(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2017 年 4 月 20 日(20.04.2017)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2017/065237 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 495/04 (2006.01) *A01P 5/00* (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) *A01P 7/02* (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01) *A01P 7/04* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2016/080439

(22) 国際出願日: 2016 年 10 月 13 日(13.10.2016)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2015-201809 2015 年 10 月 13 日(13.10.2015) JP

(71) 出願人: 石原産業株式会社(ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目３番１５号 Osaka (JP).

(72) 発明者: 桐山 和久(KIRIYAMA Kazuhisa); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目３番１５号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 西濱 悠子(NISHIHAMA Yuko); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目３番１５号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 清水 学(SHIMIZU Manabu); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目３番１５号 石原産業株式会社内 Osaka (JP). 鳥居 綾香(TORII Ayaka); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目３番１５号 石原産業株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人栄光特許事務所(EIKOH PATENT FIRM, P.C.); 〒1050003 東京都港区西新橋一丁目７番１３号 虎ノ門イーストビルディング１０階 Tokyo (JP).

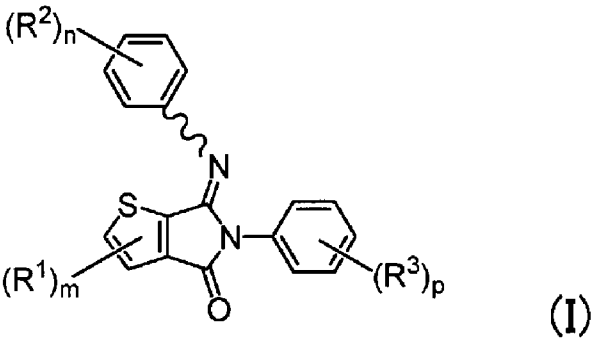
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, 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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, 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),

[続葉有]

(54) **Title**: PEST CONTROL AGENT CONTAINING THIENOPYRROLE COMPOUND OR SALT THEREOF AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称 : チエノピロール系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤



(I)

(57) **Abstract**: Provided are: a thienopyrrole compound represented by formula (I) [wherein R^1 represents a halogen atom, an alkyl group, a haloalkyl group, a cyanoalkyl group, an alkoxy group, a haloalkoxy group, a cyanoalkoxy group, a nitro group, a cyano group, a phenyl group which may be substituted by A, a carboxy group, an alkoxycarbonyl group or $CONR^4R^5$; R^2 and R^3 independently represent a halogen atom or the like; m represents an integer of 0 to 2; and n and p independently represent an integer of 0 to 5] or a salt thereof; a pest control agent containing the compound or a salt thereof as an active ingredient; a method for controlling a pest by applying an effective amount of the compound or a salt thereof; and others.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2017/065237 A1

OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

式（Ｉ）：〔式中、Ｒ[1]はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、ニトロ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル又はＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]であり；Ｒ[2]及びＲ[3]は各々独立に、ハロゲン等であり；ｍは０～２の整数であり；ｎ及びｐは各々独立に、０～５の整数である〕で表されるチエノピロール系化合物又はその塩、該化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤、該化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法等を提供する。

明　細　書

発明の名称 ：

チエノピロール系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規なチエノピロール系化合物又はその塩、該化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

背景技術

[0002] 特許文献１には、特定のイソインドリノン系化合物が、殺虫剤として有用であることが記載されている。しかしながら、この化合物は、母核の縮合環がイソインドリノン環である点で、本発明化合物とは異なる。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献1：国際公開第２００４／１１０１４９号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、有害昆虫類等が抵抗性を獲得しその使用が制限されるなど、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤の開発が望まれている。本発明の目的は、有害生物に対して高活性な化合物又はその塩を提供すること、該化合物又はその塩を用いた有害生物防除剤を提供すること、並びに該化合物又はその塩を施用して有害生物を防除する方法を提供することである。

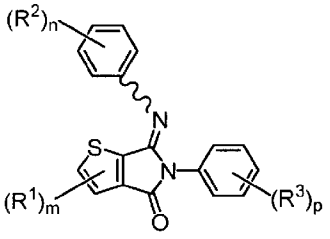
課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべく、種々検討した。その結果、チエノピロール系化合物が、低薬量で有害昆虫類等の有害生物に

対して極めて高い防除効果を有することを見出し、本発明を完成した。

即ち本発明は、式（Ｉ）：

[0006] [化1]



(I)

[0007] 〔式中、Ｒ[1]はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、ニトロ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル又はＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]であり；Ｒ[2]及びＲ[3]は各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ニトロ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであり；Ａはハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ又はシアノであり；Ｒ[4]及びＲ[5]は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルであり；ｍは０～２の整数であり；ｎ及びｐは各々独立に、０～５の整数であり；ｎ＝２の場合、２つのＲ[2]は互いに結合してＲ[2]が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのＲ[2]部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのＲ[3]は互いに結合してＲ[3]が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのＲ[3]部分はＡで置換されてもよい〕で表されるチエノピロール系化合物又はその塩、該化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤、並びに該化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法に関する。

発明の効果

[0008] 前記式（Ｉ）の化合物又はその塩は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

発明を実施するための形態

[0009] 前記式（Ｉ）の化合物中のハロゲン原子又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は１又は２以上であってよく、２以上の場合、各ハロゲン原子は同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置は何れの位置でもよい。

[0010] 前記式（Ｉ）の化合物中のアルキル又はアルキル部分としては、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、ノルマルペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ノルマルヘキシル、ネオヘキシルのような直鎖又は分岐鎖状のC_1－C_6の基が挙げられる。

[0011] 前記式（Ｉ）の化合物中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのような環状のC_3－C_6の基が挙げられる。

[0012] 前記式（Ｉ）の化合物の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、ｐ－トルエンスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

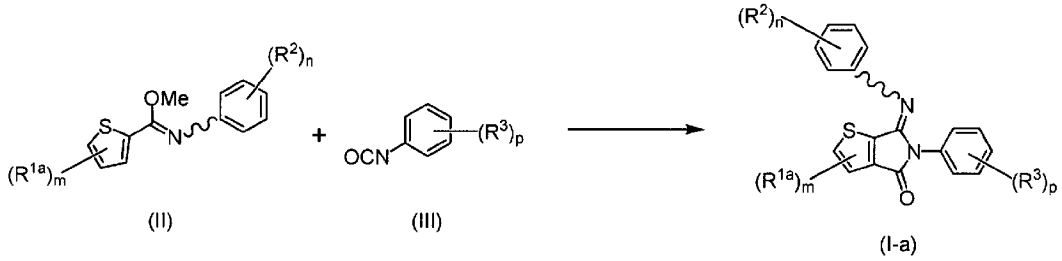
[0013] 前記式（Ｉ）の化合物又はその塩には、立体異性体、光学異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本願明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種

類によっては、前記式（Ｉ）とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

[0014] 前記式（Ｉ）の化合物又はその塩（以下、本発明化合物と略す）は、以下の製造方法、並びに通常の塩の製造方法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

[0015] 製法〔１〕

[化2]



[0016] 製法〔１〕において、Ｒ^{1a}はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ又はニトロであり、Ｍｅはメチル基であり；Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、ｍ、ｎ及びｐは前述の定義通りである。

製法〔１〕の反応では、式（ＩＩ）の化合物と式（ＩＩＩ）の化合物を遷移金属触媒の存在下、溶媒中で反応させることにより、式（Ｉ－ａ）の化合物を製造することができる。

式（ＩＩＩ）の化合物は、公知物であるか、或いは、式（ＩＩＩ）の化合物に対応するアニリンと、ホスゲン、ジホスゲン又はトリホスゲンを反応させることにより製造することができる。式（ＩＩＩ）の化合物は、式（ＩＩ）の化合物に対して１～３倍モル、望ましくは１～１．５倍モル使用することができる。

遷移金属触媒としては、例えば酢酸パラジウム、ジクロロビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、トリス（ジベンジリデン）ジパラジウムなどのパラジウム化合物類

；レニウムカルボニル、ブロモトリカルボニル（テトラヒドロフラン）レニウムダイマーなどのレニウム化合物類などから適宜選択することができる。遷移金属触媒は、式（ＩＩ）の化合物に対して０．００１～１倍モル、望ましくは０．０１～０．１倍モル使用することができる。

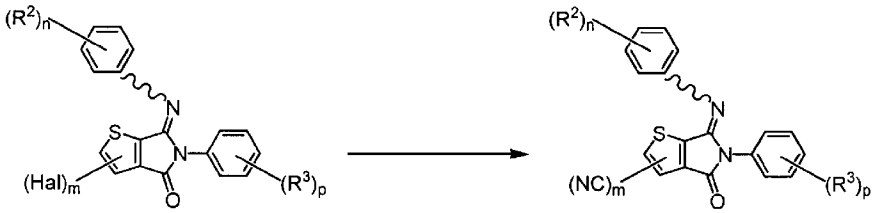
[0017] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

反応温度は、通常２０～２００℃、望ましくは５０～１８０℃である。

反応時間は、通常１～４８時間、望ましくは１０～３０時間である。

[0018] 製法〔２〕

[化3]



[0019] 製法〔２〕において、Ｈａｌはハロゲンであり；R^2、R^3、ｍ、ｎ及びｐは前述の定義通りである。

製法〔２〕では、式（Ｉ－ａ－１）の化合物と、シアノ化剤を遷移金属触媒の存在下、溶媒中で反応させることにより、式（Ｉ－ｂ－１）の化合物を製造することができる。

[0020] 遷移金属触媒としては、例えば酢酸パラジウム、ジクロロビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、トリス（ジベンジリデン）ジパラジウムなどのパラジウム化合物類；１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンなどから適宜選択することができる。遷移金属触媒は、式（Ｉ－ａ－１）の化合物に対して０．０１～１倍モル、望ましくは０．０１～０．２倍モル使用することができる。

[0021] シアノ化剤としては、例えばシアン化亜鉛、シアン化カリウム、シアン化銅などから適宜選択することができる。シアノ化剤は、式の（Ｉ－ａ－１）の化合物に対して０．１～５倍モル、望ましくは０．５～２倍モル使用することができる。

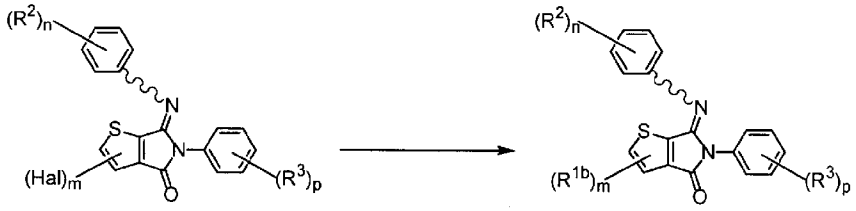
[0022] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

反応温度は、通常２０～２００℃、望ましくは５０～１５０℃である。

反応時間は、通常０．５～１２時間、望ましくは１～５時間である。

[0023] 製法〔３〕

[化4]



[0024] 製法〔３〕において、Ｈａｌはハロゲンであり；Ｒ^{1b}はＡで置換されてもよいフェニルであり；Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、ｍ、ｎ及びｐは前述の定義通りである。

製法〔３〕では、式（Ｉ－ａ－１）の化合物と、Ａで置換されてもよいフェニルボロン酸を、遷移金属触媒及び塩基の存在下、溶媒中で反応させることにより、式（Ｉ－ｂ－２）の化合物を製造することができる。

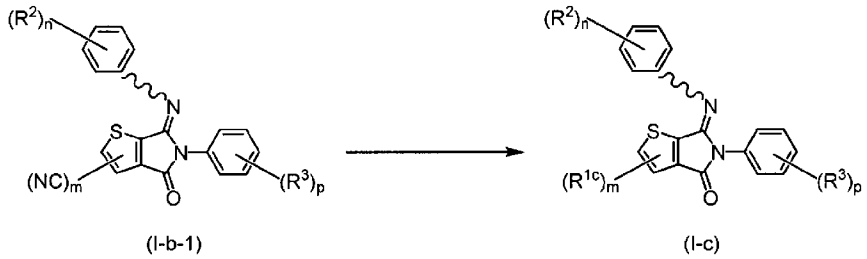
[0025] 遷移金属触媒としては、製法〔２〕に記載のものを使用できる。また、その使用量も製法〔２〕と同様とすることができる。

[0026] 塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属重炭酸塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどのアルコール金属塩類；トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン、ピリジン、４－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノピリジン、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］－７－ウンデセンなどの有機塩基類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。塩基は、式（Ｉ－ａ－１）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～３倍モル使用することができる。

[0027] 溶媒としては、製法〔２〕に記載のものや水などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。また、反応温度及び反応時間は、製法〔２〕と同様とすることができる。

[0028] 製法〔４〕

[化5]



[0029] 製法〔４〕において、Ｒ^{1c}はカルボキシ、アルコキシカルボニル又はＣＯＮＨ$_2$であり、Ｒ^2、Ｒ^3、ｍ、ｎ及びｐは前述の定義通りである。

製法〔４〕では、式（Ｉ－ｂ－１）の化合物を、酸又は塩基を用いて、加水分解することにより、式（Ｉ－ｃ）の化合物を製造することができる。なお、Ｒ^{1c}がアルコキシカルボニルである式（Ｉ－ｃ）の化合物は、Ｒ^{1c}がカルボキシである化合物とアルコールを通常の方法で、エステル化することにより、製造することができる。

[0030] 酸としては、例えば塩酸、硫酸などから適宜選択することができる。

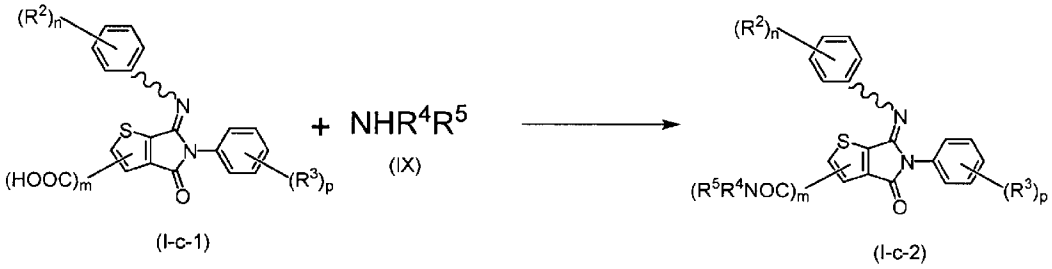
塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属重炭酸塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどのアルコール金属塩類などから適宜選択することができる。

反応温度は、通常２０～２００℃、望ましくは５０～１５０℃である。

反応時間は、通常３～４８時間、望ましくは１２～２４時間である。

[0031] 製法〔５〕

[化6]



[0032] 製法〔５〕において、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、ｍ、ｎ及びｐは前述の定義通りである。

製法〔５〕では、式（Ｉ－ｃ－１）の化合物と、式（ＩＸ）で表されるアミン又はその塩を、縮合剤の存在下、溶媒中で反応させることにより、式（Ｉ－ｃ－２）の化合物を製造することができる。

また、式（Ｉ－ｃ－２）の化合物は、式（Ｉ－ｃ－１）の化合物と、塩化チオニル又は塩化オキサリルとの反応物を、式（ＩＸ）で表されるアミンと、塩基の存在下、溶媒中で反応させることによっても製造することができる。

[0033] 塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属重炭酸塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどのアルコール金属塩類；トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン、ピリジン、４－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノピリジン、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］－７－ウンデセンなどの有機塩基類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。塩基は、式（Ｉ－ｃ－１）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～３倍モル使用することができる。

[0034] 縮合剤としては、例えば１－（３－（ジメチルアミノ）プロピル）－３－エチルカルボジイミド又はその塩、Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイ

ミドなどのカルボジイミド系縮合剤；Ｎ，Ｎ’－カルボニルジイミダゾールなどのイミダゾール系縮合剤；（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウム　クロリドなどのトリアジン系縮合剤；などから適宜選択することができる。縮合剤は、式（Ｉ－ｃ－１）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～２倍モル使用することができる。

[0035] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のような脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

反応温度は、通常－５０～２００℃、望ましくは－１０～１００℃である。

反応時間は、通常０．５～４８時間、望ましくは１～２４時間である。

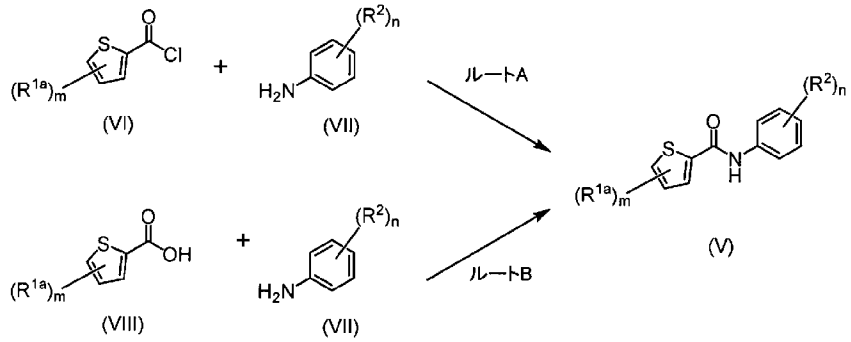
[0036] 中間体製法

製法〔１〕で使用される式（ＩＩ）の化合物は、以下の第１工程～第３工程から成る方法に従って製造できる。

〔第１工程〕

[0037]

[化7]



[0038] 第１工程において、Ｒ^{1a}、Ｒ^{2}、ｍ及びｎは前述の定義通りである。

第１工程のルートＡの反応は、式（ＶＩ）の化合物と式（ＶＩＩ）の化合物を塩基の存在下、溶媒中で反応させることにより行うことができる。

第１工程のルートＢの反応は、式（ＶＩＩＩ）の化合物と式（ＶＩＩ）の化合物を縮合剤の存在下、溶媒中で反応させることにより行うことができる。

式（ＶＩ）の化合物は、公知物であるか、あるいは、対応するカルボン酸と塩化チオニル又は塩化オキサリルとを反応させることにより製造することができる。式（ＶＩ）の化合物は、式（ＶＩＩ）の化合物に対して１～３倍モル、望ましくは１～１．５倍モル使用することができる。

式（ＶＩＩＩ）の化合物は、式（ＶＩＩ）の化合物に対して１～３倍モル、望ましくは１～１．５倍モル使用することができる。

[0039] 塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属重炭酸塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどのアルコール金属塩類；トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン、ピリジン、４－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノピリジン、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］－７－ウンデセンなどの有機塩基類；などから１種又は２種以上を

適宜選択することができる。塩基は、式（ＶＩＩ）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～３倍モル使用することができる。

[0040] 縮合剤としては、例えば１－（３－（ジメチルアミノ）プロピル）－３－エチルカルボジイミド又はその塩、Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミドなどのカルボジイミド系縮合剤；Ｎ，Ｎ’－カルボニルジイミダゾールなどのイミダゾール系縮合剤；（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウム　クロリドなどのトリアジン系縮合剤；などから適宜選択することができる。縮合剤は、式（ＶＩＩＩ）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～２倍モル使用することができる。

[0041] ルートＡでもルートＢでも同様の溶媒が使用できる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

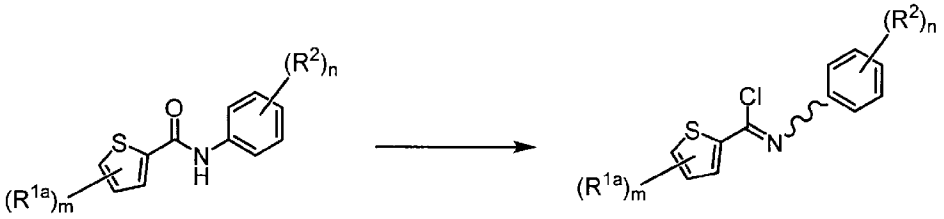
反応温度は、通常－５０～２００℃、望ましくは－１０～１００℃である。

反応時間は、通常０．５～４８時間、望ましくは１～２４時間である。

[0042] 〔第２工程〕

[0043]

[化8]



(V) (IV)

[0044] 第２工程において、Ｒ^{1a}、Ｒ^{2}、ｍ及びｎは前述の定義通りである。

第２工程の反応は、式（Ｖ）の化合物と塩化チオニル又は塩化オキサリルとを必要に応じ溶媒の存在下で反応させることにより行うことができる。

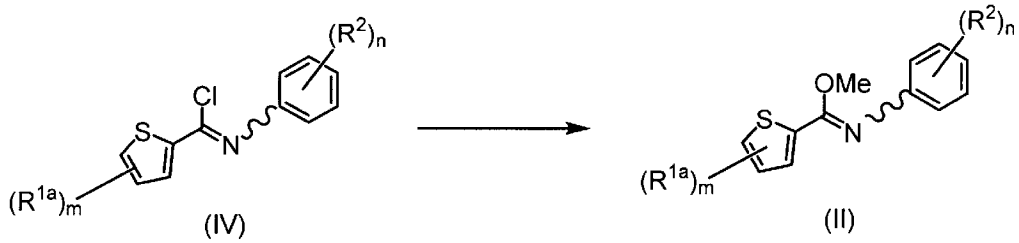
溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

反応温度は、通常－５０～２００℃、望ましくは２０～１００℃である。

反応時間は、通常０．５～４８時間、望ましくは１～２４時間である。

[0045] 〔第３工程〕

[0046] [化9]



(IV) (II)

[0047] 第３工程において、R^{1a}、R^{2}、ｍ及びｎは前述の定義通りである。Ｍｅはメチル基を表す。

第３工程の反応は、式（ＩＶ）の化合物とメタノールを塩基の存在下、溶媒中で反応させることにより行うことができる。

塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属重炭酸塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの金属水素化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどのアルコール金属塩類；トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン、ピリジン、４－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノピリジン、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］－７－ウンデセンなどの有機塩基類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。塩基は、式（ＩＶ）の化合物に対して１～５倍モル、望ましくは１～３倍モル使用することができる。

[0048] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから１種又は２種以上を適宜選択することができる。

反応温度は、通常－５０～２００℃、望ましくは－１０～１００℃である。

反応時間は、通常０．５～４８時間、望ましくは１～２４時間である。

[0049] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる有害昆虫類、ダニ類、線虫類又は土壌害虫類の防除剤、例えば、農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用である。

[0050] 本発明化合物は、有害生物防除剤、例えば、農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用であるが、具体的には、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ等のようなアブラムシ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリンガ、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類等のような農業害虫類；ナメクジ、マイマイ等のような腹足類；イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカ等のような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類等のような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類等のような衣類、家屋害虫類；等の有害昆虫類、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニ等のような植物寄生性ダニ類；ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニ等のような屋内塵性ダニ類；等のダニ類、ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシンガレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウ等のような植物寄生性線虫類；等の線虫類、ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚類；等の土壌害虫類の防除に有効である。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類等の防除に特に有効である。その中でも、植物寄生性ダニ類、農業害虫類の防除にさらに優れた効果を示すため、殺虫剤又は殺ダニ剤として非常に有用である。また、本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤、ネオニコチノイド剤等の薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有

効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する有害生物防除剤を土壌に処理することによって土壌に生息する有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部に生息する有害昆虫類、ダニ類、線虫類をも防除することができる。

[0051] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様としては、前記した植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類等を総合的に防除する有害生物防除剤が挙げられる。

[0052] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、通常、該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、顆粒水溶剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤等の種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉等の固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチル－２－ピロリドン、アルコール等の溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル

塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルムアルデヒド縮合物のような陰イオン系の界面活性剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤；オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィン等の植物油や鉱物油；等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、１種又は２種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、等通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は０．００１：９９．９９９～９５：５、望ましくは０．００５：９９．９９５～９０：１０である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。

[0053] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、有害生物の種類や発生状況等の相違により一概に規定できないが、一般に０．０５～８００，０００ｐｐｍ、望ましくは０．５～５００，０００ｐｐｍの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用

量は、１ヘクタール当り本発明化合物が０．０５～５０，０００ｇ、望ましくは１～３０，０００ｇである。また、本発明には、このような施用方法による有害生物の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。

[0054] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常、一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生及び生育を阻害することも可能である。また、いわゆる超高濃度少量散布法（ｕｌｔｒａ　ｌｏｗ　ｖｏｌｕｍｅ　ａｐｐｌｉｃａｔｉｏｎ　ｍｅｔｈｏｄ）により施用することもできる。この方法においては、活性成分を１００％含有することが可能である。

[0055] また、本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤等と混用或いは併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤、等が挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の１種又は２種以上とを混用或いは併用した殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物も含まれる。

[0056] 上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えばプロフェノホス（profenofos）、ジクロルボス（dichl

orvos）、フェナミホス（fenamiphos）、フェニトロチオン（fenitrothion）、ＥＰＮ、ダイアジノン（diazinon）、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル（chlorpyrifos‐methyl）、アセフェート（acephate）、プロチオホス（prothiofos）、ホスチアゼート（fosthiazate）、カズサホス（cadusafos）、ジスルホトン（dislufoton）、イソキサチオン（isoxathion）、イソフェンホス(isofenphos)、エチオン(ethion)、エトリムホス(etrimfos)、キナルホス(quinalphos)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、スルプロホス(sulprofos)、チオメトン(thiometon)、バミドチオン(vamidothion)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、プロパホス(propaphos)、ホサロン(phosalone)、ホルモチオン(formothion)、マラチオン(malathion)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、シアノホス(cyanophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、メチダチオン(methidathion)、フェントエート(phenthoate)、ＥＳＰ、アジンホスメチル(azinphos-methyl)、フェンチオン(fenthion)、ヘプテノホス(heptenophos)、メトキシクロル（methoxychlor）、パラチオン（parathion）、ホスホカルブ(phosphocarb)、デメトン-Ｓ-メチル（demeton-S-methyl）、モノクロトホス（monocrotophos）、メタミドホス（methamidophos）、イミシアホス（imicyafos）、パラチオン-メチル（parathion-methyl）、テルブホス（terbufos）、ホスファミドン（phosphamidon）、ホスメット（phosmet）、ホレート（phorate）、ホキシム(phoxim)、トリアゾホス（triazophos）のような有機リン酸エステル系化合物；

カルバリル（carbaryl）、プロポキスル（propoxur）、アルジカルブ（aldicarb）、カルボフラン（carbofuran）、チオジカルブ（thiodicarb）、メソミル（methomyl）、オキサミル（oxamyl）、エチオフェンカルブ（ethiofencarb）、ピリミカルブ（pirimicarb）、フェノブカルブ（fenobucarb）、カルボスルファン（carbosulfan）、ベンフラカルブ（benfuracarb）、ベンダイオカルブ（bendiocarb）、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(

isoprocarb)、メトルカルブ(metolcarb)、キシリルカルブ(xylylcarb)、ＸＭＣ、フェノチオカルブ（fenothiocarb）のようなカーバメート系化合物；

カルタップ（cartap）、チオシクラム（thiocyclam）、ベンスルタップ（bensultap）、チオスルタップナトリウム（thiosultap-sodium）、チオスルタップジナトリウム（thiosultap-disodium）、モノスルタップ（monosultap）、ビスルタップ（bisultap）、シュウ酸水素チオシクラム（thiocyclam hydrogen oxalate）のようなネライストキシン誘導体；

ジコホル（dicofol）、テトラジホン（tetradifon）、エンドスルファン（endosulfan）、ジエノクロル（dienochlor）、ディルドリン（dieldrin）のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ（fenbutatin oxide）、シヘキサチン（cyhexatin）のような有機金属系化合物；

フェンバレレート（fenvalerate）、ペルメトリン（permethrin）、シペルメトリン（cypermethrin）、デルタメトリン（deltamethrin）、シハロトリン（cyhalothrin）、テフルトリン（tefluthrin）、エトフェンプロックス（ethofenprox）、フルフェンプロックス（flufenprox）、シフルトリン（cyfluthrin）、フェンプロパトリン（fenpropathrin）、フルシトリネート（flucythrinate）、フルバリネート(fluvalinate)、シクロプロトリン（cycloprothrin）、ラムダシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ピレスリン（pyrethrins）、エスフェンバレレート（esfenvalerate）、テトラメスリン（tetramethrin）、レスメスリン（resmethrin）、プロトリフェンブト(protrifenbute)、ビフェントリン（bifenthrin）、ゼータシペルメトリン（zeta-cypermethrin）、アクリナトリン（acrinathrin）、アルファシペルメトリン（alpha-cypermethrin）、アレスリン（allethrin）、ガンマシハロトリン（gamma-cyhalothrin）、シータシペルメトリン（theta-cypermethrin）、タウフルバリネート（tau-fluvalinate）、トラロメスリン（tralomethrin）、プロフルスリン（profluthrin）、ベータシペルメトリン（beta-cypermethrin）、ベータシフルトリン（beta-cyfluthrin）、メトフルトリン（metofluthrin）、フェ

ノトリン(phenothrin)、フルメトリン(flumethrin)、デカメトリン（decamethrin）のようなピレスロイド系化合物；

ジフルベンズロン(diflubenzuron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、トリフルムロン(triflumuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフェヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン（noviflumuron）、ビストリフルロン（bistrifluron）、フルアズロン（fluazuron）のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン（methoprene）、ピリプロキシフェン（pyriproxyfen）、フェノキシカルブ（fenoxycarb）、ジオフェノラン（diofenolan）のような幼若ホルモン様化合物；

ピリダベン（pyridaben）のようなピリダジノン系化合物；

フェンピロキシメート（fenpyroximate）、フィプロニル（fipronil）、テブフェンピラド（tebufenpyrad）、エチプロール（ethiprole）、トルフェンピラド（tolfenpyrad）、アセトプロール（acetoprole）、ピラフルプロール（pyrafluprole）、ピリプロール（pyriprole）のようなピラゾール系化合物；

イミダクロプリド（imidacloprid）、ニテンピラム（nitenpyram）、アセタミプリド（acetamiprid）、チアクロプリド（thiacloprid）、チアメトキサム（thiamethoxam）、クロチアニジン（clothianidin）、ニジノテフラン（nidinotefuran）、ジノテフラン（dinotefuran）、ニチアジン(nithiazine)のようなネオニコチノイド系化合物；

テブフェノジド（tebufenozide）、メトキシフェノジド（methoxyfenozide）、クロマフェノジド（chromafenozide）、ハロフェノジド（halofenozide）のようなヒドラジン系化合物；

ピリダリル（pyridalyl）、フロニカミド（flonicamid）のようなピリジン系化合物； スピロジクロフェン（spirodiclofen）、スピロメシフェン（spiromesifen）、スピロテトラマト（spirotetramat）のような環状ケトエノー

ル系化合物；

フルアクリピリム（fluacrypyrim）のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム（flufenerim）のようなピリジナミン系化合物；

ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラゾン系化合物、また、その他の化合物として、フロメトキン（flometoquin）、ブプロフェジン（buprofezin）、ヘキシチアゾクス（hexythiazox）、アミトラズ（amitraz）、クロルジメホルム（chlordimeform）、シラフルオフェン（silafluofen）、トリアザメイト（triazamate）、ピメトロジン（pymetrozine）、ピリミジフェン（pyrimidifen）、クロルフェナピル（chlorfenapyr）、インドキサカルブ（indoxacarb）、アセキノシル（acequinocyl）、エトキサゾール（etoxazole）、シロマジン（cyromazine）、１，３－ジクロロプロペン（1, 3-dichloropropene）、ジアフェンチウロン（diafenthiuron）、ベンクロチアズ（benclothiaz）、ビフェナゼート（bifenazate）、プロパルギット（propargite）、クロフェンテジン（clofentezine）、メタフルミゾン（metaflumizone）、フルベンジアミド（flubendiamide）、シフルメトフェン（cyflumetofen）、クロラントラニリプロール（chlorantraniliprole）、シアントラニリプロール（cyantraniliprole）、シクラニリプロール（cyclaniliprole）、シエノピラフェン（cyenopyrafen）、ピリフルキナゾン（pyrifluquinazon）、フェナザキン（fenazaquin）、アミドフルメット（amidoflumet）、スルフルアミド（sulfluramid）、ヒドラメチルノン（hydramethylnon）、メタアルデヒド（metaldehyde）、リアノジン（ryanodine）、ベルブチン（verbutin）、クロロベンゾエート（chlorobenzoate）、チアゾリルシナノニトリル（thiazolylcinnanonitrile）、スルホキサフロル（sulfoxaflor）、フルエンスルホン（fluensulfone）、トリフルメゾピリム（triflumezopyrim）、アフィドピロペン（afidopyropen）、フルピラジフロン（flupyradifuron）、ＮＣ－５１５、テトラニリプロール（tetraniliprole）、フルララネル（fluralaner）、broflanilide、dicloromezotiaz、fluhexafon、チオキサザフェン（tioxazafen）、ＤＫＮ－２６０１、ＭＳＩ－１３

０２、ＮＡ－８９、ＭＩＥ－１２０９、ＺＤＩ－２５０２、ＭＳＩ－１５０１、ＭＳＩ－１６０１、ＮＮＩ－１５０１、Ｓ－１５７８、ＢＡＩ－１６０２、ＢＡＩ－１６０３、ＤＡＩ－１６０１のような化合物；等が挙げられる。更に、Bacillus thuringiensis aizawai、Bacillus thuringiensis kurstaki、Bacillus thuringiensis israelensis、Bacillus thuringiensis japonensis、Bacillus thuringiensis tenebrionis等のBacillus thuringiensisが生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤等のような微生物農薬；アベルメクチン（avermectin）、エマメクチンベンゾエート（emamectin Benzoate）、ミルベメクチン（milbemectin）、ミルベマイシン（milbemycin）、スピノサド（spinosad）、イベルメクチン（ivermectin）、レピメクチン（lepimectin）、ＤＥ－１７５、アバメクチン（abamectin）、エマメクチン（emamectin）、スピネトラム（spinetoram)のような抗生物質及び半合成抗生物質;アザディラクチン（azadirachtin）、ロテノン（rotenone）のような天然物；ディート（deet）のような忌避剤；等と、混用、併用することもできる。

[0057] 上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えば、メパニピリム（mepanipyrim）、ピリメサニル（pyrimethanil）、シプロジニル（cyprodinil）、フェリムゾン（ferimzone）のようなアニリノピリミジン系化合物；

５－クロロ－７－（４－メチルピペリジン－１－イル）－６－（２，４，６－トリフルオロフェニル）［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジンのようなトリアゾロピリミジン系化合物；

フルアジナム（fluazinam）のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン（triadimefon）、ビテルタノール（bitertanol）、トリフルミゾール（triflumizole）、エタコナゾール（etaconazole）、プロピコナゾール（propiconazole）、ペンコナゾール（penconazole）、フルシラゾール（flusilazole）、マイクロブタニル（myclobutanil）、シプロコナゾール（cyproconazole）、テブコナゾール（tebuconazole）、ヘキサコナゾール（

hexaconazole）、ファーコナゾールシス（furconazole－cis）、プロクロラズ（prochloraz）、メトコナゾール（metconazole）、エポキシコナゾール（epoxiconazole）、テトラコナゾール（tetraconazole）、オキスポコナゾールフマル酸塩（oxpoconazole fumarate）、シプコナゾール（sipconazole）、プロチオコナゾール（prothioconazole）、トリアジメノール（triadimenol）、フルトリアホール（flutriafol）、ジフェノコナゾール（difenoconazole）、フルキンコナゾール（fluquinconazole）、フェンブコナゾール（fenbuconazole）、ブロムコナゾール（bromuconazole）、ジニコナゾール（diniconazole）、トリシクラゾール（tricyclazole）、プロベナゾール（probenazole）、シメコナゾール（simeconazole）、ペフラゾエート（pefurazoate）、イプコナゾール（ipconazole）、イミベンコナゾール（imibenconazole）のようなアゾール系化合物；

キノメチオネート（quinomethionate）のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ（maneb）、ジネブ（zineb）、マンゼブ（mancozeb）、ポリカーバメート（polycarbamate）、メチラム（metiram）、プロピネブ（propineb）、チラム(thiram)のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライド（fthalide）、クロロタロニル（chlorothalonil）、キントゼン（quintozene）のような有機塩素系化合物；

ベノミル（benomyl）、シアゾファミド（cyazofamid）、チオファネートメチル（thiophanate－methyl）、カーベンダジム（carbendazim）、チアベンダゾール(thiabendazole)、フベリアゾール(fuberiazole)のようなイミダゾール系化合物；

シモキサニル（cymoxanil）のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル（metalaxyl）、メタラキシルーM（metalaxyl-M）、メフェノキサム(mefenoxam)、オキサジキシル（oxadixyl）、オフレース（ofurace）、ベナラキシル（benalaxyl）、ベナラキシルーM（benalaxyl-M、別名キララキシル(kiralaxyl、chiralaxyl)）、フララキシル（furalaxyl）、シプロフラム（cyprofuram）、カルボキシン(carboxin)、オキシカルボキシン(oxyc

arboxin)、チフルザミド(thifluzamide)、ボスカリド(boscalid)、ビキサフェン(bixafen)、イソチアニル(isothianil)、チアジニル（tiadinil）、セダキサン(sedaxane)のようなアニリド系化合物；

ジクロフルアニド（dichlofluanid）のようなスルファミド系化合物；

水酸化第二銅（cupric hydroxide）、有機銅（oxine copper）のような銅系化合物； ヒメキサゾール（hymexazol）のようなイソキサゾール系化合物；

ホセチルアルミニウム（fosetyl－Al）、トルクロホスメチル（tolclofos－Methyl）、Ｓ－ベンジル Ｏ，Ｏ－ジイソプロピルホスホロチオエート、Ｏ－エチル Ｓ，Ｓ－ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネート、エジフェンホス（edifenphos）、イプロベンホス（iprobenfos）のような有機リン系化合物；

キャプタン（captan）、キャプタホル（captafol）、フォルペット（folpet）のようなフタルイミド系化合物；

プロシミドン（procymidone）、イプロジオン（iprodione）、ビンクロゾリン（vinclozolin）のようなジカルボキシイミド系化合物；

フルトラニル（flutolanil）、メプロニル（mepronil）のようなベンズアニリド系化合物；

ペンチオピラド(penthiopyrad)、３－（ジフロロメチル）－１－メチル－Ｎ－［（１ＲＳ，４ＳＲ，９ＲＳ）－１，２，３，４－テトラヒドロ－９－イソプロピル－１，４－メタノナフタレン－５－イル］ピラゾール－４－カルボキサミドと３－（ジフロロメチル）－１－メチル－Ｎ－［（１ＲＳ，４ＳＲ，９ＳＲ）－１，２，３，４－テトラヒドロ－９－イソプロピル－１，４－メタノナフタレン－５－イル］ピラゾール－４－カルボキサミドの混合物（イソピラザム（isopyrazam））、シルチオファム（silthiopham）、フェノキサニル（fenoxanil）、フラメトピル（furametpyr）のようなアミド系化合物；

フルオピラム(fluopyram)、ゾキサミド（zoxamide）のようなベンズアミド

系化合物；

トリホリン（triforine）のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス（pyrifenox）のようなピリジン系化合物；

フェナリモル（fenarimol）のようなカルビノール系化合物；

フェンプロピディン（fenpropidin）のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ（fenpropimorph）、トリデモルフ(tridemorph)のようなモルフォリン系化合物；

フェンチンヒドロキシド（fentin hydroxide）、フェンチンアセテート（fentin acetate）のような有機スズ系化合物；

ペンシキュロン（pencycuron）のような尿素系化合物；

ジメトモルフ（dimethomorph）、フルモルフ（flumorph）のようなシンナミック酸系化合物；

ジエトフェンカルブ（diethofencarb）のようなフェニルカーバメート系化合物；

フルジオキソニル（fludioxonil）、フェンピクロニル（fenpiclonil）のようなシアノピロール系化合物；

アゾキシストロビン（azoxystrobin）、クレソキシムメチル（kresoxim-methyl）、メトミノストロビン（metominostrobin）、トリフロキシストロビン（trifloxystrobin）、ピコキシストロビン（picoxystrobin）、オリザストロビン（oryzastrobin）、ジモキシストロビン（dimoxystrobin）、ピラクロストロビン（pyraclostrobin）、フルオキサストロビン（fluoxastrobin）のようなストロビルリン系化合物；

ファモキサドン（famoxadone）のようなオキサゾリジノン系化合物；

エタボキサム（ethaboxam）のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；

イプロバリカルブ（iprovalicarb）、ベンチアバリカルブ－イソプロピル（benthiavalicarb-isopropyl）のようなバリンアミド系化合物；

メチル　Ｎ－（イソプロポキシカルボニル）－Ｌ－バリル－（３ＲＳ）－３－（４－クロロフェニル）－β－アラニナート（valifenalate）のような

アシルアミノアシッド系化合物；

フェナミドン（fenamidone）のようなイミダゾリノン系化合物；

フェンヘキサミド（fenhexamid）のようなハイドロキシアニリド系化合物；

フルスルファミド（flusulfamide）のようなベンゼンスルホンアミド系化合物；

シフルフェナミド（cyflufenamid）のようなオキシムエーテル系化合物；

アトラキノン系化合物；

クロトン酸系化合物；

バリダマイシン（validamycin）、カスガマイシン（kasugamycin）、ポリオキシン(polyoxins)のような抗生物質；

イミノクタジン（iminoctadine）、ドディン（dodine）のようなグアニジン系化合物； ６－ターシャリーブチル－８－フルオロ－２，３－ジメチルキノリン－４－イル　アセテート（テブフロキン(tebufloquin)）のようなキノリン系化合物；

（Ｚ）－２－（２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニルチオ）－２－（３－（２－メトキシフェニル）チアゾリジン－２－イリデン）アセトニトリル（フルチアニル（ｆｌｕｔｉａｎｉｌ））のようなチアゾリジン系化合物；

その他の化合物として、ピリベンカルブ（pyribencarb）、イソプロチオラン（isoprothiolane）、ピロキロン（pyroquilon）、ジクロメジン（diclomezine）、キノキシフェン（quinoxyfen）、プロパモカルブ塩酸塩（propamocarb hydrochloride）クロルピクリン（chloropicrin）、ダゾメット（dazomet）、メタムナトリウム塩（metam‐sodium）、ニコビフェン（nicobifen）、メトラフェノン（metrafenone）、UBF-307、ジクロシメット（diclocymet）、プロキンアジド（proquinazid）、アミスルブロム（amisulbrom；別名アミブロドール（amibromdole））、３－（２，３，４－トリメトキシ－６－メチルベンゾイル）－５－クロロ－２－メトキシ－４－メチルピリジン、４－（

２，３，４－トリメトキシ－６－メチルベンゾイル）－２，５－ジクロロ－３－トリフルオロメチルピリジン、ピリオフェノン（pyriofenone）、イソフェタミド（isofetamid）、マンジプロパミド（mandipropamid）、フルオピコリド(fluopicolide)、カルプロパミド（carpropamid）、メプチルジノキャップ（meptyldinocap）、スピロキサミン（spiroxamine）、フェンピラザミン（fenpyrazamine）、マンデストロビン（mandestrobin）、ZF-9646、BCF-051、BCM-061、BCM-062等が挙げられる。

[0058] その他、本発明化合物と混用或いは併用することが可能な農薬としては、例えば、The Pesticide Manual（第15版）に記載されているような除草剤の有効成分化合物、特に土壌処理型のもの等がある。

[0059] 次に、本発明化合物の望ましい実施形態のいくつかを例示するが、これらは本発明を限定するものではない。

[0060] （１）前記式（Ｉ）のチエノピロール系化合物又はその塩。

（２）R^1がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（３）R^1がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、ＣＯＮＲ^{4}Ｒ^{5}又はＡで置換されてもよいフェニルであり、R^4及びR^5は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（４）R^1がハロゲン、アルキル、ハロアルキル又はシアノである、（３）に記載の化合物又はその塩。

（５）R^1がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ又はニトロである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（６）R^1がハロゲンである、（５）に記載の化合物又はその塩。

（７）R^1がシアノである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（８）R^1がＡで置換されてもよいフェニルである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（９）R^1がカルボキシ、アルコキシカルボニル又はＣＯＮR^4R^5であり、R^4及びR^5は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルである、（１）に記載の化合物又はその塩。

（１０）R^1がカルボキシ、$CONH_2$又はアルコキシカルボニルである、（９）に記載の化合物又はその塩。

（１１）R^1がカルボキシである、（９）に記載の化合物又はその塩。

（１２）R^1がＣＯＮR^4R^5であり、R^4及びR^5は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルである、（９）に記載の化合物又はその塩。

（１３）R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであるか；ｎ＝２の場合、２つのR^2は互いに結合してR^2が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^2部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのR^3は互いに結合してR^3が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^3部分はＡで置換されてもよい、（１）～（１２）のいずれか１に記載の化合物又はその塩。

（１４）R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであり；ｎ＝２の場合、２つのR^2は互いに結合してR^2が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^2部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのR^3は互いに結合してR^3が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^3部分はＡで置換されてもよい、（１３）に記載の化合物又はその塩。

（１５）R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシである、（１）～（１２）のいずれか１に記載の化合物又はその塩。

（１６）R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシである、（１４）に記載の化合物又はその塩。

（１７）Ａがハロアルキル又はシアノである、（１）～（１６）のいずれか１に記載の化合物又はその塩。

（１８）Ａがハロアルキルである、（１６）に記載の化合物又はその塩。

（１９）ｍが０又は１である、（１）～（１８）のいずれか１に記載の化合物又はその塩。

（２０）ｎ及びｐが各々独立に、０～２の整数である、（１）～（１９）のいずれか１に記載の化合物又はその塩。

（２１）ｐが０又は１である、（２０）に記載の化合物又はその塩。

実施例

[0061] 次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

[0062] 合成例１

５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物Ｎｏ．Ｉ－５）

[0063] （１）４－トリフルオロメトキシアニリン１．０ｇ、トリエチルアミン１．１４ｇ及びテトラヒドロフラン２５ｍＬの混合溶液に２－テノイルクロリド０．８３ｇを滴下した。滴下終了後、室温で１５時間反応させた。溶媒を減圧下に留去し、Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン

－２－カルボキサミド１．６６ｇを得た。

[0064] （２）（１）で得た化合物０．８０ｇと塩化チオニル３ｍＬの混合溶液を１５時間加熱還流させた。反応液を減圧下に留去し、Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン－２－カルボイミドイルクロリド０．８５ｇを得た。

[0065] （３）水素化ナトリウム０．１１ｇとテトラヒドロフラン３ｍＬの混合溶液にメタノール０．１ｇを０℃で滴下した。３０分撹拌した後、（２）で得た化合物０．８５ｇとテトラヒドロフラン１．５ｍＬの混合溶液を０℃で滴下し、０℃で３０分、室温で５時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を水、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝１５／１、容積比、以下同様）で精製して、メチル　Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン－２－カルボイミデート０．５８ｇを得た。

[0066] （４）（３）で得た化合物８０ｍｇとトルエン２ｍＬの混合溶液に４－（トリフルオロメトキシ）フェニルイソシアナート５４ｍｇとレニウムカルボニル４．４ｍｇを加え、１５０℃で２０時間反応させた。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝１０／１）で精製して、油状の目的物（３５ｍｇ）を得た。

[0067] 合成例２

２－ブロモ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物Ｎｏ．Ｉ－１０８）

[0068] （１）２－ブロモチオフェン－５－カルボン酸１．２９ｇとトルエン５ｍＬの混合溶媒に塩化チオニル２．０ｇを加え１００℃で４時間反応させた。反応液を減圧下で留去し、得られた残渣をテトラヒドロフラン４ｍＬに溶解させ、４－トリフルオロメトキシアニリン１．０ｇ、トリエチルアミン１．１

４ｇ及びテトラヒドロフラン８ｍＬの混合溶液に滴下した。滴下終了後、室温で１９時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を水、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、５－ブロモ－Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン－２－カルボキサミド２．０５ｇを得た。

[0069] （２）（１）で得た化合物２．０５ｇと塩化チオニル６ｍＬの混合溶液を２４時間加熱還流させた。反応液を減圧下に留去し、５－ブロモ－Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン－２－カルボイミドイルクロリド２．１５ｇを得た。

[0070] （３）水素化ナトリウム０．２２ｇとテトラヒドロフラン８ｍＬの混合溶液にメタノール０．２ｇを０℃で滴下した。３０分撹拌した後、（２）で得た化合物２．０５ｇとテトラヒドロフラン４ｍＬの混合溶液を０℃で滴下し、０℃で３０分、室温で２０時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を水、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝２０／１）で精製して、メチル　５－ブロモ－Ｎ－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）チオフェン－２－カルボイミデート１．９４ｇを得た。

[0071] （４）（３）で得た化合物０．３２ｇとトルエン４ｍＬの混合溶液に４－（トリフルオロメトキシ）フェニルイソシアナート０．１７ｇとレニウムカルボニル１０ｍｇを加え、１５０℃で２４時間反応させた。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝２０／１）で精製して、油状の目的物（５５ｍｇ）を得た。

[0072] 合成例３

２－シアノ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物Ｎｏ．Ｉ－１９２）

[0073] ２－ブロモ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－１０８）０．６５ｇとＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１２ｍＬの混合溶液にシアン化亜鉛０．１０ｇとトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム６０ｍｇと１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン４０ｍｇを加え、１３０℃で２時間反応させた。反応液を酢酸エチルで希釈した後、２Ｍ水酸化アンモニウム、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝９／１）で精製して、油状の目的物（０．３６ｇ）を得た。

[0074] 合成例４

２－（２－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（４－ブロモフェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－３０７）および２－（２－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（４－（２－（トリフルオロメチル）フェニル）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－３０８）

[0075] ２－クロロ－５－（４－ブロモフェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－６７）５０ｍｇとテトラヒドロフラン１．５ｍＬと水１．５ｍＬの混合溶液に２－（トリフルオロメチル）フェニルボロン酸２３ｍｇと炭酸カリウム２８ｍｇとテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム６ｍｇを加え、１００℃で２時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を水、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル

＝２０／１）で精製して、油状のＩ－３０７（２６ｍｇ）と固体のＩ－３０８（２７ｍｇ）を得た。

[0076] 合成例５

２－カルバモイル－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物Ｎｏ．Ｉ－２９８）

[0077] ２－シアノ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－１９２）０．２７ｇと濃硫酸１ｍＬの混合溶液を室温で１８時間反応させた。反応液に氷を加えた後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝１／１）で精製して、固体の目的物（０．２１ｇ）を得た。

[0078] 合成例６

２－カルボキシ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物Ｎｏ．Ｉ－２９９）

[0079] ２－シアノ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－１９２）０．５８ｇとメタノール１０ｍＬの混合溶液に２Ｍ水酸化ナトリウム水溶液６ｍＬ加え、３１時間加熱還流させた。減圧下、メタノールを留去した後、２Ｍ塩化水素水溶液を加え、３０分撹拌させた。析出した個体をろ過、水で洗浄し、固体の目的物（０．５７ｇ）を得た。

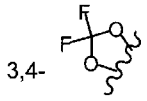
[0080] 合成例７

２－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノカルボニル－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オンの合成（化合物のＮｏ．Ｉ－３００）

[0081] ２－カルボキシ－５－（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）－６－（（４－（トリフルオロメトキシ）フェニル）イミノ）－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－チエノ［２，３－ｃ］ピロール－４－オン（化合物Ｎｏ．Ｉ－２９９）０．１０ｇとジクロロメタン１．６ｍＬの混合溶液にジメチルアミン塩酸塩２５ｍｇと４－Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノピリジン５５ｍｇと１－（３－（ジメチルアミノ）プロピル）－３－エチルカルボジイミド塩酸塩７０ｍｇを加え、室温で６．５時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を水、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：ｎ－ヘプタン／酢酸エチル＝１／１）で精製して、油状の目的物（５８ｍｇ）を得た。

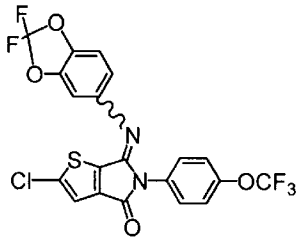
[0082] 次に、本発明に係る式（Ｉ）の化合物の代表例を第１表に挙げる。また、これらの化合物は、前記合成例或いは前記した製造方法に基づいて合成することができる。第１表の物性欄の数値は融点（℃）を、「Ｏｉｌ」は油状物を各々示す。融点が記載されていない化合物についてはそれらの^{1}Ｈ－ＮＭＲスペクトルデータを第２表に挙げる。尚、第１表及び第２表中のＮｏ．は化合物番号を示す。また、表中、Ｍｅはメチル基を表し、Ｅｔはエチル基を表し、Ｐｈはフェニル基を表す。また、R^{1}の欄において、例えば「２－Ｃｌ」と記載された化合物は、表中の化学構造式に付与した置換位置のみがR^{1}で置換されていること、即ち、２位が塩素原子にて置換されていることを表し、「２，３－Cl_2」と記載された化合物は、２位及び３位が塩素原子にて置換されていることを表し、「－」と記載された化合物は無置換であることを表し、他の同様の記載もこれに準じる。R^{2}の欄において、

[0083] [化10]



[0084] と記載された化合物は、式（Ｉ）の化合物において、ｎ＝２の場合、２つのＲ^{2}は互いに結合してＲ^{2}が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成し、そのＲ^{2}部分がフッ素原子で置換されたものである。例えば、第１表中の化合物Ｎｏ．Ｉ－２９４の化学構造は以下のものであることを表している。Ｒ^{3}の欄も同様である。

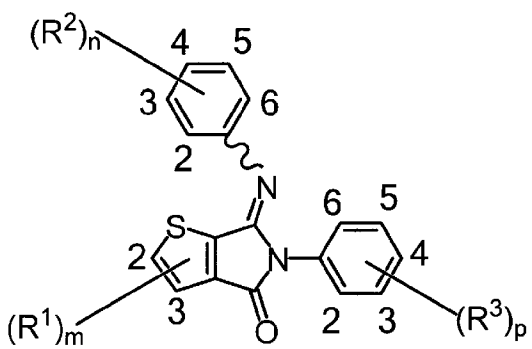
[0085] [化11]



[0086]

[表1]

式（I）：



第1表

No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-1	—	0	—	0	—	0	Oil
I-2	—	0	—	0	4-OCF_3	1	Oil
I-3	—	0	4-OCF_3	1	—	0	Oil
I-4	—	0	4-OCF_3	1	2-OCF_3	1	Oil
I-5	—	0	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-6	—	0	4-OCF_3	1	4-F	1	Oil
I-7	—	0	4-OCF_3	1	4-Cl	1	Oil
I-8	—	0	4-OCF_3	1	4-Br	1	Oil
I-9	—	0	4-OCF_3	1	4-Me	1	Oil
I-10	—	0	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	Oil
I-11	—	0	4-OCF_3	1	4-CN	1	143-145
I-12	—	0	4-OCF_3	1	4-OMe	1	Oil
I-13	—	0	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-14	—	0	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-15	—	0	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-16	—	0	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-17	—	0	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-18	—	0	4-OCF_3	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	225-228
I-19	—	0	4-OCF_3	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	130-133
I-20	—	0	4-OCF_3	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	143-146
I-21	—	0	2-OCF_3	1	2-OCF_3	1	Oil
I-22	—	0	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-23	—	0	3-OCF_3	1	2-OCF_3	1	Oil
I-24	—	0	3-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-25	—	0	4-F	1	4-OCF_3	1	Oil
I-26	—	0	4-Cl	1	4-OCF_3	1	Oil
I-27	—	0	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-28	—	0	4-Me	1	4-OCF_3	1	Oil
I-29	—	0	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-30	—	0	4-OMe	1	4-OCF_3	1	

[0087]

[表2]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-31	—	0	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	Oil
I-32	—	0	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-33	—	0	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-34	—	0	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-35	—	0	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-36	—	0	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-37	—	0	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-38	—	0	4-(2-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-39	—	0	4-(3-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-40	—	0	4-(4-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-41	—	0	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	Oil
I-42	2-Cl	1	—	0	—	0	
I-43	2-Cl	1	—	0	4-OCF_3	1	
I-44	2-Cl	1	4-OCF_3	1	—	0	
I-45	2-Cl	1	4-OCF_3	1	2-OCF_3	1	Oil
I-46	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-47	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-F	1	Oil
I-48	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	Oil
I-49	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	Oil
I-50	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	Oil
I-51	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	Oil
I-52	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	Oil
I-53	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-54	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	Oil
I-55	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-56	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-57	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-58	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	
I-59	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	Oil
I-60	2-Cl	1	4-OCF_3	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	Oil
I-61	2-Cl	1	2-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-62	2-Cl	1	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-63	2-Cl	1	3-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-64	2-Cl	1	3-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-65	2-Cl	1	4-F	1	4-OCF_3	1	Oil

[0088]

[表3]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-66	2-Cl	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	Oil
I-67	2-Cl	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	126-131
I-68	2-Cl	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	Oil
I-69	2-Cl	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-70	2-Cl	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	Oil
I-71	2-Cl	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	Oil
I-72	2-Cl	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-73	2-Cl	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-74	2-Cl	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-75	2-Cl	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-76	2-Cl	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	Oil
I-77	2-Cl	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	Oil
I-78	2-Cl	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	Oil
I-79	2-Cl	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	Oil
I-80	2-Cl	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	188-191
I-81	2-Cl	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	Oil
I-82	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-83	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-84	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-85	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-86	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-87	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-88	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-89	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-90	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-91	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-92	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-93	2,3-Cl_2	2	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-94	2,3-Cl_2	2	2-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-95	2,3-Cl_2	2	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-96	2,3-Cl_2	2	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-97	2,3-Cl_2	2	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-98	2,3-Cl_2	2	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-99	2,3-Cl_2	2	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-100	2,3-Cl_2	2	4-OMe	1	4-OCF_3	1	

[0089]

[表4]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-101	2,3-Cl_2	2	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-102	2,3-Cl_2	2	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-103	2,3-Cl_2	2	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-104	2,3-Cl_2	2	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-105	2,3-Cl_2	2	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-106	2,3-Cl_2	2	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-107	2,3-Cl_2	2	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-108	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-109	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-F	1	Oil
I-110	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	Oil
I-111	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	Oil
I-112	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	Oil
I-113	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	Oil
I-114	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-115	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-116	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-117	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-118	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-119	2-Br	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-120	2-Br	1	4-F	1	4-OCF_3	1	Oil
I-121	2-Br	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-122	2-Br	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	Oil
I-123	2-Br	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-124	2-Br	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-125	2-Br	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-126	2-Br	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-127	2-Br	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	137-140
I-128	2-Br	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-129	2-Br	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-130	2-Br	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-131	2-Br	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-132	2-Br	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	Oil
I-133	2-Br	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	
I-134	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-135	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-F	1	

[0090]

[表5]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-136	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-137	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-138	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-139	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-140	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-141	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-142	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-143	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-144	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-145	3-Br	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-146	3-Br	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-147	3-Br	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-148	3-Br	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-149	3-Br	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-150	3-Br	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-151	3-Br	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-152	3-Br	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-153	3-Br	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-154	3-Br	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-155	3-Br	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-156	3-Br	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-157	3-Br	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-158	3-Br	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-159	3-Br	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	
I-160	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-161	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-F	1	118-121
I-162	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-163	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	Oil
I-164	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-165	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-166	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-167	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-168	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-169	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-170	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	

[0091]

[表6]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-171	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-172	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	
I-173	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	
I-174	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	
I-175	2-CF_3	1	4-F	1	4-OCF_3	1	Oil
I-176	2-CF_3	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-177	2-CF_3	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	Oil
I-178	2-CF_3	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-179	2-CF_3	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-180	2-CF_3	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-181	2-CF_3	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-182	2-CF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-183	2-CF_3	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-184	2-CF_3	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-185	2-CF_3	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-186	2-CF_3	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-187	2-CF_3	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-188	2-CF_3	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-189	2-CF_3	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-190	2-CF_3	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	
I-191	2-CF_3	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	
I-192	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-193	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-F	1	Oil
I-194	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-195	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-CN	1	
I-196	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	120-124
I-197	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	Oil
I-198	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-199	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-200	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-201	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-202	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-203	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-204	2-CN	1	2-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-205	2-CN	1	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	

[0092]

[表7]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-206	2-CN	1	3-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-207	2-CN	1	3-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-208	2-CN	1	4-F	1	4-OCF_3	1	Oil
I-209	2-CN	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-210	2-CN	1	4-CN	1	4-OCF_3	1	
I-211	2-CN	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-212	2-CN	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-213	2-CN	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-214	2-CN	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-215	2-CN	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-216	2-CN	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-217	2-CN	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-218	2-CN	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-219	2-CN	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-220	2-CN	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-221	2-CN	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	
I-222	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-223	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-224	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-225	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-CN	1	
I-226	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-227	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-228	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-229	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-230	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-231	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-SCF_3	1	
I-232	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-$SOCF_3$	1	
I-233	3-CN	1	4-OCF_3	1	4-SO_2CF_3	1	
I-234	3-CN	1	2-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-235	3-CN	1	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-236	3-CN	1	3-OCF_3	1	2-OCF_3	1	
I-237	3-CN	1	3-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-238	3-CN	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-239	3-CN	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-240	3-CN	1	4-CN	1	4-OCF_3	1	

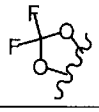
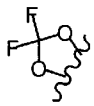
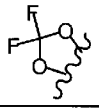
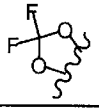
[0093]

[表8]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-241	3-CN	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-242	3-CN	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-243	3-CN	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-244	3-CN	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-245	3-CN	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-246	3-CN	1	4-SCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-247	3-CN	1	4-$SOCF_3$	1	4-OCF_3	1	
I-248	3-CN	1	4-SO_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-249	3-CN	1	2-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-250	3-CN	1	3-F-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	
I-251	3-CN	1	4-(4-CF_3-PhO)	1	4-OCF_3	1	
I-252	2-Me	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-253	2-F	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-254	2-Cl	1	4-OCF_3	1	3,4-Cl_2	2	Oil
I-255	2-Cl	1	4-OCF_3	1	3,4-F_2	2	Oil
I-256	2-Cl	1	4-OCF_3	1	3,5-Cl_2	2	105-108
I-257	2-Cl	1	4-OCF_3	1	3,5-$(CF_3)_2$	2	Oil
I-258	2-Cl	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-OCF_3	2	Oil
I-259	2-Cl	1	4-OCF_3	1	2-F-4-OCF_3	2	Oil
I-260	2-Cl	1	4-OCF_3	1	3-F-4-OCF_3	2	Oil
I-261	2-Cl	1	4-I	1	4-OCF_3	1	Oil
I-262	2-Cl	1	4-CH_2CN	1	4-OCF_3	1	Oil
I-263	2-Cl	1	2,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-264	2-Cl	1	3,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-265	2-Cl	1	2,4-Cl_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-266	2-Cl	1	3,4-Cl_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-267	2-Cl	1	2-Me-4-Cl	2	4-OCF_3	1	Oil
I-268	2-Cl	1	2-Me-4-OCF_3	2	4-OCF_3	1	Oil
I-269	2-Cl	1	3-Me-4-F	2	4-OCF_3	1	Oil
I-270	2-Cl	1	3-CF_3-4-F	2	4-OCF_3	1	64-67
I-271	2-Cl	1	4-F	1	4-Cl	1	190-193
I-272	2-Cl	1	4-F	1	4-$OCHF_2$	1	127-131
I-273	2-Cl	1	4-F	1	4-F	1	212-215
I-274	2-Cl	1	4-Cl	1	4-Cl	1	145-147
I-275	2-Cl	1	4-$OCHF_2$	1	4-$OCHF_2$	1	Oil

[0094]

[表9]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-276	2-Cl	1	4-CF_3	1	4-CF_3	1	Oil
I-277	2-Cl	1	3,4-F_2	2	3,4-F_2	2	114-117
I-278	2-Br	1	4-OCF_3	1	3,4-F_2	2	Oil
I-279	2-Br	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-OCF_3	2	Oil
I-280	2-Br	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-F	2	Oil
I-281	2-Br	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-Cl	2	Oil
I-282	2-Br	1	3,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-283	2-CN	1	4-OCF_3	1	3,4-F_2	2	Oil
I-284	2-CN	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-OCF_3	2	Oil
I-285	2-CN	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-F	2	Oil
I-286	2-CN	1	4-OCF_3	1	2-Me-4-Cl	2	Oil
I-287	2-CN	1	3,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-288	2-CF_3	1	4-OCF_3	1	3,4-F_2	2	Oil
I-289	2-CF_3	1	2,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-290	2-CF_3	1	3,4-F_2	2	4-OCF_3	1	Oil
I-291	2-CF_3	1	4-F	1	4-$OCHF_2$	1	Oil
I-292	2-CF_3	1	4-F	1	4-Cl	1	142-145
I-293	2-Et	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-294	2-Cl	1	3,4- 	2	4-OCF_3	1	Oil
I-295	2-Cl	1	4-OCF_3	1	 3,4-	2	Oil
I-296	2-Br	1	3,4- 	2	4-OCF_3	1	Oil
I-297	2-CN	1	3,4- 	2	4-OCF_3	1	Oil
I-298	2-$CONH_2$	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	216-221
I-299	2-CO_2H	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	218-221
I-300	2-$CONMe_2$	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil

[0095]

[表10]

第１表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-301	2-$CONEt_2$	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	Oil
I-302		1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	336-339
I-303	2-Cl	1	4-Br	1	4-Br	1	134-137
I-304	2-CN	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-305	2-CN	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	150-154
I-306	2-(2-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-307	2-(2-CF_3-Ph)	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	Oil
I-308	2-(2-CF_3-Ph)	1	4-(2-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	150-154
I-309	2-(3-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-310	2-(3-CF_3-Ph)	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	188-191
I-311	2-(3-CF_3-Ph)	1	4-(3-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	148-151
I-312	2-(4-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-313	2-(4-CF_3-Ph)	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	213-217
I-314	2-(4-CF_3-Ph)	1	4-(4-CF_3-Ph)	1	4-OCF_3	1	225-228
I-315	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-316	2-NO_2	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-317	2-NO_2	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-318	2-NO_2	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-319	2-NO_2	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-320	2-NO_2	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-321	2-NO_2	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-322	2-NO_2	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-323	2-NO_2	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-324	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-325	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-326	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-327	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-328	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-329	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-330	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-331	2-NO_2	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-332	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-333	2-OMe	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-334	2-OMe	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-335	2-OMe	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	

[0096]

[表11]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-336	2-OMe	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-337	2-OMe	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-338	2-OMe	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-339	2-OMe	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-340	2-OMe	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-341	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-342	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-343	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-344	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-345	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-346	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-347	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-348	2-OMe	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-349	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-350	2-OCF_3	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-351	2-OCF_3	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-352	2-OCF_3	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-353	2-OCF_3	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-354	2-OCF_3	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-355	2-OCF_3	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-356	2-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-357	2-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-358	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-359	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-360	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-361	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-362	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-363	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-364	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-365	2-OCF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-366	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-367	2-OCH_2CF_3	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-368	2-OCH_2CF_3	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-369	2-OCH_2CF_3	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-370	2-OCH_2CF_3	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	

[0097]

[表12]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-371	2-OCH_2CF_3	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-372	2-OCH_2CF_3	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-373	2-OCH_2CF_3	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-374	2-OCH_2CF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-375	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-376	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-377	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-378	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-379	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-380	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-381	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-382	2-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-383	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-384	2-$OCHF_2$	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-385	2-$OCHF_2$	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-386	2-$OCHF_2$	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-387	2-$OCHF_2$	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-388	2-$OCHF_2$	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-389	2-$OCHF_2$	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-390	2-$OCHF_2$	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-391	2-$OCHF_2$	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-392	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-393	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-394	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-395	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-396	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-397	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-398	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-399	2-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-400	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-401	2-CO_2Me	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-402	2-CO_2Me	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-403	2-CO_2Me	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-404	2-CO_2Me	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-405	2-CO_2Me	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	

[0098]

[表13]

第1表（続き）							
No.	R^1	m	R^2	n	R^3	p	物性
I-406	2-CO_2Me	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-407	2-CO_2Me	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-408	2-CO_2Me	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-409	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-410	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-411	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-412	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-413	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-414	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-415	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-416	2-CO_2Me	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	
I-417	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-OCF_3	1	
I-418	2-CO_2Et	1	4-F	1	4-OCF_3	1	
I-419	2-CO_2Et	1	4-Cl	1	4-OCF_3	1	
I-420	2-CO_2Et	1	4-Br	1	4-OCF_3	1	
I-421	2-CO_2Et	1	4-Me	1	4-OCF_3	1	
I-422	2-CO_2Et	1	4-CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-423	2-CO_2Et	1	4-OMe	1	4-OCF_3	1	
I-424	2-CO_2Et	1	4-$OCHF_2$	1	4-OCF_3	1	
I-425	2-CO_2Et	1	4-OCH_2CF_3	1	4-OCF_3	1	
I-426	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-F	1	
I-427	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-Cl	1	
I-428	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-Br	1	
I-429	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-Me	1	
I-430	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-CF_3	1	
I-431	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-OMe	1	
I-432	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-$OCHF_2$	1	
I-433	2-CO_2Et	1	4-OCF_3	1	4-OCH_2CF_3	1	

[0099]

[表14]

第２表	
No.	^{1}H-NMR δ値 ppm
I-1	7.53-7.48(5H,m), 7.40-7.35(4H,m), 7.30(1H,d), 6.97(2H,m)
I-2	7.58(2H,m), 7.50(1H,d), 7.40(2H,m), 7.34(2H,d), 7.30(1H,d), 7.23(1H,m), 6.97(2H,m)
I-3	7.93(1H,d), 7.60-7.37(5H,m), 7.28(2H,m), 7.17(2H,m), 7.00(1H,t)
I-4	7.56-7.42(5H,m), 7.33(1H,d), 7.25-7.23(2H,m), 6.95(2H,m)
I-5	7.96(1H,d), 7.78(2H,m), 7.51-7.35(5H,m), 7.22(2H,m)
I-6	7.55(1H,d), 7.49-7.46(2H,m), 7.32(1H,d), 7.25(2H,d), 7.18(2H,m), 6.99(2H,m)
I-7	7.55(1H,d), 7.46(4H,m), 7.32-7.24(3H,m), 6.99(2H,m)
I-8	7.62(2H,m), 7.55(1H,d), 7.40(2H,m), 7.32(1H,d), 7.25(2H,d), 6.99(2H,m)
I-9	7.52(1H,d), 7.36(2H,m), 7.32-7.29(3H,m), 7.23(2H,d), 6.98(2H,m), 2.39(3H,s)
I-10	7.76(2H,d), 7.69(2H,d), 7.57(1H,d), 7.34(1H,d), 7.27(2H,d), 7.00(2H,m)
I-12	7.53(1H,d), 7.39(2H,m), 7.31(1H,d), 7.24(2H,d), 7.03-6.97(4H,m), 3.83(3H,s)
I-13	7.55(1H,d), 7.52(2H,m), 7.32(1H,d), 7.26-7.22(3H,m), 7.06(1H,d), 6.99(2H,m), 6.53(1H,t)
I-21	7.55(1H,d), 7.52-7.48(2H,m), 7.45-7.42(2H,m), 7.34-7.29(3H,m), 7.23(1H,m),7.00(1H,dd)
I-23	7.56(1H,d), 7.53-7.39(5H,m), 7.33(1H,d), 7.07(1H,m), 6.88(1H,m), 6.82(1H,s)
I-25	7.57-7.53(3H,m), 7.34-7.31(3H,m), 7.10(2H,m), 6.95(2H,m)
I-26	7.57-7.54(3H,m), 7.39-7.32(5H,m), 6.93(2H,m)
I-28	7.57(2H,m), 7.49(1H,d), 7.33(2H,d), 7.30(1H,d), 7.20(2H,d), 6.87(2H,m), 2.37(3H,s)
I-31	7.56(2H,m), 7.54(1H,d), 7.35-7.32(3H,m), 7.17(2H,m), 6.98(2H,m), 6.52(1H,t)
I-32	7.56(2H,m), 7.52(1H,d), 7.33(2H,d), 7.32(1H,d), 7.00-6.94(4H,m), 4.37(2H,q)
I-33	7.69(2H,m), 7.57-7.55(3H,m), 7.35-7.32(3H,m), 7.03(2H,m)
I-41	7.58(4H,m),7.40-7.34(4H,m)7.16-7.11(3H,m),7.07-7.02(3H,m)
I-45	7.50(2H,m), 7.44(2H,m), 7.26(2H,d), 7.20(1H,s), 6.93(2H,m)
I-46	7.74(2H,m), 7.49(2H,d), 7.46-7.44(3H,m), 7.19(2H,m)
I-47	7.47-7.43(4H,m), 7.26(2H,d), 7.20-7.16(3H,m), 6.96(2H,m)
I-48	7.47-7.42(4H,m), 7.26(2H,d), 7.19(1H,s), 6.96(2H,m)
I-49	7.61(2H,m), 7.37(2H,m), 7.26(2H,d), 7.19(1H,s), 6.96(2H,m)
I-50	7.35-7.29(4H,m), 7.25(2H,d), 7.18(1H,s), 6.95(2H,m)

[0100]

[表15]

第２表（続き）	
No.	^{1}H-NMR δ値 ppm
I-51	7.75(2H,d), 7.65(2H,d), 7.28(2H,d), 7.21(1H,s), 6.98(2H,m)
I-52	7.37(2H,m), 7.25(2H,d), 7.18(1H,s), 7.01(2H,m), 6.96(2H,m), 3.83(3H,s)
I-53	7.49(2H,m), 7.27-7.24(4H,m), 7.19(1H,s), 6.97(2H,m), 6.53(1H,t)
I-54	7.43(2H,m), 7.26(2H,d), 7.18(1H,s), 7.05(2H,m), 6.96(2H,m), 4.37(2H,q)
I-59	7.83(1H,s), 7.76(1H,d), 7.71(2H,m), 7.61-7.54(4H,m), 7.27(2H,d), 7.21(1H,s), 7.00(2H,m)
I-60	7.72-7.69(6H,m), 7.60(2H,m), 7.27(2H,d), 7.21(1H,s), 7.00(2H,m)
I-65	7.53(2H,m), 7.33(2H,d), 7.19(1H,s), 7.11(2H,m), 6.93-6.90(2H,m)
I-66	7.52(2H,m), 7.38(2H,m), 7.33(2H,d), 7.19(1H,s), 6.89(2H,m)
I-68	7.55(2H,m), 7.32(2H,d), 7.21(2H,d), 7.17(1H,s), 6.83(2H,m), 2.38(3H,s)
I-69	7.68(2H,d), 7.54(2H,m), 7.34(2H,m), 7.20(1H,s), 7.05(2H,d)
I-70	7.56(2H,m), 7.34(2H,d), 7.19(1H,s), 6.95(2H,m), 6.91(2H,m), 3.85(3H,s)
I-71	7.53(2H,m), 7.33(2H,d), 7.17(2H,m), 6.95(2H,m), 6.53(1H,t)
I-72	7.54(2H,m), 7.33(2H,d), 7.18(1H,s), 6.99(2H,m), 6.92(2H,m), 4.37(2H,q)
I-73	7.70(2H,d), 7.53(2H,m), 7.34(2H,d), 7.20(1H,s), 7.00(2H,m)
I-76	7.55(2H,m), 7.34(2H,d), 7.22(1H,s), 7.13-6.99(3H,m)
I-77	7.51(2H,m), 7.37-7.33(3H,m), 7.22(1H,s), 6.84(1H,dd), 6.75(1H,m)
I-78	7.75(1H,d), 7.59-7.56(3H,m), 7.48(1H,t), 7.39-7.34(5H,m), 7.19(1H,s), 6.98(2H,m)
I-79	7.87(1H,s), 7.81(1H,d), 7.68(2H,m), 7.61-7.56(4H,m), 7.35(2H,d), 7.20(1H,s), 7.06(2H,m)
I-81	7.59(2H,d), 7.55(2H,m), 7.34(2H,d), 7.21(1H,s), 7.12(2H,m), 7.06(2H,d), 6.98(2H,m)
I-82	7.69(2H,m), 7.55(2H,d), 7.48(2H,d), 7.18(2H,m)
I-108	7.75(2H,m), 7.57(1H,s), 7.50(2H,d), 7.45(2H,d), 7.20(2H,m)
I-109	7.45(2H,m), 7.32(1H,s), 7.26(2H,d), 7.18(2H,m), 6.96(2H,m)
I-110	7.47-7.42(4H,m), 7.32(1H,s), 7.26(2H,d), 6.96(2H,m)
I-111	7.61(2H,m), 7.37(2H,m), 7.32(1H,s), 7.26(2H,d), 6.96(2H,m)
I-112	7.34(2H,m), 7.31(1H,s), 7.29(2H,m), 7.25(2H,m), 6.96(2H,m), 2.38(3H,s)
I-113	7.75(2H,d), 7.66(2H,d), 7.34(1H,s), 7.28(2H,d), 6.98(2H,m)
I-115	7.19(2H,m), 7.32(1H,s), 7.27-7.22(4H,m), 6.97(2H,m), 6.53(1H,t)
I-120	7.53(2H,m), 7.34-7.32(3H,m), 7.11(2H,m), 6.92(2H,m)
I-122	7.54-7.51(4H,m), 7.34-7.32(3H,m), 6.84(2H,m)
I-128	7.71(2H,d), 7.53(2H,m), 7.35-7.33(3H,m), 7.00(2H,m)
I-132	7.51(2H,m), 7.37-7.33(3H,m), 6.84(1H,dd), 6.75(1H,m)
I-134	7.55(2H,m), 7.45(1H,s), 7.33(2H,d), 7.26(2H,d), 6.98(2H,m)
I-160	8.00(1H,s), 7.77(2H,m), 7.52(2H,d), 7.48(2H,d), 7.23(2H,m)
I-163	7.66(3H,m), 7.38(2H,m), 7.30(2H,d), 6.98(2H,m)
I-167	7.66(1H,s), 7.50(2H,m), 7.31-7.25(4H,m), 6.98(2H,m), 6.54(1H,t)
I-175	7.66(1H,s), 7.54(2H,m), 7.35(2H,d), 7.14(2H,m), 6.94(2H,m)

[0101]

[表16]

第２表（続き）	
No.	^{1}H-NMR δ値 ppm
I-177	7.66(1H,s), 7.56(2H,m), 7.53(2H,m), 7.35(2H,d), 6.86(2H,m)
I-192	7.80(1H,s), 7.54(2H,m), 7.36(2H,d), 7.31(2H,d), 6.98(2H,m)
I-193	7.79(1H,s), 7.45(2H,m), 7.30(2H,d), 7.20(2H,m), 6.97(2H,m)
I-197	7.81(1H,s), 7.78(2H,d), 7.66(2H,d), 7.32(2H,d), 6.98(2H,m)
I-199	7.79(1H,s), 7.49(2H,m), 7.31(2H,d), 7.26(2H,d), 6.98(2H,m), 6.54(1H,t)
I-208	7.79(1H,s), 7.54(2H,m), 7.35(2H,d), 7.15(2H,m), 6.93(2H,m)
I-215	7.78(1H,s), 7.54(2H,m), 7.35(2H,d), 7.03(2H,m), 6.93(2H,m), 4.39(2H,q)
I-216	7.80(1H,s), 7.74(2H,d), 7.54(2H,m), 7.36(2H,d), 7.01(2H,m)
I-222	8.08(1H,s), 7.55(2H,m), 7.35(2H,d), 7.29(2H,d), 6.99(2H,m)
I-252	7.53(2H,m),7.35(2H,d),7.27(2H,d),6.99(2H,m),6.83(1H,s)
I-253	7.54(2H,m),7.34(2H,d),7.27(2H,d),7.00-6.97(3H,m)
I-254	7.63(1H,d), 7.56(1H,d), 7.37(1H,dd), 7.28(2H,d), 7.19(1H,s), 6.97(2H,m)
I-255	7.36(1H,m), 7.28-7.25(4H,m), 7.19(1H,s), 6.97(2H,m)
I-257	8.03(2H,m), 7.87(1H,m), 7.30-7.22(3H,m), 6.99(2H,m)
I-258	7.35(1H,d), 7.30(1H,dd), 7.25-7.22(3H,m), 7.19(1H,s), 6.93(2H,m), 2.26(3H,s)
I-259	8.16(1H,m), 7.26(2H,m), 7.22(1H,s), 7.18-6.92(4H,m)
I-260	7.44(1H,dd), 7.41(1H,d), 7.37-7.26(3H,m), 7.20(1H,s), 6.97(2H,m)
I-261	7.72(2H,m), 7.52(2H,m), 7.33(2H,d), 7.19(1H,s), 6.71(2H,m)
I-262	7.54(2H,m), 7.38(2H,d), 7.34(2H,d), 7.19(1H,s), 6.97(2H,m), 3.80(2H,s)
I-263	7.55(2H,m), 7.34(2H,d), 7.21(1H,s), 6.99-6.93(3H,m)
I-264	7.51(2H,m), 7.34(2H,d), 7.22-7.18(2H,m), 6.82(1H,m), 6.69(1H,m)
I-265	7.58(2H,m), 7.52(1H,d), 7.35(2H,d), 7.29(1H,dd), 7.21(1H,s), 6.89(1H,d)
I-266	7.51-7.47(3H,m), 7.33(2H,d), 7.21(1H,s), 7.10(1H,d), 6.82(1H,dd)
I-267	7.54(2H,m), 7.34(2H,d), 7.28-7.19(3H,m), 6.75(1H,d), 2.11(3H,s)
I-268	7.55(2H,m), 7.34(2H,d), 7.19(1H,s), 7.15(1H,s), 7.10(1H,d), 6.83(1H,d), 2.15(3H,s)
I-269	7.53(2H,m), 7.33(2H,d), 7.18(1H,s), 7.04(1H,t), 6.79(1H,dd), 6.73(1H,m), 2.28(3H,s)
I-275	7.49(2H,m), 7.25-7.23(2H,m), 7.19-7.17(3H,m), 6.94(2H,m), 6.53(2H,m)
I-276	7.76(2H,d), 7.69-7.65(4H,m), 7.2(1H,s), 7.06(2H,d)
I-278	7.37(1H,m), 7.34(1H,s), 7.30-7.27(4H,m), 6.98(2H,m)
I-279	7.34-7.32(2H,m), 7.26(2H,d), 7.20(1H,s), 7.18(1H,d), 6.94(2H,m), 2.29(3H,s)
I-280	7.32(1H,s), 7.29-7.24(3H,m), 7.07-7.00(2H,m), 6.93(2H,m), 2.26(3H,s)
I-281	7.35(1H,d), 7.32(1H,s), 7.30(1H,dd), 7.26-7.23(3H,m), 6.93(2H,m), 2.25(3H,s)
I-282	7.51(2H,m), 7.34-7.33(3H,m), 7.21(1H,m), 6.82(1H,m), 6.69(1H,m)
I-283	7.79(1H,s), 7.39-7.27(5H,m), 6.98(2H,m)

[0102]

[表17]

第２表（続き）	
No.	1H-NMR δ値 ppm
I-284	7.80(1H,s), 7.34(1H,d), 7.29(2H,d), 7.24-7.19(2H,m), 6.95(2H,m), 2.30(3H,s)
I-285	7.79(1H,s), 7.29-7.27(3H,m), 7.09-7.03(2H,m), 6.94(2H,m), 2.27(3H,s)
I-286	7.79(1H,s), 7.38(1H,d), 7.33(1H,dd), 7.29(2H,d), 7.25-7.23(1H,m), 6.94(2H,m), 2.26(3H,s)
I-287	7.81(1H,s), 7.52(2H,m), 7.36(2H,d), 7.26(1H,m), 6.83(1H,m), 6.70(1H,m)
I-288	7.66(1H,s), 7.37(1H,m), 7.32-7.25(4H,m), 6.99(2H,m)
I-289	7.68(1H,s), 7.56(2H,m), 7.36(2H,d), 7.02-6.96(3H,m)
I-290	7.68(1H,s), 7.52(2H,m), 7.35(2H,d), 7.25(1H,m), 6.84(1H,m), 6.71(1H,m)
I-291	7.65(1H,s), 7.50(2H,m), 7.26(2H,d), 7.14(2H,m), 6.93(2H,m), 6.54(1H,t)
I-293	7.54(2H,m), 7.32(2H,d), 7.25(2H,d), 7.02(1H,s), 6.98(2H,m), 2.81(2H,q), 1.26(3H,t)
I-294	7.51(2H,m), 7.33(2H,d), 7.21(1H,s), 7.08(1H,d), 6.73(1H,d), 6.66(1H,dd)
I-295	7.27(2H,d), 7.22-7.14(4H,m), 6.97(2H,m)
I-296	7.51(2H,m), 7.34-7.33(3H,m), 7.08(1H,d), 6.73(1H,d), 6.66(1H,dd)
I-297	7.80(1H,s), 7.52(2H,m), 7.36(2H,d), 7.12(1H,d), 6.74(1H,d), 6.67(1H,dd)
I-300	7.56(2H,m), 7.47(1H,s), 7.36(2H,d), 7.27(2H,d), 6.99(2H,m), 3.20-3.11(6H,m)
I-301	7.55(2H,m), 7.41(1H,s), 7.35(2H,d), 7.25(2H,d), 6.98(2H,m), 3.48(4H,q), 1.23(6H,m)
I-307	7.77(2H,d), 7.58-7.49(5H,m), 7.37-7.32(5H,m), 6.90(2H,m)

[0103] 第２表の^{1}Ｈ－ＮＭＲスペクトルを測定した機器はＪＥＯＬ－ＥＣＸ（５００ ＭＨｚ）である。化合物Ｎｏ．Ｉ－５、Ｉ－４６、Ｉ－１０８、Ｉ－１６０は測定溶媒としてアセトン－ｄ６を、化合物Ｎｏ．Ｉ－８２はジメチルスルホキシド－ｄ６を用い、これら以外は測定溶媒としてＣＤＣｌ$_3$を用いた。

[0104] 試験例１ ハスモンヨトウに対する効果試験

本発明化合物を、界面活性剤を含むアセトンに溶解した後、濃度が２００ｐｐｍとなるよう水で希釈した薬液に、キャベツの葉片を浸漬処理した。薬液が風乾した後、湿った濾紙を敷いた直径９ｃｍのペトリ皿にキャベツの葉片を入れた。そこへハスモンヨトウ２～３齢幼虫を１０頭放ち、ふたをして２５℃の照明付恒温室内に放置した。放虫５日後にハスモンヨトウの生死を判定し、下記の計算式により死虫率（％）を求めた。その結果、前記化合物Ｎｏ．Ｉ－５、Ｉ－６、Ｉ－７、Ｉ－８、Ｉ－１０、Ｉ－１１、Ｉ－１３、

Ｉ－２０、Ｉ－２５、Ｉ－２６、Ｉ－３１、Ｉ－３２、Ｉ－３３、Ｉ－４１、Ｉ－４６、Ｉ－４７、Ｉ－４８、Ｉ－４９、Ｉ－５０、Ｉ－５１、Ｉ－５２、Ｉ－５３、Ｉ－５４、Ｉ－５９、Ｉ－６０、Ｉ－６５、Ｉ－６６、Ｉ－６７、Ｉ－６８、Ｉ－６９、Ｉ－７０、Ｉ－７１、Ｉ－７２、Ｉ－７３、Ｉ－７６、Ｉ－７７、Ｉ－７８、Ｉ－８１、Ｉ－８２、Ｉ－１０８、Ｉ－１０９、Ｉ－１１０、Ｉ－１１１、Ｉ－１１２、Ｉ－１１３、Ｉ－１１５、Ｉ－１２２、Ｉ－１２７、Ｉ－１２８、Ｉ－１３２、Ｉ－１３４、Ｉ－１６０、Ｉ－１６１、Ｉ－１６３、Ｉ－１６７、Ｉ－１７５、Ｉ－１７７、Ｉ－１９２、Ｉ－１９３、Ｉ－１９６、Ｉ－１９７、Ｉ－１９９、Ｉ－２０８、Ｉ－２１５、Ｉ－２１６、Ｉ－２２２、Ｉ－２５２、Ｉ－２５３、Ｉ－２５４、Ｉ－２５５、Ｉ－２５８、Ｉ－２５９、Ｉ－２６０、Ｉ－２６１、Ｉ－２６３、Ｉ－２６４、Ｉ－２６５、Ｉ－２６６、Ｉ－２６７、Ｉ－２６８、Ｉ－２６９、Ｉ－２７１、Ｉ－２７２、Ｉ－２７３、Ｉ－２７４、Ｉ－２７５、Ｉ－２７７、Ｉ－２７８、Ｉ－２７９、Ｉ－２８０、Ｉ－２８２、Ｉ－２８３、Ｉ－２８４、Ｉ－２８５、Ｉ－２８６、Ｉ－２８７、Ｉ－２８８、Ｉ－２８９、Ｉ－２９０、Ｉ－２９１、Ｉ－２９２、Ｉ－２９３、Ｉ－２９４、Ｉ－２９５、Ｉ－２９６、Ｉ－２９７、Ｉ－３００、Ｉ－３０１、Ｉ－３０３及びＩ－３０５が９０％以上の死虫率を示した。

死虫率（％）＝（死虫数／放虫数）×１００

[0105] 次に製剤例を記載する。

製剤例１

（１）本発明化合物　２０重量部

（２）クレー　７０重量部

（３）ホワイトカーボン　５重量部

（４）ポリカルボン酸ナトリウム　３重量部

（５）アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム　２重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

[0106] 製剤例２

（１）本発明化合物　５重量部

（２）タルク　６０重量部

（３）炭酸カルシウム　３４．５重量部

（４）流動パラフィン　０．５重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

[0107] 製剤例３

（１）本発明化合物　２０重量部

（２）Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド　２０重量部

（３）ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル　１０重量部

（４）ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム　２重量部

（５）キシレン　４８重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

[0108] 製剤例４

（１）クレー　６８重量部

（２）リグニンスルホン酸ナトリウム　２重量部

（３）ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート　５重量部

（４）ホワイトカーボン　２５重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを４：１の重量割合で混合し、水和剤とする。

[0109] 製剤例５

（１）本発明化合物　５０重量部

（２）アルキル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２重量部

（３）シリコーンオイル　０．２重量部

（４）水　４７．８重量部

以上のものを均一に混合、粉砕した原液に更に

（５）ポリカルボン酸ナトリウム　５重量部

（６）無水硫酸ナトリウム　４２．８重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

[0110] 製剤例６

（１）本発明化合物　５重量部

（２）ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル　１重量部

（３）ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル　０．１重量部

（４）粒状炭酸カルシウム　９３．９重量部

（１）～（３）を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、（４）に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

[0111] 製剤例７

（１）本発明化合物　２．５重量部

（２）Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド　２．５重量部

（３）大豆油　９５．０重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤（ｕｌｔｒａ　ｌｏｗ　ｖｏｌｕｍｅ　ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ）とする。

[0112] 製剤例８

（１）本発明化合物　１０重量部

（２）ジエチレングリコールモノエチルエーテル　８０重量部

（３）ポリオキシエチレンアルキルエーテル　１０重量部

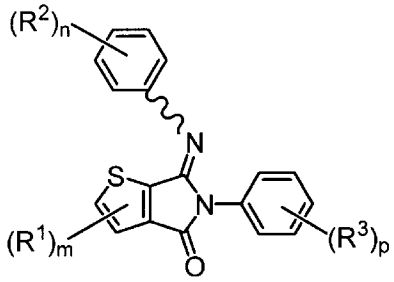
以上の成分を均一に混合し、液剤とする。

[0113] 本発明を詳細にまた特定の実施態様を参照して説明したが、本発明の精神と範囲を逸脱することなく様々な変更や修正を加えることができることは当業者にとって明らかである。本出願は２０１５年１０月１３日出願の日本特許出願（特願２０１５－２０１８０９）に基づくものであり、その内容はここに参照として取り込まれる。

請求の範囲

[請求項1] 式（Ｉ）：

[化1]



(I)

〔式中、Ｒ[1]はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、ニトロ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル、カルボキシ、アルコキシカルボニル又はＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]であり；Ｒ[2]及びＲ[3]は各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ニトロ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであり；Ａはハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ又はシアノであり；Ｒ[4]及びＲ[5]は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルであり；ｍは０～２の整数であり；ｎ及びｐは各々独立に、０～５の整数であり；ｎ＝２の場合、２つのＲ[2]は互いに結合してＲ[2]が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのＲ[2]部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのＲ[3]は互いに結合してＲ[3]が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのＲ[3]部分はＡで置換されてもよい〕で表されるチエノピロール系化合物又はその塩。

[請求項2] R^1がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、ＣＯＮR^4R^5又はＡで置換されてもよいフェニルであり、R^4及びR^5は各々独立に、水素原子、アルキル又はＡで置換されてもよいシクロアルキルである、請求項１に記載の化合物又はその塩。

[請求項3] R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであり；ｎ＝２の場合、２つのR^2は互いに結合してR^2が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^2部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのR^3は互いに結合してR^3が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^3部分はＡで置換されてもよい、請求項１に記載の化合物又はその塩。

[請求項4] R^2及びR^3が各々独立に、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノ、Ａで置換されてもよいフェニル又はＡで置換されてもよいフェノキシであり；ｎ＝２の場合、２つのR^2は互いに結合してR^2が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^2部分はＡで置換されてもよく；ｐ＝２の場合、２つのR^3は互いに結合してR^3が結合するフェニル環と縮合し１，３－ベンゾジオキソール環を形成してもよく、さらにそのR^3部分はＡで置換されてもよい、請求項１に記載の化合物又はその塩。

[請求項5] Ａがハロアルキル又はシアノである、請求項１に記載の化合物又はその塩。

[請求項6] 請求項１に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する有害

生物防除剤。

[請求項7] 請求項１に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

[請求項8] 請求項１に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤又は殺ダニ剤。

[請求項9] 請求項１に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2016/080439

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D495/04(2006.01)i, *A01N43/90*(2006.01)i, *A01N47/02*(2006.01)i, *A01P5/00*(2006.01)i, *A01P7/02*(2006.01)i, *A01P7/04*(2006.01)i

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)
C07D495/04, A01N43/90, A01N47/02, A01P5/00, A01P7/02, A01P7/04, C07D209/02, C07D491/048, C07D495/04, A01P13/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2016
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2016	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2016

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus/REGISTRY(STN), MARPAT(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2004-359633 A (Bayer Cropscience AG.), 24 December 2004 (24.12.2004), claim 1; tables 1 to 4; paragraphs [0232] to [0254], [0318] to [0327] & JP 2006-527172 A & US 2007/0031514 A1 claims 11 to 12; tables 1 to 4; paragraphs [0390] to [0423], [0476] to [0489] & WO 2004/110149 A1 & EP 1635639 A1 & KR 10-2006-0031612 A & CN 1802091 A & BR PI0411209 A & AR 44473 A & AU 2004246765 A & MX PA05012987 A	1-9
A	JP 11-279179 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 12 October 1999 (12.10.1999), claims 1 to 3; paragraphs [0003] to [0006], [0029] to [0057] (Family: none)	1-9

☒ 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	Date of mailing of the international search report
18 November 2016 (18.11.16)	06 December 2016 (06.12.16)

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
Japan Patent Office 3-4-3,Kasumigaseki,Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915,Japan	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2016/080439

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 4-234393 A (BASF AG.), 24 August 1992 (24.08.1992), claim 1; paragraph [0003]; table 1 & JP 2000-297087 A & US 5386036 A claims 1 to 2; page 2, column 2, lines 28 to 51; pages 8 to 19 & US 5276009 A & EP 467206 A2 & DE 4023048 A & DE 59108419 D & HU 58190 A & AT 146475 T & CA 2047452 A & HU 912433 A0	1-9
A	MIURA T. et al., Palladium-Catalyzed Denitrogenation Reaction of 1,2,3-Benzotriazin-4(3H)-ones Incorporating Isocyanides, ORGANIC LETTERS, 2011, Vol. 13, No. 6, pp. 1429-1431, ISSN 1523-7052, table 1	1-9

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２０１６／０８０４３９

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D495/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P5/00(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i

Ｂ．　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D495/04, A01N43/90, A01N47/02, A01P5/00, A01P7/02, A01P7/04, C07D209/02, C07D491/048, C07D495/04, A01P13/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２０１６年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０１６年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０１６年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY (STN), MARPAT(STN)

Ｃ．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	JP 2004-359633 A (バイエル・クロツプサイエンス・アクチエンゲゼルシヤフト) 2004.12.24, 請求項１, 表１－４, 段落[0232]－[0254], 段落[0318]－[0327] & JP 2006-527172 A & US 2007/0031514 A1, 請求項１１－１２, 表１－４, 段落[0390]－[0423], 段落[0476]－[0489] & WO 2004/110149 A1 & EP 1635639 A1 & KR 10-2006-0031612 A & CN 1802091 A & BR PI0411209 A & AR 44473 A & AU 2004246765 A & MX PA05012987 A	１－９
A	JP 11-279179 A (日本化薬株式会社) 1999.10.12, 請求項１－３, 段	１－９

☑ Ｃ欄の続きにも文献が列挙されている。　☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊　引用文献のカテゴリー
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の１以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 １８．１１．２０１６	国際調査報告の発送日 ０６．１２．２０１６
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｐ　８３７９ 早乙女　智美 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４９２

C（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
	落[0003]－[0006]，段落[0029]－[0057]（ファミリーなし）	
A	JP 4-234393 A（ビーエーエスエフ　アクチエンゲゼルシヤフト）1992.08.24，請求項１，段落[0003]，表１ & JP 2000-297087 A & US 5386036 A，請求項１－２，第２頁第２欄２８－５１行目、第８－１９頁 & US 5276009 A & EP 467206 A2 & DE 4023048 A & DE 59108419 D & HU 58190 A & AT 146475 T & CA 2047452 A & HU 912433 A0	１－９
A	MIURA T. et al., Palladium-Catalyzed Denitrogenation Reaction of 1,2,3-Benzotriazin-4(3H)-ones Incorporating Isocyanides, ORGANIC LETTERS, 2011, Vol. 13, No. 6, pp. 1429-1431, ISSN 1523-7052, 表１	１－９