



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 104245665 B

(45)授权公告日 2017.08.25

(21)申请号 201380018859.9

(72)发明人 大仓广成

(22)申请日 2013.03.29

(74)专利代理机构 北京市金杜律师事务所
11256

(65)同一申请的已公布的文献号

申请公布号 CN 104245665 A

代理人 杨宏军 马妮楠

(43)申请公布日 2014.12.24

(51)Int.Cl.

C07C 231/12(2006.01)

(30)优先权数据

C07C 237/42(2006.01)

2012-085053 2012.04.03 JP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2014.10.08

(56)对比文件

CN 101203484 A, 2008.06.18,

CN 101203484 A, 2008.06.18,

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/JP2013/059695 2013.03.29

Takamasa Fuchikami et al..DIRECT

PERFLUOROALKYLATION OF FUNCTIONALIZED

(87)PCT国际申请的公布数据

W02013/150988 JA 2013.10.10

BENZENES WITH PERFLUOROALKYL HALIDES AND

COPPER BRONZE.《Journal of Fluorine

(73)专利权人 三井化学AGRO株式会社

地址 日本东京都

Chemistry》.1983,第22卷第541-556页.

审查员 原学宁

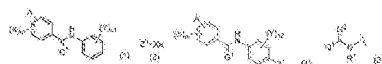
权利要求书5页 说明书48页

(54)发明名称

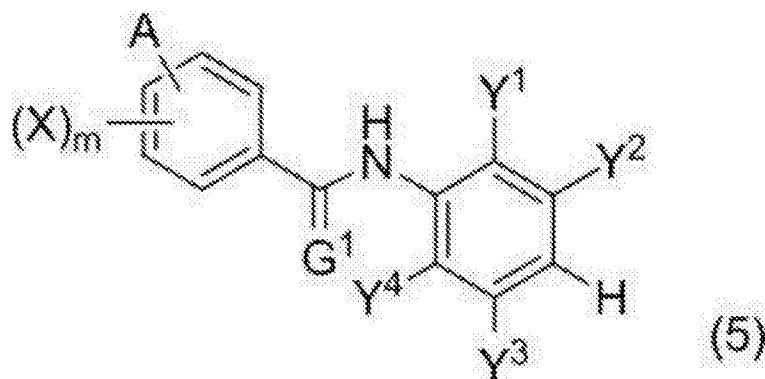
烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法

(57)摘要

本发明提供通式(4)表示的芳香族酰胺衍生物的制造方法,所述方法包括在碱、及金属或金属盐的存在下使通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物和通式(3)表示的卤代烷基化合物反应的工序。通式中,X及Y表示氢原子、卤素原子等。A表示氢原子、烷基、通式(2)表示的基团等。G¹及G²表示氧原子等。Q¹表示苯基等。R¹表示氢原子、烷基等。Z¹表示卤代烷基等。Xa表示碘原子等。m表示1~4,n1表示1~5,n2表示1~4。



1. 下述通式 (6) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法, 包括在碱、及显示 2 价的铁金属盐、显示 1 价的铜金属盐或碘化钐 (II) 的存在下, 在惰性溶剂中使下述通式 (5) 表示的芳香族酰胺衍生物与下述通式 (3) 表示的卤代烷基化合物反应的工序, 所述碱选自有机碱类、碱金属氢氧化物类、氢化碱金属盐类、碱金属醇化物类之一,



通式 (5) 中, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6 烷基、C1—C6 卤代烷基、C1—C4 烷基硫基、C1—C4 卤代烷基硫基、C1—C4 烷基亚磺酰基、C1—C4 卤代烷基亚磺酰基、C1—C4 烷基磺酰基、或 C1—C4 卤代烷基磺酰基,

X 各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4 烷氧基、或二甲基氨基,

m 表示 1~4 的整数, n 表示 1~5 的整数,

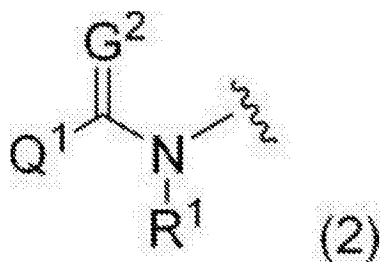
G^1 表示氧原子、或硫原子,

A 表示氢原子、C1—C6 烷基、C1—C6 卤代烷基、C2—C4 链烯基、C2—C4 卤代链烯基、C2—C4 炔基、C2—C4 卤代炔基、C3—C6 环烷基、C3—C6 卤代环烷基、C1—C4 烷氧基、C1—C4 卤代烷氧基、C1—C4 烷基硫基、C1—C4 卤代烷基硫基、C1—C4 烷基亚磺酰基、C1—C4 卤代烷基亚磺酰基、C1—C4 烷基磺酰基、C1—C4 卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4 烷基氨基、二 C1—C4 烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4 烷基羰基、C1—C4 卤代烷基羰基、C1—C4 烷基羰基氧基、C1—C4 烷氧基羰基、C1—C4 烷基氨基羰基、甲基亚磺酰基 C1—C4 烷基氨基羰基、甲基磺酰基 C1—C4 烷基氨基羰基、乙酰基氨基、

无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6 烷基、C1—C6 卤代烷基、C2—C4 链烯基、C2—C4 卤代链烯基、C2—C4 炔基、C2—C4 卤代炔基、C3—C6 环烷基、C3—C6 卤代环烷基、C1—C4 烷氧基、C1—C4 卤代烷氧基、C1—C4 烷基硫基、C1—C4 卤代烷基硫基、C1—C4 烷基亚磺酰基、C1—C4 卤代烷基亚磺酰基、C1—C4 烷基磺酰基、C1—C4 卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4 烷基氨基、二 C1—C4 烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4 烷基羰基、C1—C4 卤代烷基羰基、C1—C4 烷基羰基氧基、C1—C4 烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的 1 个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、

无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6 烷基、C1—C6 卤代烷基、C2—C4 链烯基、C2—C4 卤代链烯基、C2—C4 炔基、C2—C4 卤代炔基、C3—C6 环烷基、C3—C6 卤代环烷基、C1—C4 烷氧基、C1—C4 卤代烷氧基、C1—C4 烷基硫基、C1—C4 卤代烷基硫基、C1—C4 烷基亚磺酰基、C1—C4 卤代烷基亚磺酰基、C1—C4 烷基磺酰基、C1—C4 卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4 烷基氨基、二 C1—C4 烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4 烷基羰基、C1—C4 卤代烷基羰基、C1—C4 烷基羰基氧基、C1—C4 烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的 1 个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基、或

下述通式 (2) 表示的基团，



通式 (2) 中, G^2 表示氧原子、或硫原子,

R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基,

Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

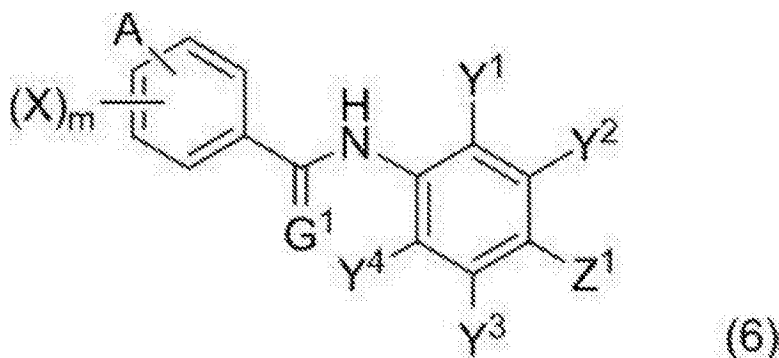
无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基,

所述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基或嘧啶基,

Z^1-Xa (3)

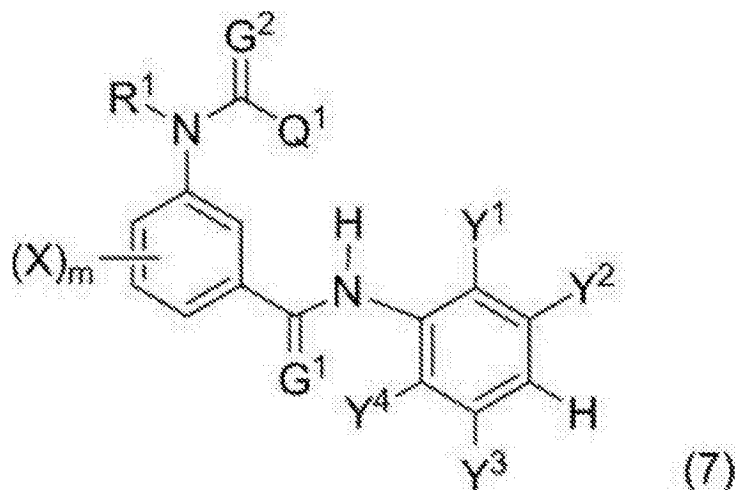
通式 (3) 中, Z^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基, Xa 表示碘原子或溴原子,



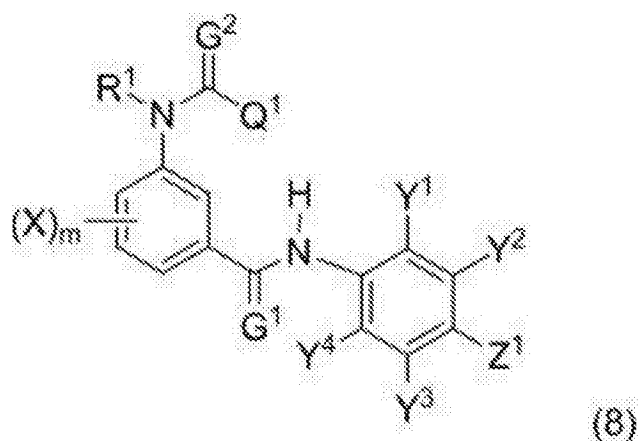
通式 (6) 中, Z^1 与所述通式 (3) 中的 Z^1 含义相同, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 分别与所述通式 (5) 中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 含义相同。

2. 如权利要求1所述的制造方法, 其中, 所述通式 (5) 表示的芳香族酰胺衍生物为下述通式 (7) 表示的芳香族酰胺衍生物, 所述通式 (6) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物为下述通

式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,



通式(7)中, G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与所述通式(2)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同, X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 分别与所述通式(5)中的 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 含义相同,

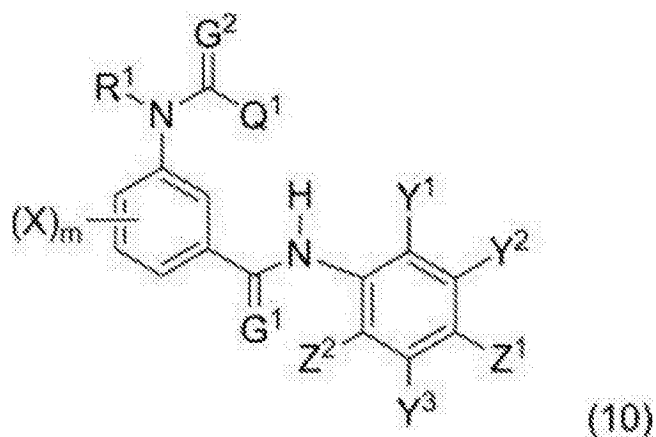


通式(8)中, Z^1 与所述通式(3)中的 Z^1 含义相同, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与所述通式(7)中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。

3. 下述通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物的制造方法,包括以下工序:

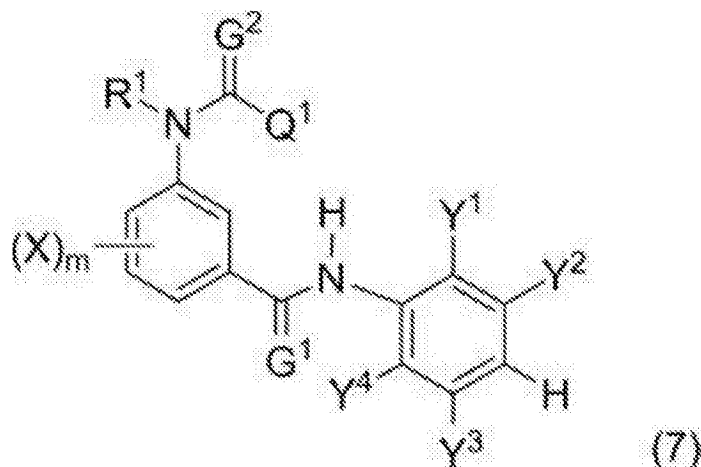
利用权利要求2所述的制造方法得到所述通式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的工序;和

在碱性条件下将所述通式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化的工序,
所述通式(8)中, Y^4 为氢原子,



通式(10)中, Z^2 表示卤素原子, X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 分别与所述通式(8)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 含义相同。

4. 下述通式(7)表示的芳香族酰胺衍生物,



通式(7)中, X 各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、 $C1-C4$ 烷氧基、或二甲基氨基, m 表示1~4的整数,

G^1 及 G^2 表示氧原子,

Y^1 表示 $C1-C6$ 卤代烷基, Y^2 及 Y^3 各自独立地表示氢原子、卤素原子、 $C1-C6$ 烷基、或 $C1-C6$ 卤代烷基, Y^4 表示氟原子、溴原子或碘原子,

R^1 表示 $C1-C6$ 烷基、或 $C1-C6$ 卤代烷基,

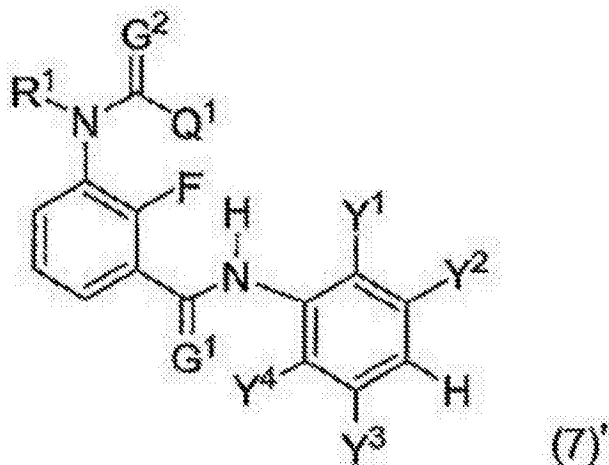
Q^1 表示 $C1-C6$ 烷基、 $C1-C6$ 卤代烷基、

无取代的苯基、或具有选自卤素原子、 $C1-C6$ 烷基、 $C1-C6$ 卤代烷基、 $C1-C4$ 烷氧基、 $C1-C4$ 卤代烷氧基、 $C1-C4$ 烷基硫基、 $C1-C4$ 卤代烷基硫基、 $C1-C4$ 烷基磺酰基、 $C1-C4$ 卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、 $C1-C6$ 烷基、 $C1-C6$ 卤代烷基、 $C1-C4$ 烷氧基、 $C1-C4$ 卤代烷氧基、 $C1-C4$ 烷基硫基、 $C1-C4$ 卤代烷基硫基、 $C1-C4$ 烷基磺酰基、 $C1-C4$ 卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基,

所述杂环基表示吡啶基、吡啶- N -氧化物基或嘧啶基。

5. 下述通式(7)'表示的芳香族酰胺衍生物,



通式(7)'中, G^1 及 G^2 表示氧原子,

Y^1 表示C1—C6卤代烷基, Y^2 及 Y^3 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基, Y^4 表示氟原子、溴原子或碘原子,

R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基,

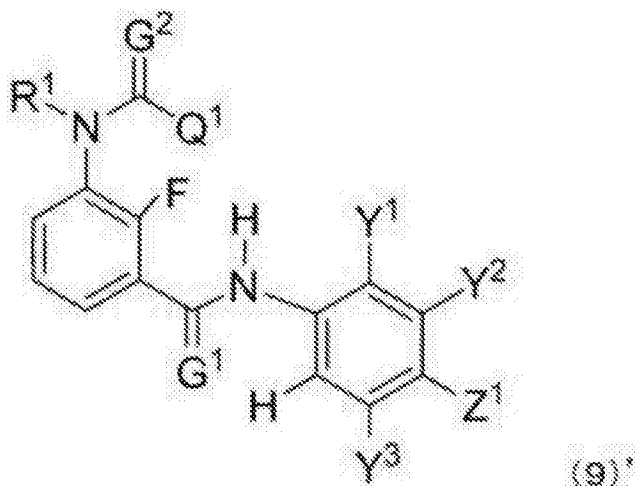
Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基,

所述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基或嘧啶基。

6.如权利要求1所述的制造方法,其中,所述通式(6)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物为下述通式(9)'表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,



通式(9)'中,

G^1 及 G^2 表示氧原子,

Y^1 、 Y^2 及 Y^3 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基,

Z^1 表示C1—C4卤代烷基,

R^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基,

Q^1 表示C1—C6卤代烷基、

无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、氰基及硝基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基,

所述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基或嘧啶基。

烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法

技术领域

[0001] 本发明涉及烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法。

背景技术

[0002] 国际公开第2005/73165号小册子、国际公开第2006/137376号小册子及国际公开第2010/18714号小册子中,作为具有有害生物防除作用的酰胺衍生物,公开了多种化合物,并公开了在该酰胺衍生物的制造的方面,具有经全氟烷基化的苯基的酰胺衍生物是有用的。

[0003] 作为具有经全氟烷基化的苯基的苯胺的制造方法,已知有在还原剂的存在下使全氟烷基卤素化合物反应的制造方法(例如,参见日本特开2001-122836号公报)。进而,作为具有经全氟烷基化的苯基的酰胺衍生物的制造方法,已知有Journal of Fluorine Chemistry 22,541-556,1983。

[0004] 另外,已知一些将具备具有吸电子基团的芳香族环的酰胺化合物卤化的方法(例如,参见Bioorganic&Medicinal Chemistry, 15 (3), 1212-1228, 2007),但不知将具有经全氟烷基化的苯基的酰胺衍生物卤化的方法。

发明内容

[0005] 发明所要解决的课题

[0006] 日本特开2001-122836号公报中仅记载了苯胺的例子,对于酰胺化合物没有具体公开。本发明人等按照日本特开2001-122836号公报中记载的方法尝试了酰胺化合物的全氟烷基化,结果反应未进行。

[0007] 另外,在Journal of Fluorine chemistry 22,541-556,1983中记载的方法中,反应需要高温,因而无法应用于沸点低的全氟烷基卤素化合物,产生限制。另外,该方法由于生成物的收率及反应选择性也低,而无法期待实用性。

[0008] Bioorganic&Medicinal Chemistry, 15 (3), 1212-1228, 2007中记载的方法中,卤化的收率低,本发明人等按照非专利文献2中记载的方法进行了具有吸电子基团的酰胺化合物的卤化反应,结果生成物的收率低。结果,现阶段的实际情况是:尚未发现暗示了将具有经全氟烷基化的苯基的酰胺衍生物进行卤化的对工业制造而言能够利用的反应方法的知识。

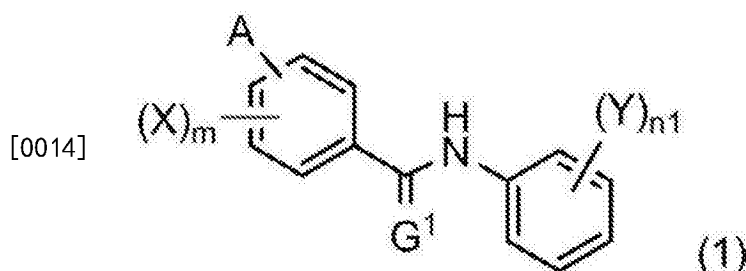
[0009] 鉴于上述情况,本发明的课题在于提供短工序、且能在工业上利用的制造具有烷基的芳香族酰胺衍生物的方法,及在该制造方法中有用的制造中间体。

[0010] 用于解决课题的手段

[0011] 本发明人等为了解决上述课题而进行了深入研究,结果发现了具有烷基(优选全氟烷基)的芳香族酰胺衍生物的新型制造方法和可应用于该制造方法的新型的有用中间体,进而发现,能将该有用中间体选择性地卤化。由此,发现了用于容易制造具有高的杀虫活性的新型杀虫剂的方法,从而完成了本发明。

[0012] 即,本发明如下所述。

[0013] <1>下述通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法,包括在碱、及金属或金属盐的存在下,使下述通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物与下述通式(3)表示的卤代烷基化合物反应的工序,



[0015] (通式(1)中,X各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基。m表示1~4的整数,n1表示1~5的整数。G¹表示氧原子、或硫原子。

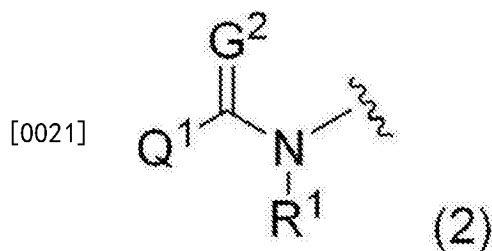
[0016] Y各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、或乙酰基氨基。

[0017] A表示氢原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、C1—C4烷基氨基羰基、甲基亚磺酰基C1—C4烷基氨基羰基、甲基磺酰基C1—C4烷基氨基羰基、乙酰基氨基、

[0018] 无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、

[0019] 无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基、

[0020] 或下述通式 (2) 表示的基团,



[0022] (通式 (2) 中, G^2 表示氧原子、或硫原子。

[0023] R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

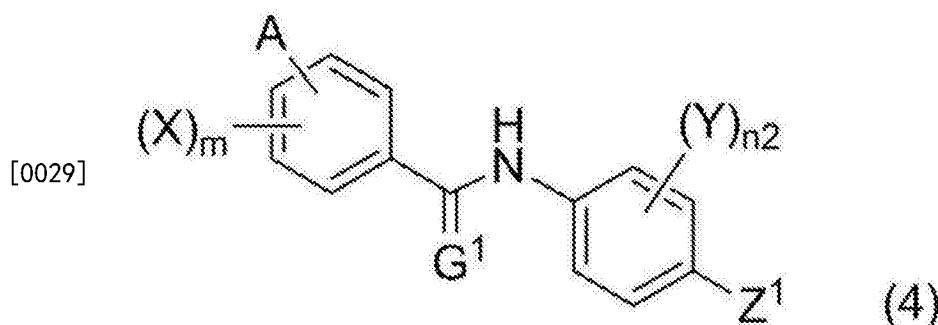
[0024] Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

[0025] 无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或者无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基。)

[0026] 上述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基 (pyrazyl)、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。)

[0027] Z^1-Xa (3)

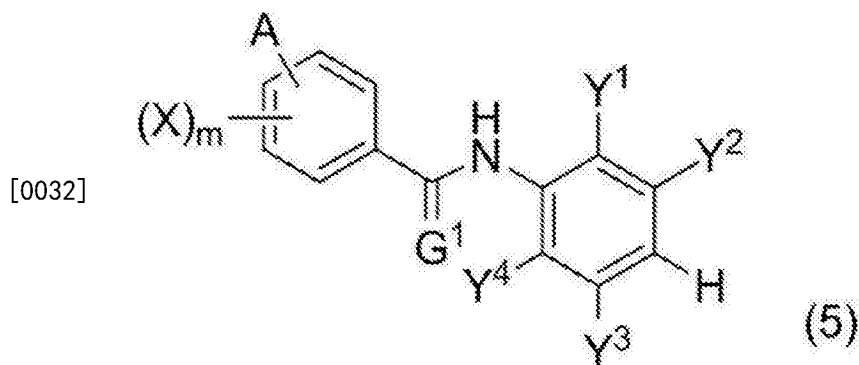
[0028] (通式 (3) 中, Z^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。 Xa 表示碘原子或溴原子。)



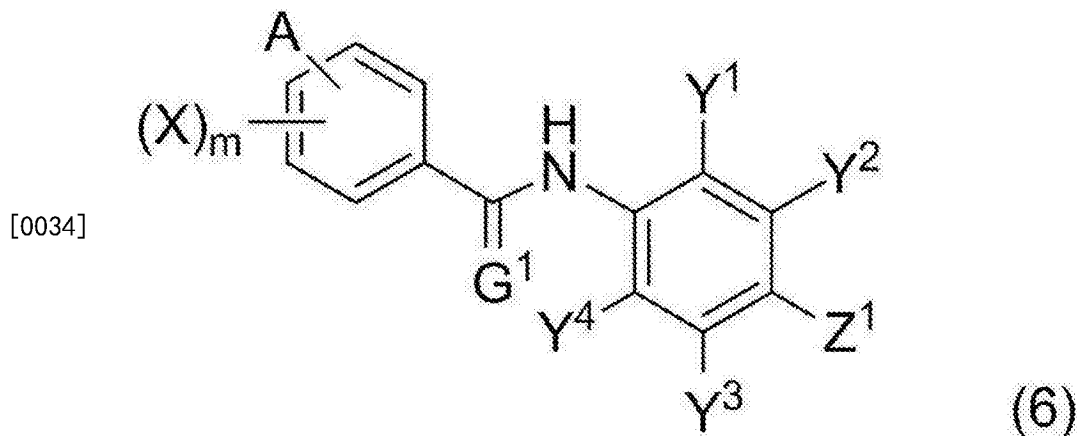
[0030] (通式 (4) 中, n_2 表示1~4的整数。 Z^1 与上述通式 (3) 中的 Z^1 含义相同, X 、 m 、 G^1 、 Y 及 A 分别与上述通式 (1) 中的 X 、 m 、 G^1 、 Y 及 A 含义相同。)

[0031] <2> 上述<1>所述的制造方法, 其中, 上述通式 (1) 表示的芳香族酰胺衍生物为下述通式 (5) 表示的芳香族酰胺衍生物, 上述通式 (4) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物为下

述通式 (6) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物。

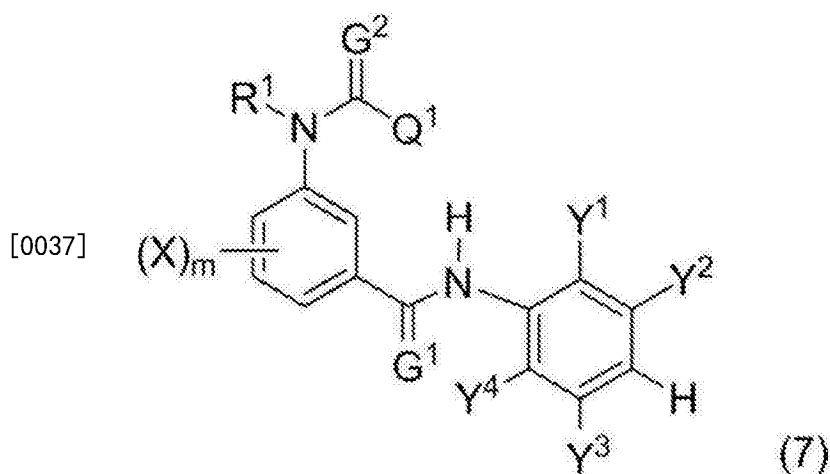


[0033] (通式 (5) 中, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6 烷基、C1—C6 卤代烷基、C1—C4 烷基硫基、C1—C4 卤代烷基硫基、C1—C4 烷基亚磺酰基、C1—C4 卤代烷基亚磺酰基、C1—C4 烷基磺酰基、或 C1—C4 卤代烷基磺酰基。 X 、 m 、 G^1 及 A 分别与上述通式 (1) 中的 X 、 m 、 G^1 及 A 含义相同。)



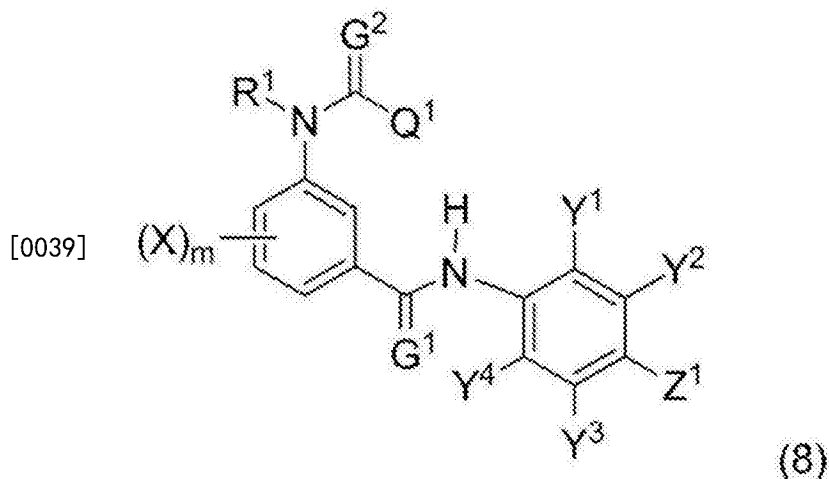
[0035] (通式 (6) 中, Z^1 与上述通式 (3) 中的 Z^1 含义相同。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 分别与上述通式 (5) 中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 含义相同。)

[0036] <3> 上述<2>所述的制造方法, 其中, 上述通式 (5) 表示的芳香族酰胺衍生物为下述通式 (7) 表示的芳香族酰胺衍生物, 上述通式 (6) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物为下述通式 (8) 表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,



[0038] (通式 (7) 中, G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式 (2) 中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、

Y^3 及 Y^4 分别与上述通式(5)中的 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 含义相同。)

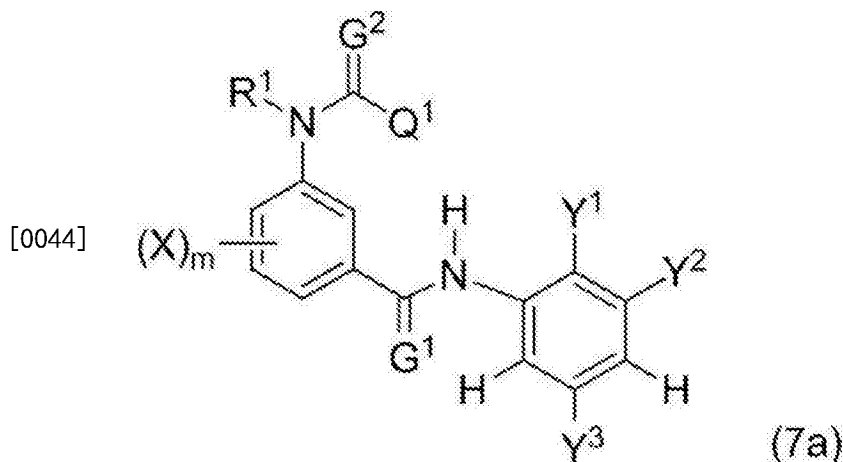


[0040] (通式(8)中, Z^1 与上述通式(3)中的 Z^1 含义相同。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式(7)中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。)

[0041] <4>下述通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物的制造方法,包括以下工序:

[0042] 在碱、及金属或金属盐的存在下,使下述通式(7a)表示的芳香族酰胺衍生物与下述通式(3)表示的卤代烷基化合物反应,得到下述通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的工序;和

[0043] 在碱性条件下将上述通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化的工序,



[0045] (通式(7a)中, X 各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基。 m 表示1~4的整数。

[0046] G^1 及 G^2 各自独立地表示氧原子、或硫原子。

[0047] Y^1 、 Y^2 及 Y^3 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。

[0048] R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

[0049] Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

[0050] 无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、

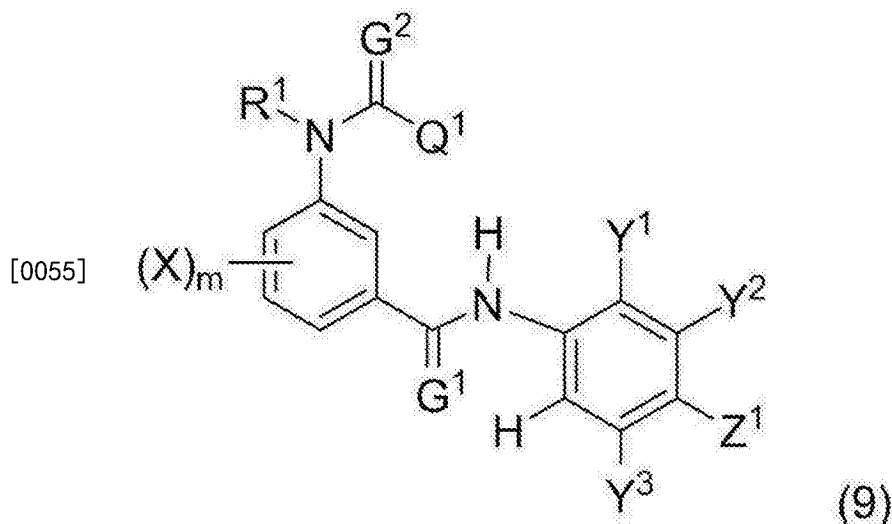
C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

[0051] 无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基。

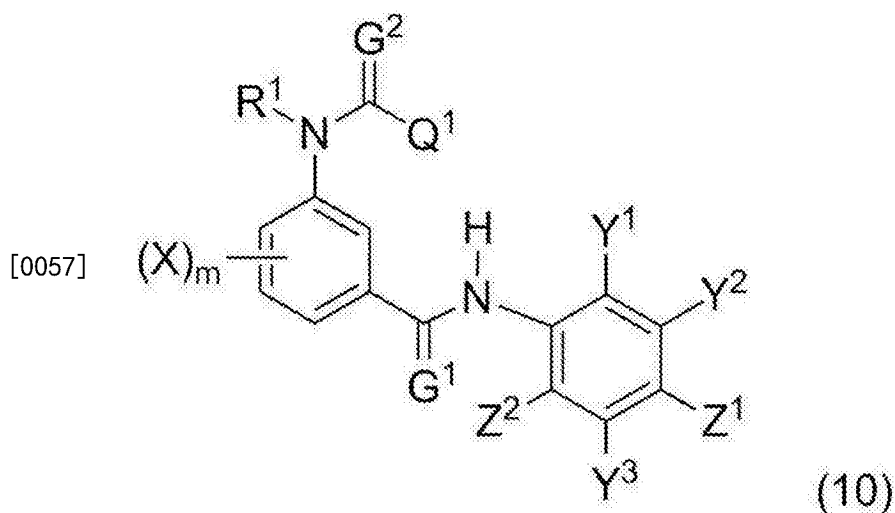
[0052] 上述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。)

[0053] Z^1-X_a (3)

[0054] (通式(3)中, Z^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。 X_a 表示碘原子或溴原子。)



[0056] (通式(9)中, Z^1 与通式(3)中的 Z^1 含义相同。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 分别与上述通式(7a)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 含义相同。)



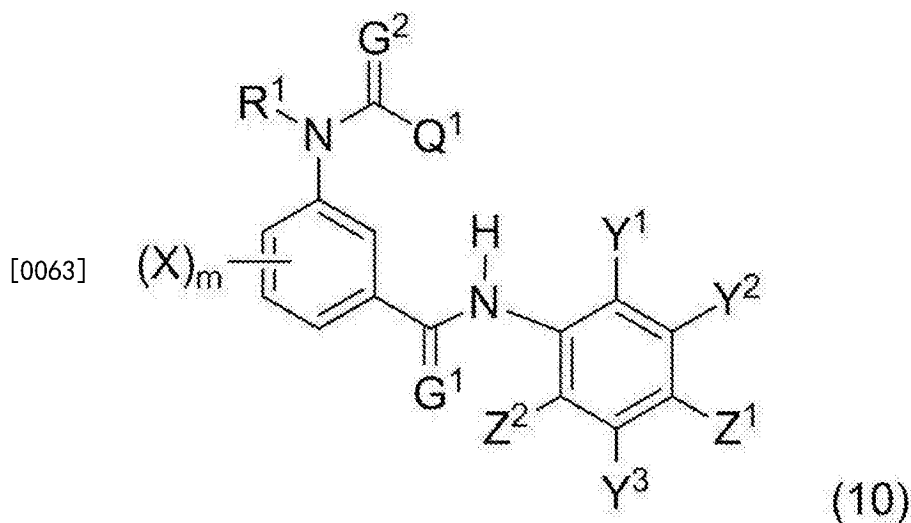
[0058] (通式(10)中, Z^2 表示卤素原子。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 分别与上述通式(9)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 含义相同。)

[0059] <4A>下述通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物的制造方法,包括以下工序:

[0060] 利用<2>所述的制造方法得到上述通式(6)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的工序;和

[0061] 在碱性条件下将上述通式(6)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化的工序,

[0062] 上述通式(6)中, A 由上述通式(2)表示, Y^4 为氢原子。



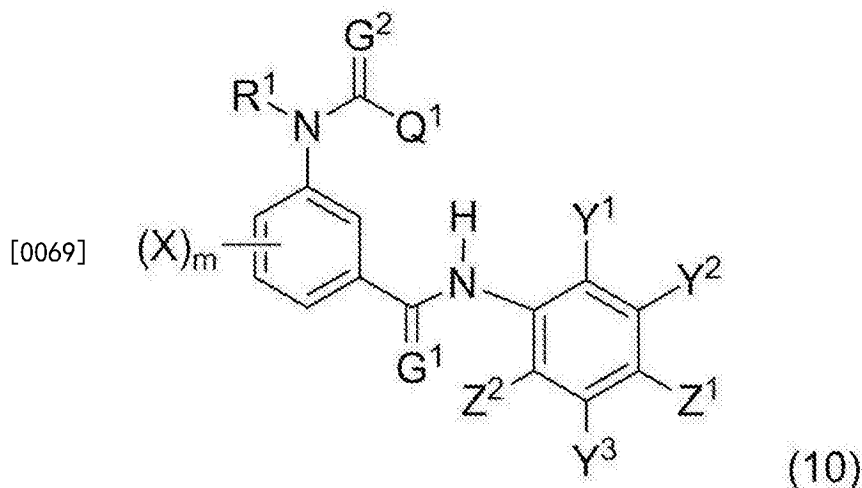
[0064] (通式(10)中, Z^2 表示卤素原子。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 分别与上述通式(6)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 含义相同, G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式(2)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。)

[0065] <4B>下述通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物的制造方法,包括以下工序:

[0066] 利用<3>所述的制造方法得到上述通式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的工序;和

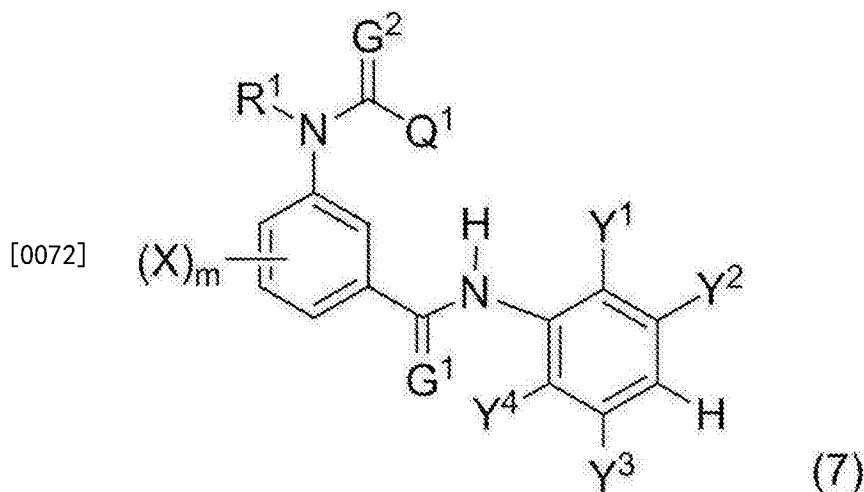
[0067] 在碱性条件下将上述通式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化的工序,

[0068] 上述通式(8)中, Y^4 为氢原子。



[0070] (通式(10)中, Z^2 表示卤素原子。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 分别与上述通式(8)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Z^1 含义相同。)

[0071] <5>下述通式(7)表示的芳香族酰胺衍生物,



[0073] (通式(7)中, X 各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基。 m 表示1~4的整数。

[0074] G^1 及 G^2 各自独立地表示氧原子、或硫原子。

[0075] Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。

[0076] R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

[0077] Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

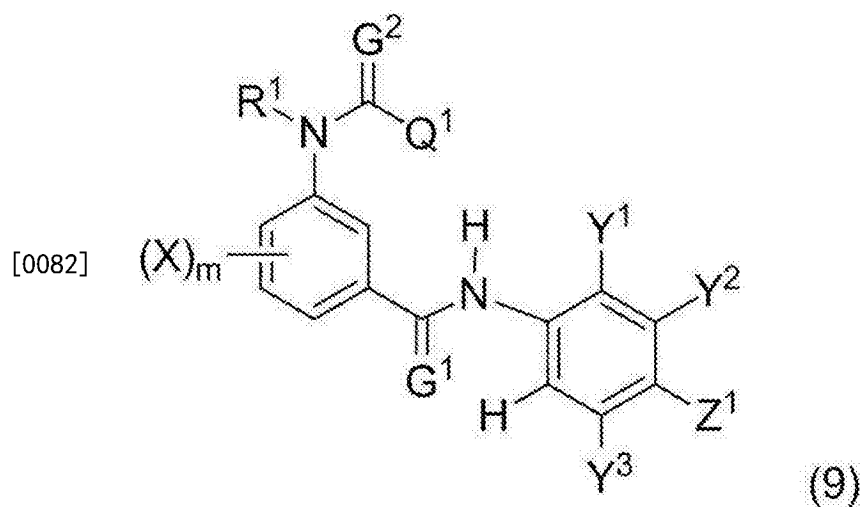
[0078] 无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不

同的取代基的苯基、或

[0079] 无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基。

[0080] 上述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。)

[0081] <6>下述通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物，



[0083] (通式(9)中,X各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基。m表示1~4的整数。

[0084] G^1 及 G^2 各自独立地表示氧原子、或硫原子。

[0085] Y^1 、 Y^2 及 Y^3 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。

[0086] Z^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

[0087] R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

[0088] Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、

[0089] 无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或

[0090] 无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基。

[0091] 上述杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。)

[0092] <7> 上述<6>所述的烷基化芳香族酰胺衍生物,其中,上述通式(9)中的Y¹为C1—C2卤代烷基,Y²及Y³分别为氢原子,Z¹为C1—C6卤代烷基,X为卤素原子。

[0093] 发明效果

[0094] 通过本发明,可提供短工序、且能在工业上利用的制造具有烷基的芳香族酰胺衍生物的方法。另外,可提供在该制造方法中有用的制造中间体。

具体实施方式

[0095] 本说明书中,术语“工序”不仅是指独立的工序,即使在无法与其他工序明确区别的情况下,只要能实现该工序所期望的作用,则也包含在本术语中。另外,使用“~”表示的数值范围表示包含“~”的前后记载的数值分别作为最小值及最大值的范围。

[0096] 另外,本说明书的通式中使用的术语在其定义中分别具有以下说明那样的意思。

[0097] 所谓“卤素原子”,表示氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。“n—”是指正,“i—”是指异,“s—”是指仲,“t—”是指叔。

[0098] 对于“Ca—Cb(a、b表示1以上的整数)”这样的记载而言,例如,所谓“C1—C3”,是指碳原子数为1~3个,所谓“C2—C6”,是指碳原子数为2~6个,所谓“C1—C4”,是指碳原子数为1~4个。

[0099] 另外,所谓“C1—C3烷基”,例如表示甲基、乙基、正丙基、异丙基等直链状或支链状的碳原子数为1~3个的烷基,所谓“C1—C4烷基”,除了“C1—C3烷基”之外,例如表示正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基,所谓“C1—C6烷基”,除了“C1—C4烷基”之外,例如表示正戊基、2—戊基、3—戊基、新戊基、正己基、2—己基、4—甲基—2—戊基、3—甲基—正戊基等直链状或支链状的碳原子数为1~6个的烷基。

[0100] 所谓“C1—C6卤代烷基”,例如表示单氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、单氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、单溴甲基、二溴甲基、三溴甲基、1—氟乙基、2—氟乙基、2,2—二氟乙基、2,2,2—三氟乙基、1—氯乙基、2—氯乙基、2,2—二氯乙基、2,2,2—三氯乙基、1—溴乙基、2—溴乙基、2,2—二溴乙基、2,2,2—三溴乙基、2—碘乙基、五氟乙基、3—氟—正丙基、3—氯—正丙基、3—溴—正丙基、1,3—二氟—2—丙基、1,3—二氯—2—丙基、1,1,1—三氟—2—丙基、1—氯—3—氟—2—丙基、1,1,1,3,3,3—六氟—2—丙基、1,1,1,3,3,3—六氯—2—丙基、2,2,3,3,3—五氟—正丙基、七氟—异丙基、七氟—正丙基、4—氟—正丁基、九氟—正丁基、九氟—2—丁基、九氟—异丁基、十一氟—正戊基、十一氟—异戊基、十一

氟一新戊基、十三氟一正己基、十三氟一正己基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的直链状或支链状的碳原子数为1~6个的烷基。

[0101] 所谓“C2—C4链烯基”，例如表示乙烯基、烯丙基、2—丁烯基、3—丁烯基等在碳链中具有双键的碳原子数为2~4个的链烯基，所谓“C2—C4卤代链烯基”，例如表示3,3—二氟—2—丙烯基、3,3—二氯—2—丙烯基、3,3—二溴—2—丙烯基、2,3—二溴—2—丙烯基、4,4—二氟—3—丁烯基、3,4,4—三溴—3—丁烯基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的在碳链中具有双键的直链状或支链状的碳原子数为2~4个的链烯基。

[0102] 所谓“C2—C4炔基”，例如表示炔丙基、1—丁炔—3—基、1—丁炔—3—甲基—3—基等在碳链中具有三键的直链状或支链状的碳原子数为2~4个的炔基，所谓“C2—C4卤代炔基”，例如表示被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的在碳链中具有三键的直链状或支链状的碳原子数为2~4个的链炔基。

[0103] 所谓“C3—C6环烷基”，例如表示环丙基、环丁基、环戊基、2—甲基环戊基、3—甲基环戊基、环己基等具有环状结构的碳原子数为3~6个的环烷基，所谓“C3—C6卤代环烷基”，例如表示2,2,3,3—四氟环丁基、2—氯环己基、4—氯环己基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的具有环状结构的碳原子数为3~6个的环烷基。

[0104] 所谓“C1—C4烷氧基”，例如表示甲氧基、乙氧基、正丙基氧基、异丙基氧基、正丁基氧基、异丁基氧基等直链状或支链状的碳原子数为1~3个的烷氧基，所谓“C1—C4卤代烷氧基”，例如表示三氟甲氧基、1,1,1,3,3,3—六氟—2—丙基氧基、2,2,2—三氟乙氧基、2—氯乙氧基、3—氟—正丙基氧基、1,1,1,3,3,4,4,4—八氟—2—丁基氧基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的卤代烷氧基。

[0105] 所谓“C1—C4烷基硫基”，例如表示甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、异丙基硫基、环丙基硫基、正丁基硫基、异丁基硫基、仲丁基硫基、叔丁基硫基、环丙基甲基硫基等直链状、支链状或环状的碳原子数为1~4个的烷基硫基。所谓“C1—C4卤代烷基硫基”，例如表示三氟甲基硫基、五氟乙基硫基、2,2,2—三氟乙基硫基、七氟—正丙基硫基、七氟—异丙基硫基、九氟—正丁基硫基、九氟—异丁基硫基、九氟—仲丁基硫基、4,4,4—三氟—正丁基硫基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基硫基。

[0106] 所谓“C1—C4烷基亚磺酰基”，例如表示甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、环丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、异丁基亚磺酰基等直链状或支链状或环状的碳原子数为1~4个的烷基亚磺酰基，所谓“C1—C4卤代烷基亚磺酰基”，例如表示三氟甲基亚磺酰基、五氟乙基亚磺酰基、2,2,2—三氟乙基亚磺酰基、七氟—正丙基亚磺酰基、七氟—异丙基亚磺酰基、九氟—正丁基亚磺酰基、九氟—异丁基亚磺酰基、九氟—仲丁基亚磺酰基、4,4,4—三氟—正丁基亚磺酰基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基亚磺酰基。

[0107] 所谓“C1—C4烷基磺酰基”，例如表示甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、环丙基磺酰基、正丁基磺酰基、异丁基磺酰基等直链状或支链状或环状的碳原子数为1~4个的烷基磺酰基，所谓“C1—C4卤代烷基磺酰基”，例如表示三氟甲基磺酰基、五氟乙基磺酰基、2,2,2—三氟乙基磺酰基、七氟—正丙基磺酰基、七氟—异丙基磺酰基、九氟—正丁基磺酰基、九氟—仲丁基磺酰基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子

取代的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基磺酰基。

[0108] 所谓“芳基磺酰基”，例如表示苯基磺酰基、对甲苯磺酰基、1-萘基磺酰基、2-萘基磺酰基、蒽基磺酰基、菲基磺酰基、茚基磺酰基等具有芳香环的碳原子数为6~14个的芳基磺酰基。

[0109] 所谓“C1-C4烷基氨基”，例如表示甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基、正丁基氨基、环丙基氨基等直链状、支链状或环状的碳原子数为1~4个的烷基氨基，所谓“二C1-C4烷基氨基”，例如表示二甲基氨基、二乙基氨基、N-乙基-N-甲基氨基等被两个可以相同也可以不同的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基取代的氨基。

[0110] 所谓“C1-C4烷基羰基”，例如表示甲酰基、乙酰基、丙酰基、异丙基羰基、环丙基羰基等直链状、支链状或环状的碳原子数为1~4个的烷基羰基。所谓“C1-C4卤代烷基羰基”，例如表示氟乙酰基、二氟乙酰基、三氟乙酰基、氯乙酰基、二氯乙酰基、三氯乙酰基、溴乙酰基、碘乙酰基、3,3,3-三氟丙酰基、2,2,3,3,3-五氟丙酰基等被可以相同也可以不同的1个以上的卤素原子取代的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基羰基。

[0111] 所谓“C1-C4烷基羰基氧基”，例如表示乙酰氧基、丙酰基氧基等直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基羰基氧基，所谓“C1-C4烷氧基羰基”，例如表示甲氧基羰基、乙氧基羰基、异丙基氧基羰基等直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷氧基羰基。

[0112] 所谓“C1-C6全氟烷基”，例如表示三氟甲基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-异丙基、九氟-正丁基、九氟-2-丁基、九氟-异丁基、全氟-正戊基、全氟-正己基等被氟原子全部取代了的直链状或支链状的碳原子数为1~4个的烷基。

[0113] 所谓“C1-C6全氟烷基硫基”，例如表示三氟甲基硫基、五氟乙基硫基、七氟-正丙基硫基、七氟-异丙基硫基、九氟-正丁基硫基、九氟-2-丁基硫基、九氟-异丁基硫基、全氟-正戊基硫基、全氟-正己基硫基等被氟原子全部取代了的直链状或支链状的碳原子数为1~6个的烷基硫基。

[0114] 所谓“C1-C6全氟烷基亚磺酰基”，例如表示三氟甲基亚磺酰基、五氟乙基亚磺酰基、七氟-正丙基亚磺酰基、七氟-异丙基亚磺酰基、九氟-正丁基亚磺酰基、九氟-2-丁基亚磺酰基、九氟-异丁基亚磺酰基、全氟-正戊基亚磺酰基、全氟-正己基亚磺酰基等被氟原子全部取代了的直链状或支链状的碳原子数为1~6个的烷基亚磺酰基。

[0115] 所谓“C1-C6全氟烷基磺酰基”，例如表示三氟甲基磺酰基、五氟乙基磺酰基、七氟-正丙基磺酰基、七氟-异丙基磺酰基、九氟-正丁基磺酰基、九氟-2-丁基磺酰基、九氟-异丁基磺酰基、全氟-正戊基磺酰基、全氟-正己基磺酰基等被氟原子全部取代了的直链状或支链状的碳原子数为1~6个的烷基磺酰基。

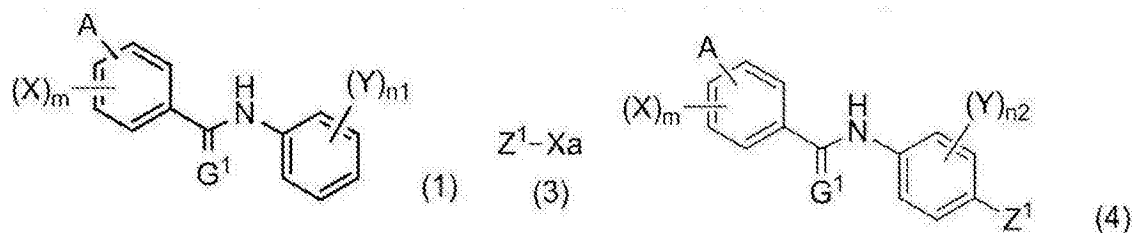
[0116] 对于本发明中的通式(1)及通式(3)等表示的化合物而言，有在其结构式中包含1个或多个的手性碳原子或手性中心的情况，也有存在2种以上的光学异构体的情况。本发明也包含全部的各光学异构体及以任意的比例包含它们的混合物。

[0117] 另外，对于本发明中的通式(1)及通式(3)等表示的化合物而言，还存在在其结构式中存在源自碳-碳双键的2种以上的几何异构体的情况。本发明也包含全部的以任意的比例包含各几何异构体的混合物。

[0118] 本发明的下述通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法包括在碱、及金属或金属盐的存在下使下述通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物与下述通式(3)表示的卤

代烷基化合物反应的工序。根据需要,上述制造方法也可以进一步包含其他工序。

[0119]



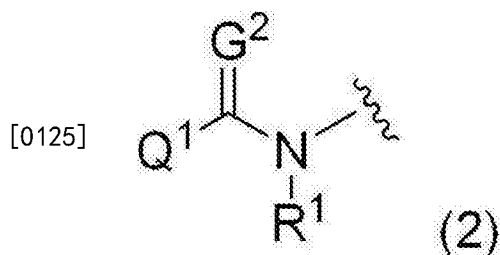
[0120] 通式(1)中,X各自独立地表示氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基。m表示1~4的整数,n1表示1~5的整数。上述X存在多个时,各X可以相同也可以不同。

[0121] G^1 表示氧原子、或硫原子。

[0122] Y各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、或乙酰基氨基。

[0123] 上述Y存在多个时,各Y可以相同也可以不同。

[0124] A表示氢原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、C1—C4烷基氨基羰基、甲基亚磺酰基C1—C4烷基氨基羰基、甲基磺酰基C1—C4烷基氨基羰基、乙酰基氨基、无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基、或下述通式(2)表示的基团。



[0126] 通式(2)中, G^2 表示氧原子、或硫原子。

[0127] R^1 表示氢原子、C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。

[0128] Q^1 表示C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、无取代的苯基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4卤代烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的苯基、或者无取代的杂环基、或具有选自卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C2—C4链烯基、C2—C4卤代链烯基、C2—C4炔基、C2—C4卤代炔基、C3—C6环烷基、C3—C6卤代环烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、C1—C4卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、C1—C4烷基氨基、二C1—C4烷基氨基、氰基、硝基、羟基、C1—C4烷基羰基、C1—C4烷基羰基、C1—C4烷基羰基氧基、C1—C4烷氧基羰基、乙酰基氨基及苯基中的1个以上的可以相同也可以不同的取代基的杂环基。

[0129] 需要说明的是,通式(1)中的杂环基表示吡啶基、吡啶—N—氧化物基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。

[0130] 本发明中的通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物是在制造作为杀虫剂有用的通式(10)表示的化合物方面特别有用的制造中间体。

[0131] 通式(1)中的取代基X为氢原子、卤素原子、硝基、氰基、C1—C4烷氧基、或二甲基氨基,优选为卤素原子、硝基、氰基、或二甲基氨基。 m 为1~4的整数,更优选为1~3的整数。

[0132] 另外,取代基A优选为C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基、具有取代基的苯基、卤素原子、硝基、氰基或上述通式(2)表示的基团。

[0133] 通式(2)中的取代基 G^2 为氧原子、或硫原子,优选为氧原子。

[0134] 取代基 Q^1 优选为无取代的苯基、具有取代基的苯基、或无取代的杂环基、具有取代基的杂环基、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷氧基、C1—C4卤代烷氧基。

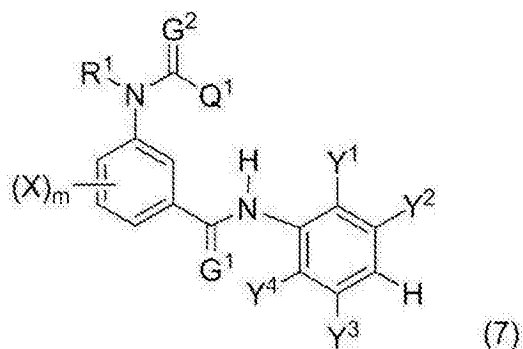
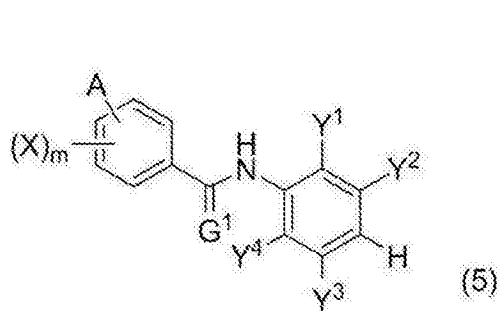
[0135] 取代基 R^1 优选为氢原子、C1—C6烷基或C1—C6卤代烷基。

[0136] 取代基Y优选为氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。 n_1 为1~5的整数,更优选为1~3的整数。

[0137] 上述通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物优选为下述通式(5)表示的芳香族酰胺衍

生物,更优选为下述通式(7)表示的芳香族酰胺衍生物。

[0138]



[0139] 通式(5)中, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 各自独立地表示氢原子、卤素原子、C1—C6烷基、C1—C6卤代烷基、C1—C4烷基硫基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4烷基亚磺酰基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、C1—C4烷基磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。 X 、 m 、 G^1 及 A 分别与上述通式(1)中的 X 、 m 、 G^1 及 A 含义相同。

[0140] 通式(5)中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 各自独立地优选为氢原子、卤素原子、C1—C6卤代烷基、C1—C4卤代烷基硫基、C1—C4卤代烷基亚磺酰基、或C1—C4卤代烷基磺酰基。

[0141] 通式(7)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式(2)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 分别与上述通式(5)中的 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及 Y^4 含义相同。

[0142] 通式(7)表示的化合物例如可以以2-氨基三氟甲苯和苯甲酸衍生物为原料来制造。苯甲酸衍生物可以以2-氯-3-硝基苯甲酸为原料,利用W02010/18857号中记载的方法来制造。

[0143] 通式(3)中的 Z^1 表示C1—C6烷基、或C1—C6卤代烷基。优选为C1—C6卤代烷基,更优选为C1—C6全氟烷基。

[0144] X_a 表示碘原子或溴原子。

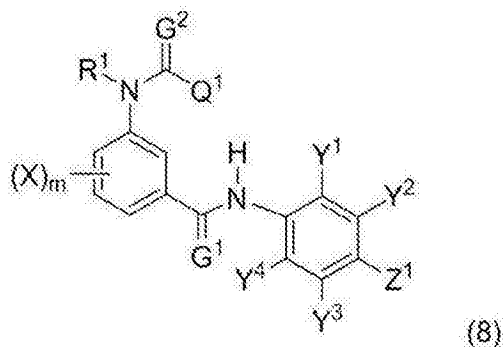
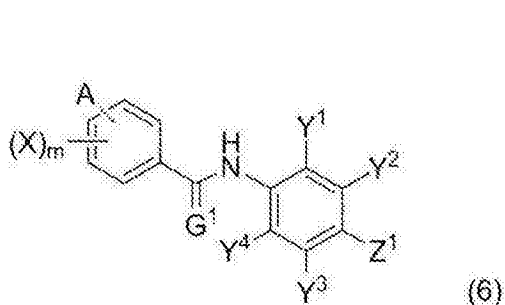
[0145] 通式(4)中的 n_2 表示1~4的整数,优选为1~3的整数。

[0146] Z^1 与上述通式(3)中的 Z^1 含义相同,优选方式也相同。

[0147] X 、 m 、 G^1 、 Y 及 A 分别与上述通式(1)中的 X 、 m 、 G^1 、 Y 及 A 含义相同,优选方式也相同。

[0148] 上述通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物优选为下述通式(6)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,更优选为下述通式(8)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物。

[0149]



[0150] 通式(6)中的 Z^1 与上述通式(3)中的 Z^1 含义相同,优选方式也相同。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 分别与上述通式(5)中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 及 A 含义相同,优选方式也相同。

[0151] 通式(8)中的 Z^1 与上述通式(3)中的 Z^1 含义相同,优选方式也相同。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式(7)中的 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同,优选方式也相同。

[0152] 作为在通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物与通式(3)表示的卤代烷基化合物的反应中使用的金属,可例举锂、钠、钾、镁、锌、铝、锰、钨、锡、铬、金、铂、银、铜、铁、镍、钴、铅、钛及它们的合金。其中,优选为选自铜、铁及锌中的至少1种。

[0153] 另外,作为在上述反应中使用的金属盐,可举出显示2价的铁金属盐,具体为硫酸铵铁(II)、氟化铁(II)、氯化铁(II)、溴化铁(II)、碘化铁(II)、硫酸铁(II)、草酸铁(II)、六氰合铁(II)酸钾、葡糖酸铁(II) n 水合物、硫酸三(1,10-菲咯啉)铁(II)、六氰合铁(II)酸铵铁(III)、硬脂酸铁(II)、六氰合铁(II)酸铵、富马酸铁(II)、乙酸铁(II)、环烷酸铁(II)、四氟硼酸铁(II)、氨基磺酸铁(II)、氧化铁(II)钛、乙二铵硫酸铁(II);及显示1价的铜金属,具体为氯化铜(I)、氰化铜(I)、溴化铜(I)、碘化铜(I)、硫化铜(I)、乙酸铜(I)、三氟甲烷硫醇铜(I)、硫氰酸铜(I);或碘化钐(II)等。其中,优选为氯化铁(II)、硫酸铁(II)、硫酸铁(II)水合物。

[0154] 上述金属及金属盐可以单独使用,也可混合2种以上来使用。对其使用量没有特别限制,通常相对于作为反应原料的通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物,在0.01倍摩尔当量~5倍摩尔当量的范围、优选1倍摩尔当量~2倍摩尔当量的范围内适当选择使用即可。

[0155] 作为上述反应中使用的碱,可举出三乙基胺、三正丁基胺、吡啶、4-二甲基氨基吡啶等有机碱类、氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属氢氧化物类、碳酸氢钠、碳酸钾等碳酸盐类、磷酸氢二钾、磷酸三钠等磷酸盐类、氢化钠等氢化碱金属盐类、甲醇钠、乙醇钠等碱金属醇化物类等。

[0156] 其中,特别优选使用氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属氢氧化物类。

[0157] 对于这些碱而言,相对于通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物,在0.01倍摩尔当量~10倍摩尔当量的范围、优选5倍摩尔当量~10倍摩尔当量的范围内适当选择使用即可。

[0158] 上述反应可以在无溶剂下进行,还可以在惰性溶剂的存在下进行。

[0159] 作为在惰性溶剂的存在下进行的情况下的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行,就没有特别限制。例如,可示出水;苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤化烃类;乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷等链状或环状醚类;乙酸乙酯、乙酸丁酯等酯类;甲醇、乙醇等醇类;丙酮、甲基异丁基酮、环己酮等酮类; N,N -二甲基甲酰胺、 N,N -二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮(1,3-dimethyl-2-imidazolidinone)、 N -甲基-2-吡咯烷酮等酰胺类;乙腈等腈类;二甲基亚砷等惰性溶剂。这些溶剂可以单独使用或混合2种以上来使用。

[0160] 其中,特别优选使用 N,N -二甲基甲酰胺、 N,N -二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、 N -甲基-2-吡咯烷酮等酰胺类、二甲基亚砷。

[0161] 对于这些惰性溶剂的使用量而言,相对于通式(1)表示的芳香族酰胺衍生物,在2重量倍~20重量倍的范围、优选5重量倍~15重量倍的范围适当选择使用即可。

[0162] 使上述反应中的反应温度在 -20°C ~ 200°C 的范围、当使用惰性溶剂时在其沸点以下即可。另外,反应时间在数分钟~96小时的范围内分别适当选择即可。

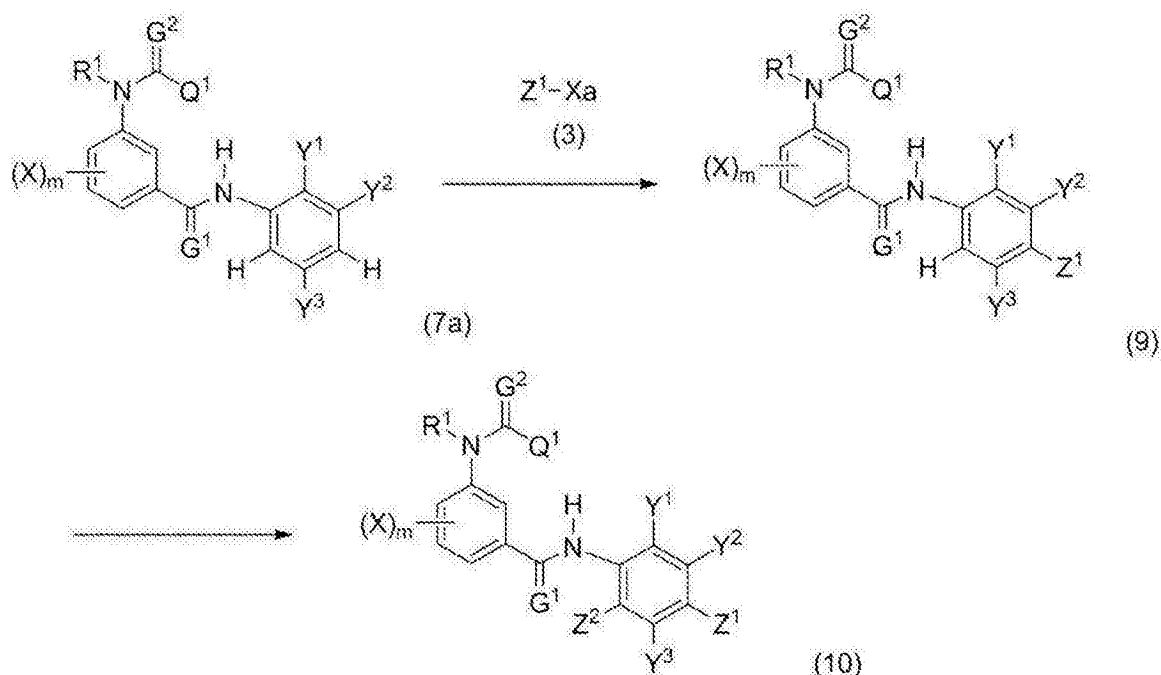
[0163] 对于上述反应中的通式(3)表示的卤代烷基化合物相对于通式(1)表示的芳香族

酰胺衍生物的混合比没有特别限制。从经济性的观点考虑,优选1倍摩尔当量~3倍摩尔当量。

[0164] 在上述示出的制造方法中,对于作为目标物的通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物而言,在反应结束后,按照常规方法从反应体系中分离即可,但根据需要,可进行重结晶、柱色谱、蒸馏等操作来进行纯化。

[0165] 本发明的通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物的制造方法包括以下工序:第一工序,在碱、及金属或金属盐的存在下使下述通式(7a)表示的芳香族酰胺衍生物与下述通式(3)表示的卤代烷基化合物反应,得到下述通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物;和第二工序,在碱性条件下将上述通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化。根据需要,上述制造方法也可以进一步包含其他工序。

[0166]



[0167] 通式(7a)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 分别与上述通式(2)中的 G^2 、 Q^1 及 R^1 含义相同。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 分别与上述通式(5)中的 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 含义相同。

[0168] 通式(9)中的 Z^1 与通式(3)中的 Z^1 含义相同。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 分别与上述通式(7a)中的 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 及 Y^3 含义相同。

[0169] 关于上述第一工序的详细情况,与上文说明的通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法相同。

[0170] 在上述第二工序中,通过在碱性条件下将通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物卤化,可制造通式(10)表示的卤化芳香族酰胺衍生物。对于上述第二工序而言,例如,可在碱性条件下、惰性溶剂中或无溶剂下使用通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物和卤化剂来进行。

[0171] 作为卤化剂,只要能将氢原子转化为氯原子、溴原子或碘原子,就没有特别限制。具体而言,例如,可示出氯、溴、碘、硫酰氯、N-氯代丁二酰亚胺、N-溴代丁二酰亚胺、N-碘代丁二酰亚胺、一氯化碘、1,3-二溴-5,5-二甲基乙内酰脲、1,3-二碘-5,5-二甲基乙

内酰胺等。

[0172] 对于上述反应中的卤化剂的使用量而言,相对于通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,优选为1.0倍摩尔当量~5倍摩尔当量,更优选为1.01倍摩尔当量~1.5倍摩尔当量。

[0173] 作为在上述反应中使用的惰性溶剂,只要不显著阻碍本反应的进行,就没有特别限制。例如,可示出水;苯、甲苯、二甲苯等芳香族烃类;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等卤化烃类;乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷等链状或环状醚类;乙酸乙酯、乙酸丁酯等酯类;甲醇、乙醇等醇类;丙酮、甲基异丁基酮、环己酮等酮类;N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等酰胺类;乙腈等腈类;二甲基亚砷等惰性溶剂。这些溶剂可以单独使用或混合2种以上来使用。

[0174] 其中,特别优选使用N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、1,3-二甲基-2-咪唑烷酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等酰胺类;二甲基亚砷。

[0175] 对于这些惰性溶剂的使用量而言,相对于通式(9)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物,在2重量倍~10重量倍的范围、优选3重量倍~8重量倍的范围适当选择使用即可。

[0176] 另外,作为上述反应中使用的碱,可举出三乙基胺、三正丁基胺、吡啶、4-二甲基氨基吡啶等有机碱类、氢氧化钠、氢氧化钾等碱金属氢氧化物类、碳酸氢钠、碳酸钾等碳酸盐类、磷酸氢二钾、磷酸三钠等磷酸盐类、氢化钠等氢化碱金属盐类、甲醇钠、乙醇钠等碱金属醇化物类等。

[0177] 其中,特别优选使用氢化钠等氢化碱金属盐类、氢氧化钠等碱金属氢氧化物类。

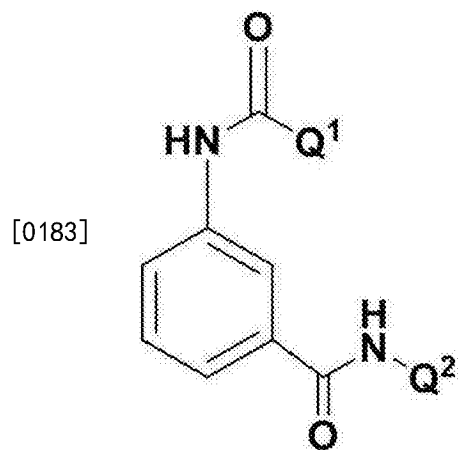
[0178] 对于这些碱而言,相对于通式(9)表示的芳香族酰胺衍生物,在0.01倍摩尔当量~5倍摩尔当量的范围、优选1倍摩尔当量~3倍摩尔当量的范围适当选择使用即可。

[0179] 使反应温度在例如-20℃~200℃的范围、当使用惰性溶剂时在其沸点以下即可。另外,反应时间在数分钟~96小时的范围内分别适当选择即可。

[0180] 在上述示出的制造方法中,对于目标物而言,在反应结束后,按照常规方法从反应体系中分离即可,但根据需要,可进行重结晶、柱色谱、蒸馏等操作来将其纯化。

[0181] 以下,在第1表~第3表中示出了作为本发明的有效中间体的通式(7)表示的化合物的代表化合物,但本发明不限于此。

[0182] 需要说明的是,表中,分别地,“Me”表示甲基,“Et”表示乙基,“H”表示氢原子,“F”表示氟原子,“Cl”表示氯原子,“Br”表示溴原子,“I”表示碘原子,“CF₃”表示三氟甲基。



[0184] [表1]

[0185] 第1表(1)

[0186]

化合物编号	Q ₁	Q ₂
1	苯基	2,6-二氯苯基
2	2-氟苯基	2,6-二溴苯基
3	4-氟苯基	2,6-二溴苯基
4	4-硝基苯基	2,6-二溴苯基
5	4-氰基苯基	2,6-二溴苯基
6	2-氯吡啶-3-基	2,6-二溴苯基
7	苯基	2,6-二甲基苯基
8	2-氟苯基	2,6-二甲基苯基
9	4-氟苯基	2,6-二甲基苯基
10	4-硝基苯基	2,6-二甲基苯基
11	4-氰基苯基	2,6-二甲基苯基
12	2-氯吡啶-3-基	2,6-二甲基苯基
13	苯基	2-溴-6-甲基苯基
14	苯基	2-乙基-6-甲基苯基
15	4-氟苯基	2-乙基-6-甲基苯基
16	苯基	2-碘-6-甲基苯基
17	苯基	2-羟基-6-甲基苯基
18	苯基	2-氯-6-乙基苯基
19	苯基	2-溴-6-乙基苯基
20	4-氟苯基	2-溴-6-乙基苯基
21	苯基	2-乙基-6-碘苯基
22	4-氟苯基	2-乙基-6-碘苯基
23	4-硝基苯基	2-乙基-6-碘苯基
24	4-氰基苯基	2-乙基-6-碘苯基
25	4-硝基苯基	2-甲基-6-正丙基苯基
26	苯基	2-异丙基-6-甲基苯基
27	4-氟苯基	2-异丙基-6-甲基苯基
28	苯基	2-溴-6-正丙基苯基
29	4-氟苯基	2-溴-6-正丙基苯基
30	4-硝基苯基	2-溴-6-正丙基苯基
31	4-氰基苯基	2-溴-6-正丙基苯基
32	苯基	2-碘-6-正丙基苯基
33	4-氟苯基	2-碘-6-正丙基苯基
34	4-硝基苯基	2-碘-6-正丙基苯基
35	4-氰基苯基	2-碘-6-正丙基苯基

36	4-三氟甲基苯基	2-碘-6-正丙基苯基
37	苯基	2-氯-6-正丁基苯基
38	4-氟苯基	2-氯-6-正丁基苯基
39	苯基	2-溴-6-正丁基苯基
40	4-氟苯基	2-溴-6-正丁基苯基

[0187] [表2]

[0188] 第1表(2)

[0189]

化合物编号	Q ₁	Q ₂
41	苯基	2-碘-6-正丁基苯基
42	4-氟苯基	2-碘-6-正丁基苯基
43	苯基	2-(2-丁基)-6-氯苯基
44	苯基	2-溴-6-(2-丁基)苯基
45	4-氟苯基	2-溴-6-(2-丁基)苯基
46	苯基	2-(2-丁基)-6-碘苯基
47	4-氟苯基	2-溴-6-氰基苯基
48	苯基	2-溴-6-甲基硫基苯基
49	4-氟苯基	2-溴-6-甲基硫基苯基
50	苯基	2-溴-6-(甲基亚磺酰基)苯基
51	4-氟苯基	2-氯-6-(甲基磺酰基)苯基
52	2-氯吡啶-3-基	2-氯-6-(甲基磺酰基)苯基
53	苯基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
54	4-氟苯基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
55	4-氟苯基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
56	4-硝基苯基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
57	4-氰基苯基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
58	2-氯吡啶-3-基	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
59	苯基	2-甲基硫基甲基-6-三氟甲基苯基
60	苯基	2-溴-6-(三氟甲基硫基)苯基
61	苯基	2-三氟甲基苯基
62	2-氟苯基	2-三氟甲基苯基
63	4-氟苯基	2-三氟甲基苯基
64	4-硝基苯基	2-三氟甲基苯基
65	4-氰基苯基	2-三氟甲基苯基
66	2-氯吡啶-3-基	2-三氟甲基苯基
67	苯基	2-五氟乙基苯基
68	2-氟苯基	2-五氟乙基苯基
69	4-氟苯基	2-五氟乙基苯基
70	4-硝基苯基	2-五氟乙基苯基

71	4-氰基苯基	2-五氟乙基苯基
72	2-氯吡啶-3-基	2-五氟乙基苯基
73	苯基	2-甲基苯基
74	2-氟苯基	2-甲基苯基
75	4-氟苯基	2-甲基苯基
76	4-硝基苯基	2-甲基苯基
77	4-氰基苯基	2-甲基苯基
78	2-氯吡啶-3-基	2-甲基苯基
79	苯基	2-氟苯基
80	2-氟苯基	2-氟苯基

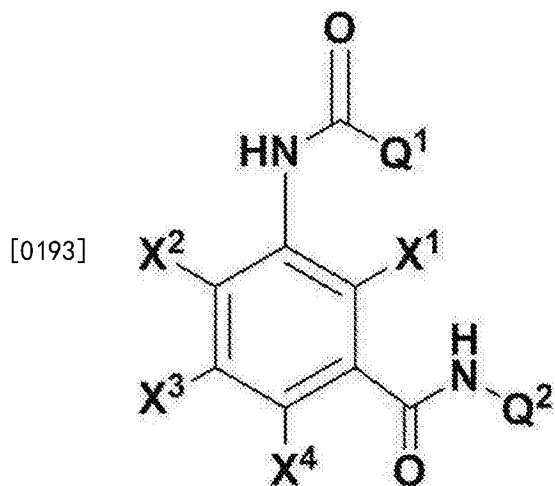
[0190] [表3]

[0191] 第1表 (3)

[0192]

化合物编号	Q ₁	Q ₂
81	4-氟苯基	2-氟苯基
82	4-硝基苯基	2-氟苯基
83	4-氰基苯基	2-氟苯基
84	2-氯吡啶-3-基	2-氟苯基
85	苯基	2-氯苯基
86	2-氟苯基	2-氯苯基
87	4-氟苯基	2-氯苯基
88	4-硝基苯基	2-氯苯基
89	4-氰基苯基	2-氯苯基
90	2-氯吡啶-3-基	2-氯苯基
91	苯基	2-溴苯基
92	2-氟苯基	2-溴苯基
93	4-氟苯基	2-溴苯基
94	4-硝基苯基	2-溴苯基
95	4-氰基苯基	2-溴苯基
96	2-氯吡啶-3-基	2-溴苯基
97	苯基	2-碘苯基
98	2-氟苯基	2-碘苯基
99	4-氟苯基	2-碘苯基
100	4-硝基苯基	2-碘苯基
101	4-氰基苯基	2-碘苯基
102	2-氯吡啶-3-基	2-碘苯基
103	苯基	2-碘苯基
104	2-氟苯基	2-碘苯基
105	4-氟苯基	2-碘苯基

106	4-硝基苯基	2-碘苯基
107	4-氰基苯基	2-碘苯基
108	2-氯吡啶-3-基	2-碘苯基
109	苯基	2-三氟甲基硫基苯基
110	2-氟苯基	2-三氟甲基硫基苯基
111	4-氟苯基	2-三氟甲基硫基苯基
112	4-硝基苯基	2-三氟甲基硫基苯基
113	4-氰基苯基	2-三氟甲基硫基苯基
114	2-氯吡啶-3-基	2-三氟甲基硫基苯基



[0194] [表4]

[0195] 第2表 (1)

[0196]

化合物编号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
115	苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
116	2-氟苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
117	4-氟苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
118	4-硝基苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
119	4-氰基苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
120	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
121	苯基	H	Cl	H	H	2,6-二甲基苯基
122	苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
123	4-硝基苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
124	4-氰基苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
125	2-氟苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
126	4-氟苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
127	4-三氟甲基苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
128	2,4-二氟苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
129	2-氯吡啶-3-基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
130	苯基	H	H	CF ₃	H	2,6-二甲基苯基
131	苯基	H	H	H	F	2,6-二甲基苯基
132	苯基	H	H	H	Cl	2,6-二甲基苯基
133	苯基	H	H	H	Br	2,6-二甲基苯基
134	苯基	H	H	H	I	2,6-二甲基苯基
135	苯基	F	H	H	F	2,6-二甲基苯基
136	苯基	H	Br	H	Br	2,6-二甲基苯基
137	苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
138	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
139	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
140	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
141	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
142	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
143	苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
144	2-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
145	4-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
146	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
147	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
148	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
149	苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基
150	2-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基
151	4-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基
152	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基

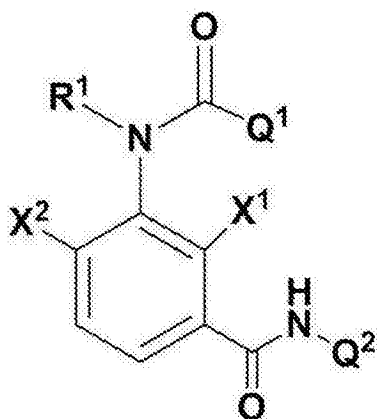
[0197] [表5]

[0198] 第2表(2)

[0199]

化合物编号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
153	4-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基
154	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-甲基苯基
155	苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
156	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
157	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
158	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
159	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
160	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氟苯基
161	苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
162	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
163	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
164	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
165	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
166	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氯苯基
167	苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
168	2-氟苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
169	4-氟苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
170	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
171	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
172	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-溴苯基
173	苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
174	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
175	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
176	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
177	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
178	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘苯基
179	苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
180	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
181	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
182	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
183	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
184	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘苯基
185	苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
186	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
187	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
188	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
189	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
190	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基硫基苯基

[0200]



[0201] [表6]

[0202] 第3表(1)

[0203]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
191	苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
192	2-甲基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
193	4-甲基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
194	2-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
195	3-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
196	4-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
197	2-氯苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
198	4-氯苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
199	2-溴苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
200	2-碘苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
201	3-氰基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
202	4-氰基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
203	2-硝基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
204	3-硝基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
205	4-硝基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
206	2-三氟甲基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
207	4-三氟甲基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
208	4-三氟甲氧基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
209	2,3-二氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
210	2,4-二氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
211	2,5-二氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
212	2,6-二氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
213	2,4-二氯苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
214	2,6-二氯苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
215	3,4-二氯苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
216	2-氯-4-硝基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
217	2-氯-4-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
218	2-氯-6-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
219	4-氯-2-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
220	4-氯-2-硝基苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
221	2,3,6-三氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
222	3-(乙酰氨基)苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
223	吡啶-2-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
224	吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
225	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
226	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
227	2-氯吡啶-5-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
228	2-三氟甲基吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基

[0204] [表7]

[0205] 第3表 (2)

[0206]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
229	2-甲基硫基吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
230	吡嗪-2-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
231	呋喃-2-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
232	呋喃-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
233	2-四氢呋喃基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
234	苯并呋喃-2-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
235	噻吩-2-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
236	苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
237	2-甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
238	4-甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
239	2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
240	3-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
241	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
242	2-氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
243	4-氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
244	2-溴苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
245	2-碘苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
246	3-氰基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
247	4-氰基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
248	2-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
249	3-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
250	4-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
251	2-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基

[0207] [表8]

[0208] 第3表 (3)

[0209]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
252	4-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
253	4-三氟甲氧基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
254	2,3-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
255	2,4-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
256	2,5-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
257	2,6-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
258	2,4-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
259	2,6-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
260	3,4-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
261	2-氯-4-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
262	2-氯-4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
263	2-氯-6-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
264	4-氯-2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
265	4-氯-2-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
266	2,3,6-三氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
267	吡啶-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
268	吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
269	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
270	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
271	2-氯吡啶-5-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
272	2-甲基磺基吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
273	吡嗪-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
274	咪唑-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
275	噻吩-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基

[0210] [表9]

[0211] 第3表(4)

[0212]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
276	苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
277	2-甲基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
278	4-甲基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
279	2-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
280	3-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
281	4-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
282	2-氯苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
283	4-氯苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
284	2-溴苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
285	2-碘苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
286	3-氰基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
287	4-氰基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
288	2-硝基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
289	3-硝基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
290	4-硝基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
291	2-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
292	4-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
293	4-三氟甲氧基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
294	2,3-二氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
295	2,4-二氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
296	2,5-二氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
297	2,6-二氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
298	2,4-二氯苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
299	2,6-二氯苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
300	3,4-二氯苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
301	2-氯-4-硝基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
302	2-氯-4-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
303	2-氯-6-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
304	4-氯-2-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
305	4-氯-2-硝基苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
306	2,3,6-三氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
307	吡啶-2-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
308	吡啶-3-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
309	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基

[0213] [表10]

[0214] 第3表(5)

[0215]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
310	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
311	2-氯吡啶-5-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
312	2-甲基硫基吡啶-3-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
313	吡嗪-2-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基

314	呋喃-2-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
315	2-氟苯基	Et	H	H	2,6-二甲基苯基
316	吡啶-3-基	Et	H	H	2,6-二甲基苯基
317	苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
318	2-甲基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
319	3-甲基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
320	4-甲基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
321	2-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
322	3-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
323	4-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
324	2-氰基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
325	3-氰基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
326	4-氰基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
327	2-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
328	3-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
329	4-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
330	2-氯苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
331	4-氯苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
332	2-溴苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
333	2-碘苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
334	2-三氟甲基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
335	4-三氟甲基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
336	4-三氟甲氧基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
337	2,3-二氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
338	2,4-二氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
339	2,5-二氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
340	2,6-二氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
341	2,4-二氯苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
342	2,6-二氯苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
343	3,4-二氯苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
344	2-氟-4-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
345	4-氟-2-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
346	2-氯-4-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
347	4-氯-2-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
348	2-氯-6-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
349	2-氯-4-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基

[0216] [表11]

[0217] 第3表 (6)

[0218]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
350	4-氯-2-硝基苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
351	2,3,6-三氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
352	吡啶-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
353	吡啶-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
354	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
355	2-氟吡啶-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
356	2-氯吡啶-5-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
357	2-甲基硫基吡啶-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
358	吡嗪-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
359	呋喃-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
360	呋喃-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
361	2-四氢呋喃基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
362	苯并呋喃-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
363	噻吩-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
364	苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
365	2-甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
366	4-甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
367	2-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
368	3-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
369	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
370	2-氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
371	4-氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
372	2-溴苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
373	2-碘苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
374	3-氟基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
375	4-氟基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
376	2-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
377	3-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
378	4-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基

[0219] [表12]

[0220] 第3表(7)

[0221]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
379	2-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
380	4-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
381	4-三氟甲氧基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
382	2,3-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
383	2,4-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
384	2,5-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
385	2,6-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
386	2,4-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
387	2,6-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
388	3,4-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
389	2-氯-4-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
390	2-氯-4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
391	2-氯-6-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
392	4-氯-2-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
393	4-氯-2-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
394	2,3,6-三氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
395	吡啶-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
396	吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
397	2-氟吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
398	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
399	2-氯吡啶-5-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
400	2-甲基硫基吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
401	吡嗪-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
402	咪唑-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
403	噻吩-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基

[0222] [表13]

[0223] 第3表(8)

[0224]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
404	苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
405	2-甲基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
406	4-甲基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
407	2-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
408	3-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
409	4-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
410	2-氯苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
411	4-氯苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
412	2-溴苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
413	2-碘苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
414	3-氰基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
415	4-氰基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
416	2-硝基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
417	3-硝基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
418	4-硝基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
419	2-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
420	4-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
421	4-三氟甲氧基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
422	2,3-二氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
423	2,4-二氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
424	2,5-二氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
425	2,6-二氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
426	2,4-二氯苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
427	2,6-二氯苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
428	3,4-二氯苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
429	2-氯-4-硝基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
430	2-氯-4-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
431	2-氯-6-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
432	4-氯-2-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
433	4-氯-2-硝基苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
434	2,3,6-三氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
435	吡啶-2-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
436	吡啶-3-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
437	2-氟吡啶-3-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
438	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
439	2-氯吡啶-5-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基

[0225] [表14]

[0226] 第3表 (9)

[0227]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
440	2-甲基硫基吡啶-3-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
441	吡嗪-2-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
442	呋喃-2-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
443	噻吩-2-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
444	苯基	Et	F	H	2,6-二甲基苯基
445	苯基	Me	H	F	2,6-二甲基苯基
446	4-硝基苯基	Me	H	F	2,6-二甲基苯基
447	4-氰基苯基	Me	H	F	2,6-二甲基苯基
448	苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
449	4-硝基苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
450	4-氰基苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺酰基)苯基
451	苯基	Me	H	F	2-正丙基-6-碘苯基
452	4-硝基苯基	Me	H	F	2-正丙基-6-碘苯基
453	4-氰基苯基	Me	H	F	2-正丙基-6-碘苯基
454	苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
455	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
456	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
457	4-硝基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
458	4-氰基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
459	2-氰吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
460	苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
461	2-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
462	4-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
463	4-硝基苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
464	4-氰基苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
465	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
466	苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
467	2-氟苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
468	4-氟苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
469	4-硝基苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
470	4-氰基苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
471	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-甲基苯基
472	苯基	Me	H	H	2-氟苯基
473	2-氟苯基	Me	H	H	2-氟苯基
474	4-氟苯基	Me	H	H	2-氟苯基
475	4-硝基苯基	Me	H	H	2-氟苯基
476	4-氰基苯基	Me	H	H	2-氟苯基

[0228] [表15]

[0229] 第3表(10)

[0230]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
477	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氟苯基
478	苯基	Me	H	H	2-氯苯基
479	2-氟苯基	Me	H	H	2-氯苯基
480	4-氟苯基	Me	H	H	2-氯苯基
481	4-硝基苯基	Me	H	H	2-氯苯基
482	4-氰基苯基	Me	H	H	2-氯苯基
483	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氯苯基
484	苯基	Me	H	H	2-溴苯基
485	2-氟苯基	Me	H	H	2-溴苯基
486	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴苯基
487	4-硝基苯基	Me	H	H	2-溴苯基
488	4-氰基苯基	Me	H	H	2-溴苯基
489	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴苯基
490	苯基	Me	H	H	2-碘苯基
491	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘苯基
492	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘苯基
493	4-硝基苯基	Me	H	H	2-碘苯基
494	4-氰基苯基	Me	H	H	2-碘苯基
495	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘苯基
496	苯基	Me	H	H	2-碘苯基
497	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘苯基
498	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘苯基
499	4-硝基苯基	Me	H	H	2-碘苯基
500	4-氰基苯基	Me	H	H	2-碘苯基
501	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘苯基
502	苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
503	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
504	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
505	4-硝基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
506	4-氰基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
507	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基苯基
508	苯基	Et	H	H	2-三氟甲基苯基
509	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基
510	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基
511	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基

[0231] [表16]

[0232] 第3表(11)

[0233]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
512	4-硝基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基
513	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基
514	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-三氟甲基苯基
515	苯基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
516	2-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
517	4-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
518	4-硝基苯基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
519	4-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
520	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-五氟乙基苯基
521	苯基	Me	F	H	2-甲基苯基
522	2-氟苯基	Me	F	H	2-甲基苯基
523	4-氟苯基	Me	F	H	2-甲基苯基
524	4-硝基苯基	Me	F	H	2-甲基苯基
525	4-氟苯基	Me	F	H	2-甲基苯基
526	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-甲基苯基
527	苯基	Me	F	H	2-氟苯基
528	2-氟苯基	Me	F	H	2-氟苯基
529	4-氟苯基	Me	F	H	2-氟苯基
530	4-硝基苯基	Me	F	H	2-氟苯基
531	4-氟苯基	Me	F	H	2-氟苯基
532	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-氟苯基
533	苯基	Me	F	H	2-氯苯基
534	2-氟苯基	Me	F	H	2-氯苯基
535	4-氟苯基	Me	F	H	2-氯苯基
536	4-硝基苯基	Me	F	H	2-氯苯基
537	4-氟苯基	Me	F	H	2-氯苯基
538	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-氯苯基
539	苯基	Me	F	H	2-溴苯基

[0234] [表17]

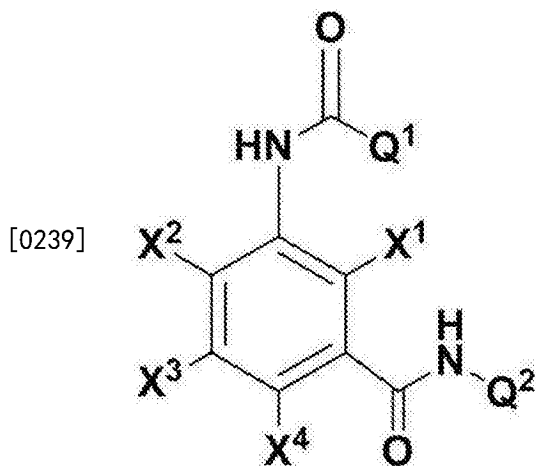
[0235] 第3表 (12)

[0236]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
540	2-氟苯基	Me	F	H	2-溴苯基
541	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴苯基
542	4-硝基苯基	Me	F	H	2-溴苯基
543	4-氰基苯基	Me	F	H	2-溴苯基
544	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴苯基
545	苯基	Me	F	H	2-碘苯基
546	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
547	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
548	4-硝基苯基	Me	F	H	2-碘苯基
549	4-氰基苯基	Me	F	H	2-碘苯基
550	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘苯基
551	苯基	Me	F	H	2-碘苯基
552	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
553	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
554	4-硝基苯基	Me	F	H	2-碘苯基
555	4-氰基苯基	Me	F	H	2-碘苯基
556	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘苯基
557	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基硫基苯基
558	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基硫基苯基
559	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基硫基苯基
560	4-硝基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基硫基苯基

[0237] 以下,在第4表~第5表中示出了作为本发明的有效中间体的通式(9)表示的化合物的代表化合物,但本发明不限于此。

[0238] 需要说明的是,表中,分别地,“Me”表示甲基,“Et”表示乙基,“H”表示氢原子,“F”表示氟原子,“Cl”表示氯原子,“Br”表示溴原子,“I”表示碘原子,“CF₃”表示三氟甲基。



[0240] [表18]

[0241] 第4表(1)

[0242]

化合物编号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
561	苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
562	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
563	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
564	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
565	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
566	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
567	苯基	H	H	CF ₃	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
568	苯基	H	H	H	F	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
569	苯基	H	H	H	Cl	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
570	苯基	H	H	H	Br	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
571	苯基	H	H	H	I	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
572	苯基	F	H	H	F	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
573	苯基	H	Br	H	Br	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
574	苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
575	2-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
576	4-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
577	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
578	4-氰基苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
579	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
580	苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基

[0243] [表19]

[0244] 第4表(2)

[0245]

化合物编号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
581	2-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
582	4-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
583	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
584	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
585	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
586	苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
587	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
588	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
589	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
590	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
591	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
592	苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
593	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
594	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
595	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
596	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
597	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
598	苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
599	2-氟苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基

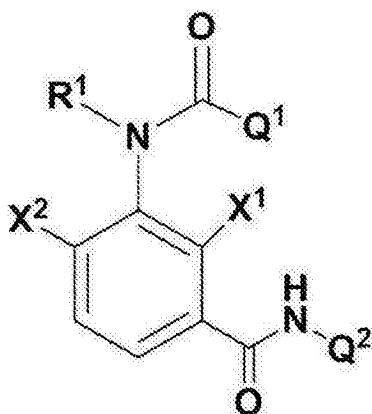
[0246] [表20]

[0247] 第4表(3)

[0248]

化合物编号	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
600	4-氟苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
601	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
602	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
603	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
604	苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
605	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
606	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
607	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
608	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
609	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
610	苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
611	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
612	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
613	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
614	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
615	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
616	苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
617	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
618	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
619	4-硝基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
620	4-氟基苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
621	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基

[0249]



[0250] [表21]

[0251] 第5表(1)

[0252]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
622	苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
623	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
624	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
625	4-硝基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
626	4-氟基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
627	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
628	苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
629	2-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
630	4-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
631	4-硝基苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
632	4-氟基苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
633	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
634	苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
635	2-氟苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
636	4-氟苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
637	4-硝基苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
638	4-氟基苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
639	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
640	苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
641	2-氟苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
642	4-氟苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
643	4-硝基苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
644	4-氟基苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基

[0253] [表22]

[0254] 第5表(2)

[0255]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
645	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
646	苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
647	2-氟苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
648	4-氟苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
649	4-硝基苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
650	4-氰基苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
651	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
652	苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
653	2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
654	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
655	4-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
656	4-氰基苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
657	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
658	苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
659	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
660	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
661	4-硝基苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
662	4-氰基苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
663	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
664	苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基

[0256] [表23]

[0257] 第5表(3)

[0258]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
665	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
666	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
667	4-硝基苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
668	4-氟基苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
669	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
670	苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
671	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
672	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
673	4-硝基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
674	4-氟基苯基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
675	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
676	苯基	Et	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
677	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
678	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
679	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
680	4-硝基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
681	4-氟基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
682	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基
683	苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
684	2-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
685	4-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
686	4-硝基苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基

[0259] [表24]

[0260] 第5表(4)

[0261]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
687	4-氟基苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
688	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟异丙基)苯基
689	苯基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
690	2-氟苯基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
691	4-氟苯基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
692	4-硝基苯基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
693	4-氟基苯基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
694	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基
695	苯基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
696	2-氟苯基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
697	4-氟苯基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
698	4-硝基苯基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
699	4-氟基苯基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
700	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-氟-4-(七氟异丙基)苯基
701	苯基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
702	2-氟苯基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
703	4-氟苯基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
704	4-硝基苯基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
705	4-氟基苯基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
706	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-氯-4-(七氟异丙基)苯基
707	苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
708	2-氟苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基

[0262] [表25]

[0263] 第5表(5)

[0264]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
709	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
710	4-硝基苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
711	4-氟基苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
712	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟异丙基)苯基
713	苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
714	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
715	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
716	4-硝基苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
717	4-氟基苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
718	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
719	苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
720	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
721	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
722	4-硝基苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
723	4-氟基苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
724	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟异丙基)苯基
725	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
726	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
727	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
728	4-硝基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
729	4-氟基苯基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
730	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-三氟甲基磺基-4-(七氟异丙基)苯基
731	苯基	Et	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟异丙基)苯基

[0265] [表26]

[0266] 第5表(6)

[0267]

化合物编号	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
732	苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
733	2-氟苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
734	4-氟苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
735	4-硝基苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
736	4-氰基苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
737	2-氯吡啶-3-基	Me	MeO	H	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
738	苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
739	2-氟苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
740	4-氟苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
741	4-硝基苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
742	4-氰基苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
743	2-氯吡啶-3-基	Me	F	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
744	苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
745	2-氟苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
746	4-氟苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
747	4-硝基苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
748	4-氰基苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基

[0268] [表27]

[0269] 第5表(7)

[0270]

化合物编号	Q1	R1	X1	X2	Q2
749	2-氯吡啶-3-基	Me	F	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
750	苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
751	2-氟苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
752	4-氟苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
753	4-硝基苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
754	4-氰基苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
755	2-氯吡啶-3-基	Me	H	氰基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
756	苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
757	2-氟苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
758	4-氟苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
759	4-硝基苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
760	4-氰基苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基
761	2-氯吡啶-3-基	Me	H	硝基	2-三氟甲基硫基-4-(七氟异丙基)苯基

[0271] 利用本发明的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法得到的通式(4)表示的烷基化芳香族酰胺衍生物是在对于有害生物防除作用显示卓越效果的酰胺衍生物的制造方法中极其有用的制造中间体。

[0272] [实施例]

[0273] 以下,参照实施例进一步具体地说明本发明,但本发明不受这些实施例的限制。

[0274] 需要说明的是,对于¹H-NMR的化学位移值而言,只要没有特别记载,以四甲基硅

烷为基准,在低磁场侧,以ppm单位表示。另外,“s”是指单峰,“d”是指双峰,“t”是指三重峰,“m”是指多重峰,“brs”是指宽单峰。另外,只要没有特别限制,“%”是质量基准。

[0275] <合成例1>

[0276] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0277] 将2-(三氟甲基)苯胺26.8g (166.3mmol)、三乙基胺37.0g (365.9mmol)及2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)苯甲酰氯100.9g (365.9mmol)加入到四氢呋喃(400mL)中,在50℃下搅拌3小时。对反应溶液进行过滤器过滤,然后向滤液中加入氢氧化钠14.6g (365.9mmol)的水溶液(125mL),在50℃下搅拌30分钟。在减压下蒸馏去除溶剂,然后,用乙酸乙酯萃取,依次用碳酸钾水溶液及饱和食盐水洗涤。用硫酸镁干燥有机层,然后过滤除去硫酸镁,减压下蒸馏去除溶剂。用正己烷及异丙基醚洗涤得到的固体,进行干燥,由此以白色固体形式得到了标题化合物63.2g (收率91%)。

[0278] $^1\text{H-NMR}$ (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)。

[0279] <实施例1>

[0280] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0281] 在冰浴下搅拌粉状的氢氧化钠0.8g (20mmol)和硫酸铁(II)·七水合物0.93g (3.3mmol),直到变色为黑色。在变色后,立即加入N,N-二甲基甲酰胺5g,加入2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺1g (2.4mmol)及七氟异丙基碘1g (3.4mmol)的N,N-二甲基甲酰胺5g溶液,在室温下搅拌3小时。对得到的反应液进行硅藻土过滤,用乙酸乙酯50mL洗涤,然后向得到的反应液中加入水40g,进行萃取,然后用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁,在减压下蒸馏去除溶剂,然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化,由此以白色固体形式得到了标题化合物0.89g (收率63%)。

[0282] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, δ ppm) 8.86 (1H, d, J=8.9Hz), 8.68 (1H, d, J=8.3Hz), 8.01 (1H, s), 7.88—7.84 (2H, m), 7.36—7.29 (7H, m), 3.48 (3H, s)。

[0283] <实施例2>

[0284] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-溴-4-(七氟异丙基)-6-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0285] 向氢化钠(60%产品)68.5mg (1.71mmol)中加入N,N-二甲基甲酰胺4g及上述得到的2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺1g (1.72mmol),在冰浴下搅拌10分钟。向反应溶液中加入N-溴代丁二酰亚胺0.31g (1.80mmol),在室温下搅拌2小时。向反应溶液中加入水,用乙酸乙酯萃取,然后用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁,在减压下蒸馏去除溶剂,然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化,由此以白色固体形式得到了标题化合物0.93g (收率82%)。

[0286] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 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)。

[0287] <实施例2-1>

[0288] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-溴-4-(七氟异丙基)-6-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0289] 向氢氧化钠140mg (3.42mmol) 中加入N,N-二甲基甲酰胺5g及上述得到的2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺1g (1.72mmol), 在室温下搅拌10分钟。向反应溶液中加入N-溴代丁二酰亚胺0.34g (1.90mmol), 在室温下搅拌2小时。向反应溶液中加入水, 用乙酸乙酯萃取后, 用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁, 在减压下蒸馏去除溶剂, 然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化, 由此以白色固体形式得到了标题化合物0.64g (收率56%)。

[0290] <实施例3>

[0291] [3-硝基-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0292] 在冰浴下搅拌粉状的氢氧化钠1.1g (27mmol) 和硫酸铁(II)·七水合物1.2g (4.5mmol), 直到变色为黑色。在变色后, 立即加入N,N-二甲基甲酰胺5g, 加入3-硝基-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺1.0g (3.2mmol) 及七氟异丙基碘1.3g (4.5mmol) 的N,N-二甲基甲酰胺5g溶液, 在室温下搅拌3小时。对得到的反应液进行硅藻土过滤, 用乙酸乙酯50mL洗涤, 然后向得到的反应液中加入水40g, 进行萃取, 然后用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁, 在减压下蒸馏去除溶剂, 然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化, 由此以红色固体形式得到了标题化合物0.44g (收率28%)。

[0293] $^1\text{H-NMR}$ (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)。

[0294] <实施例4>

[0295] [3-氰基-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0296] 在冰浴下搅拌粉状的氢氧化钠1.1g (29mmol) 和硫酸铁(II)·七水合物1.3g (4.8mmol), 直到变色为黑色。在变色后, 立即加入N,N-二甲基甲酰胺5g, 加入3-氰基-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲酰胺1.0g (3.5mmol) 及七氟异丙基碘1.4g (4.8mmol) 的N,N-二甲基甲酰胺5g溶液, 在室温下搅拌3小时。对得到的反应液进行硅藻土过滤, 用乙酸乙酯50mL洗涤, 然后向得到的反应液中加入水40g, 进行萃取, 然后用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁, 在减压下蒸馏去除溶剂, 然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化, 由此以白色固体形式得到了标题化合物0.93g (收率59%)。

[0297] $^1\text{H-NMR}$ (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)。

[0298] <实施例5>

[0299] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-甲基-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0300] 在冰浴下搅拌粉状的氢氧化钠0.55g (14mmol) 和硫酸铁(II)·七水合物0.64g (2.3mmol), 直到变色为黑色。在变色后, 立即加入N,N-二甲基甲酰胺3g, 加入2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-甲基-苯基)苯甲酰胺0.60g (1.7mmol) 及七氟异丙基碘0.68g (2.3mmol) 的N,N-二甲基甲酰胺3g溶液, 在室温下搅拌3小时。对得到的反应液进行硅藻土过滤, 用乙酸乙酯50mL洗涤, 然后向得到的反应液中加入水40g, 进行萃取, 然后用硫

酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁,在减压下蒸馏去除溶剂,然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化,由此以白色固体形式得到了标题化合物0.26g (收率30%)。

[0301] $^1\text{H-NMR}$ (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)。

[0302] <实施例6>

[0303] [2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-溴-4-(七氟异丙基)苯基)苯甲酰胺的制造]

[0304] 在冰浴下搅拌粉状的氢氧化钠0.47g (12mmol) 和硫酸铁(II)·七水合物0.54g (1.9mmol),直到变色为黑色。在变色后,立即加入N,N-二甲基甲酰胺3g,加入2-氟-3-(N-甲基苯甲酰胺)-N-(2-溴-苯基)苯甲酰胺0.60g (1.4mmol) 及七氟异丙基碘0.57g (1.9mmol) 的N,N-二甲基甲酰胺3g溶液,在室温下搅拌3小时。对得到的反应液进行硅藻土过滤,用乙酸乙酯50mL洗涤,然后向得到的反应液中加入水40g,进行萃取,然后用硫酸镁干燥有机层。过滤除去硫酸镁,在减压下蒸馏去除溶剂,然后用硅胶柱色谱法对浓缩残渣进行纯化,由此以白色固体形式得到了标题化合物0.092g (收率11%)。

[0305] $^1\text{H-NMR}$ (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)。

[0306] 以上,通过本发明的烷基化芳香族酰胺衍生物的制造方法,能以短工序得到目标烷基化芳香族酰胺衍生物。

[0307] 将日本申请第2012-085053号的全部公开内容通过参照并入本说明书中。

[0308] 在本说明书中记载的所有文献、专利申请和技术标准通过参照并入本说明书中,各文献、专利申请和技术标准通过参照被并入的情况与具体且分别地记载的情况程度相同。