

(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
2013 年 10 月 10 日(10.10.2013)

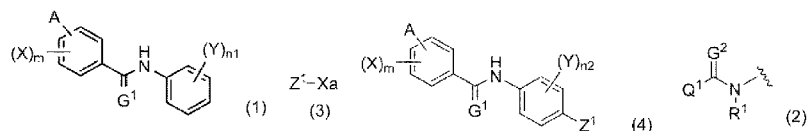


(10) 国際公開番号
WO 2013/150988 A1

- (51) 国際特許分類:
C07C 231/12 (2006.01) C07C 237/42 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2013/059695
- (22) 国際出願日: 2013 年 3 月 29 日(29.03.2013)
- (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 2012-085053 2012 年 4 月 3 日(03.04.2012) JP
- (71) 出願人: 三井化学アグロ株式会社 (MITSUI CHEMICALS AGRO, INC.) [JP/JP]; 〒1057117 東京都港区東新橋一丁目 5 番 2 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 大倉 広成(OKURA, Hironari); 〒2970017 千葉県茂原市東郷 1 1 4 4 三井化学アグロ株式会社内 Chiba (JP).
- (74) 代理人: 中島 淳, 外(NAKAJIMA, Jun et al.); 〒1600022 東京都新宿区新宿 4 丁目 3 番 1 7 号 H K 新宿ビル 7 階 太陽国際特許事務所 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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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, 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, 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), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING ALKYLATED AROMATIC AMIDE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: アルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法



(57) Abstract: Provided is a method for producing an aromatic amide derivative represented by general formula (4), which comprises a step wherein an aromatic amide derivative represented by general formula (1) and a haloalkyl compound represented by general formula (3) are reacted with each other in the presence of a base and a metal or metal salt. In the general formulae, each of X and Y represents a hydrogen atom, a halogen atom or the like; A represents a hydrogen atom, an alkyl group, a group represented by general formula (2) or the like; each of G¹ and G² represents an oxygen atom or the like; Q¹ represents a phenyl group or the like; R¹ represents a hydrogen atom, an alkyl group or the like; Z¹ represents a haloalkyl group or the like; Xa represents an iodine atom or the like; m represents a number of 1-4; n1 represents a number of 1-5; and n2 represents a number of 1-4.

(57) 要約: 一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体と、一般式(3)で表されるハロアルキル化合物とを、塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させる工程を含む一般式(4)で表される芳香族アミド誘導体の製造方法が提供される。一般式中、XおよびYは水素原子、ハロゲン原子等を示す。Aは水素原子、アルキル基、一般式(2)で表される基等を示す。G¹およびG²は酸素原子等を示す。Q¹はフェニル基等を示す。R¹は水素原子、アルキル基等を示す。Z¹はハロアルキル基等を示す。Xaはヨウ素原子等を示す。mは1~4、n1は1~5、n2は1~4を示す。

WO 2013/150988 A1

明 細 書

発明の名称：アルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法

技術分野

[0001] 本発明は、アルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法に関する。

背景技術

[0002] 国際公開第2005/73165号パンフレット、国際公開第2006/137376号パンフレット、及び国際公開第2010/18714号パンフレットには、有害生物防除作用を有するアミド誘導体として種々の化合物が開示され、該アミド誘導体を製造する上でパーフルオロアルキル化されたフェニル基を有するアミド誘導体が有用であることが開示されている。

パーフルオロアルキル化されたフェニル基を有するアニリンの製造方法として、パーフルオロアルキルハロゲン化合物を還元剤の存在下で反応させる製造方法が知られている（例えば、特開2001-122836号公報参照）。更に、パーフルオロアルキル化されたフェニル基を有するアミド誘導体の製造方法として、Journal of Fluorine Chemistry 22, 541-556, 1983が知られている。

[0003] また電子吸引基を有する芳香族環を有するアミド化合物をハロゲン化する方法は幾つか知られている（例えば、Bioorganic & Medicinal Chemistry, 15 (3), 1212-1228, 2007参照）が、パーフルオロアルキル化されたフェニル基を有するアミド誘導体をハロゲン化する方法は知られていない。

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 特開2001-122836号公報にはアニリンの例が記載されているだけで、アミド化合物が具体的に開示されていない。本発明者らが特開2001-122836号公報に記載の方法でアミド化合物のパーフルオロアルキル化を試みたところ、反応は進行しなかった。

[0005] また Journal of Fluorine chemistry 22, 541-556, 1983 に記載の方法では、反応に高温を必要とするため、沸点が低いパーフルオロアルキルハロゲン化合物には適用できず、制約を生じる。また、この方法は、生成物の収率および反応選択性も低いため実用性が期待できない。

[0006] Bioorganic & Medicinal Chemistry, 15 (3), 1212-1228, 2007 に記載の方法では、ハロゲン化の収率は低く、本発明者らが非特許文献 2 に記載の方法に従い電子吸引基を有するアミド化合物のハロゲン化反応を行ったところ、生成物の収率は低かった。結局、現時点では、パーフルオロアルキル化されたフェニル基を有するアミド誘導体をハロゲン化する工業的製造にとって利用可能な、反応方法を示唆する知見は見出されていないのが実情である。

[0007] 本発明は上記に鑑み、アルキル基を有する芳香族アミド誘導体を、短工程、且つ工業的に利用可能な製造方法を提供すること、および当該製造方法に有用な製造中間体を提供することを課題とする。

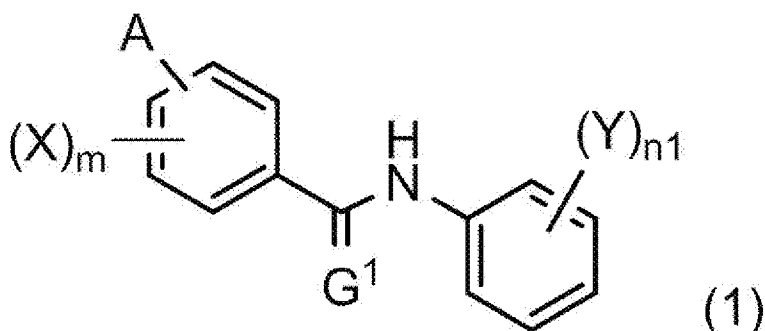
課題を解決するための手段

[0008] 本発明者等は、上記課題を解決するために鋭意検討を行った結果、アルキル基（好ましくはパーフルオロアルキル基）を有する芳香族アミド誘導体の新規な製造方法と該製造方法に利用できる新規な有用中間体を見出し、さらに該有用中間体を選択的にハロゲン化できることを見出した。このことにより、高い殺虫活性を有する新規殺虫剤を容易に製造するための方法を見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は以下のとおりである。

[0009] <1> 下記一般式（1）

[化1]



[0010] (一般式(1)中、Xはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C1-C4アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。mは1~4の整数を示し、n1は1~5の整数を示す。G¹は酸素原子、または硫黄原子を示す。

[0011] Yはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4ハロアルケニル基、C2-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、C3-C6ハロシクロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、C1-C4ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C1-C4アルキルアミノ基、ジC1-C4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C1-C4アルキルカルボニル基、C1-C4ハロアルキルカルボニル基、C1-C4アルキルカルボニルオキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、またはアセチルアミノ基を示す。

[0012] Aは水素原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4ハロアルケニル基、C2-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、C3-C6ハロシクロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1

ーC₄アルキルスルフィニル基、C₁ーC₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁ーC₄アルキルスルホニル基、C₁ーC₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁ーC₄アルキルアミノ基、ジC₁ーC₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁ーC₄アルキルカルボニル基、C₁ーC₄ハロアルキルカルボニル基、C₁ーC₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁ーC₄アルコキシカルボニル基、C₁ーC₄アルキルアミノカルボニル基、メチルスルフィニルC₁ーC₄アルキルアミノカルボニル基、メチルスルホニルC₁ーC₄アルキルアミノカルボニル基、アセチルアミノ基、

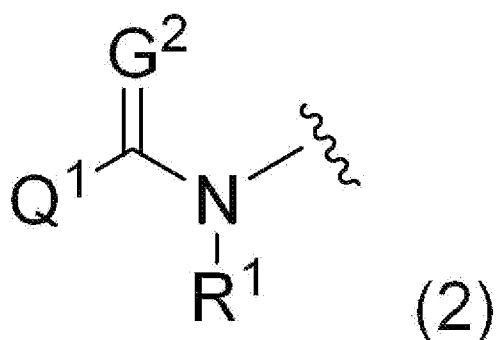
無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C₁ーC₆アルキル基、C₁ーC₆ハロアルキル基、C₂ーC₄アルケニル基、C₂ーC₄ハロアルケニル基、C₂ーC₄アルキニル基、C₂ーC₄ハロアルキニル基、C₃ーC₆シクロアルキル基、C₃ーC₆ハロシクロアルキル基、C₁ーC₄アルコキシ基、C₁ーC₄ハロアルコキシ基、C₁ーC₄アルキルチオ基、C₁ーC₄ハロアルキルチオ基、C₁ーC₄アルキルスルフィニル基、C₁ーC₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁ーC₄アルキルスルホニル基、C₁ーC₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁ーC₄アルキルアミノ基、ジC₁ーC₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁ーC₄アルキルカルボニル基、C₁ーC₄ハロアルキルカルボニル基、C₁ーC₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁ーC₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、

無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C₁ーC₆アルキル基、C₁ーC₆ハロアルキル基、C₂ーC₄アルケニル基、C₂ーC₄ハロアルケニル基、C₂ーC₄アルキニル基、C₂ーC₄ハロアルキニル基、C₃ーC₆シクロアルキル基、C₃ーC₆ハロシクロアルキル基、C₁ーC₄アルコキシ基、C₁ーC₄ハロアルコキシ基、C₁ーC₄アルキルチオ基、C₁ーC₄ハロアルキルチオ基、C₁ーC₄アルキルスルフィニル基、C₁ーC₄ハロ

アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっている置換基を有する複素環基、

[0013] または下記一般式 (2)

[化2]



[0014] (一般式 (2) 中、G²は酸素原子、または硫黄原子を示す。

R¹は水素原子、C 1－C 6 アルキル基、またはC 1－C 6 ハロアルキル基を示す。

Q¹はC 1－C 6 のアルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルア

ミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または、無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。) で表される基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジリル基、ピラジリル基、フリリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表される芳香族アミド誘導体と、

[0015] 下記一般式 (3)

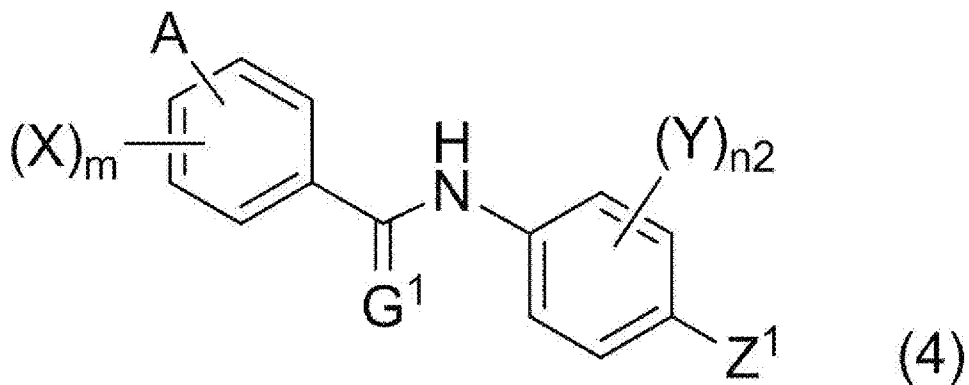
[化3]



(一般式(3)中、 Z^1 はC1-C6アルキル基、またはC1-C6ハロアルキル基を示す。 X_a はヨウ素原子または臭素原子を示す。)で表されるハロアルキル化合物とを、

塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させる工程を含む、下記一般式(4)

[0016] [化4]

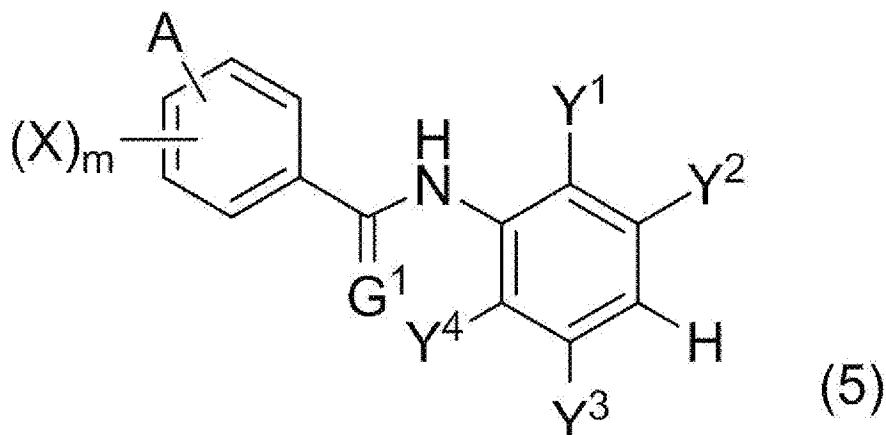


[0017] (一般式(4)中、 n_2 は1~4の整数を示す。 Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義であり、 X 、 m 、 G^1 、 Y 、および A は前記一般式(1)における X 、 m 、 G^1 、 Y 、および A とそれぞれ同義である。)

で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法。

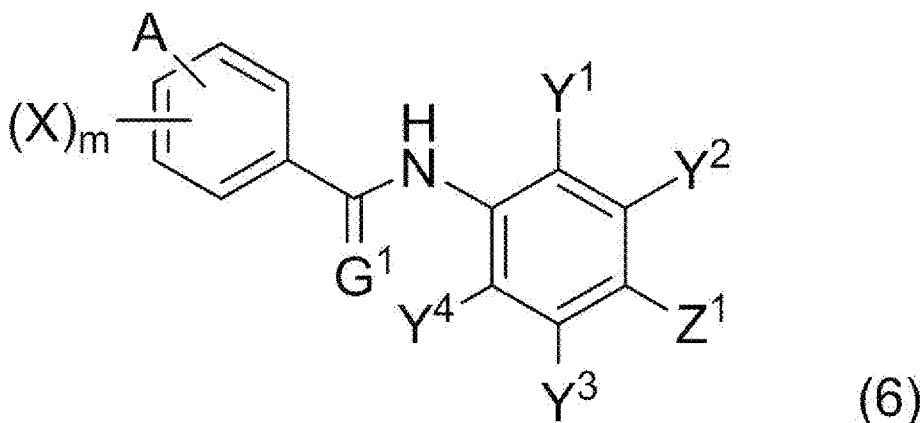
[0018] <2> 前記一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体が下記一般式(5)

[0019] [化5]



[0020] (一般式(5)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、またはC1-C4ハロアルキルスルホニル基を示す。 X 、 m 、 G^1 、および A は前記一般式(1)における X 、 m 、 G^1 、および A とそれぞれ同義である。)で表される芳香族アミド誘導体であり、前記一般式(4)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体が、下記一般式(6)

[0021] [化6]

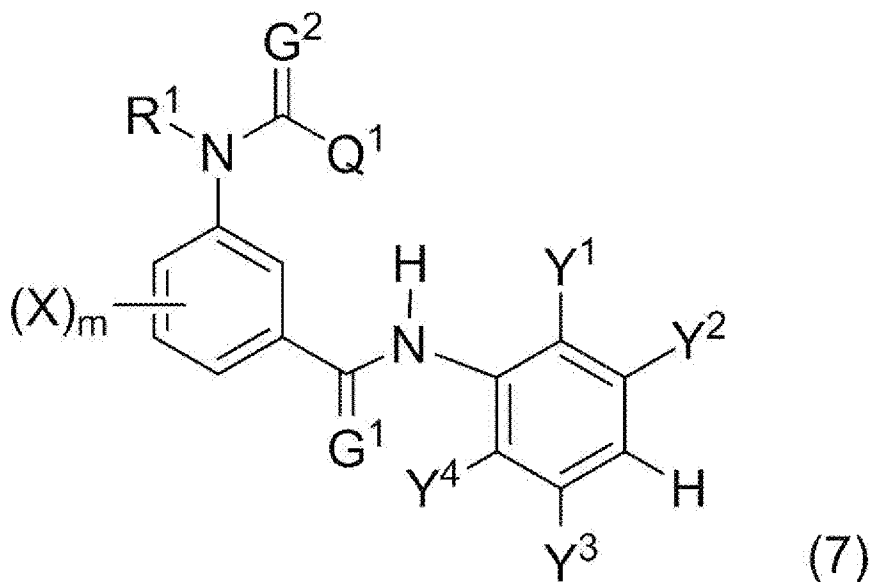


[0022] (一般式(6)中、 Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義である。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、および A は前記一般式(5)における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、および A とそれぞれ同義である。)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体である、前記<1>に記載の製造方法。

[0023] <3> 前記一般式(5)で表される芳香族アミド誘導体が下記一般式(7)

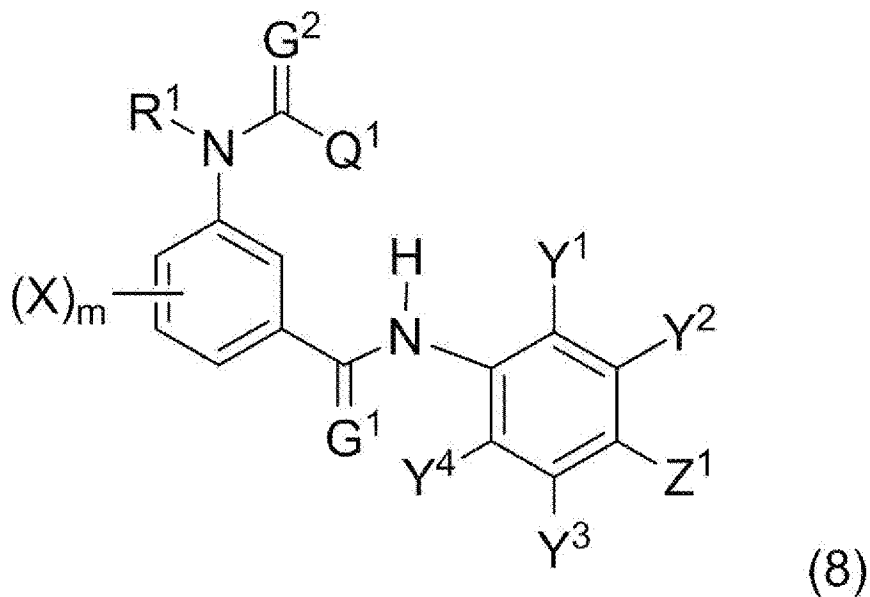
[0024]

[化7]



[0025] (一般式(7)中、 G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式(2)における G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 は前記一般式(5)における X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 とそれぞれ同義である。)で表される芳香族アミド誘導体であり、前記一般式(6)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体が、下記一般式(8)

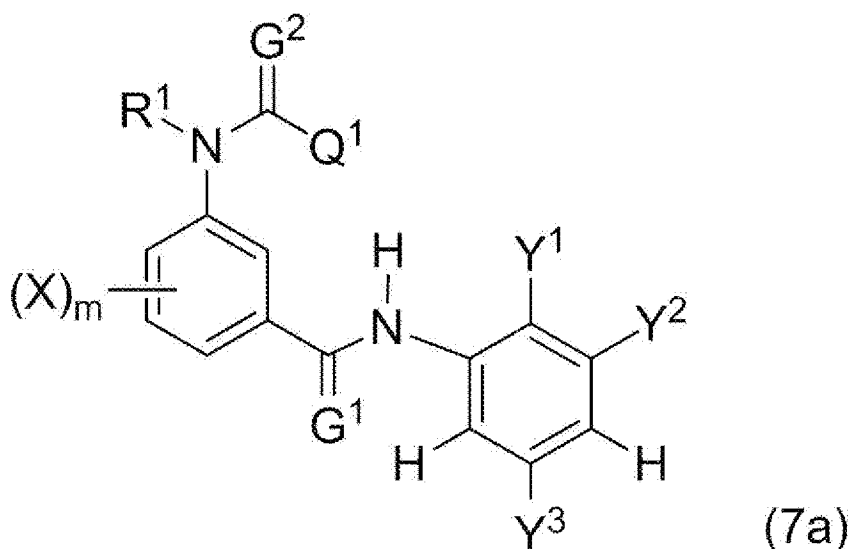
[0026] [化8]



[0027] (一般式(8)中、 Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義である。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式(7)における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体である<2>に記載の製造方法。

[0028] <4> 下記一般式(7a)

[化9]



[0029] (一般式(7a)中、 X はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C1-C4$ アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。 m は1~4の整数を示す。

G^1 および G^2 はそれぞれ独立に、酸素原子、または硫黄原子を示す。

Y^1 、 Y^2 、および Y^3 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、 $C1-C6$ アルキル基、 $C1-C6$ ハロアルキル基、 $C1-C4$ アルキルチオ基、 $C1-C4$ ハロアルキルチオ基、 $C1-C4$ アルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ アルキルスルホニル基、または $C1-C4$ ハロアルキルスルホニル基を示す。

[0030] R^1 は水素原子、 $C1-C6$ アルキル基、または $C1-C6$ ハロアルキル基を示す。

Q¹はC 1－C 6のアルキル基、C 1－C 6ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6アルキル基、C 1－C 6ハロアルキル基、C 2－C 4アルケニル基、C 2－C 4ハロアルケニル基、C 2－C 4アルキニル基、C 2－C 4ハロアルキニル基、C 3－C 6シクロアルキル基、C 3－C 6ハロシクロアルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 4ハロアルキルチオ基、C 1－C 4アルキルスルフィニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4アルキルスルホニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4アルキルアミノ基、ジC 1－C 4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4アルキルカルボニル基、C 1－C 4ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6アルキル基、C 1－C 6ハロアルキル基、C 2－C 4アルケニル基、C 2－C 4ハロアルケニル基、C 2－C 4アルキニル基、C 2－C 4ハロアルキニル基、C 3－C 6シクロアルキル基、C 3－C 6ハロシクロアルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 4ハロアルキルチオ基、C 1－C 4アルキルスルフィニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4アルキルスルホニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4アルキルアミノ基、ジC 1－C 4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4アルキルカルボニル基、C 1－C 4ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。

[0031] 前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル

基、ピリダジル基、ピラジル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表される芳香族アミド誘導体と、下記一般式 (3)

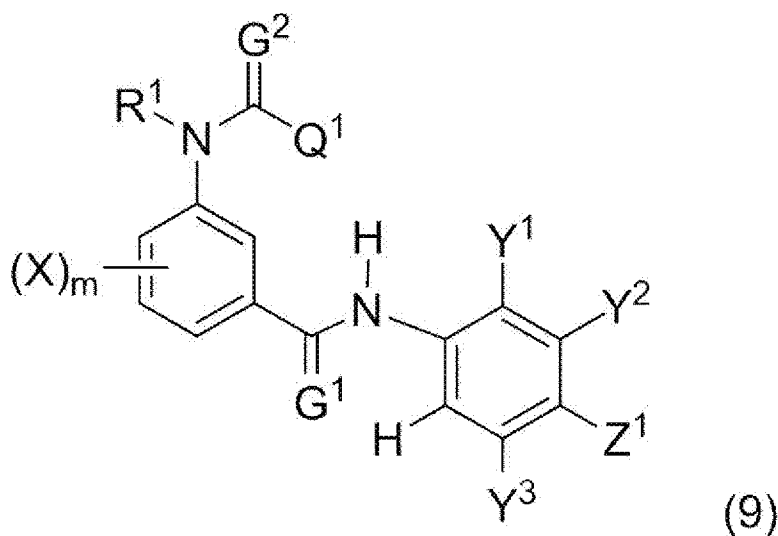
[0032] [化10]



(一般式 (3) 中、 Z^1 は C 1 - C 6 アルキル基、または C 1 - C 6 ハロアルキル基を示す。 Xa はヨウ素原子または臭素原子を示す。) で表されるハロアルキル化合物とを、

塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させて下記一般式 (9)

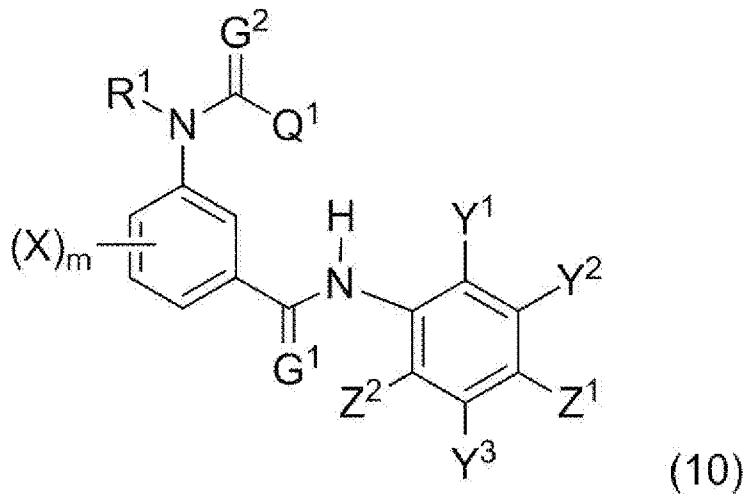
[0033] [化11]



[0034] (一般式 (9) 中、 Z^1 は一般式 (3) における Z^1 と同義である。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 は前記一般式 (7 a) における X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 とそれぞれ同義である。) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を得る工程と、

前記一般式（９）で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下で、ハロゲン化する工程とを含む、下記一般式（１０）

[0035] [化12]

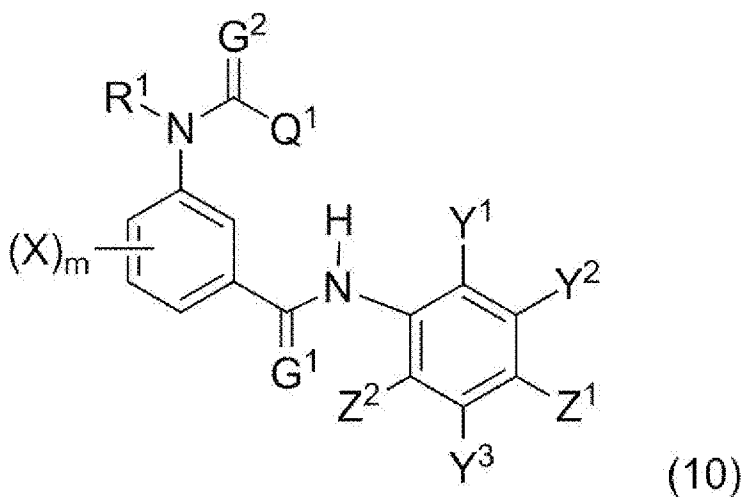


[0036] （一般式（１０）中、 Z^2 はハロゲン原子を示す。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 は前記一般式（９）における X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 とそれぞれ同義である。）で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法。

[0037] <４Ａ> <２>に記載の製造方法により前記一般式（６）で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を得る工程と、

前記一般式（６）で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下でハロゲン化する工程とを含む、下記一般式（１０）

[化13]

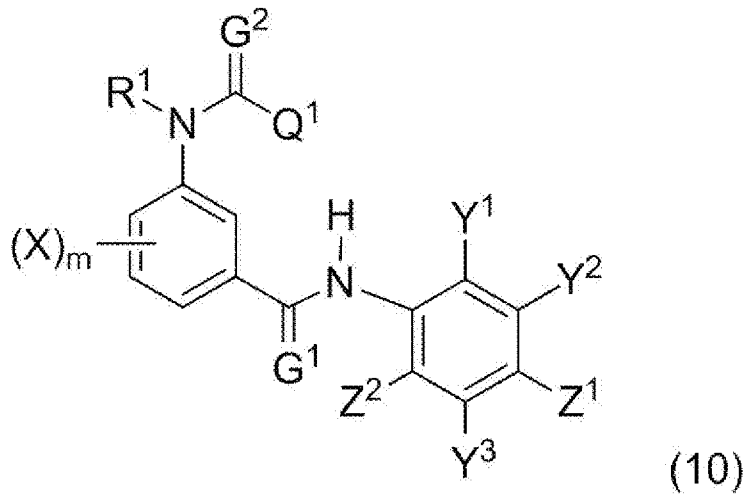


(一般式 (10) 中、 Z^2 はハロゲン原子を示す。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 は前記一般式 (6) における X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 とそれぞれ同義であり、 G^2 、 Q^1 、および R^1 は、前記一般式 (2) における G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。) で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法であって、前記一般式 (6) において、 A は前記一般式 (2) で表され、 Y^4 は水素原子である。

<4 B> <3>に記載の製造方法により前記一般式 (8) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を得る工程と、

前記一般式 (8) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下でハロゲン化する工程とを含む、下記一般式 (10)

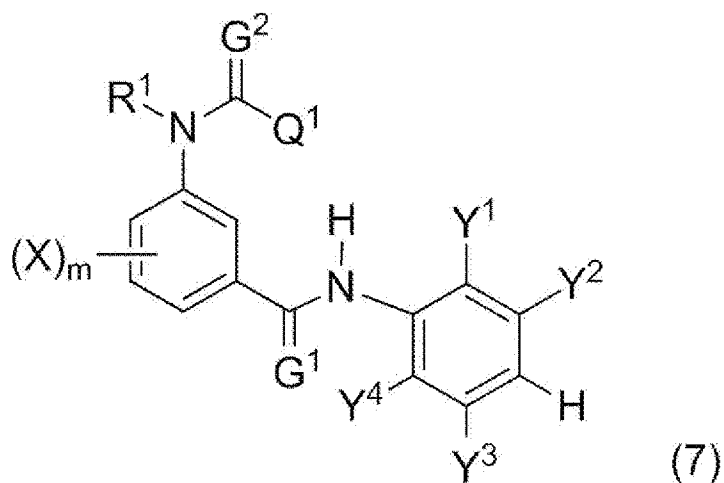
[化14]



(一般式 (10) 中、 Z^2 はハロゲン原子を示す。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 は前記一般式 (8) における X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 とそれぞれ同義である。) で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法であって、前記一般式 (8) において、 Y^4 は水素原子である。

[0038] <5> 下記一般式 (7)

[化15]



(一般式 (7) 中、 X はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C1-C4$ アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。

mは1～4の整数を示す。

G¹およびG²はそれぞれ独立に、酸素原子、または硫黄原子を示す。

Y¹、Y²、Y³、およびY⁴はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、またはC1-C4ハロアルキルスルホニル基を示す。

[0039] R¹は水素原子、C1-C6アルキル基、またはC1-C6ハロアルキル基を示す。

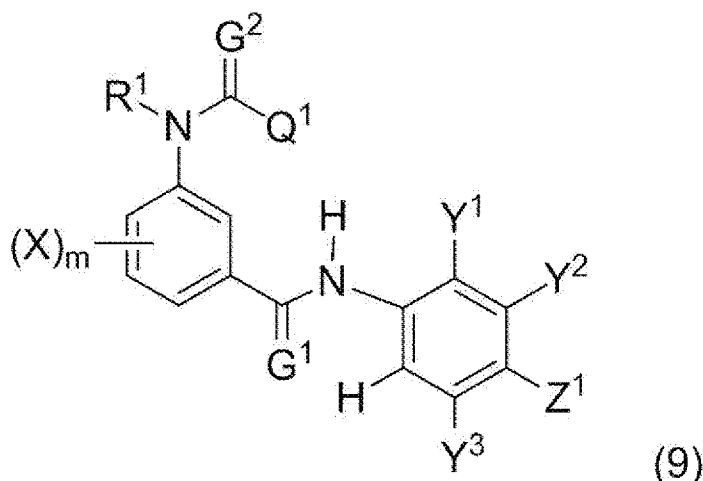
Q¹はC1-C6のアルキル基、C1-C6ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4ハロアルケニル基、C2-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、C3-C6ハロシクロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、C1-C4ハロアルキルスルホニル基、C1-C4アルキルアミノ基、ジC1-C4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C1-C4アルキルカルボニル基、C1-C4ハロアルキルカルボニル基、C1-C4アルキルカルボニルオキシ基、C1-C4アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっている置換基を有するフェニル基、または無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4ハロアルケニル基、C2-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、C3-C6ハロシクロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4

ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン－N－オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジリル基、ピラジリル基、フリリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表される芳香族アミド誘導体。

[0040] < 6 > 下記一般式 (9)

[化16]



[0041] (一般式 (9) 中、X はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C 1－C 4 アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。
m は 1 ～ 4 の整数を示す。

G¹ および G² はそれぞれ独立に、酸素原子、または硫黄原子を示す。

Y¹、Y²、および Y³ はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C 1－

C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 4 アルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 アルキルスルホニル基、またはC 1 - C 4 ハロアルキルスルホニル基を示す。

Z¹はC 1 - C 6 アルキル基、またはC 1 - C 6 ハロアルキル基を示す。

[0042] R¹は水素原子、C 1 - C 6 アルキル基、またはC 1 - C 6 ハロアルキル基を示す。

Q¹はC 1 - C 6 のアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 2 - C 4 アルケニル基、C 2 - C 4 ハロアルケニル基、C 2 - C 4 アルキニル基、C 2 - C 4 ハロアルキニル基、C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 3 - C 6 ハロシクロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 4 アルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 アルキルスルホニル基、C 1 - C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1 - C 4 アルキルアミノ基、ジC 1 - C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1 - C 4 アルキルカルボニル基、C 1 - C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1 - C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1 - C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 2 - C 4 アルケニル基、C 2 - C 4 ハロアルケニル基、C 2 - C 4 アルキニル基、C 2 - C 4 ハロアルキニル基、C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 3 - C 6 ハロシクロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 4 アルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 4 アルキルスルホニル基、C 1 - C 4 ハ

ロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジリル基、ピラジリル基、フリリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体。

[0043] < 7 > 前記一般式 (9) における Y¹ が C 1－C 2 ハロアルキル基であり、Y² および Y³ がそれぞれ水素原子であり、Z¹ が C 1－C 6 ハロアルキル基であり、X がハロゲン原子である前記 < 6 > に記載のアルキル化芳香族アミド誘導体。

発明の効果

[0044] 本発明によれば、アルキル基を有する芳香族アミド誘導体を、短工程、且つ工業的に利用可能な製造方法を提供することができる。また当該製造方法に有用な製造中間体を提供することができる。

発明を実施するための形態

[0045] 本明細書において「工程」との語は、独立した工程だけではなく、他の工程と明確に区別できない場合であってもその工程の所期の作用が達成されれば、本用語に含まれる。また「～」を用いて示された数値範囲は、「～」の前後に記載される数値をそれぞれ最小値および最大値として含む範囲を示す。

また本明細書の一般式において使用される文言は、その定義においてそれぞれ以下に説明されるような意味を有する。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原

子を示す。「n-」はノルマルを意味し、「i-」はイソを意味し、「s-」はセカンダリーを意味し、「t-」はターシャリーを意味する。

「C_a-C_b (a、bは1以上の整数を表す)」との表記は、例えば、「C₁-C₃」とは炭素原子数が1～3個であることを意味し、「C₂-C₆」とは炭素原子数が2～6個であることを意味し、「C₁-C₄」とは炭素原子数が1～4個であることを意味する。

[0046] また「C₁-C₃アルキル基」とは例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルキル基を示し、「C₁-C₄アルキル基」とは「C₁-C₃アルキル基」に加えて例えば、n-ブチル、s-ブチル、i-ブチル、t-ブチルなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～4個のアルキル基を示し、「C₁-C₆アルキル基」とは、「C₁-C₄アルキル基」に加えて例えば、n-ペンチル、2-ペンチル、3-ペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、2-ヘキシル、4-メチル-2-ペンチル、3-メチル-n-ペンチルなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示す。

[0047] 「C₁-C₆ハロアルキル基」とは例えば、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、モノクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、モノブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、2, 2-ジクロロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、1-ブロモエチル、2-ブロモエチル、2, 2-ジブロモエチル、2, 2, 2-トリブロモエチル、2-ヨードエチル、ペンタフルオロエチル、3-フルオロ-n-プロピル、3-クロロ-n-プロピル、3-ブロモ-n-プロピル、1, 3-ジフルオロ-2-プロピル、1, 3-ジクロロ-2-プロピル、1, 1, 1-トリフルオロ-2-プロピル、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロピル、2, 2, 3, 3,

3-ペンタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロ-i-プロピル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、4-フルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-2-ブチル、ノナフルオロ-i-ブチル、ウンデカフルオロ-n-ペンチル、ウンデカフルオロ-i-ペンチル、ウンデカフルオロ-ネオペンチル、トリデカフルオロ-n-ヘキシル、トリデカフルオロ-n-ヘキシル、などの同一または異なってもよい1以上のハロゲン原子によって置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示す。

[0048] 「C2-C4アルケニル基」とは例えば、ビニル、アリル、2-ブテニル、3-ブテニルなどの炭素鎖の中に二重結合を有する炭素原子数2～4個のアルケニル基を示し、「C2-C4ハロアルケニル基」とは例えば、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジブロモ-2-プロペニル、2,3-ジブロモ-2-プロペニル、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル、3,4,4-トリブロモ-3-ブテニルなどの同一または異なってもよい1以上のハロゲン原子によって置換された炭素鎖の中に二重結合を有する直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数2～4個のアルケニル基を示す。

[0049] 「C2-C4アルキニル基」とは例えば、プロパルギル、1-ブチン-3-イル、1-ブチン-3-メチル-3-イルなどの炭素鎖の中に三重結合を有する直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数2～4個のアルキニル基を示し、「C2-C4ハロアルキニル基」とは例えば、同一または異なってもよい1以上のハロゲン原子によって置換された炭素鎖の中に三重結合を有する直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数2～4個のアルケニル基を示す。

[0050] 「C3-C6シクロアルキル基」とは例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、2-メチルシクロペンチル、3-メチルシクロペンチル、シクロヘキシルなどの環状構造を有する炭素原子数3～6個のシクロアルキル基を示し、「C3-C6ハロシクロアルキル基」とは例えば、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル、2-クロロシクロヘキシル、4

ークロロシクロヘキシルなどの同一または異なっているハロゲン原子によって置換された環状構造を有する炭素原子数3～6個のシクロアルキル基を示す。

[0051] 「C1-C4アルコキシ基」とは例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、n-ブチルオキシ、i-ブチルオキシなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルコキシ基を示し、「C1-C4ハロアルコキシ基」とは例えば、トリフルオロメトキシ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロピルオキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、3-フルオロ-n-プロピルオキシ、1, 1, 1, 3, 3, 4, 4, 4-オクタフルオロ-2-ブチルオキシなどの同一または異なっているハロゲン原子により置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～4個のハロアルコキシ基を示す。

[0052] 「C1-C4アルキルチオ基」とは例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、シクロプロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、シクロプロピルメチルチオなどの直鎖状、分岐鎖状または環状の炭素原子数1～4個のアルキルチオ基を示す。「C1-C4ハロアルキルチオ基」とは例えば、トリフルオロメチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、ヘプタフルオロ-n-プロピルチオ、ヘプタフルオロ-i-プロピルチオ、ノナフルオロ-n-ブチルチオ、ノナフルオロ-i-ブチルチオ、ノナフルオロ-s-ブチルチオ、4, 4, 4-トリフルオロ-n-ブチルチオなどの同一または異なっているハロゲン原子により置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数1～4個のアルキルチオ基を示す。

[0053] 「C1-C4アルキルスルフィニル基」とは例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、i-プロピルスルフィニル、シクロプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、i-ブチル

スルフィニルなどの直鎖状または分岐鎖状または環状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルスルフィニル基を示し、「C 1 – C 4 ハロアルキルスルフィニル基」とは例えば、トリフルオロメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピルスルフィニル、ヘプタフルオロ-*i*-プロピルスルフィニル、ノナフルオロ-*n*-ブチルスルフィニル、ノナフルオロ-*i*-ブチルスルフィニル、ノナフルオロ-*s*-ブチルスルフィニル、4, 4, 4-トリフルオロ-*n*-ブチルスルフィニルなどの同一または異なっているもよい 1 個以上のハロゲン原子により置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルスルフィニル基を示す。

[0054] 「C 1 – C 4 アルキルスルホニル基」とは例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、*n*-プロピルスルホニル、*i*-プロピルスルホニル、シクロプロピルスルホニル、*n*-ブチルスルホニル、*i*-ブチルスルホニルなどの直鎖状または分岐鎖状または環状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルスルホニル基を示し、「C 1 – C 4 ハロアルキルスルホニル基」とは例えば、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピルスルホニル、ヘプタフルオロ-*i*-プロピルスルホニル、ノナフルオロ-*n*-ブチルスルホニル、ノナフルオロ-*s*-ブチルスルホニルなどの同一または異なっているもよい 1 個以上のハロゲン原子により置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルスルホニル基を示す。

「アリールスルホニル基」とは例えば、フェニルスルホニル、*p*-トルエンスルホニル、1-ナフチルスルホニル、2-ナフチルスルホニル、アントリルスルホニル、フェナントリルスルホニル、アセナフチレニルスルホニルなどの芳香環を有する炭素原子数 6 ～ 14 個のアリールスルホニル基を示す。

[0055] 「C 1 – C 4 アルキルアミノ基」とは例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-プロピルアミノ、*i*-プロピルアミノ、*n*-ブチルアミノ、シクロ

プロピルアミノなどの直鎖状、分岐鎖状または環状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルアミノ基を示し、「ジ C 1 – C 4 アルキルアミノ基」とは例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N – エチル – N – メチルアミノなどの同一または異なっているよい直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキル基 2 つにより置換されたアミノ基を示す。

[0056] 「C 1 – C 4 アルキルカルボニル基」とは例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、イソプロピルカルボニル、シクロプロピルカルボニルなどの直鎖状、分岐鎖状または環状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルカルボニル基を示す。「C 1 – C 4 ハロアルキルカルボニル基」とは例えば、フルオロアセチル、ジフルオロアセチル、トリフルオロアセチル、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリクロロアセチル、ブromoアセチル、ヨードアセチル、3, 3, 3 – トリフルオロプロピオニル、2, 2, 3, 3, 3 – ペンタフルオロプロピオニルなどの同一または異なっているよい 1 以上のハロゲン原子により置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルカルボニル基を示す。

[0057] 「C 1 – C 4 アルキルカルボニルオキシ基」とは例えば、アセトキシ、プロピオニルオキシなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキルカルボニルオキシ基を示し、「C 1 – C 4 アルコキシカルボニル基」とは例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、イソプロピルオキシカルボニルなどの直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルコキシカルボニル基を示す。

[0058] 「C 1 – C 6 パーフルオロアルキル基」とは例えば、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ – n – プロピル、ヘプタフルオロ – i – プロピル、ノナフルオロ – n – ブチル、ノナフルオロ – 2 – ブチル、ノナフルオロ – i – ブチル、パーフルオロ – n – ペンチル、パーフルオロ – n – ヘキシルなどのフッ素原子により全て置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 4 個のアルキル基を示す。

「C 1 – C 6 パーフルオロアルキルチオ基」とは例えば、トリフルオロメ

チルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、ヘプタフルオロー n -プロピルチオ、ヘプタフルオロー i -プロピルチオ、ノナフルオロー n -ブチルチオ、ノナフルオロー 2 -ブチルチオ、ノナフルオロー i -ブチルチオ、パーフルオロー n -ペンチルチオ、パーフルオロー n -ヘキシルチオなどのフッ素原子により全て置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 $1\sim 6$ 個のアルキルチオ基を示す。

「 $C1-C6$ パーフルオロアルキルスルフィニル基」とは例えば、トリフルオロメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル、ヘプタフルオロー n -プロピルスルフィニル、ヘプタフルオロー i -プロピルスルフィニル、ノナフルオロー n -ブチルスルフィニル、ノナフルオロー 2 -ブチルスルフィニル、ノナフルオロー i -ブチルスルフィニル、パーフルオロー n -ペンチルスルフィニル、パーフルオロー n -ヘキシルスルフィニルなどのフッ素原子により全て置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 $1\sim 6$ 個のアルキルスルフィニル基を示す。

「 $C1-C6$ パーフルオロアルキルスルホニル基」とは例えば、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、ヘプタフルオロー n -プロピルスルホニル、ヘプタフルオロー i -プロピルスルホニル、ノナフルオロー n -ブチルスルホニル、ノナフルオロー 2 -ブチルスルホニル、ノナフルオロー i -ブチルスルホニル、パーフルオロー n -ペンチルスルホニル、パーフルオロー n -ヘキシルスルホニルなどのフッ素原子により全て置換された直鎖状または分岐鎖状の炭素原子数 $1\sim 6$ 個のアルキルスルホニル基を示す。

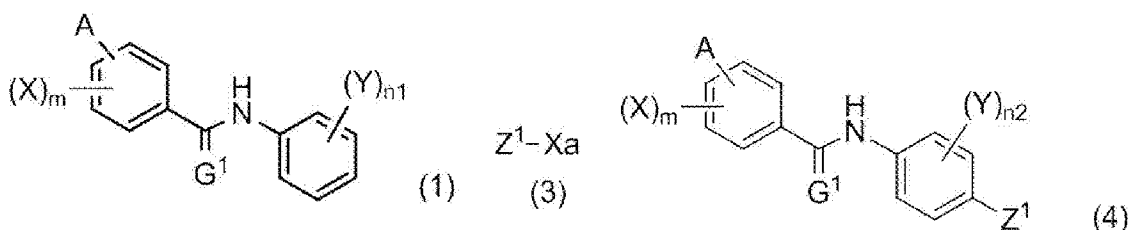
[0059] 本発明における一般式(1)および一般式(3)等で表される化合物は、その構造式中に1個または複数個の不斉炭素原子または不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体が存在する場合もある。本発明は各々の光学異性体およびそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

また、本発明における一般式(1)および一般式(3)等で表される化合

物は、その構造式中に、炭素－炭素二重結合に由来する２種以上の幾何異性体が存在する場合もある。本発明は各々の幾何異性体が任意の割合で含まれる混合物をも全て包含する。

[0060] 本発明の下記一般式（４）で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法は、下記一般式（１）で表される芳香族アミド誘導体と、下記一般式（３）で表されるハロアルキル化合物とを、塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させる工程を含む。前記製造方法は必要に応じてその他の工程を更に含んでもよい。

[0061] [化17]



[0062] 一般式（１）中、Xはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C１－C４アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。mは１～４の整数を示し、n１は１～５の整数を示す。前記Xが複数存在する場合、それぞれのXは同一でも異なってもよい。

G¹は酸素原子、または硫黄原子を示す。

[0063] Yはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C１－C６アルキル基、C１－C６ハロアルキル基、C２－C４アルケニル基、C２－C４ハロアルケニル基、C２－C４アルキニル基、C２－C４ハロアルキニル基、C３－C６シクロアルキル基、C３－C６ハロシクロアルキル基、C１－C４アルコキシ基、C１－C４ハロアルコキシ基、C１－C４アルキルチオ基、C１－C４ハロアルキルチオ基、C１－C４アルキルスルフィニル基、C１－C４ハロアルキルスルフィニル基、C１－C４アルキルスルホニル基、C１－C４ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C１－C４アルキルアミノ基、ジC１－C４アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロ

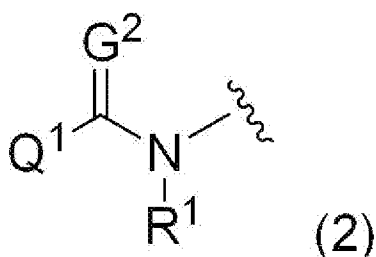
キシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、またはアセチルアミノ基を示す。

前記 Y が複数存在する場合、それぞれの Y は同一でも異なってもよい。

[0064] A は水素原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジ C 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、C 1－C 4 アルキルアミノカルボニル基、メチルスルフィニル C 1－C 4 アルキルアミノカルボニル基、メチルスルホニル C 1－C 4 アルキルアミノカルボニル基、アセチルアミノ基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジ C 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキ

ルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基、または下記一般式（2）で表される基を示す。

[0065] [化18]



[0066] 一般式（2）中、G²は酸素原子、または硫黄原子を示す。

R¹は水素原子、C 1－C 6 アルキル基、またはC 1－C 6 ハロアルキル基を示す。

Q¹はC 1－C 6 のアルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロア

ルキル基、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または、無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C₁－C₆アルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。

なお、一般式(1)における複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジル基、ピラジル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリ

ル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。

[0067] 本発明における一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体は、殺虫剤として有用な一般式(10)で表される化合物を製造する上で特に有用な製造中間体である。

一般式(1)における置換基Xは、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C1-C4アルコキシ基、またはジメチルアミノ基であり、好ましくはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、またはジメチルアミノ基である。mは、1~4の整数であり、より好ましくは1~3の整数である。

[0068] また置換基Aは、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基、置換基を有するフェニル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基または上記一般式(2)で表される基であることが好ましい。

一般式(2)中の置換基G²は酸素原子、または硫黄原子であり、好ましくは酸素原子である。

置換基Q¹は無置換のフェニル基、置換基を有するフェニル基、または無置換の複素環基、置換基を有する複素環基、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4ハロアルコキシ基であることが好ましい。

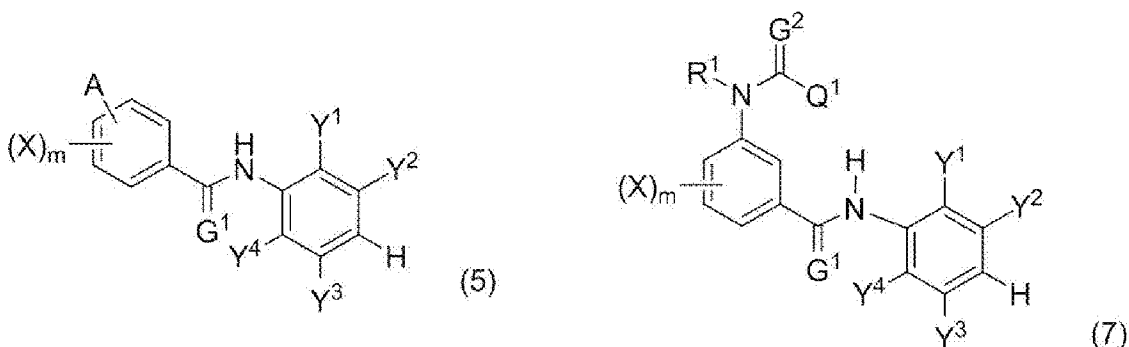
置換基R¹は、水素原子、C1-C6アルキル基またはC1-C6ハロアルキル基であることが好ましい。

[0069] 置換基Yは、水素原子、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、またはC1-C4ハロアルキルスルホニル基であることが好ましい。n₁は1~5の整数であり、より好ましくは1~3の整数である。

[0070] 前記一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体は、下記一般式(5)で

表される芳香族アミド誘導体であることが好ましく、下記一般式（７）で表される芳香族アミド誘導体であることがより好ましい。

[0071] [化19]



[0072] 一般式（５）中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、 $C1-C6$ アルキル基、 $C1-C6$ ハロアルキル基、 $C1-C4$ アルキルチオ基、 $C1-C4$ ハロアルキルチオ基、 $C1-C4$ アルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ アルキルスルホニル基、または $C1-C4$ ハロアルキルスルホニル基を示す。 X 、 m 、 G^1 、および A は前記一般式（１）における X 、 m 、 G^1 、および A とそれぞれ同義である。

[0073] 一般式（５）における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、 $C1-C6$ ハロアルキル基、 $C1-C4$ ハロアルキルチオ基、 $C1-C4$ ハロアルキルスルフィニル基、または $C1-C4$ ハロアルキルスルホニル基であることが好ましい。

[0074] 一般式（７）における G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式（２）における G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 は前記一般式（５）における X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 とそれぞれ同義である。

[0075] 一般式（７）で表される化合物は、例えば、２-アミノベンゾトリフルオリドと安息香酸誘導体とを原料として製造される。安息香酸誘導体は、２-クロロ-３-ニトロ安息香酸を原料として、WO2010/18857号に

記載の方法で製造することができる。

[0076] 一般式(3)における Z^1 はC1-C6アルキル基、またはC1-C6ハロアルキル基を示す。好ましくはC1-C6ハロアルキル基であり、より好ましくはC1-C6パーフルオロアルキル基である。

X_a はヨウ素原子または臭素原子を示す。

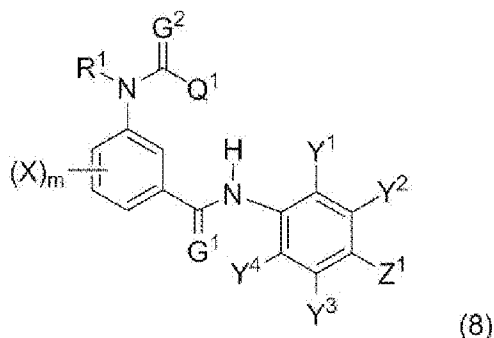
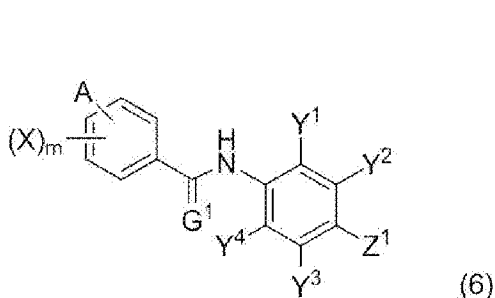
[0077] 一般式(4)における n_2 は1~4の整数を示し、1~3の整数であることが好ましい。

Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義であり、好ましい態様も同様である。

X、m、 G^1 、Y、およびAは前記一般式(1)におけるX、m、 G^1 、Y、およびAとそれぞれ同義であり、好ましい態様も同様である。

[0078] 前記一般式(4)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体は、下記一般式(6)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体であることが好ましく、下記一般式(8)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体であることがより好ましい。

[0079] [化20]



[0080] 一般式(6)における Z^1 は、前記一般式(3)における Z^1 と同義であり、好ましい態様も同様である。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、X、m、 G^1 、およびAは前記一般式(5)における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、X、m、 G^1 、およびAとそれぞれ同義であり、好ましい態様も同様である。

[0081] 一般式(8)における Z^1 は、前記一般式(3)における Z^1 と同義であり

、好ましい態様も同様である。Y¹、Y²、Y³、Y⁴、X、m、G¹、G²、Q¹、およびR¹は前記一般式(7)におけるY¹、Y²、Y³、Y⁴、X、m、G¹、G²、Q¹、およびR¹とそれぞれ同義であり、好ましい態様も同様である。

[0082] 一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体と、一般式(3)で表されるハロアルキル化合物との反応に用いられる金属としては、リチウム、ナトリウム、カルシウム、マグネシウム、亜鉛、アルミニウム、マンガン、タングステン、スズ、クロム、金、白金、銀、銅、鉄、ニッケル、コバルト、鉛、チタンおよびそれらの合金を例示することができる。中でも、銅、鉄、および亜鉛からなる群より選ばれる少なくとも1種であることが好ましい。

[0083] また上記反応に使用される金属塩としては、2価を示す鉄金属塩、具体的には硫酸アンモニウム鉄(II)、フッ化鉄(II)、塩化鉄(II)、臭化鉄(II)、ヨウ化鉄(II)、硫酸鉄(II)、シュウ酸鉄(II)、ヘキサシアノ鉄(II)酸カリウム、グルコン酸鉄(II)n水和物、硫酸トリス(1,10-フェナントロリン)鉄(II)、ヘキサシアノ鉄(II)酸アンモニウム鉄(III)、ステアリン酸鉄(II)、ヘキサシアノ鉄(II)酸アンモニウム、フマル酸鉄(II)、酢酸鉄(II)、ナフテン酸鉄(II)、テトラフルオロホウ酸鉄(II)、アミド硫酸鉄(II)、酸化鉄(II)チタン、硫酸鉄(II)エチレンジアンモニウム、および1価を示す銅金属、具体的には塩化銅(I)、シアン化銅(I)、臭化銅(I)、ヨウ化銅(I)、硫化銅(I)、酢酸銅(I)、銅(I)トリフルオロメタンチオール、チオシアン酸銅(I)、またはヨウ化サマリウム(II)等を挙げることができる。その中でも塩化鉄(II)、硫酸鉄(II)、硫酸鉄(II)水和物が好適である。

[0084] 上記金属および金属塩は、単独で使用してもよいが、2種以上混合して使用することができる。その使用量は特に限定されないが、通常は反応原料である一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体に対し、0.01倍モル当量～5倍モル当量の範囲、好ましくは、1倍モル当量～2倍モル当量の範囲

で適宜選択して使用すれば良い。

[0085] 上記反応に使用される塩基としては、トリエチルアミン、トリー n-ブチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属類、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウムなどの炭酸塩類、リン酸一水素二カリウム、リン酸三ナトリウムなどのリン酸塩類、水素化ナトリウムなどの水素化アルカリ金属塩類、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドなどのアルカリ金属アルコラート類などを挙げることができる。

その中でも、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属類が特に好適に使用できる。

これらの塩基は、一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体に対して0.01倍モル当量～10倍モル当量の範囲、好ましくは5倍モル当量～10倍モル当量の範囲で適宜選択して使用すればよい。

[0086] 上記反応は、無溶媒で行ってもよく、また不活性溶媒の存在下で行ってもよい。

不活性溶媒の存在下で行う場合の不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば特に制限されない。例えば、水；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等の鎖状または環状エーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類；アセトニトリル等のニトリル類；ジメチルスルホキシドなどの不活性溶媒を示すことができる。これらの溶媒は単独もしくは2種以上混合して使用することができる。

その中でも、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトア

ミド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、ジメチルスルホキシドが特に好適に使用できる。

[0087] これらの不活性溶媒の使用量は、一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体に対して2重量倍～20重量倍の範囲、好ましくは5重量倍～15重量倍の範囲で適宜選択して使用すればよい。

[0088] 上記反応における反応温度は、-20℃～200℃の範囲、不活性溶媒を使用する場合はその沸点以下とすればよい。また反応時間は、数分間から96時間の範囲でそれぞれ適宜選択すればよい。

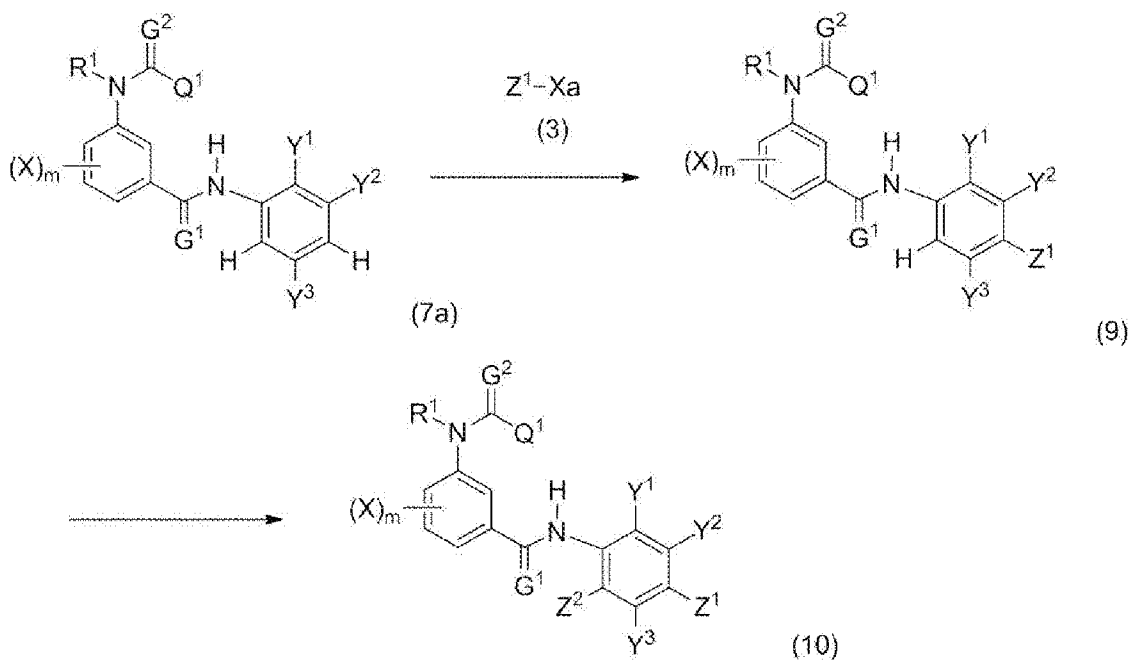
[0089] 上記反応における一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体に対する一般式(3)で表されるハロアルキル化合物の混合比に特に制限はない。経済性の観点から、1倍モル当量～3倍モル当量が好ましい。

[0090] 前記に示した製造方法において、目的物である一般式(4)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体は、反応終了後、反応系から常法に従って単離すれば良いが、必要に応じて、再結晶、カラムクロマトグラフィー、蒸留などの操作を行い精製することができる。

[0091] 本発明の一般式(10)で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法は、下記一般式(7a)で表される芳香族アミド誘導体と、下記一般式(3)で表されるハロアルキル化合物とを、塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させて下記一般式(9)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を得る第一の工程と、前記一般式(9)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下で、ハロゲン化する第二の工程とを含む。前記製造方法は必要に応じてその他の工程を更に含んでもよい。

[0092]

[化21]



[0093] 一般式 (7 a) における G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式 (2) における G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。X、m、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 は前記一般式 (5) における X、m、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 とそれぞれ同義である。

[0094] 一般式 (9) における Z^1 は一般式 (3) における Z^1 と同義である。X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 は前記一般式 (7 a) における X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 とそれぞれ同義である。

[0095] 前記第一の工程の詳細については、既述の一般式 (4) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法と同様である。

[0096] 前記第二の工程では、一般式 (9) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下にハロゲン化することで、一般式 (10) で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体が製造される。前記第二の工程は例えば、一般式 (9) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体とハロゲン化剤とを塩基性条件下、不活性溶媒中または無溶媒で行うことができる。

[0097] ハロゲン化剤としては、水素原子を塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子に変換可能であれば特に制限はない。具体的に例えば、塩素、臭素、ヨウ素、塩化スルフリル、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、一塩化ヨウ素、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジヨード-5, 5-ジメチルヒダントインなどを示すことができる。

[0098] 上記反応におけるハロゲン化剤の使用量は、一般式(9)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体に対して1.0倍モル当量～5倍モル当量が好ましく、1.01倍モル当量～1.5倍モル当量がより好ましい。

[0099] 上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば特に制限されない。例えば、水；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等の鎖状または環状エーテル類；酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、1, 3-ジメチルー2-イミダゾリジノン、N-メチルー2-ピロリドン等のアミド類；アセトニトリル等のニトリル類；ジメチルスルホキシドなどの不活性溶媒を示すことができる。これらの溶媒は単独もしくは2種以上混合して使用することができる。

その中でも、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、1, 3-ジメチルー2-イミダゾリジノン、N-メチルー2-ピロリドン等のアミド類；ジメチルスルホキシドが特に好適に使用できる。

[0100] これらの不活性溶媒の使用量は、一般式(9)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体に対して2重量倍～10重量倍の範囲、好ましくは3重量倍～8重量倍の範囲で適宜選択して使用すればよい。

[0101] また、上記反応に使用される塩基としては、トリエチルアミン、トリー n

ーブチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンなどの有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属類、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウムなどの炭酸塩類、リン酸一水素二カリウム、リン酸三ナトリウムなどのリン酸塩類、水素化ナトリウムなどの水素化アルカリ金属塩類、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドなどのアルカリ金属アルコラート類などを挙げることができる。

その中でも、水素化ナトリウムなどの水素化アルカリ金属塩類、水酸化ナトリウムなどの水酸化アルカリ金属類が特に好適に使用できる。

これらの塩基は、一般式(9)で表される芳香族アミド誘導体に対して0.01倍モル当量～5倍モル当量の範囲、好ましくは1倍モル当量～3倍モル当量の範囲で適宜選択して使用すればよい。

[0102] 反応温度は、例えば-20℃～200℃の範囲、不活性溶媒を使用する場合はその沸点以下とすればよい。また反応時間は、数分間から96時間の範囲でそれぞれ適宜選択すればよい。

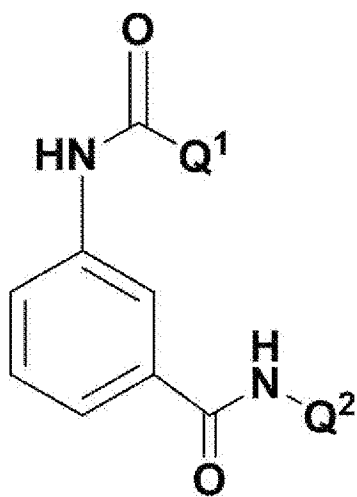
[0103] 前記に示した製造方法において、目的物は、反応終了後、反応系から常法に従って単離すれば良いが、必要に応じて、再結晶、カラムクロマトグラフィー、蒸留などの操作を行い精製することができる。

[0104] 以下、第1表から第3表に本発明の有効中間体である一般式(7)で表される化合物の代表的な化合物を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

なお、表中、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「H」は水素原子を、「F」はフッ素原子を、「Cl」は塩素原子を、「Br」は臭素原子を、「I」はヨウ素原子を、「CF₃」はトリフルオロメチル基をそれぞれ表すものである。

[0105]

[化22]



[0106]

[表1]

第1表(i)

化合物 番号	Q ₁	Q ₂
1	フェニル	2, 6-ジクロロフェニル
2	2-フルオロフェニル	2, 6-ジブロモフェニル
3	4-フルオロフェニル	2, 6-ジブロモフェニル
4	4-ニトロフェニル	2, 6-ジブロモフェニル
5	4-シアノフェニル	2, 6-ジブロモフェニル
6	2-クロロピリジン-3-イル	2, 6-ジブロモフェニル
7	フェニル	2, 6-ジメチルフェニル
8	2-フルオロフェニル	2, 6-ジメチルフェニル
9	4-フルオロフェニル	2, 6-ジメチルフェニル
10	4-ニトロフェニル	2, 6-ジメチルフェニル
11	4-シアノフェニル	2, 6-ジメチルフェニル
12	2-クロロピリジン-3-イル	2, 6-ジメチルフェニル
13	フェニル	2-ブロモ-6-メチルフェニル
14	フェニル	2-エチル-6-メチルフェニル
15	4-フルオロフェニル	2-エチル-6-メチルフェニル
16	フェニル	2-ヨード-6-メチルフェニル
17	フェニル	2-ヒドロキシ-6-メチルフェニル
18	フェニル	2-クロロ-6-エチルフェニル
19	フェニル	2-ブロモ-6-エチルフェニル
20	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-エチルフェニル
21	フェニル	2-エチル-6-ヨードフェニル
22	4-フルオロフェニル	2-エチル-6-ヨードフェニル
23	4-ニトロフェニル	2-エチル-6-ヨードフェニル
24	4-シアノフェニル	2-エチル-6-ヨードフェニル
25	4-ニトロフェニル	2-メチル-6-n-プロピルフェニル
26	フェニル	2-イソプロピル-6-メチルフェニル
27	4-フルオロフェニル	2-イソプロピル-6-メチルフェニル
28	フェニル	2-ブロモ-6-n-プロピルフェニル
29	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-n-プロピルフェニル
30	4-ニトロフェニル	2-ブロモ-6-n-プロピルフェニル
31	4-シアノフェニル	2-ブロモ-6-n-プロピルフェニル
32	フェニル	2-ヨード-6-n-プロピルフェニル
33	4-フルオロフェニル	2-ヨード-6-n-プロピルフェニル
34	4-ニトロフェニル	2-ヨード-6-n-プロピルフェニル
35	4-シアノフェニル	2-ヨード-6-n-プロピルフェニル
36	4-トリフルオロメチルフェニル	2-ヨード-6-n-プロピルフェニル
37	フェニル	2-クロロ-6-n-ブチルフェニル
38	4-フルオロフェニル	2-クロロ-6-n-ブチルフェニル
39	フェニル	2-ブロモ-6-n-ブチルフェニル
40	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-n-ブチルフェニル

[0107]

[表2]

第1表(2)

化合物 番号	Q ₁	Q ₂
41	フェニル	2-ヨード-6-n-ブチルフェニル
42	4-フルオロフェニル	2-ヨード-6-n-ブチルフェニル
43	フェニル	2-(2-ブチル)-6-クロロフェニル
44	フェニル	2-ブロモ-6-(2-ブチル)フェニル
45	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-(2-ブチル)フェニル
46	フェニル	2-(2-ブチル)-6-ヨードフェニル
47	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-シアノフェニル
48	フェニル	2-ブロモ-6-メチルチオフェニル
49	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-メチルチオフェニル
50	フェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルフィニル)フェニル
51	4-フルオロフェニル	2-クロロ-6-(メチルスルホニル)フェニル
52	2-クロロピリジン-3-イル	2-クロロ-6-(メチルスルホニル)フェニル
53	フェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
54	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
55	4-フルオロフェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
56	4-ニトロフェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
57	4-シアノフェニル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
58	2-クロロピリジン-3-イル	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
59	フェニル	2-メチルチオメチル-6-トリフルオロメチルフェニル
60	フェニル	2-ブロモ-6-(トリフルオロメチルチオ)フェニル
61	フェニル	2-トリフルオロメチルフェニル
62	2-フルオロフェニル	2-トリフルオロメチルフェニル
63	4-フルオロフェニル	2-トリフルオロメチルフェニル
64	4-ニトロフェニル	2-トリフルオロメチルフェニル
65	4-シアノフェニル	2-トリフルオロメチルフェニル
66	2-クロロピリジン-3-イル	2-トリフルオロメチルフェニル
67	フェニル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
68	2-フルオロフェニル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
69	4-フルオロフェニル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
70	4-ニトロフェニル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
71	4-シアノフェニル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
72	2-クロロピリジン-3-イル	2-ペンタフルオロエチルフェニル
73	フェニル	2-メチルフェニル
74	2-フルオロフェニル	2-メチルフェニル
75	4-フルオロフェニル	2-メチルフェニル
76	4-ニトロフェニル	2-メチルフェニル
77	4-シアノフェニル	2-メチルフェニル
78	2-クロロピリジン-3-イル	2-メチルフェニル
79	フェニル	2-フルオロフェニル
80	2-フルオロフェニル	2-フルオロフェニル

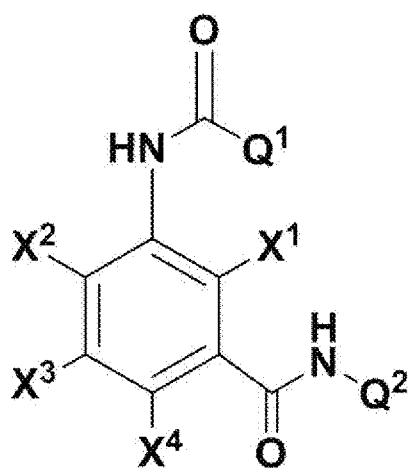
[表3]

第1表(3)

化合物 番号	Q ₁	Q ₂
81	4-フルオロフェニル	2-フルオロフェニル
82	4-ニトロフェニル	2-フルオロフェニル
83	4-シアノフェニル	2-フルオロフェニル
84	2-クロロピリジン-3-イル	2-フルオロフェニル
85	フェニル	2-クロロフェニル
86	2-フルオロフェニル	2-クロロフェニル
87	4-フルオロフェニル	2-クロロフェニル
88	4-ニトロフェニル	2-クロロフェニル
89	4-シアノフェニル	2-クロロフェニル
90	2-クロロピリジン-3-イル	2-クロロフェニル
91	フェニル	2-ブロモフェニル
92	2-フルオロフェニル	2-ブロモフェニル
93	4-フルオロフェニル	2-ブロモフェニル
94	4-ニトロフェニル	2-ブロモフェニル
95	4-シアノフェニル	2-ブロモフェニル
96	2-クロロピリジン-3-イル	2-ブロモフェニル
97	フェニル	2-ヨードフェニル
98	2-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル
99	4-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル
100	4-ニトロフェニル	2-ヨードフェニル
101	4-シアノフェニル	2-ヨードフェニル
102	2-クロロピリジン-3-イル	2-ヨードフェニル
103	フェニル	2-ヨードフェニル
104	2-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル
105	4-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル
106	4-ニトロフェニル	2-ヨードフェニル
107	4-シアノフェニル	2-ヨードフェニル
108	2-クロロピリジン-3-イル	2-ヨードフェニル
109	フェニル	2-トリフルオロメチルチオフェニル
110	2-フルオロフェニル	2-トリフルオロメチルチオフェニル
111	4-フルオロフェニル	2-トリフルオロメチルチオフェニル
112	4-ニトロフェニル	2-トリフルオロメチルチオフェニル
113	4-シアノフェニル	2-トリフルオロメチルチオフェニル
114	2-クロロピリジン-3-イル	2-トリフルオロメチルチオフェニル

[0109]

[化23]



[0110]

[表4]

第2表(I)

化合物 番号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
115	フェニル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
116	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
117	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
118	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
119	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
120	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
121	フェニル	H	Cl	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
122	フェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
123	4-ニトロフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
124	4-シアノフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
125	2-フルオロフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
126	4-フルオロフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
127	4-トリフルオロメチルフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
128	2, 4-ジフルオロフェニル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
129	2-クロロピリジン-3-イル	H	F	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
130	フェニル	H	H	CF ₃	H	2, 6-ジメチルフェニル
131	フェニル	H	H	H	F	2, 6-ジメチルフェニル
132	フェニル	H	H	H	Cl	2, 6-ジメチルフェニル
133	フェニル	H	H	H	Br	2, 6-ジメチルフェニル
134	フェニル	H	H	H	I	2, 6-ジメチルフェニル
135	フェニル	F	H	H	F	2, 6-ジメチルフェニル
136	フェニル	H	Br	H	Br	2, 6-ジメチルフェニル
137	フェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
138	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
139	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
140	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
141	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
142	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
143	フェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
144	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
145	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
146	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
147	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
148	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
149	フェニル	F	H	H	H	2-メチルフェニル
150	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-メチルフェニル
151	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-メチルフェニル
152	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-メチルフェニル

[0111]

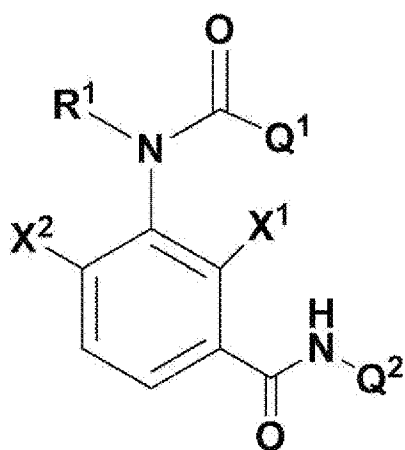
[表5]

第2表(2)

化合物 番号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
153	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-メチルフェニル
154	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-メチルフェニル
155	フェニル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
156	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
157	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
158	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
159	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
160	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-フルオロフェニル
161	フェニル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
162	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
163	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
164	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
165	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
166	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-クロロフェニル
167	フェニル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
168	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
169	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
170	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
171	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
172	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ブロモフェニル
173	フェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
174	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
175	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
176	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
177	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
178	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
179	フェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
180	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
181	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
182	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
183	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
184	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ヨードフェニル
185	フェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
186	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
187	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
188	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
189	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
190	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル

[0112]

[化24]



[0113]

[表6]

第3表(1)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
191	フェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
192	2-メチルフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
193	4-メチルフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
194	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
195	3-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
196	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
197	2-クロロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
198	4-クロロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
199	2-ブロモフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
200	2-ヨードフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
201	3-シアノフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
202	4-シアノフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
203	2-ニトロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
204	3-ニトロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
205	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
206	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
207	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
208	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
209	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
210	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
211	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
212	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
213	2, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
214	2, 6-ジクロロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
215	3, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
216	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
217	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
218	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
219	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
220	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
221	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
222	3-(アセチルアミノ)フェニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
223	ピリジン-2-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
224	ピリジン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
225	2-フルオロピリジン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
226	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
227	2-クロロピリジン-5-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
228	2-トリフルオロメチルピリジン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル

[0114]

[表7]

第3表(2)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
229	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
230	ピラジン-2-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
231	フラン-2-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
232	フラン-3-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
233	2-テトラヒドロフラニル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
234	ベンゾフラン-2-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
235	チオフェン-2-イル	Me	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
236	フェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
237	2-メチルフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
238	4-メチルフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
239	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
240	3-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
241	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
242	2-クロロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
243	4-クロロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
244	2-ブロモフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
245	2-ヨードフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
246	3-シアノフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
247	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
248	2-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
249	3-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
250	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
251	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル

[0115]

[表8]

第3表(3)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
252	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
253	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
254	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
255	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
256	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
257	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
258	2, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
259	2, 6-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
260	3, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
261	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
262	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
263	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
264	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
265	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
266	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
267	ピリジン-2-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
268	ピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
269	2-フルオロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
270	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
271	2-クロロピリジン-5-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
272	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
273	ピラジン-2-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
274	フラン-2-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル
275	チオフェン-2-イル	Me	H	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル)フェニル

[表9]

第3表(4)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
276	フェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
277	2-メチルフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
278	4-メチルフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
279	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
280	3-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
281	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
282	2-クロロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
283	4-クロロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
284	2-ブロモフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
285	2-ヨードフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
286	3-シアノフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
287	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
288	2-ニトロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
289	3-ニトロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
290	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
291	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
292	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
293	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
294	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
295	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
296	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
297	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
298	2, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
299	2, 6-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
300	3, 4-ジクロロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
301	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
302	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
303	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
304	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
305	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
306	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
307	ビリジン-2-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
308	ビリジン-3-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
309	2-フルオロビリジン-3-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル

[0117]

[表10]

第3表(5)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
310	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
311	2-クロロピリジン-5-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
312	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
313	ピラジン-2-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
314	フラン-2-イル	Me	H	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
315	2-フルオロフェニル	Et	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
316	ピリジン-3-イル	Et	H	H	2, 6-ジメチルフェニル
317	フェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
318	2-メチルフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
319	3-メチルフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
320	4-メチルフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
321	2-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
322	3-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
323	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
324	2-シアノフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
325	3-シアノフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
326	4-シアノフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
327	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
328	3-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
329	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
330	2-クロロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
331	4-クロロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
332	2-ブロモフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
333	2-ヨードフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
334	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
335	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
336	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
337	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
338	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
339	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
340	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
341	2, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
342	2, 6-ジクロロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
343	3, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
344	2-フルオロ-4-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
345	4-フルオロ-2-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
346	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
347	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
348	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
349	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル

[表11]

第3表(6)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
350	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
351	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
352	ピリジン-2-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
353	ピリジン-3-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
354	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
355	2-フルオロピリジン-3-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
356	2-クロロピリジン-5-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
357	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
358	ピラジン-2-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
359	フラン-2-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
360	フラン-3-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
361	2-テトラヒドロフラン	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
362	ベンゾフラン-2-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
363	チオフェン-2-イル	Me	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
364	フェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
365	2-メチルフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
366	4-メチルフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
367	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
368	3-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
369	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
370	2-クロロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
371	4-クロロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
372	2-ブロモフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
373	2-ヨードフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
374	3-シアノフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
375	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
376	2-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
377	3-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
378	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル

[表12]

第3表(7)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
379	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
380	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
381	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
382	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
383	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
384	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
385	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
386	2, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
387	2, 6-ジクロロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
388	3, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
389	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
390	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
391	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
392	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
393	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
394	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
395	ピリジン-2-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
396	ピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
397	2-フルオロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
398	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
399	2-クロロピリジン-5-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
400	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
401	ピラジン-2-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
402	フラン-2-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
403	チオフェン-2-イル	Me	F	H	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル

[0120] [表13]

第3表(8)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
404	フェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
405	2-メチルフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
406	4-メチルフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
407	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
408	3-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
409	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
410	2-クロロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
411	4-クロロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
412	2-ブロモフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
413	2-ヨードフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
414	3-シアノフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
415	4-シアノフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
416	2-ニトロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
417	3-ニトロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
418	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
419	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
420	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
421	4-トリフルオロメトキシフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
422	2, 3-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
423	2, 4-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
424	2, 5-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
425	2, 6-ジフルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
426	2, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
427	2, 6-ジクロロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
428	3, 4-ジクロロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
429	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
430	2-クロロ-4-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
431	2-クロロ-6-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
432	4-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
433	4-クロロ-2-ニトロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
434	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
435	ビリジン-2-イル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
436	ビリジン-3-イル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
437	2-フルオロビリジン-3-イル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
438	2-クロロビリジン-3-イル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル
439	2-クロロビリジン-5-イル	Me	F	H	2- <i>n</i> -プロピル-6-ヨードフェニル

[0121]

[表14]

第3表(9)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
440	2-メチルチオピリジン-3-イル	Me	F	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
441	ピラジン-2-イル	Me	F	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
442	フラン-2-イル	Me	F	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
443	チオフェン-2-イル	Me	F	H	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
444	フェニル	Et	F	H	2, 6-ジメチルフェニル
445	フェニル	Me	H	F	2, 6-ジメチルフェニル
446	4-ニトロフェニル	Me	H	F	2, 6-ジメチルフェニル
447	4-シアノフェニル	Me	H	F	2, 6-ジメチルフェニル
448	フェニル	Me	H	F	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
449	4-ニトロフェニル	Me	H	F	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
450	4-シアノフェニル	Me	H	F	2-ブロモ-6-(メチルスルホニル) フェニル
451	フェニル	Me	H	F	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
452	4-ニトロフェニル	Me	H	F	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
453	4-シアノフェニル	Me	H	F	2-n-プロピル-6-ヨードフェニル
454	フェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
455	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
456	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
457	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
458	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
459	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
460	フェニル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
461	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
462	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
463	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
464	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
465	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
466	フェニル	Me	H	H	2-メチルフェニル
467	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-メチルフェニル
468	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-メチルフェニル
469	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-メチルフェニル
470	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-メチルフェニル
471	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-メチルフェニル
472	フェニル	Me	H	H	2-フルオロフェニル
473	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-フルオロフェニル
474	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-フルオロフェニル
475	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-フルオロフェニル
476	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-フルオロフェニル

[0122]

[表15]

第3表(10)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
477	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-フルオロフェニル
478	フェニル	Me	H	H	2-クロロフェニル
479	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-クロロフェニル
480	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-クロロフェニル
481	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-クロロフェニル
482	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-クロロフェニル
483	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-クロロフェニル
484	フェニル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
485	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
486	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
487	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
488	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
489	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモフェニル
490	フェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
491	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
492	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
493	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
494	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
495	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
496	フェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
497	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
498	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
499	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
500	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
501	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ヨードフェニル
502	フェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
503	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
504	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
505	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
506	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
507	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
508	フェニル	Et	H	H	2-トリフルオロメチルフェニル
509	フェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル
510	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル
511	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル

[0123]

[表16]

第3表(11)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
512	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル
513	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル
514	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルフェニル
515	フェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
516	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
517	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
518	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
519	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
520	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチルフェニル
521	フェニル	Me	F	H	2-メチルフェニル
522	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-メチルフェニル
523	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-メチルフェニル
524	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-メチルフェニル
525	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-メチルフェニル
526	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-メチルフェニル
527	フェニル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
528	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
529	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
530	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
531	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
532	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-フルオロフェニル
533	フェニル	Me	F	H	2-クロロフェニル
534	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-クロロフェニル
535	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-クロロフェニル
536	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-クロロフェニル
537	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-クロロフェニル
538	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-クロロフェニル
539	フェニル	Me	F	H	2-ブロモフェニル

[0124]

[表17]

第3表(12)

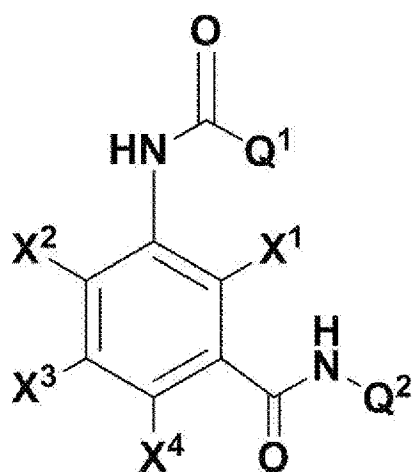
化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
540	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモフェニル
541	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモフェニル
542	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモフェニル
543	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ブロモフェニル
544	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモフェニル
545	フェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
546	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
547	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
548	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
549	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
550	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
551	フェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
552	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
553	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
554	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
555	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
556	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ヨードフェニル
557	フェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
558	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
559	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル
560	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオフェニル

[0125] 以下、第4表から第5表に本発明の有効中間体である一般式(9)で表される化合物の代表的な化合物を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

なお、表中、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「H」は水素原子を、「F」はフッ素原子を、「Cl」は塩素原子を、「Br」は臭素原子を、「I」はヨウ素原子を、「CF₃」はトリフルオロメチル基をそれぞれ表すものである。

[0126]

[化25]



[0127]

[表18]

第4表(1)

化合物 番号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
561	フェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
562	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
563	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
564	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
565	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
566	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
567	フェニル	H	H	CF ₃	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
568	フェニル	H	H	H	F	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
569	フェニル	H	H	H	Cl	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
570	フェニル	H	H	H	Br	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
571	フェニル	H	H	H	I	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
572	フェニル	F	H	H	F	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
573	フェニル	H	Br	H	Br	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
574	フェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
575	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
576	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
577	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
578	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
579	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
580	フェニル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル

[0128]

[表19]

第4表(2)

化合物 番号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
581	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
582	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
583	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
584	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
585	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
586	フェニル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
587	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
588	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
589	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
590	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
591	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
592	フェニル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
593	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
594	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
595	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
596	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
597	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
598	フェニル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
599	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル

[0129]

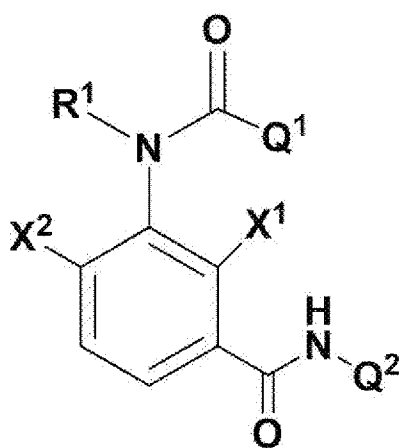
[表20]

第4表(3)

化合物 番号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
600	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
601	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
602	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
603	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
604	フェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
605	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
606	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
607	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
608	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
609	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
610	フェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
611	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
612	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
613	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
614	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
615	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
616	フェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
617	2-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
618	4-フルオロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
619	4-ニトロフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
620	4-シアノフェニル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
621	2-クロロピリジン-3-イル	F	H	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル

[0130]

[化26]



[0131]

[表21]

第5表(I)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
622	フェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
623	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
624	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
625	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
626	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
627	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
628	フェニル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
629	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
630	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
631	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
632	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
633	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ベンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
634	フェニル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
635	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
636	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
637	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
638	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
639	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
640	フェニル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
641	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
642	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
643	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
644	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル

[表22]

第5表(2)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
645	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
646	フェニル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
647	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
648	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
649	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
650	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
651	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
652	フェニル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
653	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
654	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
655	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
656	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
657	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
658	フェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
659	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
660	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
661	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
662	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
663	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
664	フェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル

[0133]

[表23]

第5表(3)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
665	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
666	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
667	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
668	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
669	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
670	フェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
671	2-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
672	4-フルオロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
673	4-ニトロフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
674	4-シアノフェニル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
675	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
676	フェニル	Et	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
677	フェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
678	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
679	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
680	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
681	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
682	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
683	フェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
684	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
685	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
686	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル

[表24]

第5表(4)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
687	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプ タフルオロイソプロピル)フェニル
688	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ペンタフルオロエチル-4-(ヘプ タフルオロイソプロピル)フェニル
689	フェニル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
690	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
691	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
692	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
693	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
694	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-メチル-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
695	フェニル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
696	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
697	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
698	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
699	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
700	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-フルオロ-4-(ヘプタフルオロイ ソプロピル)フェニル
701	フェニル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
702	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
703	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
704	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
705	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
706	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-クロロ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
707	フェニル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル
708	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソ プロピル)フェニル

[0135]

[表25]

第5表(5)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
709	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
710	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
711	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
712	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
713	フェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
714	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
715	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
716	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
717	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
718	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
719	フェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
720	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
721	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
722	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
723	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
724	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-ヨード-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
725	フェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
726	2-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
727	4-フルオロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
728	4-ニトロフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
729	4-シアノフェニル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
730	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル
731	フェニル	Et	H	H	2-トリフルオロメチル-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル

[0136] [表26]

第5表(6)

化合物 番号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
732	フェニル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
733	2-フルオロフェニル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
734	4-フルオロフェニル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
735	4-ニトロフェニル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
736	4-シアノフェニル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
737	2-クロロピリジン-3-イル	Me	Me O	H	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
738	フェニル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
739	2-フルオロフェニル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
740	4-フルオロフェニル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
741	4-ニトロフェニル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
742	4-シアノフェニル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
743	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
744	フェニル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
745	2-フルオロフェニル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
746	4-フルオロフェニル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
747	4-ニトロフェニル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
748	4-シアノフェニル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル

[0137]

[表27]

第5表(7)

化合物 番号	Q 1	R 1	X 1	X 2	Q 2
749	2-クロロピリジン-3-イル	Me	F	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
750	フェニル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
751	2-フルオロフェニル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
752	4-フルオロフェニル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
753	4-ニトロフェニル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
754	4-シアノフェニル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
755	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	シアノ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
756	フェニル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
757	2-フルオロフェニル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
758	4-フルオロフェニル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
759	4-ニトロフェニル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
760	4-シアノフェニル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル
761	2-クロロピリジン-3-イル	Me	H	ニトロ	2-トリフルオロメチルチオ-4-(ヘ プタフルオロイソプロピル)フェニル

[0138] 本発明のアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法により得られる一般式
(4) で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体は、有害生物防除作用に卓
効を示すアミド誘導体の製造方法において極めて有用な製造中間体である。

実施例

[0139] 以下、本発明を実施例を参照しつつより詳細に説明するが、本発明はこれ
らに限定されるものではない。

尚、 $^1\text{H-NMR}$ の化学シフト値は、特に記載がない限り、テトラメチルシ
ランを基準として低磁場側に ppm 単位で示される。また「s」は一重項を
意味し、「d」は二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「m」は多重
項を意味し、「b r s」は幅の広い一重項を意味する。また、特記しない限

り「%」は質量基準である。

[0140] <合成例 1>

[2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミドの製造]

2-(トリフルオロメチル)アニリン 26.8 g (166.3 mmol)、トリエチルアミン 37.0 g (365.9 mmol) および 2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)ベンゾイルクロライド 100.9 g (365.9 mmol) をテトラヒドロフラン (400 mL) に加えて 50℃ にて 3 時間攪拌した。反応溶液をフィルター濾過した後、濾液に水酸化ナトリウム 14.6 g (365.9 mmol) の水溶液 (125 mL) を加え、50℃ にて 30 分攪拌した。減圧下、溶媒を留去した後、酢酸エチルで抽出して、炭酸カリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した。得られた固体を n-ヘキサンおよびイソプロピルエーテルで洗浄し、乾燥することにより表題化合物 63.2 g (収率 91%) を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 、70℃、 δ ppm) 9.81 (1H, s), 7.80–7.69 (2H, m), 7.62–7.49 (4H, m), 7.33–7.21 (6H, m), 3.33 (3H, s)。

[0141] <実施例 1>

[2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-(トリフルオロメチル)-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル)ベンズアミドの製造]

粉状の水酸化ナトリウム 0.8 g (20 mmol) と硫酸鉄 (II)・七水和物 0.93 g (3.3 mmol) を氷浴下、黒く変色するまで攪拌する。変色後直ちに、N,N-ジメチルホルムアミド 5 g を加え、2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド 1 g (2.4 mmol) およびヨウ化ヘプタフルオロ

イソプロピル 1 g (3.4 mmol) の N, N-ジメチルホルムアミド 5 g 溶液を加え、室温にて 3 時間攪拌した。得られた反応液をセライトろ過し、酢酸エチル 50 mL で洗浄した後、得られた反応液に水 40 g を加え、抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物 0.89 g (収率 63%) を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 8.86 (1H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 8.68 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.01 (1H, s), 7.88–7.84 (2H, m), 7.36–7.29 (7H, m), 3.48 (3H, s).

[0142] <実施例 2>

[2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミドの製造]

水素化ナトリウム (60%品) 68.5 mg (1.71 mmol) に N, N-ジメチルホルムアミド 4 g、および上記で得られた 2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-(トリフルオロメチル)-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル)ベンズアミド 1 g (1.72 mmol) を加え、氷浴下、10 分間攪拌した。反応溶液に N-ブロモスクシンイミド 0.31 g (1.80 mmol) を加え、室温にて 2 時間攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物 0.93 g (収率 82%) を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , ppm) δ 8.13 (1H, s), 7.97–8.06 (2H, m), 7.90 (1H, s), 7.43–7.45 (1H, m), 6.99–7.33 (6H, m), 3.50 (3H, s).

[0143] <実施例 2-1>

[2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-ブロモ-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミドの製造]

水酸化ナトリウム 140 mg (3.42 mmol) に N, N-ジメチルホルムアミド 5 g、および上記で得られた 2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-(トリフルオロメチル)-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル)ベンズアミド 1 g (1.72 mmol) を加え、室温下、10 分間攪拌した。反応溶液に N-ブロモスクシンイミド 0.34 g (1.90 mmol) を加え、室温にて 2 時間攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出した後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物 0.64 g (収率 56%) を白色固体として得た。

[0144] <実施例 3>

[3-ニトロ-N-(2-(トリフルオロメチル)-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル)ベンズアミドの製造]

粉状の水酸化ナトリウム 1.1 g (27 mmol) と硫酸鉄(II)・七水和物 1.2 g (4.5 mmol) を氷浴下、黒く変色するまで攪拌する。変色後直ちに、N, N-ジメチルホルムアミド 5 g を加え、3-ニトロ-N-(2-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド 1.0 g (3.2 mmol) およびヨウ化ヘプタフルオロイソプロピル 1.3 g (4.5 mmol) の N, N-ジメチルホルムアミド 5 g 溶液を加え、室温にて 3 時間攪拌した。得られた反応液をセライトろ過し、酢酸エチル 50 mL で洗浄した後、得られた反応液に水 40 g を加え、抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物 0.44 g (収率 28%) を赤色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, δ ppm) 10.82 (1H*4/5, brs), 10.71 (1H*1/5, brs), 8.77 (1H*4/5, t, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.73 (1H*1/5, t, $J=2.0\text{ Hz}$), 8.50–8.46 (1H, m), 8.37–8.34 (1H, m), 8.21–8.20 (1*1/5H, m), 8.14–8.12 (1*4/5H, m), 7.96–7.94 (2H, m), 7.90–7.85 (1H, m)

[0145] <実施例4>

[3-シアノー-N-(2-(トリフルオロメチル)-4-(ヘプタフルオロイソプロピル)フェニル)ベンズアミドの製造]

粉状の水酸化ナトリウム1.1g (29mmol)と硫酸鉄(II)・七水和物1.3g (4.8mmol)を氷浴下、黒く変色するまで攪拌する。変色後直ちに、N,N-ジメチルホルムアミド5gを加え、3-シアノー-N-(2-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド1.0g (3.5mmol)およびヨウ化ヘプタフルオロイソプロピル1.4g (4.8mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド5g溶液を加え、室温にて3時間攪拌した。得られた反応液をセライトろ過し、酢酸エチル50mLで洗浄した後、得られた反応液に水40gを加え、抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物0.93g (収率59%)を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, δ ppm) 10.64 (1H*4/5, brs), 10.51 (1H*1/5, brs), 8.36 (1H*4/5, s), 8.30 (1H*1/5, s), 8.23–8.20 (1H, m), 8.13–8.04 (2H, m), 7.94–7.89 (2H, m), 7.79–7.78 (1H, m).

[0146] <実施例5>

[2-フルオロ-3-(N-メチルベンズアミド)-N-(2-メチル-4

ー（ヘプタフルオロイソプロピル）フェニル）ベンズアミドの製造]

粉状の水酸化ナトリウム0.55g（14mmol）と硫酸鉄（II）・七水和物0.64g（2.3mmol）を氷浴下、黒く変色するまで攪拌する。変色後直ちに、N，N-ジメチルホルムアミド3gを加え、2-フルオロ-3-（N-メチルベンズアミド）-N-（2-メチルフェニル）ベンズアミド0.60g（1.7mmol）およびヨウ化ヘプタフルオロイソプロピル0.68g（2.3mmol）のN，N-ジメチルホルムアミド3g溶液を加え、室温にて3時間攪拌した。得られた反応液をセライトろ過し、酢酸エチル50mLで洗浄した後、得られた反応液に水40gを加え、抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物0.26g（収率30%）を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 8.35 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.03–8.01 (1H, m), 7.49 (1H, d, $J=9.2\text{ Hz}$), 7.43–7.37 (4H, m), 7.26–7.22 (5H, m), 3.49 (3H, s), 2.34 (3H, s).

[0147] <実施例6>

[2-フルオロ-3-（N-メチルベンズアミド）-N-（2-ブロモ-4-（ヘプタフルオロイソプロピル）フェニル）ベンズアミドの製造]

粉状の水酸化ナトリウム0.47g（12mmol）と硫酸鉄（II）・七水和物0.54g（1.9mmol）を氷浴下、黒く変色するまで攪拌する。変色後直ちに、N，N-ジメチルホルムアミド3gを加え、2-フルオロ-3-（N-メチルベンズアミド）-N-（2-ブロモフェニル）ベンズアミド0.60g（1.4mmol）およびヨウ化ヘプタフルオロイソプロピル0.57g（1.9mmol）のN，N-ジメチルホルムアミド3g溶液を加え、室温にて3時間攪拌した。得られた反応液をセライトろ過し、酢酸エチル50mLで洗浄した後、得られた反応液に水40gを加え、抽出

後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。硫酸マグネシウムを濾別し、減圧下溶媒を留去した後、濃縮残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することにより、表題化合物 0.092 g (収率 11%) を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 8.97 (1H, brs), 8.70 (1H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 8.01 (1H, t, $J=6.9\text{ Hz}$), 7.84 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 7.60–7.59 (1H, m), 7.40–7.36 (3H, m), 7.29–7.22 (4H, m), 3.50 (3H, s).

[0148] 以上から、本発明のアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法により、短工程で目的とするアルキル化芳香族アミド誘導体を得ることができた。

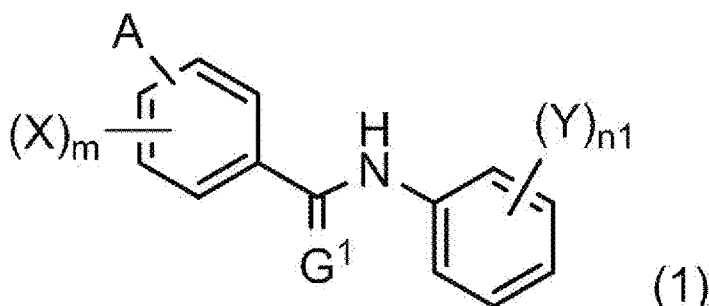
[0149] 日本出願第 2012-085053 の開示はその全体が参照により本明細書に取り込まれる。

本明細書に記載された全ての文献、特許出願、および技術規格は、個々の文献、特許出願、および技術規格が参照により取り込まれることが具体的かつ個々に記された場合と同程度に、本明細書に参照により取り込まれる。

請求の範囲

[請求項1] 下記一般式（１）

[化1]



（一般式（１）中、Xはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C１－C４アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。

mは１～４の整数を示し、n１は１～５の整数を示す。

G¹は酸素原子、または硫黄原子を示す。

Yはそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C１－C６アルキル基、C１－C６ハロアルキル基、C２－C４アルケニル基、C２－C４ハロアルケニル基、C２－C４アルキニル基、C２－C４ハロアルキニル基、C３－C６シクロアルキル基、C３－C６ハロシクロアルキル基、C１－C４アルコキシ基、C１－C４ハロアルコキシ基、C１－C４アルキルチオ基、C１－C４ハロアルキルチオ基、C１－C４アルキルスルフィニル基、C１－C４ハロアルキルスルフィニル基、C１－C４アルキルスルホニル基、C１－C４ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C１－C４アルキルアミノ基、ジC１－C４アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C１－C４アルキルカルボニル基、C１－C４ハロアルキルカルボニル基、C１－C４アルキルカルボニルオキシ基、C１－C４アルコキシカルボニル基、またはアセチルアミノ基を示す。

Aは水素原子、C１－C６アルキル基、C１－C６ハロアルキル基

、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、C₁－C₄アルキルアミノカルボニル基、メチルスルフィニルC₁－C₄アルキルアミノカルボニル基、メチルスルホニルC₁－C₄アルキルアミノカルボニル基、アセチルアミノ基、

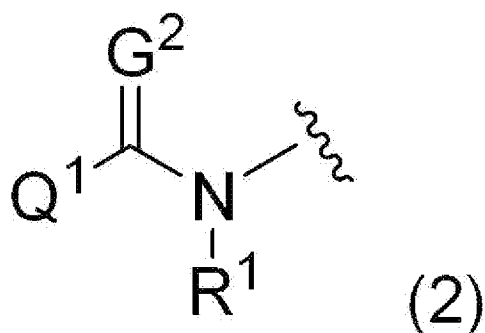
無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C₁－C₆アルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェ

ニル基、

無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、C 2－C 4 アルケニル基、C 2－C 4 ハロアルケニル基、C 2－C 4 アルキニル基、C 2－C 4 ハロアルキニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、C 3－C 6 ハロシクロアルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 ハロアルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 1－C 4 ハロアルキルチオ基、C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4 アルキルスルホニル基、C 1－C 4 ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4 アルキルアミノ基、ジC 1－C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4 アルキルカルボニル基、C 1－C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっている置換基を有する複素環基、または

下記一般式 (2)

[化2]



(一般式 (2) 中、G²は酸素原子、または硫黄原子を示す。

R¹は水素原子、C 1－C 6 アルキル基、またはC 1－C 6 ハロアルキル基を示す。

Q¹はC 1－C 6 のアルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、

無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6アルキル基、C 1－C 6ハロアルキル基、C 2－C 4アルケニル基、C 2－C 4ハロアルケニル基、C 2－C 4アルキニル基、C 2－C 4ハロアルキニル基、C 3－C 6シクロアルキル基、C 3－C 6ハロシクロアルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 4ハロアルキルチオ基、C 1－C 4アルキルスルフィニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4アルキルスルホニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4アルキルアミノ基、ジC 1－C 4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4アルキルカルボニル基、C 1－C 4ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または

無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C 1－C 6アルキル基、C 1－C 6ハロアルキル基、C 2－C 4アルケニル基、C 2－C 4ハロアルケニル基、C 2－C 4アルキニル基、C 2－C 4ハロアルキニル基、C 3－C 6シクロアルキル基、C 3－C 6ハロシクロアルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 4ハロアルキルチオ基、C 1－C 4アルキルスルフィニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルフィニル基、C 1－C 4アルキルスルホニル基、C 1－C 4ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C 1－C 4アルキルアミノ基、ジC 1－C 4アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1－C 4アルキルカルボニル基、C 1－C 4ハロアルキルカルボニル基、C 1－C 4アルキルカルボニルオキシ基、C 1－C 4アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択

される 1 以上の同一または異なっている置換基を有する複素環基を示す。) で表される基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジル基、ピラジル基、フリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表される芳香族アミド誘導体と、下記一般式 (3)

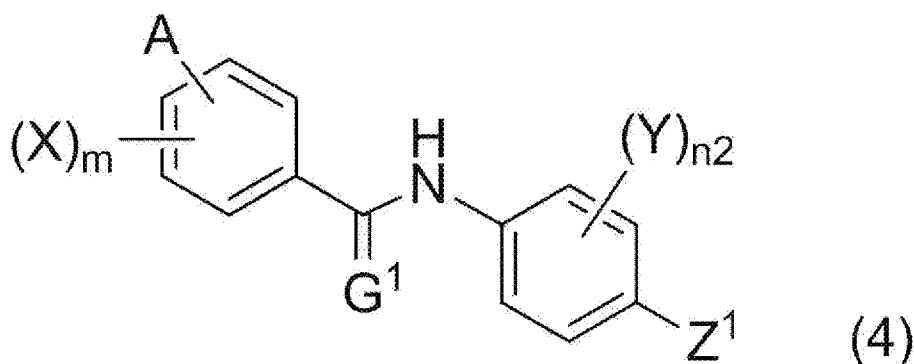
[化3]



(一般式 (3) 中、 Z^1 は C 1 - C 6 アルキル基、または C 1 - C 6 ハロアルキル基を示す。 Xa はヨウ素原子または臭素原子を示す。) で表されるハロアルキル化合物とを、

塩基、および金属または金属塩の存在下で反応させる工程を含む、下記一般式 (4)

[化4]



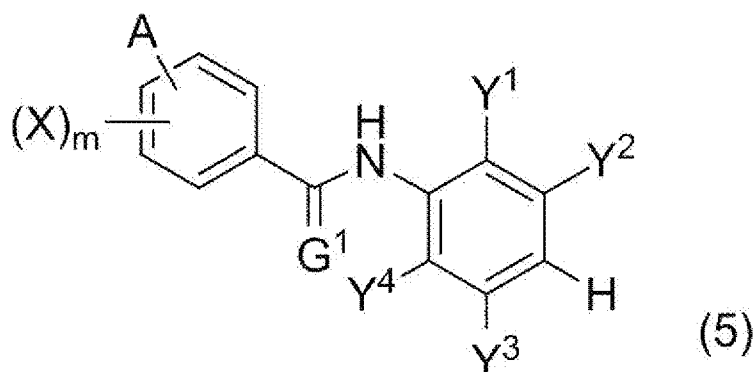
(一般式 (4) 中、 $n2$ は 1 ~ 4 の整数を示す。 Z^1 は前記一般式 (3) における Z^1 と同義であり、 X 、 m 、 G^1 、 Y 、および A は前記一般式 (1) における X 、 m 、 G^1 、 Y 、および A とそれぞれ同義で

ある。)

で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体の製造方法。

[請求項2] 前記一般式(1)で表される芳香族アミド誘導体下記一般式(5)

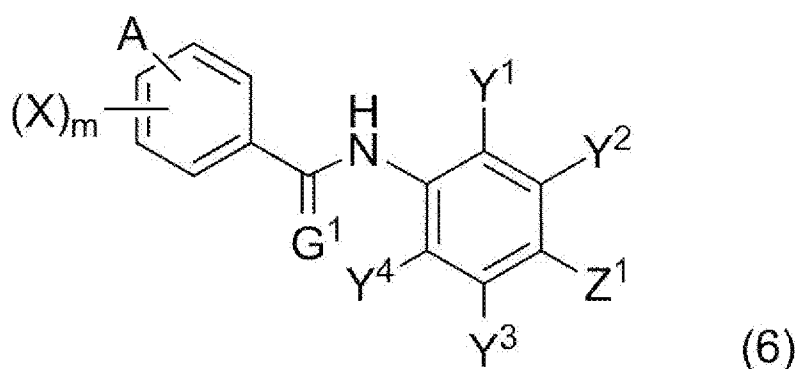
[化5]



(一般式(5)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4アルキルスルフィニル基、C1-C4ハロアルキルスルフィニル基、C1-C4アルキルスルホニル基、またはC1-C4ハロアルキルスルホニル基を示す。 X 、 m 、 G^1 、および A は前記一般式(1)における X 、 m 、 G^1 、および A とそれぞれ同義である。)

で表される芳香族アミド誘導体であり、前記一般式(4)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体が、下記一般式(6)

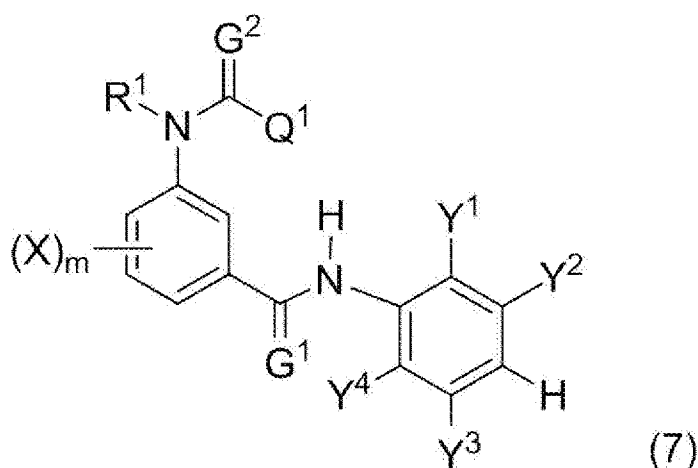
[化6]



(一般式(6)中、 Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義である。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、および A は前記一般式(5)における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、および A とそれぞれ同義である。)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体である、請求項1に記載の製造方法。

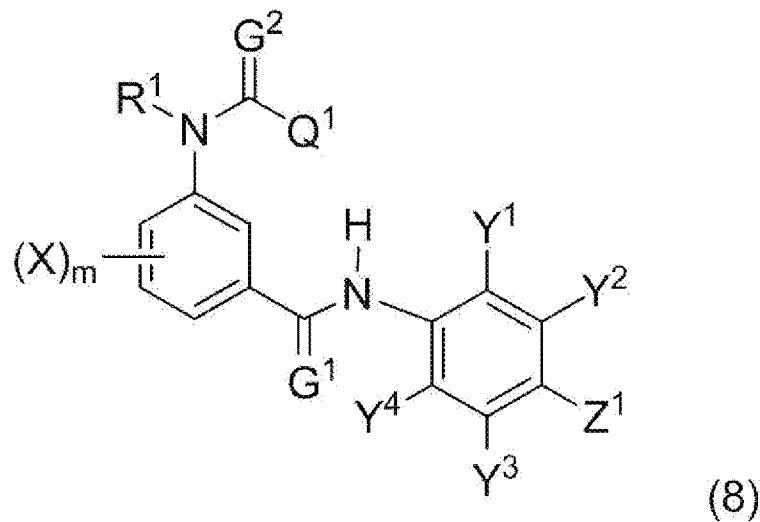
[請求項3] 前記一般式(5)で表される芳香族アミド誘導体下記一般式(7)

[化7]



(一般式(7)中、 G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式(2)における G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 は前記一般式(5)における X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 とそれぞれ同義である。)で表される芳香族アミド誘導体であり、前記一般式(6)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体が、下記一般式(8)

[化8]



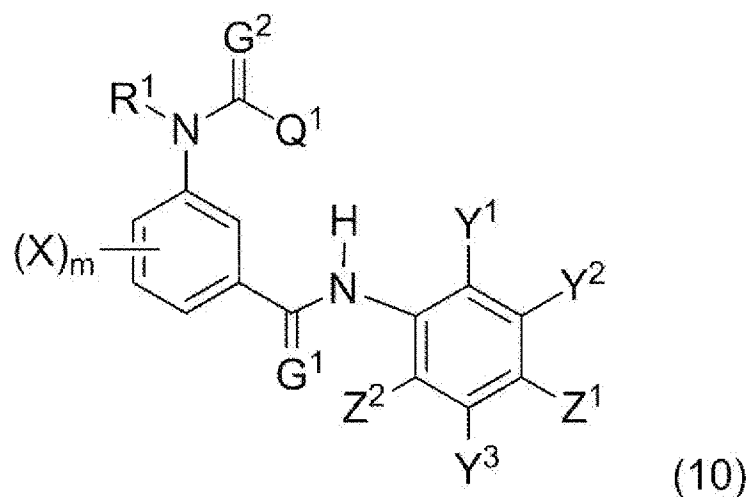
(一般式(8)中、 Z^1 は前記一般式(3)における Z^1 と同義である。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、および R^1 は前記一般式(7)における Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、および R^1 とそれぞれ同義である。)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体である請求項2に記載の製造方法。

[請求項4]

請求項3に記載の製造方法により前記一般式(8)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を得る工程と、

前記一般式(8)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体を塩基性条件下でハロゲン化する工程とを含む、下記一般式(10)

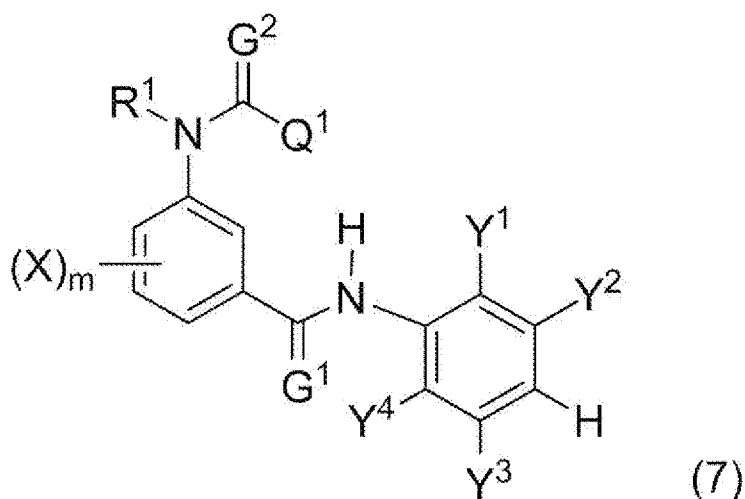
[化9]



(一般式(10)中、 Z^2 はハロゲン原子を示す。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 は前記一般式(8)における X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Z^1 とそれぞれ同義である。)で表されるハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法であって、前記一般式(8)において、 Y^4 は水素原子である、ハロゲン化芳香族アミド誘導体の製造方法。

[請求項5] 下記一般式(7)

[化10]



(一般式(7)中、 X はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C1-C4$ アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。 m は1~4の整数を示す。

G^1 および G^2 はそれぞれ独立に、酸素原子、または硫黄原子を示す。

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、 $C1-C6$ アルキル基、 $C1-C6$ ハロアルキル基、 $C1-C4$ アルキルチオ基、 $C1-C4$ ハロアルキルチオ基、 $C1-C4$ アルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C1-C4$ アルキルスルホニル基、または $C1-C4$ ハロアルキルスル

ホル基を示す。

R¹は水素原子、C₁－C₆アルキル基、またはC₁－C₆ハロアルキル基を示す。

Q¹はC₁－C₆のアルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C₁－C₆アルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっている置換基を有するフェニル基、または

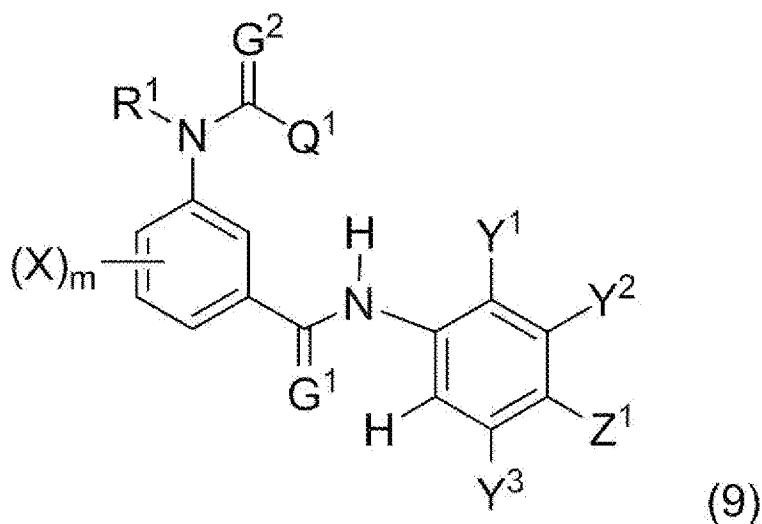
無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C₁－C₆アルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基、C₂－C₄アルケニル基、C₂－C₄ハロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－

C 4 アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C 1 – C 4 アルキルカルボニル基、C 1 – C 4 ハロアルキルカルボニル基、C 1 – C 4 アルキルカルボニルオキシ基、C 1 – C 4 アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される 1 以上の同一または異なっている置換基を有する複素環基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジリル基、ピラジリル基、フリリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。) で表される芳香族アミド誘導体。

[請求項6] 下記一般式 (9)

[化11]



(一般式 (9) 中、X はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C 1 – C 4 アルコキシ基、またはジメチルアミノ基を示す。m は 1 ~ 4 の整数を示す。

G¹ および G² はそれぞれ独立に、酸素原子、または硫黄原子を示す。

Y¹、Y²、およびY³はそれぞれ独立に、水素原子、ハロゲン原子、C₁–C₆アルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、C₁–C₄アルキルチオ基、C₁–C₄ハロアルキルチオ基、C₁–C₄アルキルスルフィニル基、C₁–C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁–C₄アルキルスルホニル基、またはC₁–C₄ハロアルキルスルホニル基を示す。

Z¹はC₁–C₆アルキル基、またはC₁–C₆ハロアルキル基を示す。

R¹は水素原子、C₁–C₆アルキル基、またはC₁–C₆ハロアルキル基を示す。

Q¹はC₁–C₆のアルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、無置換のフェニル基、もしくはハロゲン原子、C₁–C₆アルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、C₂–C₄アルケニル基、C₂–C₄ハロアルケニル基、C₂–C₄アルキニル基、C₂–C₄ハロアルキニル基、C₃–C₆シクロアルキル基、C₃–C₆ハロシクロアルキル基、C₁–C₄アルコキシ基、C₁–C₄ハロアルコキシ基、C₁–C₄アルキルチオ基、C₁–C₄ハロアルキルチオ基、C₁–C₄アルキルスルフィニル基、C₁–C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁–C₄アルキルスルホニル基、C₁–C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁–C₄アルキルアミノ基、ジC₁–C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁–C₄アルキルカルボニル基、C₁–C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁–C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁–C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有するフェニル基、または無置換の複素環基、もしくはハロゲン原子、C₁–C₆アルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、C₂–C₄アルケニル基、C₂–C₄ハ

ロアルケニル基、C₂－C₄アルキニル基、C₂－C₄ハロアルキニル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₃－C₆ハロシクロアルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、C₁－C₄ハロアルコキシ基、C₁－C₄アルキルチオ基、C₁－C₄ハロアルキルチオ基、C₁－C₄アルキルスルフィニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁－C₄アルキルスルホニル基、C₁－C₄ハロアルキルスルホニル基、アリールスルホニル基、C₁－C₄アルキルアミノ基、ジC₁－C₄アルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシ基、C₁－C₄アルキルカルボニル基、C₁－C₄ハロアルキルカルボニル基、C₁－C₄アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₄アルコキシカルボニル基、アセチルアミノ基、およびフェニル基からなる群より選択される1以上の同一または異なっているよい置換基を有する複素環基を示す。

前記複素環基は、ピリジル基、ピリジン－N－オキシド基、ピリミジニル基、ピリダジリル基、ピラジリル基、フリリル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、またはテトラゾリル基を示す。)で表されるアルキル化芳香族アミド誘導体。

[請求項7]

前記一般式(9)におけるY¹がC₁－C₂ハロアルキル基であり、Y²およびY³がそれぞれ水素原子であり、Z¹がC₁－C₆ハロアルキル基であり、Xがハロゲン原子である請求項6に記載のアルキル化芳香族アミド誘導体。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/059695

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07C231/12(2006.01) i, C07C237/42(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)

C07C231/12, C07C237/42

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	1996-2013
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2013	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2013

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X/Y	WO 2006/137376 A1 (Mitsui Chemicals, Inc.), 28 December 2006 (28.12.2006), claims; tables; examples & US 2009/0233962 A1 & EP 1911751 A1	5-7/1-7
X	CN 102206172 A (Chugoku Igaku Kagakuin Iyaku Seibutsu Gijutsu Kenkyusho), 05 October 2011 (05.10.2011), claims; tables; examples (Family: none)	5, 6
X	GRAMMATICAKIS, P., Preparation and ultraviolet absorption of some m-(amino- and m-(acylamino benzoyl)aryl amines, Comptes Rendus des Seances de l'Academie des Sciences, Serie C: Sciences Chimiques, 1966, Vol.263, No.21, pp.1306-1309	5, 6

☒ 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
21 June, 2013 (21.06.13)

Date of mailing of the international search report
02 July, 2013 (02.07.13)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/059695

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2004-502749 A (Boehringer Ingelheim Pharma GmbH), 29 January 2004 (29.01.2004), example 35 & US 2002/0032238 A1 & EP 1301464 A1 & WO 2002/004403 A1	5
X	WO 2011/118759 A1 (Okayama University), 29 September 2011 (29.09.2011), compounds 7, 9 (Family: none)	5
X	JP 2010-72101 A (Ricoh Co., Ltd.), 02 April 2010 (02.04.2010), compounds 1, 2 (Family: none)	5
X	WO 2003/103654 A1 (Institute of Medicinal Molecular Design Inc.), 18 December 2003 (18.12.2003), claims; compound 157 & US 2006/0089395 A1 & EP 1535609 A1	5
Y	Fuchikami T. et al, Journal of Fluorine Chemistry, 1983, Volume 22, Issue 6, pp.541-556	1-7
Y	CSJ: The Chemical Society of Japan, Shin Jikken Kagaku Koza 14 Yuki Kagobutsu no Gosei to Hanno I, 1st edition, vol.14, 1977, page 62	1-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/059695

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
See (extra sheet) .

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/059695

Continuation of Box No.III of continuation of first sheet (2)

The invention of claim 1 relates to a method for producing a compound represented by formula (4); the invention of claim 5 relates to a compound represented by formula (7); and the invention of claim 6 relates to a compound represented by formula (9).

The technical feature common to the compound represented by formula (4) in claim 1, the compound represented by formula (7) in claim 5 and the compound represented by formula (9) in claim 6 is an N-phenylbenzamide structure which those compounds have in common.

However, the above-said technical feature cannot be considered to be a special technical feature, since the technical feature does not make a contribution over the prior art in the light of the contents disclosed in the document 1 (WO 2006/137376 A1) and so on.

Further, there is no other same or corresponding special technical feature among these inventions.

Therefore, any same or corresponding special technical feature cannot be found between the invention of claim 1 and the inventions of claims 5-7, since there is no special technical feature in the inventions of claims 5-7.

Accordingly, the inventions of claims 1-7 comprise three inventions indicated below.

(Invention group 1) The inventions of claims 1-4 relate to a method for producing a compound represented by formula (4), which comprises a step of reacting a compound represented by formula (1) with a compound represented by formula (3).

(Invention group 2) The invention of claim 5 relates to a compound represented by formula (7).

(Invention group 3) The inventions of claims 6 and 7 relate to a compound represented by formula (9).

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））
Int.Cl. C07C231/12(2006.01)i, C07C237/42(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（I P C））

Int.Cl. C07C231/12, C07C237/42

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	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 3 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 3 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 3 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)

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
X/ Y	WO 2006/137376 A1（三井化学株式会社）2006.12.28, 特許請求の範囲、表、実施例 & US 2009/0233962 A1 & EP 1911751 A1	5-7/ 1-7
X	CN 102206172 A（中国医学科学院医薬生物技術研究所）2011.10.05, 特許請求の範囲、表、実施例 （ファミリーなし）	5, 6

☒ 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

2 1 . 0 6 . 2 0 1 3

国際調査報告の発送日

0 2 . 0 7 . 2 0 1 3

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A / J P）

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

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）

三上 晶子

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 4 3

4 H

5 2 8 0

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
X	GRAMMATICAKIS, P., Preparation and ultraviolet absorption of some m-(amino- and m-(acylaminobenzoyl)aryl amines, Comptes Rendus des Seances de l'Academie des Sciences, Serie C: Sciences Chimiques, 1966, Vol. 263, No. 21, pp. 1306-1309	5, 6
X	JP 2004-502749 A (ベーリンガー インゲルハイム ファルマ ゲーエムベーハー) 2004. 01. 29, 実施例 3 5 & US 2002/0032238 A1 & EP 1301464 A1 & WO 2002/004403 A1	5
X	WO 2011/118759 A1 (国立大学法人岡山大学) 2011. 09. 29, 化合物 7、9 (ファミリーなし)	5
X	JP 2010-72101 A (株式会社 リコー) 2010. 04. 02, 化合物 1、2 (ファミリーなし)	5
X	WO 2003/103654 A1 (株式会社医薬分子設計研究所) 2003. 12. 18, 特許請求の範囲、化合物 1 5 7 & US 2006/0089395 A1 & EP 1535609 A1	5
Y	Fuchikami T. et al, Journal of Fluorine Chemistry, 1983, Volume 22, Issue 6, pp. 541-556	1-7
Y	日本化学会, 新実験化学講座 1 4 有機化合物の合成と反応 I, 初版 第 1 4 巻, 1977, p. 62	1-7

第Ⅱ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（P C T 17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求項 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
2. ☐ 請求項 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求項 _____ は、従属請求の範囲であってP C T 規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅲ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。
（特別ページ）参照。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求項について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求項について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求項のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求項について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。
- ☐ 追加調査手数料の納付はあったが、異議申立てはなかった。

請求項1に係る発明は、式(4)で表される化合物の製造方法であり、請求項5に係る発明は、式(7)で表される化合物の発明であり、請求項6に係る発明は、式(9)で表される化合物の発明である。

請求項1の式(4)で表される化合物と請求項5の式(7)で表される化合物、請求項6の式(9)で表される化合物は、共通する骨格として、N-フェニルベンズアミド構造という、共通の技術的特徴を有している。

しかしながら、当該技術的特徴は、文献1(WO 2006/137376 A1)等の開示内容に照らして、先行技術に対する貢献をもたらすものではないから、当該技術的特徴は、特別な技術的特徴であるとはいえない。

また、これらの発明の間には、ほかに同一の又は対応する特別な技術的特徴は存在しない。

よって、請求項5-7に係る発明に特別な技術的特徴がないから、請求項1に係る発明と、請求項5-7に係る発明との間に、同一の又は対応する特別な技術的特徴を見いだすことができない。

そして、請求項1-7に係る発明は、以下に示す3つの発明からなる。

(発明1) 請求項1-4に係る発明は、式(1)で表される化合物と式(3)で表される化合物とを反応させる工程を含む式(4)で表される化合物の製造方法の発明である。

(発明2) 請求項5に係る発明は、式(7)で表される化合物の発明である。

(発明3) 請求項6-7に係る発明は、式(9)で表される化合物の発明である。