、0.1%、0.05%、0.01%、0.001%、0.0001%、0.00001%、又は0.000001%未満の量で、いかなる微粉も錠剤内に実質的に含有しない。

**【0135】**

特定の実施形態において、組成物は、任意選択的に、除草剤、殺真菌剤、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、及び成長調整剤から選択される1種以上のさらなる活性成分を含有し得る。

**【0136】**

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、錠剤組成物として配合することができる。特定の実施形態において、各単一の錠剤は、約0.0004g~約1g、約0.001g~約0.5g、約0.002g~約0.4g、約0.003g~約0.3g、約0.004g~約0.2g、約0.005g~約0.2g、約0.01g~約0.3g、約0.05g~約0.3g、約0.07g~約0.3g、約0.1g~約0.3g、約0.1g~約0.25g、約0.1g~約0.2g、約0.0034g、約0.0775g、又は約0.15gの活性成分構成要素(a)を含有する。

**【0137】**

用語「錠剤組成物」は、本明細書で用いるところでは、医薬品技術において周知であるような、錠剤プレスでの粉末の成形又は圧縮によって調製することができる固体形態を意味する。

**【0138】**

本開示の錠剤組成物は、均一であっても又は不均一であってもよい。用語「均一な」は、本明細書で用いるところでは、単一の微粒子組成物の成形又は圧縮によって製造される錠剤を意味するが、その組成物の粒子が全て必然的に同一組成のものであることを暗示しない。用語「不均一の」は、本明細書で用いるところでは、例えば層、インサート又はインサート周りのコーティングを有する複数の不連続領域を持った錠剤を意味する。

**【0139】**

錠剤は、従来の錠剤製造設備を用いて調製することができ、任意の好適なサイズ及び形状、例えば丸い、卵形の、多角形の又は枕状のものであり、任意選択的に非機能的な表面マークを有する。本発明の錠剤は、例えば、用量及び施用情報、禁忌、予防措置、薬物相互作用及び薬害反応などの関連情報を提供する添付文書を添えて、容器にパッケージすることができる。

**【0140】**

本明細書で提供される組成物は、公知の従来法によって製造することができ、好ましくは構成要素の混合、篩い分け及び圧縮を含む。典型的には、粉末ブレンドは、均一性まで混合することによって調製され、主として約70~200メッシュのメッシュサイズを有する篩に通され、錠剤機(例えば、5000~10000ポンドの力の油圧プレス)において所望の錠剤サイズ及び密度に圧縮される。

**【0141】**

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、水と接触したときに錠剤が沈むように、水の密度よりも大きい密度(1.00よりも大きい比重)を有する。

**【0142】**

実施形態において、本開示の錠剤は、コーティング、例えば非機能性コーティングを更に含み得る。非機能性コーティングは、任意選択的に他の構成要素、例えば1種以上の可塑剤、着色剤等と共に、ポリマー構成要素、例えばHPMCを含むことができる。そのよ

10

20

30

40

50

うな実施形態において、錠剤は、圧縮後に追加のコーティング工程にかけられることになる。用語「非機能性」は、本明細書で用いるところでは、錠剤の放出特性に実質的に全く影響を持たない手段を意味し、コーティングが何の有用な目的にも役立たないことを暗示すると解釈されるべきではない。例えば、そのようなコーティングは、独特の外観を錠剤に付与し、パッケージング及び輸送中の摩耗からの保護を提供し、及び/又は他の便益を有することができる。

【0143】

錠剤組成物は、その施用にとって適切である、いかなるサイズにも製造され得る。特定の実施形態において、錠剤は、約0.01g~約20g、約0.05g~約20g、約0.1g~約20g、約0.2g~約20g、約0.5g~約20g、約0.5g~約15g、約0.5g~約10g、約1g~約10g、約1g~約5g、約2g~約5g、約3g~約5g、約3g~約4.5g、約3g~約4g、約3.0g~3.4gである。

【0144】

特定の実施形態において、錠剤は、約5mm~約100mm、約5mm~約50mm、約5mm~約40mm、約5mm~約35mm、約5mm~約30mm、約10mm~約15mm、約10mm~約30mm、約15mm~約30mm、約20mm~約30mm、約20mm~約25mm、約20~約22mm、約20mm又は約22mmの直径を有する。

【0145】

特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、組成物が1重量%で水に希釈されるときに、5.0~8.0、任意選択的に6.0~7.0の範囲のpH値を有する。特定の実施形態において、本明細書で提供される組成物は、約6.5、6.7又は6.8(重量で水に1%希釈された)のpH値を有する。

【0146】

硬度は、貯蔵、輸送、及び使用前のハンドリングの条件下でコンパクトの破碎を引き起こすために必要とされる力の大きさであり、典型的にはキロポンド(kp)、Strong-Cobb単位(SCU)又はニュートン(N)などの単位で表される。約1SCUの硬度は、大ざっぱに0.7kpの力又は約7Nを表した。水溶性農薬のためのマトリックスとして働く本明細書で提供される少なくとも1種の充填材を含む、コートされていない錠剤、又はコーティング前の錠剤コアは、高速錠剤化操作(容器中への錠剤の充填までの及びそれを含む全工程を含む)中に課せられる機械的ストレスによる破損及び/又は摩耗に耐えることができるために一定の最低硬度を有する必要がある。最低の許容できる硬度は、機械的ストレスの厳しさなどの、多数の因子に依存するであろうが、典型的には少なくとも約70N(例えば、80N、90N、100N、又は105N超)である。特定の実施形態において、本明細書で提供される錠剤組成物は、106、79、又は75Nの錠剤硬度を有する。

【0147】

製剤構成要素は、ブレンドされる、粉碎される及び圧縮される前に、乾燥していてもよい。真空オープン中で45~60で16時間の乾燥がプレミックスの含水量を約3.0%未満に減らすのに十分である。これは、残存水分が貯蔵中に泡立ち反応を開始しないように役立つ。構成要素は、ミル、例えば、エアミル又はハンマーミルにおいて典型的にはすり潰され、混合される。すり潰されたプレミックスは、70~200メッシュスクリーンを通してブラッシュされる。特定の実施形態において、組成物の含水量は、3.0%、2.5%、2.0%、1.9%、1.8%、1.7%、1.6%、1.5%、1.0%、又は0.5%未満である。

【0148】

本開示は、また、作物における有害生物の防除方法であって、農学的に有効な量の組成物を、それを必要としている作物に又はその環境に施用する工程を含む方法を提供する。

【0149】

用語「農学的に有効な量」は、本明細書で用いるところでは、作物又は牧草に施用され

たときに、そこに存在する有害生物又は雑草又は真菌集団のかなりの部分を殺生する又は実質的に損傷する、及び/又は成長サイクルの任意の段階での作物又は牧草への損傷を実質的に低減するであろう農薬剤組成物の量又は施用量を意味する。

【0150】

特定の実施形態において、作物は、農業的又は非農業的である。

【0151】

用語「農業作物」は、食物及び繊維用のものなどの農作物を意味し、トウモロコシ；大豆及び他のマメ科植物；穀物（例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦、イネ、及びトウモロコシ）；野菜、例えば、葉野菜（例えば、レタス、キャベツ、及び他の葉作物）、結果野菜（例えば、トマト、コショウ、ナス、十字架植物及びウリ科植物）、ジャガイモ、サツマイモ；棉；果実、ブドウ、木になる果実（例えば、ナシ状果、核果及び柑橘類）、小さい果実（例えば、ベリー及びサクランボ）；並びに他のスペシャルティ作物（例えば、キャノーラ、ヒマワリ及びオリーブ）を含む。

10

【0152】

用語「非農業作物」は、他の園芸作物（例えば、田畑で生育されない温室植物、苗床植物又は観賞植物、都会環境及び工業環境における居住及び商業構造物での植物）、芝生（例えば、芝農場、牧草地、ゴルフコース、芝地、住宅、レクリエーション及びスポーツ分野）、木材製品、貯蔵製品、公衆衛生（すなわち、ヒト）及び動物の健康（例えば、ペット、家畜、家禽、及び野生動物などの非家畜化動物）関連用途向けの混農林業及び植生を意味する。

20

【0153】

無脊椎有害生物は、まん延の農業的及び/又は非農業的場所などの、有害生物の環境に、保護されるべきエリアに、又は防除されるべき有害生物上に直接に、この開示で提供される組成物を、有効な量で、施用することによって農業及び非農業用途において防除される。

【0154】

用語「無脊椎有害生物」は、本明細書で用いるところでは、有害生物として経済的に重要な節足動物、腹足類及び線形動物を包含する。用語「節足動物」は、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ類、ヤスデ、ワラジムシ及び結合類を包含する。用語「腹足類」は、カタツムリ、ナメクジ及び他の柄眼目（*Stylommatophora*）を包含する。用語「線形動物」は、回虫、犬糸状虫、並びに植食性線形動物（線形動物門（*Nematoda*））、吸虫（吸虫綱（*Trematoda*））、こう頭虫綱（*Acanthocephala*）、及び糸虫（糸虫綱（*Cestoda*））などの寄生ぜん虫の全てを包含する。

30

【0155】

農業用途には、播種中に畝間で、種まきの前に作物の種子に、作物植物の枝葉、茎、花及び/若しくは果実に、或いは作物が植え付けられる前若しくは後に又は作物が植え付けられている間に土壌又は他の成長媒体（例えば、水田）に、典型的には本開示の組成物又は組成物の混合物を施用することによって無脊椎有害生物から農作物を防護することが含まれる。非農業用途は、作物植物に関する以外のエリアでの無脊椎有害生物防除を意味する。非農業用語には、貯蔵された穀物、豆及び他の食料における、並びに衣類及びカーペットなどの織物における無脊椎有害生物の防除が含まれる。非農業用途には、また、観賞植物、森林における、庭園における、道路脇及び鉄道用地に沿った、並びに芝地、ゴルフコース及び牧草地などの芝土上の無脊椎有害生物防除が含まれる。非農業用途には、また、ヒト及び/又は仲間によって占有され得る家及び他の建物、農場、大牧場、動物園又は他の動物における無脊椎有害生物防除が含まれる。非農業用途には、また、建物に使用される木材又は他の構造物に損傷を与えることができるシロアリなどの有害生物の防除が含まれる。非農業用途には、また、寄生性であるか又は感染病を伝染させる無脊椎有害生物を防除することによってヒト及び動物の健康を守ることが含まれる。そのような有害生物には、例えば、ツツガムシ、マダニ、シラミ、蚊、ハエ及びノミが含まれる。

40

【0156】

50

組成物施用の一実施形態は噴霧による。或いはまた、本開示の組成物を含む錠剤組成物は、植物枝葉又は土壌に施用することができる。本開示の組成物は、また、土壌、苗床箱処理又は移植植物に土壌水浸しの錠剤製剤として施用される本開示の組成物と植物を接触させることによって植物吸収を通して効果的に配送される。特定の実施形態において、作物はイネであり、組成物は水田に施用される。特定の実施形態において、組成物は、すなわち、水田中へ入ることなく水田間の細道から手動で投入することによって、水田上に手動で又は機械的にまき散らされるか、又水田から投入することができる。

【0157】

本方法は、有害生物又は有害生物のライフステージに対して防除が必要とされる任意の作付け状況に適用できる。本方法は、播種又は移植操作と組み合わせられるときに有用であることができるが、また、十分成長した作物、特に特に確立された水田で用いることができる。

10

【0158】

組成物によって防除され得る有害生物には、ヤガ科 (*Noctuidae*) におけるアワヨトウ、ヨトウムシ、シャクトリムシ、及びヘリオチン (例えば、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith)、ビートアワヨトウ (*Spodoptera exigua* Huebner)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、キャベツシャクトリムシ (*Trichoplusia ni* Huebner)、及びニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens* Fabricius)) などの、鱗翅目 (*Lepidoptera*) の幼虫; メイガ科 (*Pyrallidae*) からの穴を開ける昆虫、繭を作る昆虫、ウェブワーム、マツマダラメイガ (*coneworms*)、アオムシ及び葉を食い荒らす幼虫 (例えば、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis* Huebner)、ネーブルオレンジワーム (*Amyelois transitella* Walker)、コーンルートウェブワーム (*Crambus caliginosellus* Clemens)、及びソッドウェブワーム (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); ハマキガ科 (*Tortricidae*) におけるハマキガ、植物の芽を貪り食う毛虫、シードワーム、及びフルーツワーム (例えば、コドリング (*Cydia pomonella* L. (L. はリンナウス (*Linnaeus*) を意味する)、ブドウ果実ガ (*grape berry moth*) (*Endopiza viteana* Clemens)、及びナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta* Busck)); 及び多くの他の経済的に重要な鱗翅目 (*Lepidoptera*) (例えば、コナガ (コナガ科 (*Plutellidae*) の *Plutella xylostella* L.)、ワタアカムシ (キバガ科 (*Gelechiidae*) の *Pectinophora gossypiella* Saunders)、及びマイマイガ (ドクガ科 (*Lymantriidae*) の *Lymantria dispar* L.)); ヒゲナガゾウムシ科 (*Anthribidae*)、マメゾウムシ科 (*Bruchidae*)、及びゾウムシ科 (*Curculionidae*) からのゾウムシなどの鞘翅目 (*Coleoptera*) の葉面摂食幼虫及び成虫 (例えば、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis* Boheman)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、及びイネゾウムシ (*Sitophilus oryzae* L.)); ハムシ科 (*Chrysomelidae*) におけるノミトビヨロイムシ、キュウリのカブトムシ、ルートワーム、ハムシ、コロラドハムシ、及びハモグリバエ (例えば、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、及びウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera* LeConte)); コガネムシ科 (*Scarabaeidae*) (例えば、マメコゴネ (*Popillia japonica* Newman) 及びヨーロピアンコガネムシ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)) からのコガネムシ及び他のカブトムシ; コメツキムシ科 (*Elaterridae*) からのコメツキムシの幼虫及びキクイムシ科 (*Scolytidae*) からのキク

20

30

40

50

イムシ；クギヌキハサミムシ科 (Forficulidae) (例えば、ヨーロッパハサミムシ (*Forficula auricularia* L.) 及びブラックハサミムシ (*Chelisoches morio* Fabricius)) からのハサミムシなどのハサミムシ目 (Dermaptera) の成虫及び幼虫；カスミカメムシ科 (Miridae) からのカスミカメムシ、セミ科 (Cicadidae) からのセミ、ヨコバイ科 (Cicadellidae) からのヨコバイ (例えば、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.))、ピワハゴロモ科 (Fulgoroidea) 及びウンカ科 (Delphacidae) からのウンカ、ツノゼミ科 (Membracidae) からのツノゼミ、キジラムシ科 (Psyllidae) からのキジラムシ、コナジラムシ科 (Aleyrodidae) からのコナジラムシ、アブラムシ科 (Aphididae) からのアブラムシ、ネアブラムシ科 (Phylloxeridae) からのネアブラムシ属昆虫、コナカイガラムシ科 (Pseudococcidae) からのコナカイガラムシ、カタカイガラムシ科 (Coccidae)、マルカイガラムシ科 (Diaspididae) 及びワタフキカイガラムシ科 (Margarodidae) からのカイガラムシ、グンバウムシ科 (Tingidae) からのグンバウムシ、カメムシ科 (Pentatomidae) からのカメムシ、ナガカメムシ科 (Lygaeidae) からのアメリカコバネナガカメムシ (例えば、コバネナガカメ種 (*Blissus* spp.)) 及び他のナガカメムシ (seed bugs)、コガシラアワフキムシ科 (Cercopidae) からのアワフキムシ、ヘリカメムシ科 (Coreidae) からのスカッシュバグ、並びにホシカメムシ科 (Pyrrhocoridae) からのツツガムシ及びコットンステイナーなどの、カメムシ目 (Hemiptera) 及びヨコバイ亜目 (Homoptera) の成虫及び若虫；グラスホッパー、イナゴ及びコオロギなどのバッタ目 (Orthoptera) (例えば、移住性グラスホー (例えば、*Melanoplus sanguinipes* Fabricius 及び *M. differentialis* Thomas)、アメリカングラスホッパー (例えば、*Schistocerca americana* Drury)、砂漠バッタ (*Schistocerca gregaria* Forskal)、移住性バッタ (*Locusta migratoria* L.)、及びケラ種 (*Grylotalpa* spp.)) の成虫及び幼若虫；ハモグリバエ、小昆虫、ミバエ (ミバエ科 (Tephritidae))、キモグリバエ (例えば、*Oscinella frit* L.)、土ウジ (soil maggots) 及び他のカ亜目 (Nematocera) などの、双翅目 (Diptera) の成虫及び幼若虫；ネギアザミウマ (onion thrips) (ネギアザミウマ (*Thrips tabaci* Lindeman)) 及び他の葉面摂取アザミウマなどのアザミウマ目 (Thysanoptera) の成虫及び幼若虫が含まれるが、それらに限定されない。

【0159】

特定の実施形態において、組成物によって防除することができる有害生物には、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)、ツマジロクサヨトウ (fall armyworm)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、サトウキビ害虫 (sugarcane borer)、サトウキビメイガ (*Diatraea saccharalis*)、イッテンオオメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、キロ・ポリクリサ (*Chilo polychrysa*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocoris acuta*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、イネアザミウマ (*Thrips oryzae*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、イネトゲハムシ (*Dicladispa armigera*)、コブノメイガ (*Cnaphalocricis medinalis*)、

ニンフラ・デプンクタリス (*nymphula depunctalis*)、イチモンジセセリ (*parnara guttata*) 及びイネノシントメタマバエ (*orseolia oryzae*) が含まれるが、それらに限定されない。

【0160】

有効な防除のために必要とされる施用の率 (すなわち、「農学的に有効な量」) は、活性成分、オペレータ、防除されるべき無脊椎動物種、有害生物のライフサイクル、ライフステージ、そのサイズ、場所、時節、ホスト作物又は動物摂食行動、配偶行動、作物の播種又は植え付けの密度及びパターン、環境湿度、温度、並びに組成物が予防的作業として又はサルベージ作業として施用されるかどうかなどの因子に依存するであろう。普通の場合下では、組成物は、1ヘクタール当たり約10グラム活性成分 ( $\text{gai/ha}$ ) ~ 約10,000  $\text{gai/ha}$  (例えば、約10 ~ 約5000  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約1000  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約500  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約200  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約100  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約90  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約80  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約70  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約60  $\text{gai/ha}$ 、約10 ~ 約50  $\text{gai/ha}$ 、約20 ~ 約50  $\text{gai/ha}$ 、約30 ~ 約50  $\text{gai/ha}$ 、又は約40  $\text{gai/ha}$ ) の範囲の率で農業生態系において施用され得るが、0.1  $\text{gai/ha}$  ほどに少なくとも十分であり得るし、又は80,000  $\text{gai/ha}$  ほどに多くが必要とされ得る。特定の実施形態において、組成物は、約40  $\text{gai/ha}$  の率で施用される。非農業用途向けに、有効な使用率は、約1.0 ~ 50  $\text{mg/平方メートル}$  ( $\text{m}^2$ ) (例えば、約1 ~ 40  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 35  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 30  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 25  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 20  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 15  $\text{mg/m}^2$ 、約1 ~ 10  $\text{mg/m}^2$ 、又は約1 ~ 5  $\text{mg/m}^2$ ) の範囲であろうが、0.1  $\text{mg/m}^2$  ほどに少なくとも十分であり得るし、又は150  $\text{mg/m}^2$  ほどに多くが必要とされ得る。当業者は、所望のレベルの無脊椎有害生物防除のために必要な農学的に有効な量を容易に決定することができる。

10

20

30

【実施例】

【0161】

本発明は、具体的な実施例によってより詳細に説明される。以下の実施例は、例示目的のために提供され、いかなるやり方でも本発明を限定することを意図しない。当業者は、変更又は修正して本質的に同じ結果をもたらすことができる様々な決定的に重要であるわけではないパラメータを容易に識別するのである。

【0162】

実施例1. アントラニルアミド錠剤スクリーニング調製

実施例において試験される錠剤は、以下の工程に従って調製した：全ての構成要素を量り取り、完全に混合し、メッシュにかけて70 ~ 200メッシュの範囲の粒子を得、その後60キロニュートン ( $\text{kN}$ ) の錠剤プレスによってプレスした。3.0 ~ 3.5  $\text{g}$  の重さがある及び約20 ~ 22  $\text{mm}$  の直径を有する、結果として得られる錠剤はそのとき形成された。

【0163】

予備スクリーニング

クロラントリニプロール含有製剤での使用のためのエンハンサー及び分散剤のスクリーニングの前に、以下の予備スクリーニング手順を行った。

40

【0164】

酸及びアルカリ。酸とアルカリとの異なる組合せを、(a) 水との接触時に望ましい期間続く、及び植物が成長する水中の活性成分の完全分散を容易にする望ましい量の泡立ちを発生させる能力、(b) 費用、及び(c) 工業的処理可能性 (安全性視点からなどの) の観点からスクリーニングした。スクリーニングに基づいて、酸とアルカリとの好ましい組合せを特定し、以下の実施例において使用した。

【0165】

潤滑剤、バインダー及び充填材。異なる種類の潤滑剤、バインダー及び充填材を、スク

50

リーニングした。スクリーニングに基づいて、好ましい潤滑剤、バインダー及び充填材を特定し、以下の実施例において使用した。

【 0 1 6 6 】

エンハンサー及び分散剤スクリーニング

異なるレシピの錠剤（例えば、エンハンサー及び分散剤の両方、エンハンサーのみ、分散剤のみ又は異なるタイプのエンハンサー及び分散剤を含む）を調製し、水との接触時の錠剤のバブル度及び拡散率の観点から比較した。バブル度は、視覚によって観察し、錠剤の拡散を追跡するために顔料を使用した。レシピ及び結果を次表 1 にまとめる。+が多ければ多いほど性能がより良好である、記号+を示す、バブル度及び拡散率の観点から、レシピ 1 - 4、レシピ 1 - 5 及びレシピ 1 - 7 が、残りのレシピよりも良好な性能を示したことを理解することができる。

10

【 0 1 6 7 】

【表 1】

表1

No.	成分	機能	レシピ							
			1-2 (g)	1-3 (g)	1-4 (g)	1-5 (g)	1-6 (g)	1-7 (g)	1-8 (g)	1-9 (g)
1	クロラントラニ リプロール	活性成分(AI)	1	1	1	1	1	1	1	1
2	Geropon SDS	エンハンサー	0.8	0.8	0.8	0.8	/	/	/	/
	ラウリル硫酸 ナトリウム		/	/	/	/	3	/	/	1
	Supragil WP		/	/	/	/	/	1	1	/
3	Tersperse 2700	分散剤	/	1.5	2.5	3.5	/	2.5	/	/
	Polyfon H		/	/	/	/	/	/	/	4
	Morwet D- 425		/	/	/	/	/	/	4	/
4	D,L酒石酸	酸	21	21	21	21	21	21	21	21
5	重炭酸 ナトリウム	アルカリ	30	30	30	30	30	30	30	30
6	炭酸 ナトリウム	アルカリ	8	8	8	8	8	8	8	8
7	ステアリン酸 マグネシウム	潤滑剤	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
8	安息香酸 デナトニウム	ビター	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
9	PEG-6000	バインダー	3	3	3	3	3	3	3	3
10	タルカム	充填材	6	6	6	6	6	6	6	6
11	レッド顔料	発色 試薬	1	1	1	1	1	1	1	1
12	マルトデキス トリン	充填材	100へ							
試験 方法	バブル度		+++	+++	+++	+++	+++	+++	+++	+++
	拡散率		+	++	+++	+++	+	+++	++	+

20

30

40

【 0 1 6 8 】

レシピ 1 - 4、レシピ 1 - 5、レシピ 1 - 7 及びレシピ 1 - 8 を、以下の方法によって分布プロファイルについて更に調べた：( a ) 1 . 2 m の半径の 1 つの円形プールを提供し、図 1 に示されるようなサンプリング場所のそれぞれの下に時計皿を置き、ここで、各 2 つの隣接する外線間の距離は 1 5 c m であり、1 つの外線上に均等に置かれた 4 つのスポット ( A 1、A 2、A 3 及び A 4 などの ) をサンプリング場所として選択した；( b )

50

約 5 c m 深さの水道水でプールを満たした；( c ) 1 つの錠剤 ( 3 g ) をプールに投入した；( d ) 3 0 分後に、時計皿をカバーし、プールから取り出した；( e ) 集めた時計皿中の活性成分 ( 溶解した及び水に懸濁した及び時計皿上に沈着した活性成分など ) の含量を H P L C によって分析した；( e ) 4 ポットから集めた活性成分の平均値を計算した。結果を図 2 に示した。ナトリウムジアルキルスルホスクシネートを含むエンハンサーとポリカルボキシレートを含む分散剤との両方を持った錠剤 ( すなわち、レシピ 1 - 4、1 - 5 及び 1 - 7 ) が他のレシピと比較してはるかにより良好な効果を達成したことを理解することができる。

【 0 1 6 9 】

実施例 2 . 新しいアントラニルアミド錠剤

10

実施例 1 におけるスクリーニングに基づいて、レシピを更に最適化し、ヒト又は動物による誤嚥を防ぐためにビター又は嫌悪剤を錠剤組成物に添加した。クロラントラニリプロール ( R y n a x y p y r ( 登録商標 ) A I ) の濃度が異なる最適化レシピを表 2 に示す。錠剤は、実施例 1 において記載されたのと同じ方法で調製した。

【 0 1 7 0 】

20

30

40

50

【表 2】

表2

成分	機能	クロラントラニプロール錠剤			
		1.0%	2.5%	5.0%	5.0%
クロラントラニプロール錠剤(98%)	活性成分(AI)	1.05g	2.6g	5.1g	5.1g
Geropon® SDS	エンハンサー	0.8g	0.8g	0.8g	0.8g
Tersperse® 2700	分散剤	2.5g	2.5g	2.5g	2.5g
D,L-酒石酸	酸	21g	21g	21g	21g
重炭酸ナトリウム	アルカリ	30g	30g	30g	30g
炭酸ナトリウム	アルカリ	8g	8g	8g	8g
ステアリン酸 マグネシウム	潤滑剤	0.5g	0.7g	0.7g	0.7g
安息香酸 デナトニウム	ビター	0.05g	0.05g	0.05g	0.1g
Polyfon H	分散剤	0	0	0	1
PEG-6000	バインダー	3.0g	5.5g	5.5g	5.5g
タルカム	充填材	6.0g	6.0g	6.0g	6.0g
マルトデキストリン	充填材	100gへ	100gへ	100gへ	100gへ

10

20

30

## 【0171】

## 分布プロファイル分析

表2の錠剤の分布プロファイルを調べるための実施例1に記載されたのと同じ方法の使用。表2の錠剤は改善された効果を達成することが分かった。

40

## 【0172】

## 安定性試験

表2の錠剤の安定性を14日の貯蔵後に試験した。データを表3に示す。

## 【0173】

50

## 【表 3】

表3

	1.0% クロラントラニリプロール 錠剤		2.5% クロラントラニリプロール 錠剤		5.0% クロラントラニリプロール 錠剤	
	当初	54℃/14日	当初	54℃/14日	当初	54℃/14日
外観	白色 一様な 錠剤	白色 一様な 錠剤	白色 一様な 錠剤	白色 一様な 錠剤	白色 一様な 錠剤	白色 一様な 錠剤
AI含量 (%)	0.99	0.97	2.51	2.53	5.1	5.06
pH (水中1% 希釈)	6.5	6.5	6.7	6.6	6.8	6.9
錠剤 硬度	106	125	79	106	75	100
摩耗の 程度	1.20%	0.80%	1.20%	0.6%	1.20%	0.8%
含水量 (%)	1.90%	1.60%	1.70%	1.2%	1.90%	1.6%

10

20

## 【0174】

効能分析（錠剤施用の21日後）

イネ苗を4.5葉段階で水田に移植し、7日間成長して苗を殺虫剤施用前に緑変させた。表2のクロラントラニリプロール錠剤並びに市販のクロラントラニリプロール製品Ferterra（登録商標）及びCORAGEN（登録商標）（対照用）を、別々に、一貫した現場条件で選択された田畑へ施用した。錠剤及びFerterra（登録商標）は、両方とも全面散布によって施用し、CORAGEN（登録商標）は、葉面散布によって施用した。クロラントラニリプロール錠剤及びFerterra（登録商標）は、一般に、40gai/haの施用量で移植の7日後に様に施用した。CORAGEN（登録商標）は、通常、水と混合し、30gai/haの施用量で縞二カメイガ（striped stem borer）の卵孵化の初期段階で葉面散布によって施用した。1つの対照チェック（いかなる処理もなしの、「CK」）水田を効能基準のために選択した。錠剤の効能を錠剤施用の21日後に更に調査した。各施用区画における縞二カメイガによって引き起こされた心枯れを示すイネ苗をカウントするために全体区画調査を採択し、効能を次式によって計算した：

30

効能% = ( (CK群における心枯れの数) - (処理群における心枯れの数) ) / (CK群における心枯れの数) \* 100。

40

## 【0175】

結果を表4に示す。

## 【0176】

50

## 【表 4】

表4

製剤タイプ	21日効能
1% クロラントラニリプロール錠剤	93.21
2.5% クロラントラニリプロール錠剤	92.52
5% クロラントラニリプロール錠剤	95.39
Ferterra <sup>®</sup>	93.70
CORAGEN <sup>®</sup>	92.25

10

## 【0177】

表4に示される結果は、40 g a i / h aで施用されたクロラントラニリプロール錠剤が、ニカメイガを効果的に防除できることを示した。1%クロラントラニリプロール錠剤、2.5%クロラントラニリプロール錠剤及び5%クロラントラニリプロール錠剤は、錠剤製剤の施用がより多い省力化でありながら、同じ用量のクロラントラニリプロールを含む粒剤（Ferterra（登録商標））及びSC剤（「SC」、CORAGEN（登録商標））の両方と類似の又は僅かにより良好なさえの防除を達成することを示した。

## 【0178】

田畑における身体検査での活性成分クロラントラニリプロール残留量

1%クロラントラニリプロール錠剤（4 g）、2.5%クロラントラニリプロール錠剤（1.6 g）、5%クロラントラニリプロール錠剤（0.8 g）、Ferterra（登録商標）（0.04 g a i / 25 m<sup>2</sup>に計算された、0.4%粒剤）、及びCORAGEN（0.04 g a i / 25 m<sup>2</sup>に計算された、200 g / LのSC）を5\*5 m区画へ施用した。イネ苗を製剤施用の3日後（3 D A A）及び20日後（20 D A A）にサンプリングした。縞ニカメイガは、イネ茎を主として攻撃するので、縞ニカメイガによって摂取され、そして毒作用を引き起こすことができる、活性成分の吸収を検証するためにイネ茎中のクロラントラニリプロール残留量を試験した。活性成分クロラントラニリプロールを抽出するために、イネ苗を切断し、茎を摘出し、24時間酸性アセトニトリル中へ浸けた。結果として得られた溶液を2時間更に振盪し、次いで濾過し、GC - MSによって分析して、イネ苗によって吸収された活性成分クロラントラニリプロールの量を測定した。

20

30

## 【0179】

GC - MSの試験結果に従って、イネ中のクロラントラニリプロールの残留量（μ g / k g）を表5にまとめ、図3に図示する。1%クロラントラニリプロール錠剤（4 g）、2.5%クロラントラニリプロール錠剤（1.6 g）、又は5%クロラントラニリプロール錠剤（0.8 g）で施用された苗は、製剤施用の3日後及び20日後に、Ferterra（登録商標）又はCORAGEN（登録商標）で施用されたものよりも高い量の活性成分クロラントラニリプロールを吸収し、特許請求されるエンハンサー及び分散剤を含む錠剤製剤が水田の水中により効果的に分散することを示唆した。

## 【0180】

40

50

## 【表 5】

表5

イネ茎中のAI残留量(μg/kg)		
	3 DAA	20 DAA
1.0%錠剤	28.2	10.9
2.5%錠剤	31.2	10.1
5.0%錠剤	25.9	10.1
0.4%顆粒	12.4	8.8
200g/L SC	13.8	5.1

10

## 【0181】

施用の場所から異なる距離で集められた苗中のクロラントラニリプロールの濃度を、上で記載されたように測定した。結果を表6及び表7にまとめ、図4に示す。

## 【0182】

## 【表6】

表6

施用3日後のイネ茎中のAI残留量(μg/kg)			
製剤	距離<1m	距離1~2m	距離>2m
1.0%錠剤	42.9	25.7	16.0
2.5%錠剤	50.4	28.5	14.7
5.0%錠剤	35.5	33.5	8.6

20

## 【0183】

## 【表7】

表7

施用20日後のイネ茎中のAI残留量(μg/kg)			
製剤	距離<1m	距離1~2m	距離>2m
1.0%錠剤	32.0	17.0	14.2
2.5%錠剤	18.8	13.8	13.4
5.0%錠剤	16.2	13.7	14.2

30

## 【0184】

実施例3. より多くの錠剤

表2の錠剤と類似の構成要素を含有するが、異なる農薬活性成分を含有する、幾つかの錠剤を調製する。特許請求されるエンハンサー及び分散剤を含むそれらの錠剤が、拡散性及び浸透の観点から表2の錠剤のものに類似の改善された効果を達成できることが期待される。

40

## 【0185】

本発明は、また、個別的に又は集合的に、本明細書で言及される又は示される部分、要素及び特徴に、並びに2つ以上の部分、要素、メンバー又は特徴のいずれかの又は全ての組合せに存すると大まかに言われ得、ここで、具体的な整数は本明細書で言及され、それらは、公知の当量を有し、そのような当量があたかも個別に明記されているかのように本明細書に組み入れられるように思われる。

## 【0186】

本発明は、その特定の実施形態に特にに関して記載されてきた。本発明の範囲から逸脱することなく上述の実施形態の様々な修正が行われることは理解されるであろう。当業者

50

は、また、目的構文によって意味されるもののコンセプトを理解するであろう。

【 図面 】

【 図 1 】

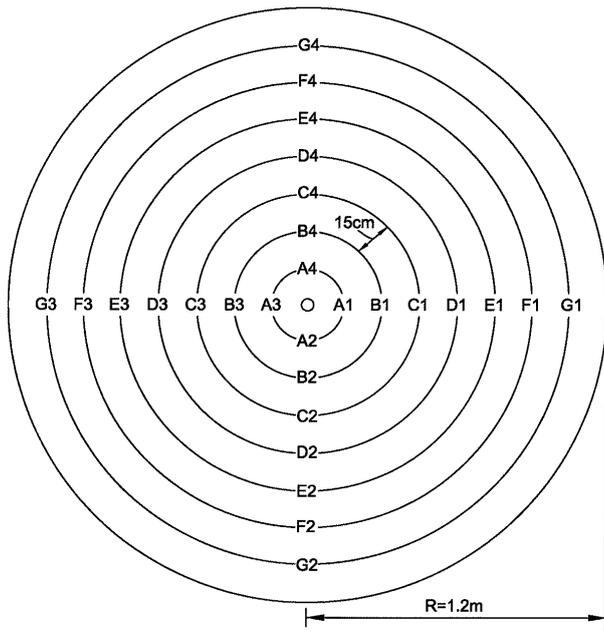


図 1

【 図 2 】

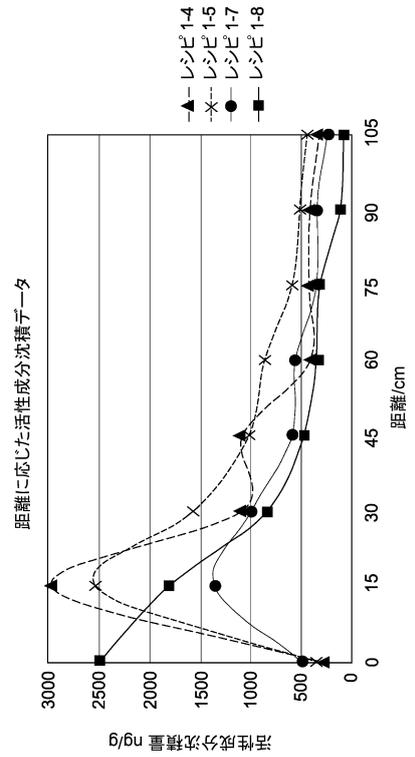


図 2

10

20

30

40

50

【 図 3 】

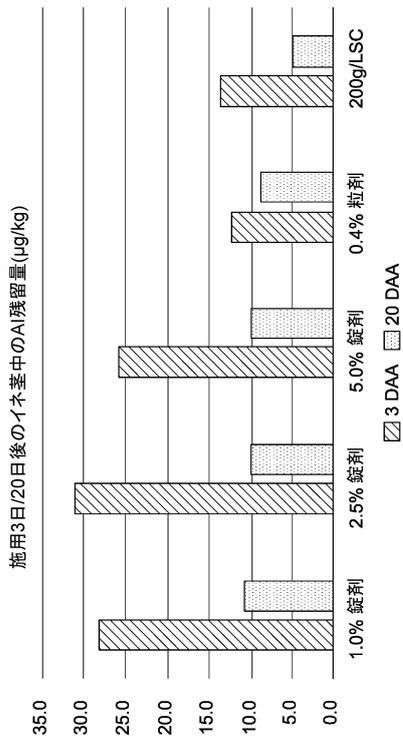


図 3

【 図 4 】

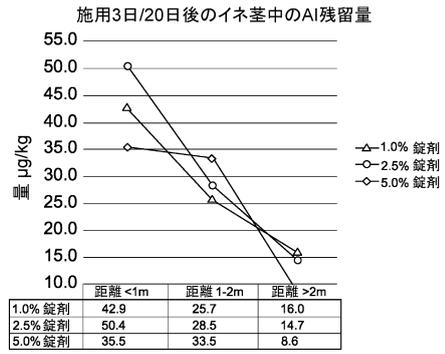


図 4A

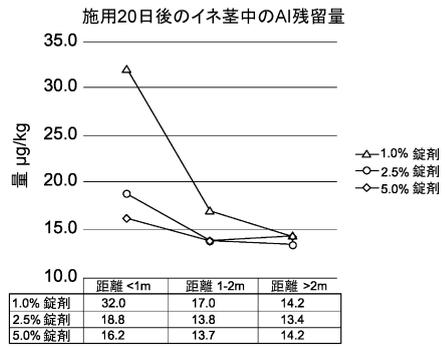


図 4B

10

20

30

40

50

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2020/052971

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> INV. A01N25/34 A01N43/56 A01P7/04 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) 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, CHEM ABS Data, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CN 103 651 424 A (QINGDAO STAR CROPS SCIENCE CO) 26 March 2014 (2014-03-26) claims example 1 example 2	1-22
X	----- CN 102 823 589 B (FIVESTAR NANTONG CHEMICAL CO LTD) 4 June 2014 (2014-06-04) claims example 4 example 2	1-22
X	----- CN 107 616 176 A (ZHEJIANG RES INST CHEMICAL IND LTD; SINO CHEM LANTIAN CO LTD) 23 January 2018 (2018-01-23) claims example 1 ----- -/--	1-22
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> 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 16 December 2020		Date of mailing of the international search report 21/01/2021
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Galley, Carl

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

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No  
PCT/US2020/052971

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	WO 2019/197631 A1 (BAYER AG [DE]; BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 17 October 2019 (2019-10-17) examples -----	1,2,5,6

10

20

30

40

1

50

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No  
PCT/US2020/052971

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
CN 103651424	A	26-03-2014	NONE
-----			
CN 102823589	B	04-06-2014	NONE
-----			
CN 107616176	A	23-01-2018	NONE
-----			
WO 2019197631	A1	17-10-2019	AR 114487 A1 09-09-2020
			AU 2019250613 A1 22-10-2020
			CN 111935979 A 13-11-2020
			TW 202002788 A 16-01-2020
			WO 2019197631 A1 17-10-2019
-----			

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(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,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,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,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100140132

弁理士 竹林 則幸

(72)発明者 チュンゲン・ニィ

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション - パテント・デパートメント

(72)発明者 ハオ・ロン

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション - パテント・デパートメント

(72)発明者 ジンファ・シィ

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション - パテント・デパートメント

(72)発明者 ヨングウイ・シュウ

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション - パテント・デパートメント

(72)発明者 シュアイ・チャン

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション - パテント・デパートメント

F ターム ( 参考 ) 4H011 AC01 AC04 BA02 BB09 BC03 BC06 BC07 BC18 BC19 DA03  
DD01 DF04 DH03 DH10