



(21)申請案號：102111931

(22)申請日：中華民國 102 (2013) 年 04 月 02 日

(51)Int. Cl. : C07C231/12 (2006.01)

C07C233/75 (2006.01)

(30)優先權：2012/04/03 日本

2012-085053

(71)申請人：三井化學 A G R O 股份有限公司 (日本) MITSUI CHEMICALS AGRO, INC. (JP)
日本

(72)發明人：大倉廣成 OKURA, HIRONARI (JP)

(74)代理人：周良謀；周良吉

(56)參考文獻：

CN 101203484A

T. Fuchikami and I. Ojima, Journal of Fluorine Chemistry, 1983, 22:
541-556

審查人員：魏鳳鳳

申請專利範圍項數：7 項 圖式數：0 共 69 頁

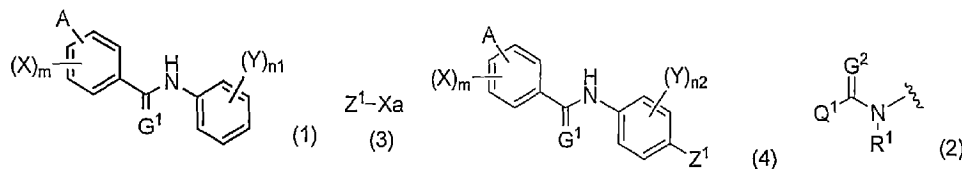
(54)名稱

烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法及烷基化芳香族醯胺衍生物

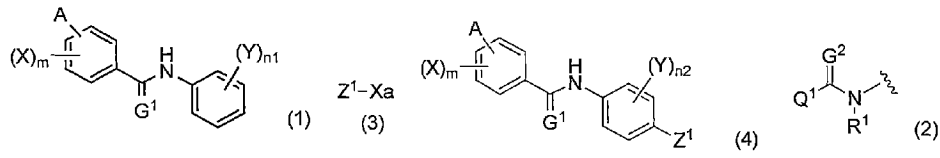
METHOD FOR PRODUCING ALKYLATED AROMATIC AMIDE DERIVATIVE AND ALKYLATED AROMATIC AMIDE DERIVATIVE

(57)摘要

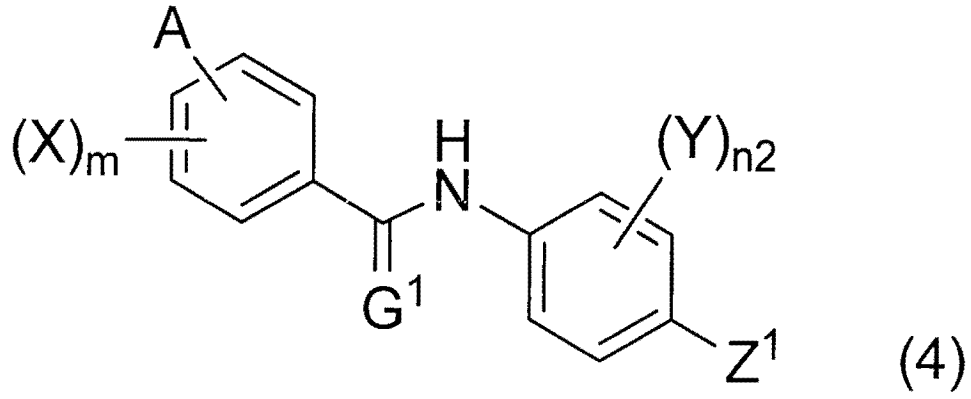
本發明提供一種通式(4)表示之芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含使通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與通式(3)表示之鹵烷基化合物，於鹼、及金屬或金屬鹽存在下反應之步驟。通式中，X及Y表示氫原子、鹵素原子等。A表示氫原子、烷基、通式(2)表示之基等。G¹及G²表示氧原子等。Q¹表示苯基等。R¹表示氫原子、烷基等。Z¹表示鹵烷基等。Xa表示碘原子等。m表示1~4、n1表示1~5、n2表示1~4。

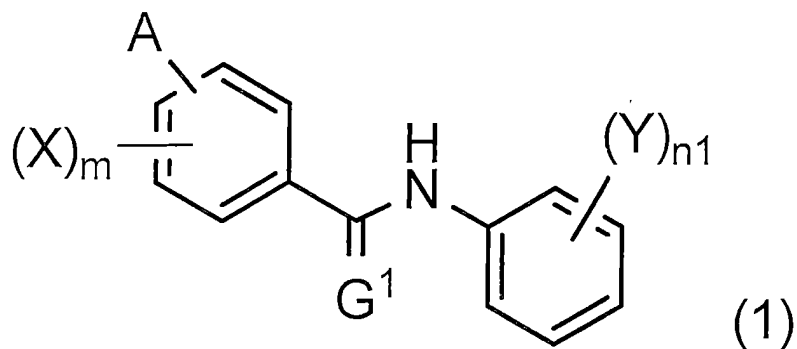


A method for producing an aromatic amide derivative represented by formula (4) is provided, the method including a step of reacting an aromatic amide derivative represented by formula (1) with a haloalkyl compound represented by formula (3) in the presence of a base and a metal or metal salt. In the formulae, X and Y represent a hydrogen atom, a halogen atom, or the like, A represents a hydrogen atom, an alkyl group, a group represented by formula (2) or the like, G¹ and G² represent 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 a iodone atom or the like, m is 1 to 4, n1 is 1 to 5 and n2 is 1 to 4.



特徵化學式：





【0010】

(通式(1)中，X 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基。 m 表示 1~4 之整數， $n1$ 表示 1~5 之整數。 G^1 表示氧原子、或硫原子。

【0011】

Y 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、或乙醯胺基。

【0012】

A 表示以下的基團：

氫原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、C1-C4 烷基胺基羰基、C1-C4 鹵烷基胺基羰基、C1-C4 氨基亞磺醯基、C1-C4 氨基磺醯基、C1-C4 氨基羰基、乙醯胺基、

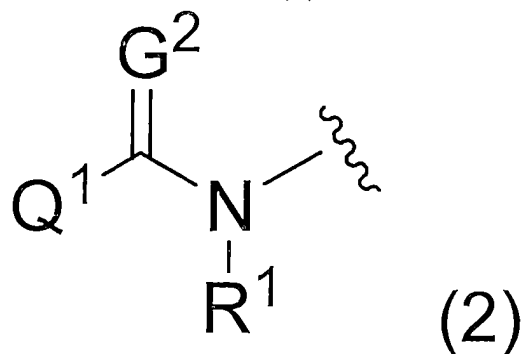
無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、

C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的雜環基、

【0013】

或下列通式(2)表示之基



【0014】

(通式(2)中，G² 表示氧原子、或硫原子。

R¹ 表示氫原子、C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

Q¹ 表示 C1-C6 之烷基、C1-C6 鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、

C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異之取代基的苯基、或無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異之取代基的雜環基)。

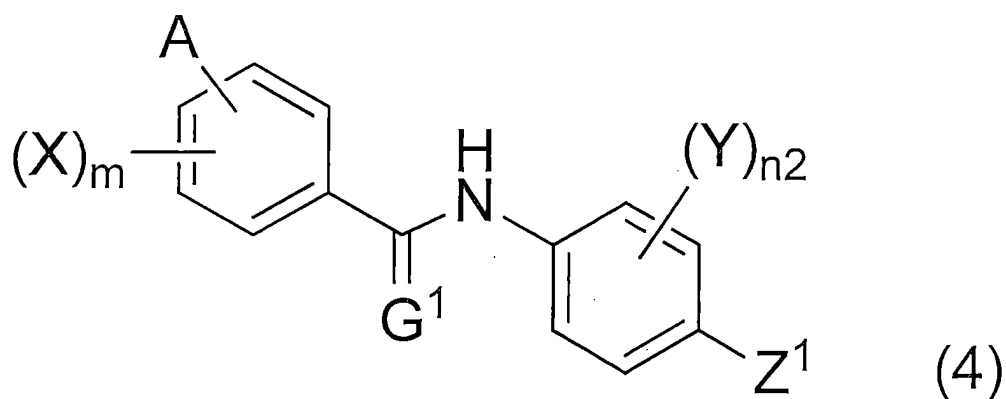
前述雜環基，表示吡啶基、N-氧化吡啶基、嘧啶基、嗒吡基、吡吡基、呋喃基、噻吩基、嘮唑基、異嘮唑基、嘮二唑基、噻唑基、異噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基)

【0015】



(通式(3)中， Z^1 表示 C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。Xa 表示碘原子或溴原子。)

【0016】



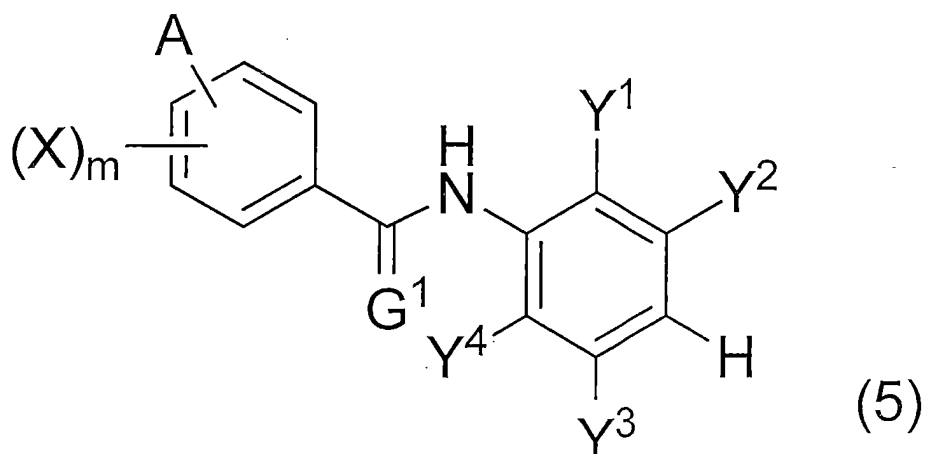
【0017】

(通式(4)中， n_2 表示 1~4 之整數。 Z^1 與前述通式(3)中之 Z^1 為同義， X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A 與前述通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A 分別為同義。)

【0018】

<2> 如前述<1>之製造方法，其中，前述通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物係下列通式(5)表示之芳香族醯胺衍生物，前述通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物係下列通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；

【0019】

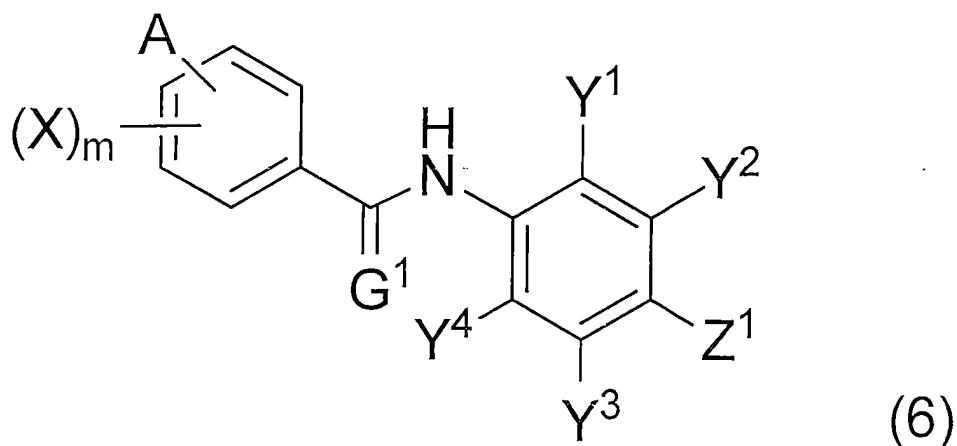


【0020】

(通式(5)中， Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基。 X 、 m 、 G^1 、及 A ，與前述通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同

義。)

【0021】



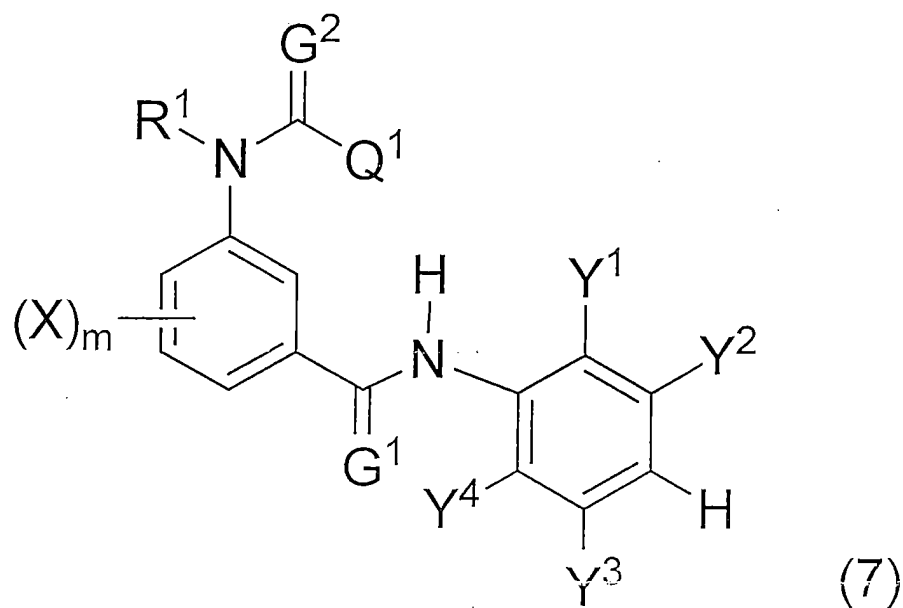
【0022】

(通式(6)中， Z^1 與前述通式(3)中之 Z^1 為同義。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A 與前述通式(5)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同義)。

【0023】

<3>如<2>之製造方法，其中，前述通式(5)表示之芳香族醯胺衍生物係下列通式(7)表示之芳香族醯胺衍生物，前述通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物係下列通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；

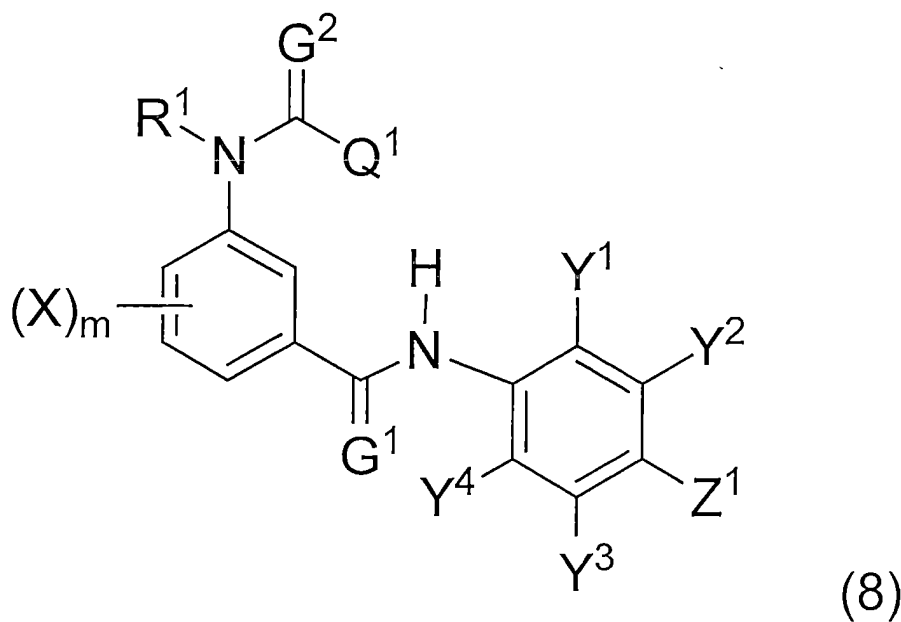
【0024】



【0025】

(通式(7)中， G^2 、 Q^1 、及 R^1 ，與前述通式(2)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 ，與前述通式(5)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 分別為同義。)

【0026】



【0027】

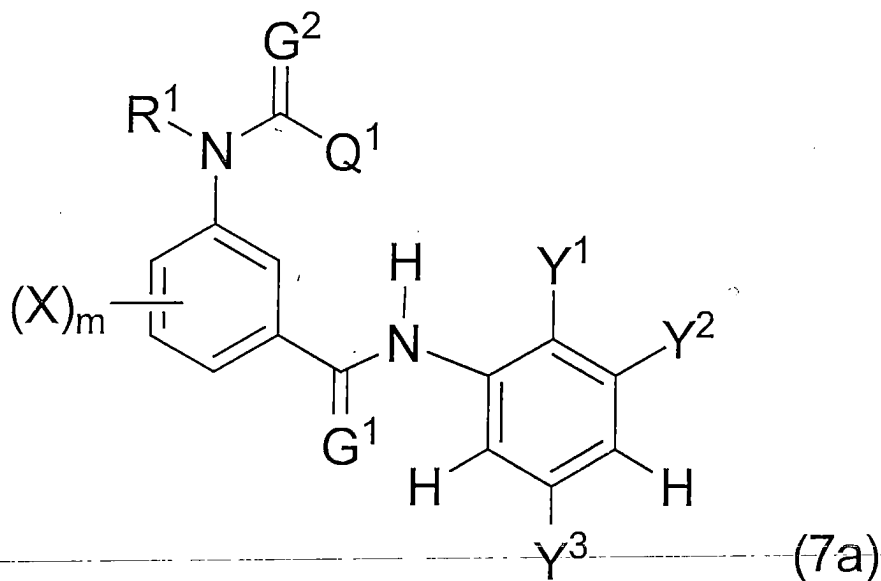
(通式(8)中， Z^1 與前述通式(3)中之 Z^1 為同義。 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、及 R^1 ，與前述通式(7)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義。)

【0028】

<4>一種通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：

使下列通式(7a)表示之芳香族醯胺衍生物與下列通式(3)表示之鹵烷基化合物於鹼、及金屬或金屬鹽之存在下反應而獲得下列通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；及

將前述通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下進行鹵化；



【0029】

(通式(7a)中，X 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基。m 表示 1~4 之整數。

G^1 及 G^2 各自獨立地表示氧原子、或硫原子。

Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基。

【0030】

R^1 表示氫原子、C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

Q^1 表示 C1-C6 之烷基、C1-C6 鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、或

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的雜環基。

【0031】

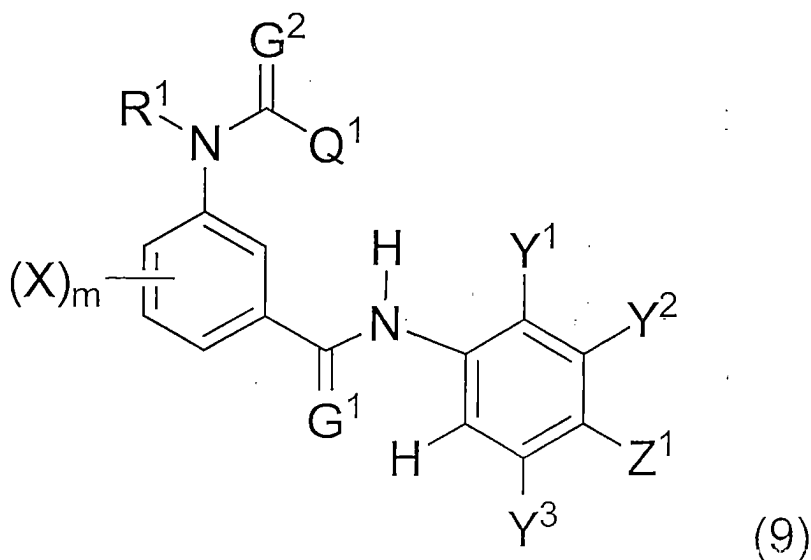
前述雜環基，表示吡啶基、N-氧化吡啶基、嘧啶基、嗒吡基、吡吡基、咪喃基、噻吩基、嘍唑基、異嘍唑基、嘍二唑基、噻唑基、異噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基。)

【0032】



(通式(3)中， Z^1 表示 C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。Xa 表示碘原子或溴原子。)

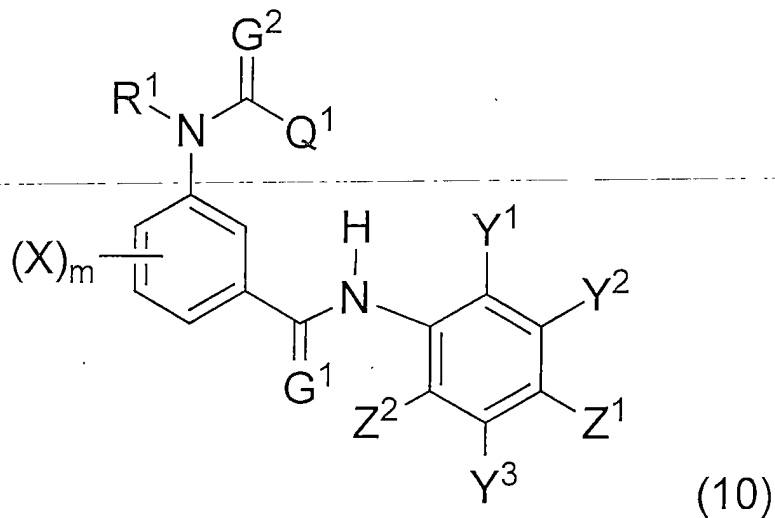
【0033】



【0034】

(通式(9)中， Z^1 與通式(3)中之 Z^1 為同義。X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 ，與前述通式(7a)中之 X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 分別為同義。)

【0035】



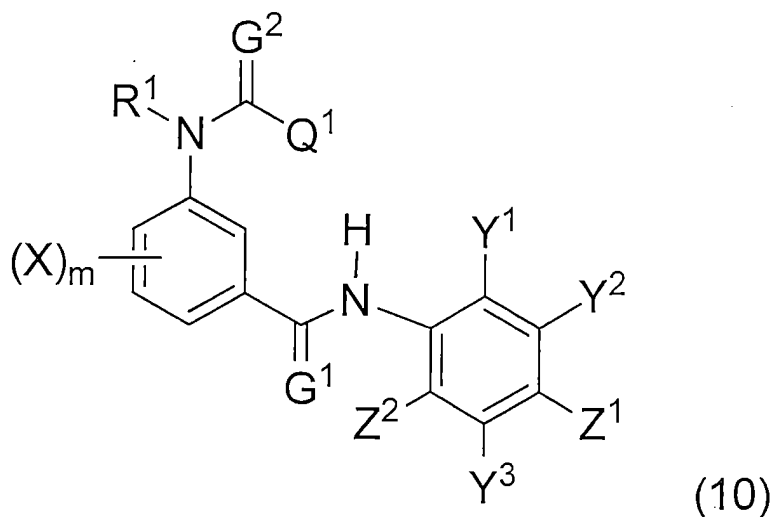
【0036】

(通式(10)中， Z^2 表示鹵素原子。X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 ，與前述通式(9)中之 X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 分別為同義。)

【0037】

<4A>一種通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：

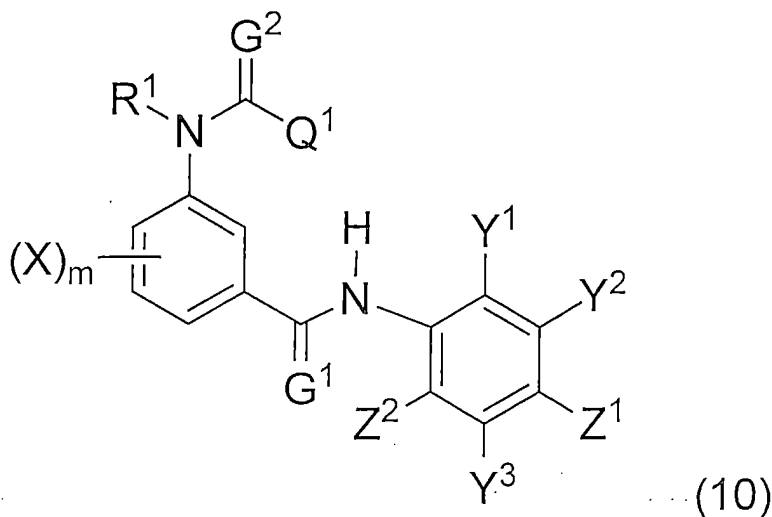
依照如<2>之製造方法獲得前述通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；及將前述通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下予以鹵化；且前述通式(6)中，A 代表前述通式(2)， Y^4 為氫原子；



(通式(10)中， Z^2 表示鹵素原子。X、m、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 ，與前述通式(6)中之 X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 分別為同義， G^2 、 Q^1 、及 R^1 與前述通式(2)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義)。

<4B>一種通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：

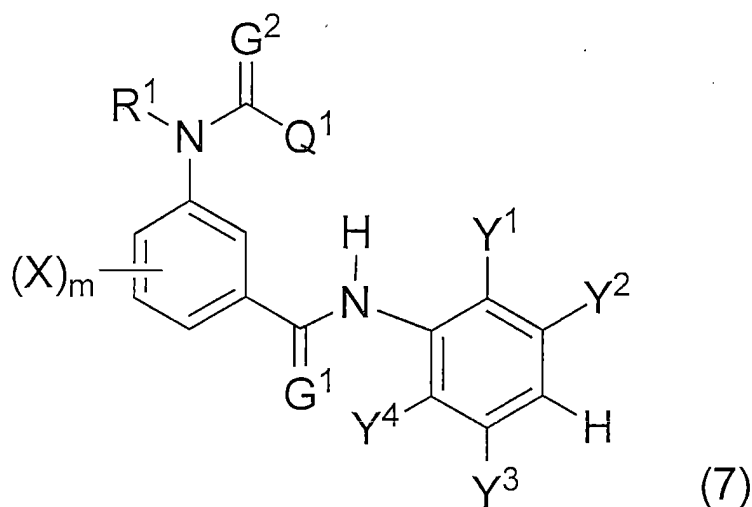
依照如<3>之製造方法獲得前述通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；及將前述通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下予以鹵化；且前述通式(8)中， Y^4 為氫原子；



(通式(10)中， Z^2 表示鹵素原子。X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 ，與前述通式(8)中之 X、m、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 分別為同義)。

【0038】

<5>一種通式(7)表示之芳香族醯胺衍生物;



(通式(7)中, X 各自獨立地, 表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基。m 表示 1~4 之整數。

G^1 及 G^2 各自獨立地表示氧原子、或硫原子。

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 各自獨立地, 表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基。

【0039】

R^1 表示氫原子、C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

Q^1 表示 C1-C6 之烷基、C1-C6 鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、或

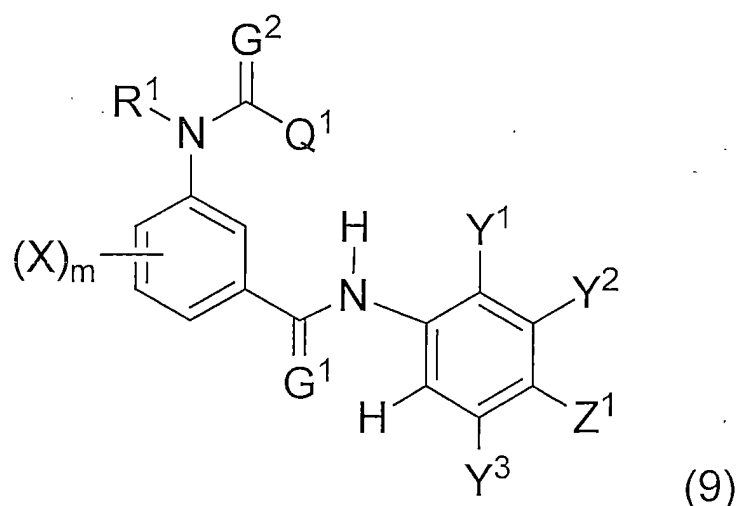
無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷

基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的雜環基。

前述雜環基，表示吡啶基、N-氧化吡啶基、嘓啶基、嗒吡基、吡吡基、呋喃基、噻吩基、嘓唑基、異嘓唑基、嘓二唑基、噻唑基、異噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基)。

【0040】

<6>一種通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物;



【0041】

(通式(9)中，X 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基。m 表示 1~4 之整數。

G¹ 及 G² 各自獨立地表示氧原子、或硫原子。

Y¹、Y²、及 Y³ 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基。

Z¹ 表示 C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

【0042】

R^1 表示氫原子、C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

Q^1 表示 C1-C6 之烷基、C1-C6 鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、或

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷胺基、二 C1-C4 烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的雜環基。

前述雜環基表示吡啶基、N-氧化吡啶基、嘧啶基、嗒吡基、吡吡基、呋喃基、噁吩基、嘍唑基、異嘍唑基、嘍二唑基、噁唑基、異噁唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡唑基、或四唑基)。

【0043】

<7> 如<6>之烷基化芳香族醯胺衍生物，其中，前述通式(9)中之 Y^1 為 C1-C2 鹵烷基， Y^2 及 Y^3 分別為氫原子， Z^1 為 C1-C6 鹵烷基，X 為鹵素原子。

[對照先前技術之功效]

【0044】

依照本發明能提供以短製程、且可利用在工業上製造具有烷基之芳香族醯胺衍生物的製造方法。又，可提供對於該製造方法為有用的製造中間體。

【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

【0045】

本說明書中的用語「步驟」，不僅是獨立步驟，在與其他步驟無法明確區別的情形，只要能達成此步驟期待的作用即包括在本用語。又，使用「~」表示的數值範圍，代表包含「~」的前後記載的數值各作為最小值及最大值的範圍。

又，本說明書之通式使用的用語，其定義各有以下說明的含意。

「鹵素原子」代表氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。「n-」代表正，「i-」代表異，「s-」代表第二，「t-」代表第三。

「Ca-Cb(a、b表示1以上之整數)」的表示記載，例如：「C1-C3」代表碳原子數為1~3個，「C2-C6」代表碳原子數為2~6個，「C1-C4」代表碳原子數為1~4個。

【0046】

又，「C1-C3 烷基」，代表例如：甲基、乙基、n-丙基、i-丙基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數1~3個之烷基，「C1-C4 烷基」，除了「C1-C3 烷基」，也代表例如：n-丁基、s-丁基、i-丁基、t-丁基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數1~4個的烷基，「C1-C6 烷基」，除了「C1-C4 烷基」以外，也代表例如：n-戊基、2-戊基、3-戊基、新戊基、n-己基、2-己基、4-甲基-2-戊基、3-甲基-n-戊基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數1~6個的烷基。

【0047】

「C1-C6 鹵烷基」，例如：單氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、單氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、單溴甲基、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-n-丙基、3-氯-n-丙基、3-溴-n-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、1,1,1,3,3,3-六氟-2-氯-2-丙基、2,2,3,3,3-五氟-n-丙基、七氟-i-丙基、七氟-n-丙基、4-氟-n-丁基、九氟-n-丁基、九氟-2-丁基、九氟-i-丁基、十一氟-n-戊基、十一氟-i-戊基、十一氟-新戊基、十三氟-n-己基、十三氟-n-己基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~6 個的烷基。

【0048】

「C2-C4 烯基」，代表例如：乙烯基、烯丙基、2-丁烯基、3-丁烯基等碳鏈中具雙鍵之碳原子數 2~4 個之烯基，「C2-C4 鹵烯基」，代表例如：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-丁烯基等經相同或不同之 1 個以上的鹵素原子取代的在碳鏈中具雙鍵之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 2~4 個的烯基。

【0049】

「C2-C4 炔基」，代表例如：炔丙基、1-丁炔-3-基、1-丁炔-3-甲基-3-基等在碳鏈中具參鍵之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 2~4 個之炔基，「C2-C4 鹵炔基」，代表例如經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之在碳鏈中具有參鍵之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 2~4 個之炔基。

【0050】

「C3-C6 環烷基」，代表例如：環丙基、環丁基、環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基、環己基等具環狀結構之碳原子數 3~6 個之環烷基，「C3-C6 鹵環烷基」，代表例如：2,2,3,3-四氟環丁基、2-氯環己基、4-氯環己基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之具環狀結構之碳原子數 3~6 個之環烷基。

【0051】

「C1-C4 烷氧基」，代表例如：甲氧基、乙氧基、n-丙氧基、異丙氧基、n-丁氧基、i-丁氧基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~3 個之烷氧基，「C1-C4 鹵烷氧基」，代表例如：三氟甲氧基、1,1,1,3,3,3-六氟-2-丙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯乙氧基、3-氟-n-丙氧基、1,1,1,3,3,4,4,4-八氟-2-丁氧基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之鹵烷氧基。

【0052】

「C1-C4 烷硫基」，代表例如：甲硫基、乙硫基、n-丙硫基、i-丙硫基、環丙硫基、n-丁硫基、i-丁硫基、s-丁硫基、t-丁硫基、環丙基甲硫基等直鏈狀、分支鏈狀或環狀之碳原子數 1~4 個之烷硫基。「C1-C4 鹵烷硫基」，代表例如：三氟甲硫基、五氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、七氟-n-丙硫基、七氟-i-丙硫基、九氟-n-丁硫基、九氟-i-丁硫基、九氟-s-丁硫基、4,4,4-三氟-n-丁硫基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷硫基。

【0053】

「C1-C4 烷基亞磺醯基」，代表例如：甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、n-丙基亞磺醯基、i-丙基亞磺醯基、環丙基亞磺醯基、n-丁基亞磺醯基、i-丁基亞磺醯基等直鏈狀或分支鏈狀或環狀之碳原子數 1~4 個之烷基亞磺醯基，「C1-C4 鹵烷基亞磺醯基」，代表例如：三氟甲基亞磺醯基、五氟乙基亞磺醯基、2,2,2-三氟乙基亞磺醯基、七氟-n-丙基亞磺醯基、七氟-i-丙基亞磺醯基、九氟-n-丁基亞磺醯基、九氟-i-丁基亞磺醯基、九氟-s-丁基亞磺醯基、4,4,4-三氟-n-丁基亞磺醯基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷基亞磺醯基。

【0054】

「C1-C4 烷基磺醯基」，代表例如：甲基磺醯基、乙基磺醯基、n-丙基磺醯基、i-丙基磺醯基、環丙基磺醯基、n-丁基磺醯基、i-丁基磺醯基等直鏈狀或分支鏈狀或環狀之碳原子數 1~4 個之烷基磺醯基，「C1-C4 鹵烷基磺醯基」代表例如：三氟甲基磺醯基、五氟乙基磺醯基、2,2,2-三氟乙基磺醯基、七氟-n-丙基磺醯基、七氟-i-丙基磺醯基、九氟-n-丁基磺醯基、九氟-s-丁基磺醯基等經相同或不同之 1 個以上之鹵素原子取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷基磺醯基。

「芳基磺醯基」，代表例如：苯基磺醯基、對甲苯磺醯基、1-萘基磺醯基、2-萘基磺醯基、蔥基磺醯基、菲基磺醯基、芴基(acenaphthylenyl)磺醯基等具芳香環之碳原子數 6~14 個之芳基磺醯基。

【0055】

「C1-C4 烷胺基」，代表例如：甲胺基、乙胺基、n-丙胺基、i-丙胺基、

n-丁胺基、環丙胺基等直鏈狀、分支鏈狀或環狀之碳原子數 1~4 個之烷胺基，「二 C1-C4 烷胺基」，代表例如：二甲胺基、二乙胺基、N-乙基-N-甲胺基等經相同或不同之直鏈狀或分支鏈狀之 2 個碳原子數 1~4 個的烷基取代的胺基。

【0056】

「C1-C4 烷基羰基」，代表例如：甲醯基、乙醯基、丙醯基、異丙基羰基、環丙基羰基等直鏈狀、分支鏈狀或環狀之碳原子數 1~4 個烷基羰基。「C1-C4 鹵烷基羰基」，代表例如：氟乙醯基、二氟乙醯基、三氟乙醯基、氯乙醯基、二氯乙醯基、三氯乙醯基、溴乙醯基、碘乙醯基、3,3,3-三氟丙醯基、2,2,3,3,3-五氟丙醯基等經相同或不同之 1 個以上的鹵素原子取代的直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷基羰基。

【0057】

「C1-C4 烷基羰氧基」，代表例如：乙醯氧基、丙醯氧基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個烷基羰氧基，「C1-C4 烷氧基羰基」，代表例如：甲氧基羰基、乙氧基羰基、異丙氧基羰基等直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷氧基羰基。

【0058】

「C1-C6 全氟烷基」，代表例如：三氟甲基、五氟乙基、七氟-n-丙基、七氟-i-丙基、九氟-n-丁基、九氟-2-丁基、九氟-i-丁基、全氟-n-戊基、全氟-n-己基等以氟原子完全取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~4 個之烷基。

「C1-C6 全氟烷硫基」，代表例如：三氟甲硫基、五氟乙硫基、七氟-n-丙硫基、七氟-i-丙硫基、九氟-n-丁硫基、九氟-2-丁硫基、九氟-i-丁硫基、全氟-n-戊硫基、全氟-n-己硫基等以氟原子完全取代之直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~6 個之烷硫基。

「C1-C6 全氟烷基亞磺醯基」，代表例如：三氟甲基亞磺醯基、五氟乙基亞磺醯基、七氟-n-丙基亞磺醯基、七氟-i-丙基亞磺醯基、九氟-n-丁基亞磺醯基、九氟-2-丁基亞磺醯基、九氟-i-丁基亞磺醯基、全氟-n-戊基亞磺醯基、全氟-n-己基亞磺醯基等以氟原子完全取代的直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~6 個的烷基亞磺醯基。

「C1-C6 全氟烷基磺醯基」，代表例如：三氟甲基磺醯基、五氟乙基磺醯

基、七氟-n-丙基磺醯基、七氟-i-丙基磺醯基、九氟-n-丁基磺醯基、九氟-2-丁基磺醯基、九氟-i-丁基磺醯基、全氟-n-戊基磺醯基、全氟-n-己基磺醯基等以氟原子完全取代的直鏈狀或分支鏈狀之碳原子數 1~6 個的烷基磺醯基。

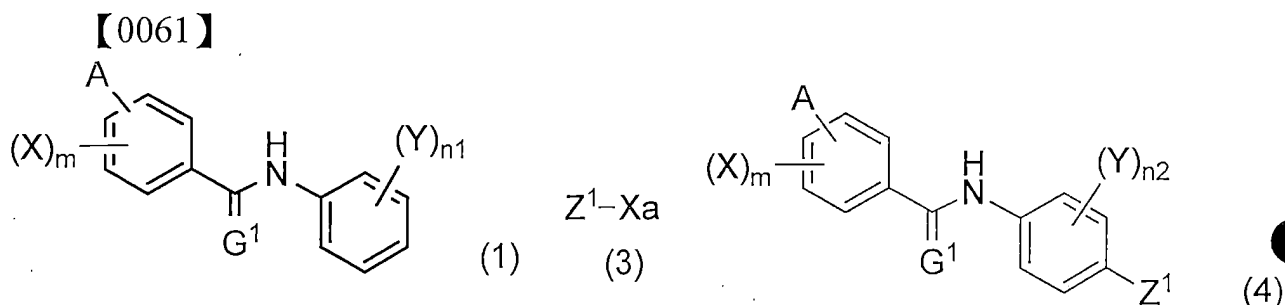
【0059】

本發明中，通式(1)及通式(3)等表示之化合物有時其結構式中會含有 1 個或多數個不對稱碳原子或不對稱中心，有時也存在 2 種以上的光學異構物。本發明包括各光學異構物及以任意比例含有此等光學異構物之混合物的全部。

又，本發明中，通式(1)及通式(3)等表示之化合物，有時在其結構式中存在來自碳-碳雙鍵之 2 種以上的幾何異構物。本發明也包括各幾何異構物含量為任意比例之混合物的全部。

【0060】

本發明之下列通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包括使下列通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與下列通式(3)表示之鹵烷基化合物於鹼、及金屬或金屬鹽存在下反應的步驟。前述製造方法視需要也可更包含其他步驟。



【0062】

通式(1)中，X 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基。m 表示 1~4 之整數，n1 表示 1~5 之整數。前述 X 存在多數個的情形，各 X 可相同或不同。

G^1 表示氧原子、或硫原子。

【0063】

Y 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、

C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、或乙醯胺基。

前述 Y 有多個存在的情形，各 Y 可相同或不同。

【0064】

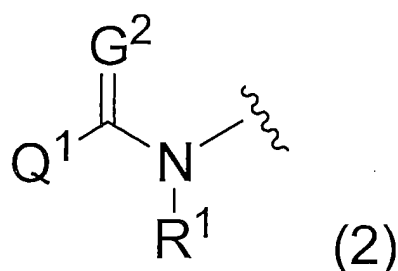
A 表示氫原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、C1-C4 烷基胺基羰基、甲基亞磺醯基 C1-C4 烷基胺基羰基、甲基磺醯基 C1-C4 烷基胺基羰基、乙醯胺基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代

基的雜環基、或下列通式(2)表示之基。

【0065】



【0066】

通式(2)中， G^2 表示氧原子、或硫原子。

R^1 表示氫原子、C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。

Q^1 表示 C1-C6 之烷基、C1-C6 鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的苯基、或

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C2-C4 烯基、C2-C4 鹵烯基、C2-C4 炔基、C2-C4 鹵炔基、C3-C6 環烷基、C3-C6 鹵環烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、C1-C4 鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4 烷基胺基、二 C1-C4 烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4 烷基羰基、C1-C4 鹵烷基羰基、C1-C4 烷基羰氧基、C1-C4 烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之 1 個以上的相同或相異的取代基的雜環基。

又，通式(1)中之雜環基，表示吡啶基、N-氧化吡啶基、嘧啶基、嘓啉基、吡啉基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、異噁唑基、噁二唑基、噻唑基、

異噻唑基、咪唑基、三唑基、吡咯基、吡啶基、或四唑基。

【0067】

本發明中，通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物係在製造作為殺蟲劑為有用之通式(10)表示之化合物方面特別有用的製造中間體。

通式(1)中之取代基 X，為氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4 烷氧基、或二甲胺基，較佳為鹵素原子、硝基、氰基、或二甲胺基。m 為 1~4 之整數，更佳為 1~3 之整數。

【0068】

又，取代基 A 宜為 C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基、具有取代基之苯基、鹵素原子、硝基、氰基或上述通式(2)表示之基較佳。

通式(2)中之取代基 G^2 為氧原子、或硫原子，較佳為氧原子。

取代基 Q^1 為無取代之苯基、具有取代基之苯基、或無取代之雜環基、具有取代基之雜環基、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷氧基、C1-C4 鹵烷氧基較佳。

取代基 R^1 為氫原子、C1-C6 烷基或 C1-C6 鹵烷基較佳。

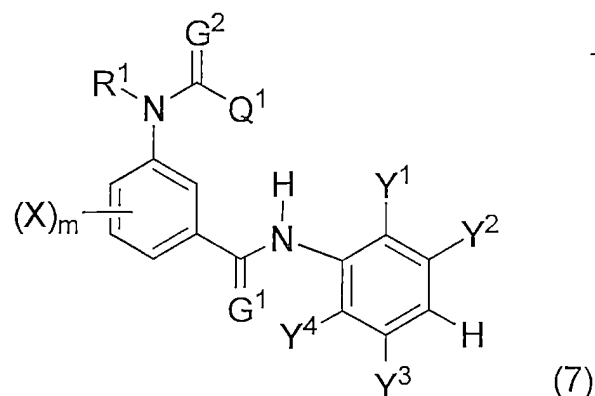
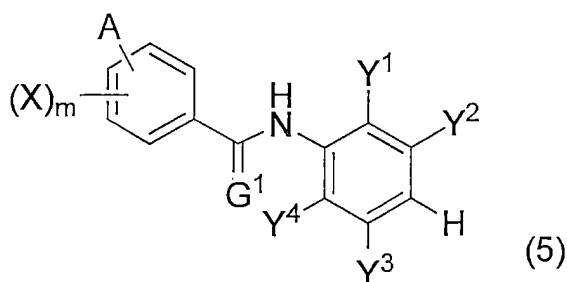
【0069】

取代基 Y 為氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基較佳。n1 為 1~5 之整數，更佳為 1~3 之整數。

【0070】

前述通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物為下列通式(5)表示之芳香族醯胺衍生物較佳，下列通式(7)表示之芳香族醯胺衍生物更佳。

【0071】



【0072】

通式(5)中， Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 烷基、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 烷硫基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 烷基亞磺醯基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、C1-C4 烷基磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基。 X 、 m 、 G^1 、及 A ，與前述通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同義。

【0073】

通式(5)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 各自獨立地表示氫原子、鹵素原子、C1-C6 鹵烷基、C1-C4 鹵烷硫基、C1-C4 鹵烷基亞磺醯基、或 C1-C4 鹵烷基磺醯基較佳。

【0074】

通式(7)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 ，與前述通式(2)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 ，與前述通式(5)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 分別為同義。

【0075】

通式(7)表示之化合物，例如以 2-胺基三氟甲苯(2-aminobenzotrifluoride)與苯甲酸衍生物作為原料而製造。苯甲酸衍生物，可藉由將 2-氯-3-硝基苯甲酸作為原料，以 WO2010/18857 號記載之方法製造。

【0076】

通式(3)中之 Z^1 表示 C1-C6 烷基、或 C1-C6 鹵烷基。較佳為 C1-C6 鹵烷基，更佳為 C1-C6 全氟烷基。

Xa 表示碘原子或溴原子。

【0077】

通式(4)中之 n_2 表示 1~4 之整數且為 1~3 之整數較佳。

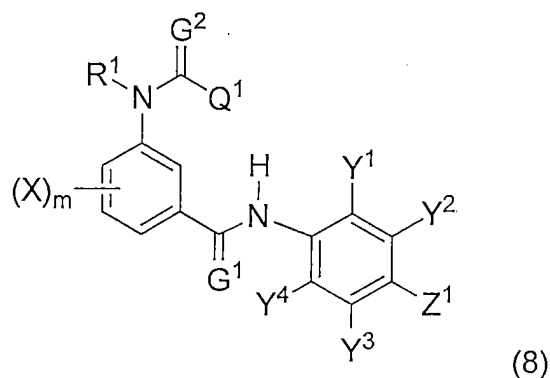
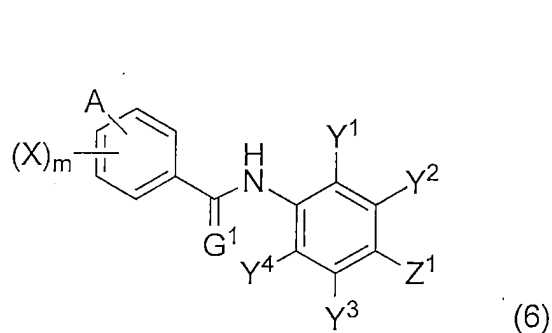
Z^1 與前述通式(3)中之 Z^1 為同義，理想的態樣也相同。

X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A ，與前述通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A 分別為同義，理想的態樣也相同。

【0078】

前述通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物，宜為下列通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物較佳，下列通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物更佳。

【0079】



【0080】

通式(6)中之 Z^1 ，與前述通式(3)中之 Z^1 為同義，理想的態樣也相同。
 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A ，與前述通式(5)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同義，理想的態樣也相同。

【0081】

通式(8)中之 Z^1 ，與前述通式(3)中之 Z^1 為同義，理想的態樣也相同。
 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、及 R^1 ，與前述通式(7)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義，理想的態樣也相同。

【0082】

通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與通式(3)表示之鹵烷基化合物的反應使用的金屬，例如鋰、鈉、鈣、鎂、鋅、鋁、錳、鎢、錫、鉻、金、鉑、銀、銅、鐵、鎳、鈷、鉛、鈦及此等的合金。其中，宜為選自於由銅、鐵、

及鋅構成的群組中之至少 1 種較佳。

【0083】

又，上述反應使用之金屬鹽，為顯示 2 價之鐵金屬鹽，具體而言例如硫酸銨鐵(II)、氟化鐵(II)、氯化鐵(II)、溴化鐵(II)、碘化鐵(II)、硫酸鐵(II)、草酸鐵(II)、六氰基鐵(II)酸鉀、葡萄糖酸(gluconic acid)鐵(II)n 水合物、硫酸參(1,10-啡啉)鐵(II)、六氰基鐵(II)酸銨鐵(III)、硬脂酸鐵(II)、六氰基鐵(II)酸銨、富馬酸鐵(II)、乙酸鐵(II)、環烷酸鐵(II)、四氟硼酸鐵(II)、醯胺硫酸鐵(II)、氧化鐵(II)鈦、硫酸鐵(II)乙二銨，及顯示 1 價之銅金屬，具體而言，例如氯化銅(I)、氟化銅(I)、溴化銅(I)、碘化銅(I)、硫化銅(I)、乙酸銅(I)、銅(I)三氟甲烷硫醇、硫氰酸銅(I)、或碘化釷(samarium) (II)等。其中氯化鐵(II)、硫酸鐵(II)、硫酸鐵(II)水合物較理想。

【0084】

上述金屬及金屬鹽，可以單獨使用，也可混用 2 種以上。其使用量不特別限定，通常相對於係反應原料之通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物，在 0.01 倍莫耳當量~5 倍莫耳當量之範圍，較佳為 1 倍莫耳當量~2 倍莫耳當量之範圍適當選用即可。

【0085】

上述反應使用之鹼，可列舉三乙胺、三-n-丁胺、吡啶、4-二甲胺基吡啶等有機鹼類、氫氧化鈉、氫氧化鉀等氫氧化鹼金屬類、碳酸氫鈉、碳酸鉀等碳酸鹽類、磷酸一氫二鉀、磷酸三鈉等磷酸鹽類、氫化鈉等氫化鹼金屬鹽類、甲醇鈉、乙醇鈉等鹼金屬醇鹽類等。

其中，氫氧化鈉、氫氧化鉀等氫氧化鹼金屬類特別理想。

該等鹼，於相對於通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物為 0.01 倍莫耳當量~10 倍莫耳當量之範圍，較佳為 5 倍莫耳當量~10 倍莫耳當量之範圍適當選用即可。

【0086】

上述反應於無溶劑也能進行，也能於鈍性溶劑存在下進行。

於鈍性溶劑存在下進行的情形，鈍性溶劑只要是不顯著妨礙本反應進行者即可，不特別限制。例如：水；苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等鹵化烴類；二乙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲

氧基乙烷等鏈狀或環狀醚類；乙酸乙酯、乙酸丁酯等酯類；甲醇、乙醇等醇類；丙酮、甲基異丁基酮、環己酮等酮類；N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、1,3-二甲基-2-四氫咪唑酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等醯胺類；乙腈等腈類；二甲基亞砷等鈍性溶劑。該等溶劑可以單獨使用也可混用 2 種以上。

其中，N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、1,3-二甲基-2-四氫咪唑酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等醯胺類、二甲基亞砷特別理想。

【0087】

該等鈍性溶劑之使用量，相對於通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物於 2 重量倍~20 重量倍之範圍，較佳為 5 重量倍~15 重量倍之範圍適當選用即可。

【0088】

上述反應中，反應溫度定為 -20°C ~ 200°C 之範圍，使用鈍性溶劑的情形，設定為其沸點以下即可。又，反應時間從數分鐘至 96 小時之範圍分別適當選擇即可。

【0089】

上述反應中，通式(3)表示之鹵烷基化合物相對於通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物之混合比不特別限制。從經濟性之觀點，宜為 1 倍莫耳當量~3 倍莫耳當量較佳。

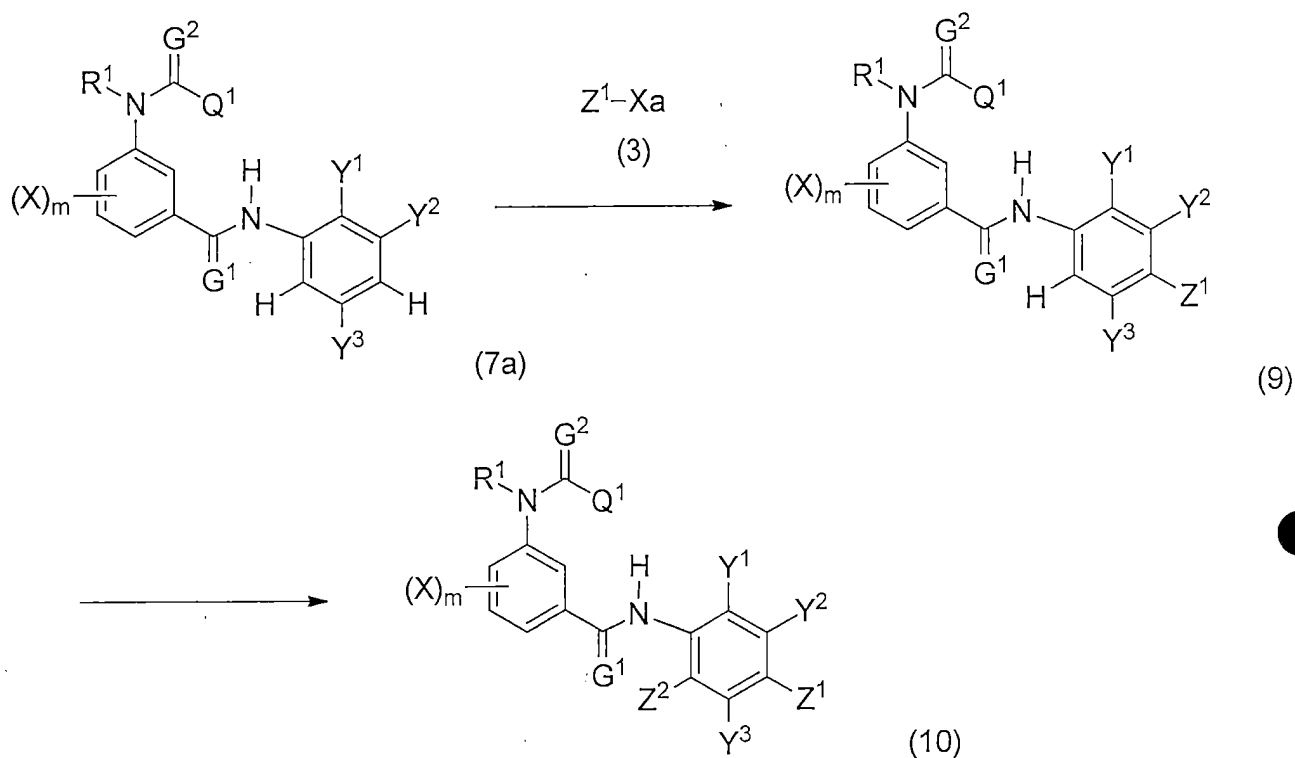
【0090】

前述所示之製造方法中，將係目的物之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於反應結束後從反應系依常法予以單離即可，但視需要可進行再結晶、管柱層析、蒸餾等操作予以精製。

【0091】

本發明之通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：第一步驟，將下列通式(7a)表示之芳香族醯胺衍生物與下列通式(3)表示之鹵烷基化合物於鹼、及金屬或金屬鹽存在下進行反應而獲得下列通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；及第二步驟，將前述通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下予以鹵化。前述製造方法視需要也可更包含其他步驟。

【0092】



【0093】

通式(7a)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 ，與前述通式(2)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義。 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 ，與前述通式(5)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 分別為同義。

【0094】

通式(9)中之 Z^1 ，與通式(3)中之 Z^1 為同義。 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 ，與前述通式(7a)中之 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 分別為同義。

【0095】

針對前述第一步驟之細節，與已述之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法相同。

【0096】

前述第二步驟中，藉由將通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下進行鹵化，以製造通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物。前述第

二步驟例如可將通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物與鹵化劑於鹼性條件下，於鈍性溶劑中或無溶劑進行。

【0097】

作為鹵化劑，只要能將氫原子變換為氯原子、溴原子或碘原子即無特別限制。具體而言，例如：氯、溴、碘、硫酰氯(sulfuryl chloride)、N-氯琥珀醯亞胺、N-溴琥珀醯亞胺、N-碘琥珀醯亞胺、一氯化碘、1,3-二溴-5,5-二甲基乙內醯脲、1,3-二碘-5,5-二甲基乙內醯脲等。

【0098】

上述反應中，鹵化劑之使用量，相對於通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物為 1.0 倍莫耳當量~5 倍莫耳當量較理想、1.01 倍莫耳當量~1.5 倍莫耳當量更理想。

【0099】

上述反應使用之鈍性溶劑，只要不顯著妨礙本反應進行則不特別限制。例如：水；苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等鹵化烴類；二乙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷等鏈狀或環狀醚類；乙酸乙酯、乙酸丁酯等酯類；甲醇、乙醇等醇類；丙酮、甲基異丁基酮、環己酮等酮類；N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、1,3-二甲基-2-四氫咪唑酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等醯胺類；乙腈等腈類；二甲基亞砷等鈍性溶劑。該等溶劑可以單獨使用也可混用 2 種以上。

其中，N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、1,3-二甲基-2-四氫咪唑酮、N-甲基-2-吡咯烷酮等醯胺類；二甲基亞砷特別理想。

【0100】

該等鈍性溶劑之使用量，相對於通式(9)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物，於 2 重量倍~10 重量倍之範圍，較佳為 3 重量倍~8 重量倍之範圍適當選使用即可。

【0101】

又，上述反應使用之鹼，例如三乙胺、三-n-丁胺、吡啶、4-二甲胺基吡啶等有機鹼類、氫氧化鈉、氫氧化鉀等氫氧化鹼金屬類、碳酸氫鈉、碳酸鉀等碳酸鹽類、磷酸一氫二鉀、磷酸三鈉等磷酸鹽類、氫化鈉等氫化鹼金屬鹽類、甲醇鈉、乙醇鈉等鹼金屬醇鹽類等。

其中，氫化鈉等氫化鹼金屬鹽類、氫氧化鈉等氫氧化鹼金屬類特別理想。

該等鹼，相對於通式(9)表示之芳香族鹽胺衍生物於 0.01 倍莫耳當量~5 倍莫耳當量之範圍，較佳為 1 倍莫耳當量~3 倍莫耳當量之範圍適當選用即可。

【0102】

反應溫度，例如-20°C~200°C之範圍，使用鈍性溶劑之情形設定為其沸點以下即可。又，反應時間，從數分鐘至 96 小時之範圍分別適當選擇即可。

【0103】

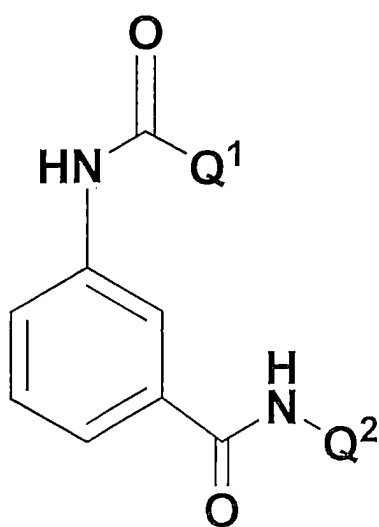
於前述所示之製造方法中，目的物於反應結束後從反應系依常法單離即可，但視需要可進行再結晶、管柱層析、蒸餾等操作予以精製。

【0104】

以下，於表 1 至表 3 顯示為本發明之有效中間體之通式(7)表示之化合物之代表性化合物，但本發明不限定於此等。

又，表中，「Me」表示甲基、「Et」表示乙基、「H」表示氫原子、「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。

【0105】



【0106】

【表 1(1)】

化合物編號	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-氯苯基	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-氯苯基	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-羥基-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-氯苯基	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-異丙基-6-甲基苯基
27	4-氟苯基	2-異丙基-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-氯苯基	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-氯苯基	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

【0107】

【表 1(2)】

化合物編號	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-氟苯基
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-氟基苯基
48	苯基	2-溴-6-甲基苯硫基
49	4-氟苯基	2-溴-6-甲基苯硫基
50	苯基	2-溴-6-(甲基亞磺醯基)苯基
51	4-氟苯基	2-氯-6-(甲基磺醯基)苯基
52	2-氯吡啶-3-基	2-氯-6-(甲基磺醯基)苯基
53	苯基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
54	4-氟苯基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
55	4-氟苯基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
56	4-硝基苯基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
57	4-氟苯基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
58	2-氯吡啶-3-基	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
59	苯基	2-甲基硫甲基-6-三氟甲基苯基
60	苯基	2-溴-6-(三氟甲硫基)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-氟苯基	2-三氟甲基苯基
66	2-氯吡啶-3-基	2-五氟乙基苯基
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-氟苯基	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-氟苯基	2-甲基苯基
78	2-氯吡啶-3-基	2-甲基苯基

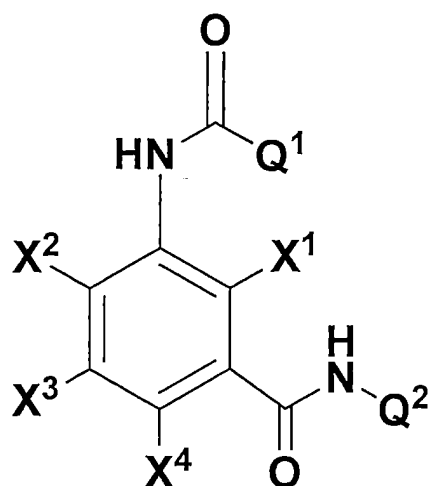
79	苯基	2-氟苯基
80	2-氟苯基	2-氟苯基

【0108】

【表 1(3)】

化合物編號	Q ₁	Q ₂
81	4-氟苯基	2-氟苯基
82	4-硝苯基	2-氟苯基
83	4-氯苯基	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-硝苯基	2-氯苯基
89	4-氯苯基	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-硝苯基	2-溴苯基
95	4-氯苯基	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-硝苯基	2-碘苯基
101	4-氯苯基	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-硝苯基	2-碘苯基
107	4-氯苯基	2-碘苯基
108	2-氯吡啶-3-基	2-碘苯基
109	苯基	2-三氟甲基苯硫基
110	2-氟苯基	2-三氟甲基苯硫基
111	4-氟苯基	2-三氟甲基苯硫基
112	4-硝苯基	2-三氟甲基苯硫基
113	4-氯苯基	2-三氟甲基苯硫基
114	2-氯吡啶-3-基	2-三氟甲基苯硫基

【0109】



【0110】

【表 2(1)】

化合物 編號	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-硝苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
119	4-氟苯基	F	H	H	H	2,6-二甲基苯基
120	2-氮吡啶-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-硝苯基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
124	4-氟苯基	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-氮吡啶-3-基	H	F	H	H	2,6-二甲基苯基
130	苯基	H	H	CH 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-硝苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯基
141	4-氯苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基苯基
147	4-氯苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-甲基苯基

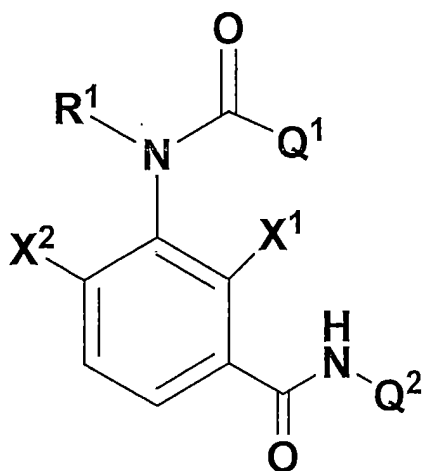
【0111】

【表 2(2)】

化合物 編號	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-硝苯基	F	H	H	H	2-氟苯基
159	4-氯苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-氯苯基
165	4-氯苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-溴苯基
171	4-氯苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
177	4-氟苯基	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-硝苯基	F	H	H	H	2-碘苯基
183	4-氟苯基	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	2-三氟甲基苯硫基
186	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯硫基
187	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯硫基
188	4-硝苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯硫基
189	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯硫基
190	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基苯硫基

【0112】



【0113】

【表 3(1)】

化合物 編號	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-氟苯基	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-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
202	4-氟苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
203	2-硝苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
204	3-硝苯基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
205	4-硝苯基	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

【0114】

【表 3(2)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
229	2-甲基硫吡啶-3-基	Me	H	H	2,6-二甲基苯基
230	吡啶-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	2-四氫呋喃基	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-(甲基磺醯基)苯基
237	2-甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
238	4-甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
239	2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
240	3-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
241	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
242	2-氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
243	4-氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
244	2-溴苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
245	2-碘苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
246	3-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
247	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
248	2-硝苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
249	3-硝苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
250	4-硝苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
251	2-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

【0115】

【表 3(3)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
252	4-三氟甲基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
253	4-三氟甲氧基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
254	2,3-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
255	2,4-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
256	2,5-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
257	2,6-二氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
258	2,4-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
259	2,6-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

260	3,4-二氯苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
261	2-氯-4-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
262	2-氯-4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
263	2-氯-6-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
264	4-氯-2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
265	4-氯-2-硝基苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
266	2,3,6-三氟苯基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
267	吡啶-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
268	吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
269	2-氟吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
270	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
271	2-氯吡啶-5-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
272	2-甲基硫吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
273	吡嗪-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
274	咪喃-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
275	噻吩-2-基	Me	H	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

【0116】

【表 3(4)】

化合物 編號	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-氟苯基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
287	4-氟苯基	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

【0117】

【表 3(5)】

化合物 編號	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-甲基硫吡啶-3-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
313	吡啶-2-基	Me	H	H	2-正丙基-6-碘苯基
314	吡啶-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-硝苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
322	3-硝苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
323	4-硝苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
324	2-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
325	3-氟苯基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
326	4-氟苯基	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-硝基苯基	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

【0118】

【表 3(6)】

化合物 編號	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-甲基硫吡啶-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
358	吡啶-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
359	咪喃-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
360	咪喃-3-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
361	2-四氫咪喃基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
362	苯并咪喃-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
363	噁吩-2-基	Me	F	H	2,6-二甲基苯基
364	苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
365	2-甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
366	4-甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
367	2-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

368	3-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
369	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
370	2-氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
371	4-氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
372	2-溴苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
373	2-碘苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
374	3-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
375	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
376	2-硝苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
377	3-硝苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
378	4-硝苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

【0119】

【表 3(7)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
379	2-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
380	4-三氟甲基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
381	4-三氟甲氧基苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
382	2,3-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
383	2,4-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
384	2,5-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
385	2,6-二氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
386	2,4-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
387	2,6-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
388	3,4-二氯苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
389	2-氯-4-硝苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
390	2-氯-4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
391	2-氯-6-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
392	4-氯-2-氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
393	4-氯-2-硝苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
394	2,3,6-三氟苯基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
395	吡啶-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
396	吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
397	2-氟吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
398	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
399	2-氯吡啶-5-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
400	2-甲基硫吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
401	吡嗪-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
402	咪嗪-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
403	噁吩-2-基	Me	F	H	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基

【0120】

【表 3(8)】

化合物 編號	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-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
415	4-氟苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
416	2-硝苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
417	3-硝苯基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
418	4-硝苯基	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

【0121】

【表 3(9)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
440	2-甲基硫吡啶-3-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
441	吡啶-2-基	Me	F	H	2-正丙基-6-碘苯基
442	咪喃-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-硝苯基	Me	H	F	2,6-二甲基苯基
447	4-氟苯基	Me	H	F	2,6-二甲基苯基
448	苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
449	4-硝苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
450	4-氟苯基	Me	H	F	2-溴-6-(甲基磺醯基)苯基
451	苯基	Me	H	F	2-正丙基-6-碘苯基
452	4-硝苯基	Me	H	F	2-正丙基-6-碘苯基
453	4-氟苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
458	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯基
459	2-氯吡啶-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-硝苯基	Me	H	H	2-五氟乙基苯基
464	4-氟苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-甲基苯基
470	4-氟苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-氟苯基
476	4-氟苯基	Me	H	H	2-氟苯基

【0122】

【表 3(10)】

化合物 編號	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-硝苯基	Me	H	H	2-氯苯基
482	4-氯苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-溴苯基
488	4-氯苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-碘苯基
494	4-氯苯基	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-硝苯基	Me	H	H	2-碘苯基
500	4-氯苯基	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	2-三氟甲基苯硫基
503	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯硫基
504	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯硫基
505	4-硝苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯硫基
506	4-氯苯基	Me	H	H	2-三氟甲基苯硫基
507	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基苯硫基
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

【0123】

【表 3(11)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
512	4-硝苯基	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

【0124】

【表 3(12)】

化合物 編號	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-硝苯基	Me	F	H	2-溴苯基

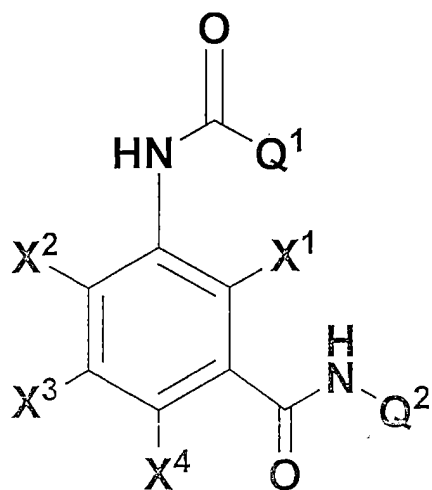
543	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴苯基
544	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴苯基
545	苯基	Me	F	H	2-碘苯基
546	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
547	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
548	4-硝苯基	Me	F	H	2-碘苯基
549	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
550	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘苯基
551	苯基	Me	F	H	2-碘苯基
552	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
553	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
554	4-硝苯基	Me	F	H	2-碘苯基
555	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘苯基
556	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘苯基
557	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯硫基
558	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯硫基
559	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯硫基
560	4-硝苯基	Me	F	H	2-三氟甲基苯硫基

【0125】

以下，表 4 至表 5 顯示係本發明之有效中間體之通式(9)表示之化合物之代表性化合物，但本發明不限定於此等。

又，表中，「Me」代表甲基、「Et」代表乙基、「H」代表氫原子、「F」代表氟原子、「Cl」代表氯原子、「Br」代表溴原子、「I」代表碘原子、「CF₃」代表三氟甲基。

【0126】



【0127】

【表 4(1)】

化合物 編號	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-(七氟異丙基)苯基
562	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
563	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
564	4-硝苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
565	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
566	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
567	苯基	H	H	CH ₃	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
568	苯基	H	H	H	F	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
569	苯基	H	H	H	Cl	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
570	苯基	H	H	H	Br	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
571	苯基	H	H	H	I	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
572	苯基	F	H	H	F	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
573	苯基	H	Br	H	Br	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
574	苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
575	2-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
576	4-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
577	4-硝苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
578	4-氟苯基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
579	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
580	苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基

【0128】

【表 4(2)】

化合物 編號	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-(七氟異丙基)苯基
582	4-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
583	4-硝苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
584	4-氟苯基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
585	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
586	苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
587	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
588	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
589	4-硝苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
590	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
591	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基

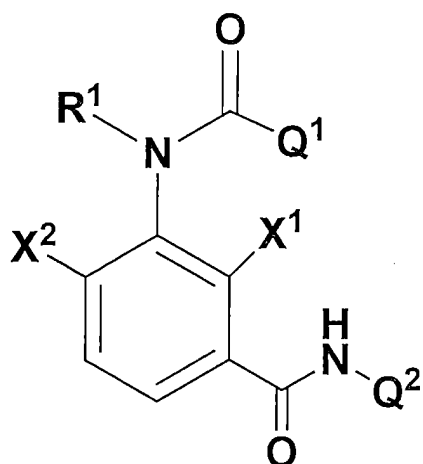
592	苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
593	2-氟苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
594	4-氟苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
595	4-硝苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
596	5-氟苯基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
597	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
598	苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
599	2-氟苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基

【0129】

【表 4(3)】

化合物 編號	Q ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q ²
600	4-氟苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
601	4-硝苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
602	4-氟苯基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
603	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
604	苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
605	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
606	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
607	4-硝苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
608	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
609	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
610	苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
611	2-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
612	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
613	4-硝苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
614	4-氟苯基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
615	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
616	苯基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
617	2-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
618	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
619	4-硝苯基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
620	4-氟苯基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
621	2-氯吡啶-3-基	F	H	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

【0130】



【0131】

【表 5(1)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
622	苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
623	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
624	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
625	4-硝苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
626	4-氰苯基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
627	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
628	苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
629	2-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
630	4-氟苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
631	4-硝苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
632	4-氰苯基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
633	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
634	苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
635	2-氟苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
636	4-氟苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
637	4-硝苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
638	4-氰苯基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
639	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基
640	苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
641	2-氟苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
642	4-氟苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
643	4-硝苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
644	4-氰苯基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基

【0132】

【表 5(2)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
645	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氟-4-(七氟異丙基)苯基
646	苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
647	2-氟苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
648	4-氟苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
649	4-硝苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
650	4-氯苯基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
651	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-氯-4-(七氟異丙基)苯基
652	苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
653	2-氟苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
654	4-氟苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
655	4-硝苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
656	4-氯苯基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
657	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
658	苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
659	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
660	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
661	4-硝苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
662	4-氯苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
663	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
664	苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基

【0133】

【表 5(3)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
665	2-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
666	4-氟苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
667	4-硝苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
668	4-氯苯基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
669	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
670	苯基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
671	2-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
672	4-氟苯基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
673	4-硝苯基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
674	4-氯苯基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
675	2-氯吡啶-3-基	Me	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

676	苯基	Et	H	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
677	苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
678	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
679	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
680	4-硝苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
681	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
682	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-三氟甲基-4-(七氟異丙基)苯基
683	苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
684	2-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
685	4-氟苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基
686	4-硝苯基	Me	F	H	2-五氟乙基-4-(七氟異丙基)苯基

【0134】

【表 5(4)】

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

【0135】

【表 5(5)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
709	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
710	4-硝苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
711	4-氟苯基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
712	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-溴-4-(七氟異丙基)苯基
713	苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
714	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
715	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
716	4-硝苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
717	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
718	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
719	苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
720	2-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
721	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
722	4-硝苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
723	4-氟苯基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
724	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-碘-4-(七氟異丙基)苯基
725	苯基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
726	2-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
727	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
728	4-硝苯基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
729	4-氟苯基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
730	2-氯吡啶-3-基	Me	F	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
731	苯基	Et	H	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

【0136】

【表 5(6)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
732	苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
733	2-氟苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
734	4-氟苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
735	4-硝苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
736	4-氟苯基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
737	2-氯吡啶-3-基	Me	MeO	H	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
738	苯基	Me	F	氟基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
739	2-氟苯基	Me	F	氟基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

740	4-氟苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
741	4-硝苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
742	4-氟苯基	Me	F	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
743	2-氯吡啶-3-基	Me	F	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
744	苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
745	2-氟苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
746	4-氟苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
747	4-硝苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
748	4-氟苯基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

【0137】

【表 5(7)】

化合物 編號	Q ¹	R ¹	X ¹	X ²	Q ²
749	2-氯吡啶-3-基	Me	F	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
750	苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
751	2-氟苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
752	4-氟苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
753	4-硝苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
754	4-氟苯基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
755	2-氯吡啶-3-基	Me	H	氰基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
756	苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
757	2-氟苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
758	4-氟苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
759	4-硝苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
760	4-氟苯基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基
761	2-氯吡啶-3-基	Me	H	硝基	2-三氟甲硫基-4-(七氟異丙基)苯基

【0138】

依本發明之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法獲得之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物，為於有害生物防除作用顯示卓越效果之醯胺衍生物之製造方法當中極有用之製造中間體。

【實施例】

【0139】

以下邊參照實施例邊更詳盡說明本發明，但本發明不限定於此等。

又，¹H-NMR 之化學偏移值，若無特別記載，代表以四甲基矽烷作為基準往低磁場側，以 ppm 單位表示。又「s」意指一重態，「d」意指二重態，

「t」意指三重態，「m」意指多重態，「brs」意指寬廣的一重態。又，若無特別指明，「%」表示質量基準。

【0140】

<合成例 1>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將 2-(三氟甲基)苯胺 26.8g(166.3mmol)、三乙胺 37.0g(365.9mmol)及 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)苯甲醯氯 100.9g(365.9mmol) 加到四氫呋喃(400mL)，於 50°C 進行 3 小時攪拌。將反應溶液以濾器過濾後，於濾液中加入氫氧化鈉 14.6g(365.9mmol)之水溶液(125mL)，於 50°C 進行 30 分鐘攪拌。於減壓下將溶劑餾去後，以乙酸乙酯萃取，依序以碳酸鉀水溶液及飽和食鹽水洗滌。將有機層以硫酸鎂乾燥後，濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去。將獲得之固體以 n-己烷及異丙醚洗滌並乾燥，獲得標題化合物 63.2g(產率 91%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 、70°C、 δppm)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】

<實施例 1>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將粉狀之氫氧化鈉 0.8g(20mmol)與硫酸鐵(II)·七水合物 0.93g(3.3mmol) 於冰浴下攪拌直到顏色變黑。變色後立即添加 N,N-二甲基甲醯胺 5g，並添加 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺 1g(2.4mmol)及碘化七氟異丙烷 1g(3.4mmol)之 N,N-二甲基甲醯胺 5g 溶液，於室溫攪拌 3 小時。將獲得之反應液以矽藻土過濾，以乙酸乙酯 50mL 洗滌後，於獲得之反應液中加入水 40g，萃取後將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.89g(產率 63%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 、 δppm)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】

<實施例 2>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-溴-4-(七氟異丙基)-6-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺之製造]

於氫化鈉(60%品)68.5mg(1.71mmol)加入 N,N-二甲基甲醯胺 4g、及上述獲得之 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺 1g(1.72mmol)，於冰浴下進行 10 分鐘攪拌。於反應溶液中加入 N-溴琥珀醯亞胺 0.31g(1.80mmol)，於室溫攪拌 2 小時。於反應溶液中加水，以乙酸乙酯萃取後，將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.93g(產率 82%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \text{ppm})\delta$ 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】

<實施例 2-1>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-溴-4-(七氟異丙基)-6-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺之製造]

添加氫氧化鈉 140mg(3.42mmol)於 N,N-二甲基甲醯胺 5g、及上述獲得之 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺 1g(1.72mmol)，於室溫下攪拌 10 分鐘。於反應溶液中加入 N-溴琥珀醯亞胺 0.34g(1.90mmol)，於室溫攪拌 2 小時。於反應溶液中加水，以乙酸乙酯萃取後，將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後、將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.64g(產率 56%)白色固體。

【0144】

<實施例 3>

[3-硝基-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將粉狀之氫氧化鈉 1.1g(27mmol)與硫酸鐵(II)·七水合物 1.2g(4.5mmol)於冰浴下攪拌直到顏色變黑。變色後立即添加 N,N-二甲基甲醯胺 5g，並添加 3-硝基-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺 1.0g(3.2mmol)及碘化七氟異丙烷 1.3g(4.5mmol)之 N,N-二甲基甲醯胺 5g 溶液，於室溫攪拌 3 小時。將獲得之

反應液以矽藻土過濾，以乙酸乙酯 50mL 洗滌後，於獲得之反應液中加入水 40g，萃取後將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.44g(產率 28%)紅色固體。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , δ ppm)10.82(1H * 4/5, brs), 10.71(1H * 1/5, brs), 8.77(1H * 4/5, t, J=1.8Hz), 8.73(1H * 1/5, t, J=2.0Hz), 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】

<實施例 4>

[3-氟基-N-(2-(三氟甲基)-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將粉狀之氫氧化鈉 1.1g(29mmol)與硫酸鐵(II)·七水合物 1.3g(4.8mmol)於冰浴下攪拌直到顏色變黑。變色後立即添加 N,N-二甲基甲醯胺 5g，並添加 3-氟基-N-(2-(三氟甲基)苯基)苯甲醯胺 1.0g(3.5mmol)及碘化七氟異丙烷 1.4g(4.8mmol)之 N,N-二甲基甲醯胺 5g 溶液，於室溫攪拌 3 小時。將獲得之反應液以矽藻土過濾，以乙酸乙酯 50mL 洗滌後，於獲得之反應液中加入水 40g，萃取後將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.93g(產率 59%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}$ (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).

【0146】

<實施例 5>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-甲基-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將粉狀之氫氧化鈉 0.55g(14mmol)與硫酸鐵(II)·七水合物 0.64g(2.3mmol)於冰浴下攪拌直到顏色變黑。變色後立即添加 N,N-二甲基甲醯胺 3g，並添加 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-甲基-苯基)苯甲醯胺 0.60g(1.7mmol)及碘化七氟異丙烷 0.68g(2.3mmol)之 N,N-二甲基甲醯胺 3g 溶液，於室溫攪拌 3 小時。將獲得之反應液以矽藻土過濾，以乙酸乙酯 50mL 洗滌後，於獲得之反應液中加水 40g，萃取後將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除

硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.26g(產率 30%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta\text{ppm})$ 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】

<實施例 6>

[2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-溴-4-(七氟異丙基)苯基)苯甲醯胺之製造]

將粉狀之氫氧化鈉 0.47g(12mmol)與硫酸鐵(II)·七水合物 0.54g(1.9mmol)於冰浴下攪拌直到顏色變黑。變色後立即添加 N,N-二甲基甲醯胺 3g，並添加 2-氟-3-(N-甲基苯甲醯胺)-N-(2-溴-苯基)苯甲醯胺 0.60g(1.4mmol)及碘化七氟異丙烷 0.57g(1.9mmol)之 N,N-二甲基甲醯胺 3g 溶液，於室溫攪拌 3 小時。將獲得之反應液以矽藻土過濾，以乙酸乙酯 50mL 洗滌後，於獲得之反應液中加入水 40g，萃取後將有機層以硫酸鎂乾燥。濾除硫酸鎂，於減壓下將溶劑餾去後，將濃縮殘渣以矽膠層析精製，獲得標題化合物 0.092g(產率 11%)白色固體。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta\text{ppm})$ 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】

從以上可知，依照本發明之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，能以短步驟獲得目的之烷基化芳香族醯胺衍生物。

【0149】

日本申請案第 2012-085053 之揭示其全體納入本說明書作為參考。

本說明書記載的所有文獻、專利申請案、及技術規格，其各文獻、專利申請案、及技術規格納入作為參照係與具體的個別記載的情形為同程度地納入於本說明書中作為參照。

【符號說明】

無

【生物材料寄存】

國內寄存資訊【請依寄存機構、日期、號碼順序註記】

無

國外寄存資訊【請依寄存國家、機構、日期、號碼順序註記】

無

【序列表】(請換頁單獨記載)

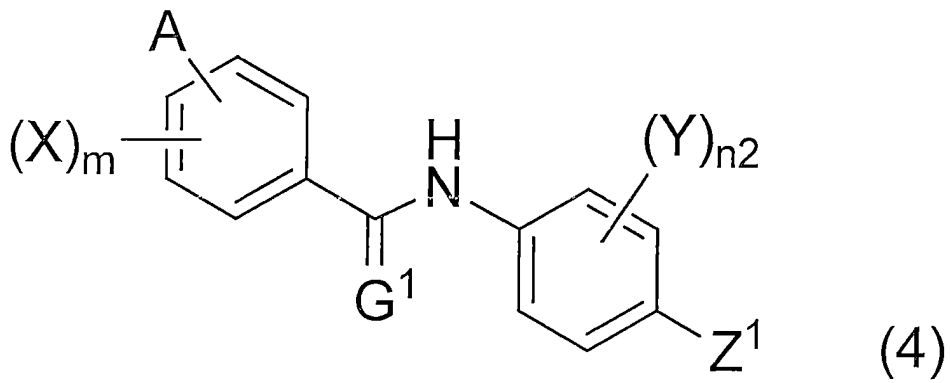
無

【代表圖】

【本案指定代表圖】：無。

【本代表圖之符號簡單說明】：無。

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：



發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法及烷基化芳香族醯胺衍生物
METHOD FOR PRODUCING ALKYLATED AROMATIC AMIDE
DERIVATIVE AND ALKYLATED AROMATIC AMIDE DERIVATIVE

【技術領域】

【0001】

本發明係關於烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法。

【先前技術】

【0002】

國際公開第 2005/73165 號小冊、國際公開第 2006/137376 號小冊、及國際公開第 2010/18714 號小冊中揭示各種化合物作為具有有害生物防除作用之醯胺衍生物，並揭示在製造該醯胺衍生物方面，具有經全氟烷基化之苯基的醯胺衍生物為有用。

作為具有經全氟烷基化之苯基的苯胺的製造方法，已知有於還原劑之存在下使全氟烷基鹵化合物反應之製造方法(例如參照日本特開 2001-122836 號公報)。又，作為具有經全氟烷基化之苯基的醯胺衍生物之製造方法，已知有 Journal of Fluorine Chemistry 22,541-556,1983。

【0003】

又，已知有一些將具電子吸引基之具芳香族環的醯胺化合物予以鹵化的方法(例如參照 Bioorganic & Medicinal Chemistry,15(3),1212-1228, 2007)，但是將具有經全氟烷基化之苯基的醯胺衍生物予以鹵化之方法並未為已知。

【發明內容】

[發明所欲解決之問題]

【0004】

日本特開 2001-122836 號公報僅記載苯胺之例，並未具體揭示醯胺化合物。本案發明人等嘗試以日本特開 2001-122836 號公報記載之方法進行醯胺化合物之全氟烷基化，結果反應未進行。

【0005】

又，Journal of Fluorine chemistry 22,541-556,1983 記載之方法中，反應須在高溫進行，所以不能適用在沸點低的全氟烷基鹵化合物，有所限制。又，此方法由於產物之產率及反應選擇性也低，無法期待實用性。

【0006】

Bioorganic & Medicinal Chemistry,15(3),1212-1228,2007 記載之方法中，鹵化的產率低，本案發明人等依非專利文獻 2 記載之方法實施具有電子吸引基之醯胺化合物的鹵化反應，結果產物之產率低。結果是，在目前並未找到啓示在工業化製造將具有經全氟烷基化之苯基的醯胺衍生物予以鹵化時可利用的反應方法的見解。

【0007】

本發明有鑑於上述實情，課題為提供短製程且工業上可利用的具有烷基之芳香族醯胺衍生物的製造方法，並提供於該製造方法為有用的製造中間體。

[解決問題之技術手段]

【0008】

本案發明人等為了解決上述課題努力鑽研，結果發現具有烷基(較佳為全氟烷基)之芳香族醯胺衍生物之新製造方法及在該製造方法能利用之新的有用中間體，並且發現能將該有用中間體予以選擇性鹵化。藉此，發現了能輕易製造有高殺蟲活性之新殺蟲劑的方法，並且完成本發明。

亦即，本發明如下。

【0009】

<1> 一種通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟:使下列通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與下列通式(3)表示之鹵烷基化合物於鹼、及金屬或金屬鹽之存在下反應;

發明摘要

※ 申請案號：102111931

※ 申請日：102.4.2

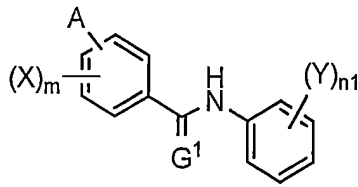
※ IPC 分類：C07C 231/12, 233/15

【發明名稱】(中文/英文)

烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法及烷基化芳香族醯胺衍生物
METHOD FOR PRODUCING ALKYLATED AROMATIC AMIDE
DERIVATIVE AND ALKYLATED AROMATIC AMIDE DERIVATIVE

【中文】

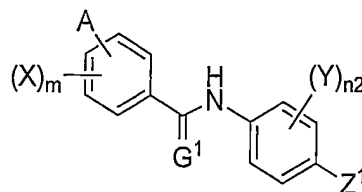
本發明提供一種通式(4)表示之芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含使通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與通式(3)表示之鹵烷基化合物，於鹼、及金屬或金屬鹽存在下反應之步驟。通式中，X 及 Y 表示氫原子、鹵素原子等。A 表示氫原子、烷基、通式(2)表示之基等。G¹ 及 G² 表示氧原子等。Q¹ 表示苯基等。R¹ 表示氫原子、烷基等。Z¹ 表示鹵烷基等。Xa 表示碘原子等。m 表示 1~4、n1 表示 1~5、n2 表示 1~4。



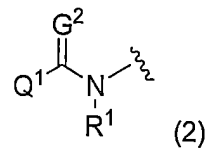
(1)



(3)



(4)

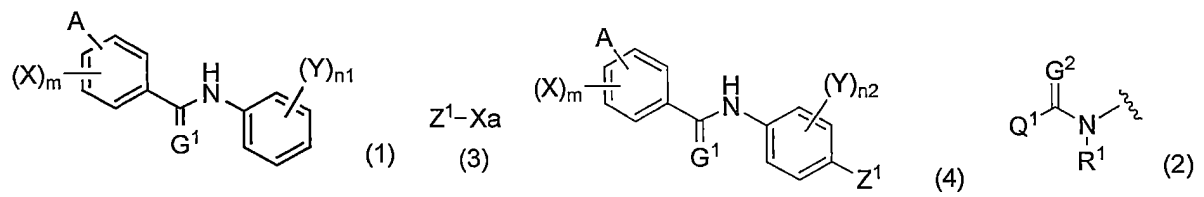


(2)

【英文】

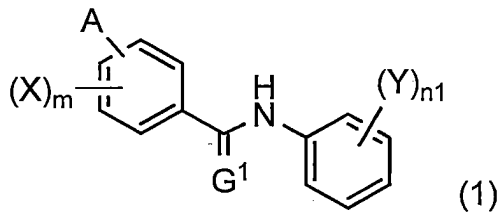
A method for producing an aromatic amide derivative represented by formula (4) is provided, the method including a step of reacting an aromatic amide derivative represented by formula (1) with a haloalkyl compound represented by formula (3) in the presence of a base and a metal or metal salt. In the formulae, X and Y represent a hydrogen atom, a halogen atom, or the like, A represents a hydrogen atom, an alkyl group, a group represented by formula (2) or the like, G¹ and G² represent 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, Z^1 represents a haloalkyl group or the like, Xa represents a iodone atom or the like, m is 1 to 4, n1 is 1 to 5 and n2 is 1 to 4.



申請專利範圍

1. 一種通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：使下列通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物與下列通式(3)表示之鹵烷基化合物於有機鹼類、氫氧化鹼金屬類、氫化鹼金屬鹽類、鹼金屬醇鹽類中之1種鹼、及選自顯示2價之鐵金屬鹽、顯示1價之銅金屬鹽、或碘化鈔(samarium)(II)之金屬鹽之存在下，於鈍性溶劑中反應；



(通式(1)中，X各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、硝基、氰基、C1-C4烷氧基、或二甲胺基；

m表示1~4之整數，n1表示1~5之整數；

G¹表示氧原子、或硫原子；

Y各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷胺基、二C1-C4烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、或乙醯胺基；

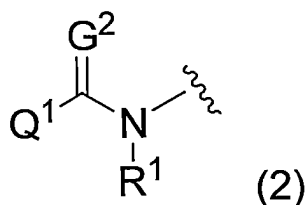
A表示以下的基團：

氫原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷胺基、二C1-C4烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、C1-C4烷胺基羰基、甲基亞磺醯基C1-C4烷胺基羰基、甲基磺醯基C1-C4烷胺基羰基、乙醯胺基、無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、

C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷基胺基、二C1-C4烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基之苯基、

無取代之雜環基、或具有選自於鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷基胺基、二C1-C4烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的雜環基、或

下列通式(2)表示之基



(通式(2)中，G²表示氧原子、或硫原子；

R¹表示氫原子、C1-C6烷基、或C1-C6鹵烷基；

Q¹表示C1-C6之烷基、C1-C6鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷基胺基、二C1-C4烷基胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基

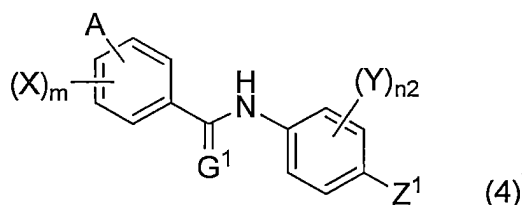
的苯基、或

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C2-C4烯基、C2-C4鹵烯基、C2-C4炔基、C2-C4鹵炔基、C3-C6環烷基、C3-C6鹵環烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、芳基磺醯基、C1-C4烷胺基、二C1-C4烷胺基、氰基、硝基、羥基、C1-C4烷基羰基、C1-C4鹵烷基羰基、C1-C4烷基羰氧基、C1-C4烷氧基羰基、乙醯胺基、及苯基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的雜環基);

該雜環基表示吡啶基、N-氧化吡啶基或嘓啶基)表示之芳香族醯胺衍生物;

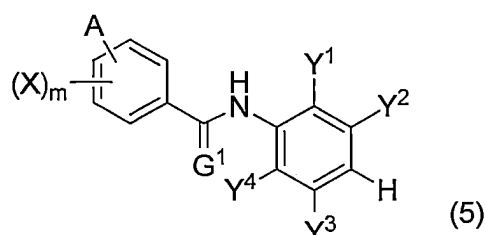


(通式(3)中， Z^1 表示C1-C6烷基、或C1-C4鹵烷基; Xa 表示碘原子或溴原子)

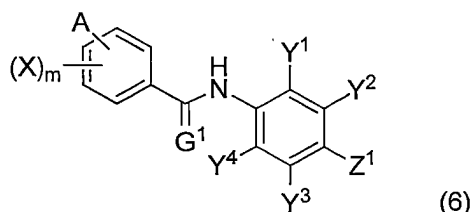


(通式(4)中， n_2 表示1~4之整數; Z^1 與該通式(3)中之 Z^1 為同義， X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A ，與該通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y 、及 A 分別為同義)。

2. 如申請專利範圍第1項之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，其中，該通式(1)表示之芳香族醯胺衍生物係下列通式(5)表示之芳香族醯胺衍生物，該通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物係下列通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物;

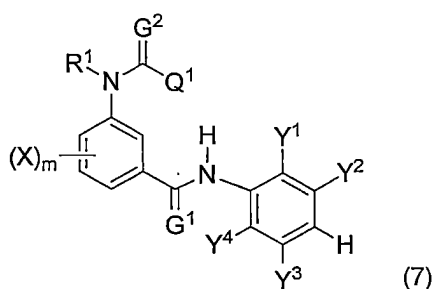


(通式(5)中, Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 各自獨立地, 表示氫原子、鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、或C1-C4鹵烷基磺醯基; X 、 m 、 G^1 、及 A , 與該通式(1)中之 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同義)

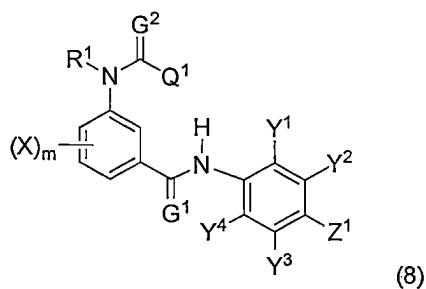


(通式(6)中, Z^1 與該通式(3)中之 Z^1 為同義; Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A , 與該通式(5)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、及 A 分別為同義)。

3. 如申請專利範圍第2項之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法, 其中, 該通式(5)表示之芳香族醯胺衍生物係下列通式(7)表示之芳香族醯胺衍生物, 該通式(6)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物係下列通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物;



(通式(7)中, G^2 、 Q^1 、及 R^1 , 與該通式(2)中之 G^2 、 Q^1 、及 R^1 分別為同義; X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 , 與該通式(5)中之 X 、 m 、 G^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Y^4 分別為同義)



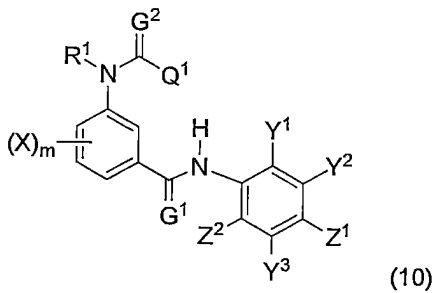
(通式(8)中, Z^1 與該通式(3)中之 Z^1 為同義; Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、及 R^1 , 與該通式(7)中之 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、

及 R^1 分別為同義)。

4. 一種通式(10)表示之鹵化芳香族醯胺衍生物之製造方法，包含以下步驟：

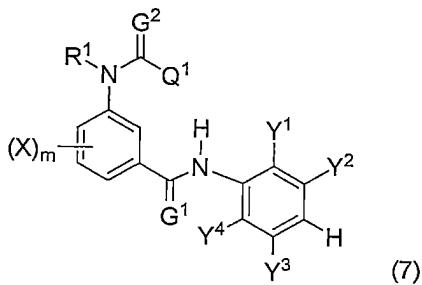
依照如申請專利範圍第3項之製造方法獲得該通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物；

將該通式(8)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物於鹼性條件下進行鹵化；且該通式(8)中， Y^4 為氫原子；



(通式(10)中， Z^2 表示鹵素原子； X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 ，與該通式(8)中之 X 、 m 、 G^1 、 G^2 、 Q^1 、 R^1 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、及 Z^1 分別為同義)。

5. 一種通式(7)表示之芳香族醯胺衍生物；



(通式(7)中， X 各自獨立地，表示氫原子、氟原子、氰基、或C1-C4烷氧基； m 表示1~4之整數；

G^1 及 G^2 表示氧原子；

Y^1 表示C1-C6鹵烷基；

Y^2 及 Y^3 表示氫原子；

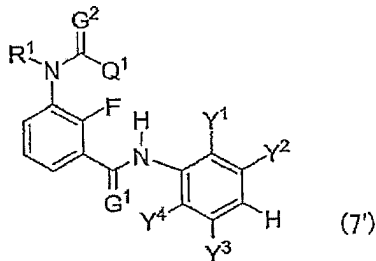
Y^4 表示氟原子、溴原子或碘原子；

R^1 表示C1-C6烷基；

Q^1 表示無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6

鹵烷基、及氰基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的苯基、或無取代之吡啶基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、及C1-C6鹵烷基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的吡啶基)。

6. 一種通式(7')表示之芳香族醯胺衍生物;



(通式(7')中，

G¹及G²表示氧原子;

Y¹表示C1-C6鹵烷基;

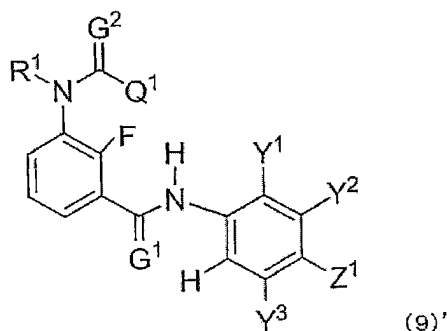
Y²及Y³表示氫原子;

Y⁴表示氟原子、溴原子或碘原子;

R¹表示氫原子、或C1-C6烷基;

Q¹表示無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、及氰基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的苯基、或無取代之吡啶基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、及C1-C6鹵烷基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的吡啶基)。

7. 如申請專利範圍第1項之通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物之製造方法，其中，該通式(4)表示之烷基化芳香族醯胺衍生物係下列通式(9)'表示之烷基化芳香族醯胺衍生物;



(通式(9)'中，

G^1 及 G^2 表示氧原子;

Y^1 、 Y^2 、及 Y^3 各自獨立地，表示氫原子、鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基亞磺醯基、C1-C4鹵烷基亞磺醯基、C1-C4烷基磺醯基、或C1-C4鹵烷基磺醯基;

Z^1 表示C1-C6鹵烷基;

R^1 表示C1-C6烷基、或C1-C6鹵烷基;

Q^1 表示C1-C6鹵烷基、

無取代之苯基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、氰基及硝基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的苯基、或

無取代之雜環基、或具有選自於由鹵素原子、C1-C6烷基、C1-C6鹵烷基、C1-C4烷氧基、C1-C4鹵烷氧基、C1-C4烷硫基、C1-C4鹵烷硫基、C1-C4烷基磺醯基、C1-C4鹵烷基磺醯基、氰基及硝基構成的群組中之1個以上的相同或相異的取代基的雜環基;

該雜環基表示吡啶基、N-氧化吡啶基或嘧啶基)。