

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局

(43) 国際公開日  
2019年10月10日(10.10.2019)



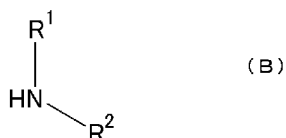
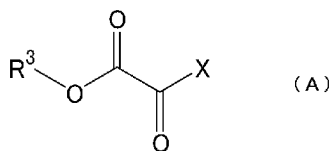
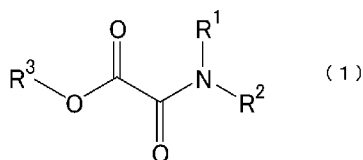
(10) 国際公開番号

WO 2019/193846 A1

- (51) 国際特許分類:  
C07C 231/02 (2006.01) C07D 295/185 (2006.01)  
C07C 235/72 (2006.01) C07F 7/10 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2019/005765
- (22) 国際出願日: 2019年2月18日(18.02.2019)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願 2018-070741 2018年4月2日(02.04.2018) JP
- (71) 出願人: ダイキン工業株式会社 (DAIKIN INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒5308323 大阪府大阪市北区中崎西二丁目4番12号梅田センタービル Osaka (JP).
- (72) 発明者: 林 航太郎 (HAYASHI, Kotaro); 〒5308323 大阪府大阪市北区中崎西二丁目4番12号梅田センタービル ダイキン工業株式会社内 Osaka (JP). 山内 昭佳(YAMAUCHI, Akiyoshi); 〒5308323 大阪府大阪市北区中崎西二丁目4番12号梅田センタービル ダイキン工業株式会社内 Osaka (JP). 鈴木 悠希 (SUZUKI, Yuuki); 〒5308323 大阪府大阪市北区中崎西二丁目4番12号梅田センタービル ダイキン工業株式会社内 Osaka (JP). 岸川 洋介 (KISHIKAWA, Yosuke); 〒5308323 大阪府大阪市北区中崎西二丁目4番12号梅田センタービル ダイキン工業株式会社内 Osaka (JP).
- (74) 代理人: 特許業務法人 安富国際特許事務所(YASUTOMI & ASSOCIATES); 〒5320003 大阪府大阪市淀川区宮原3丁目5番36号 Osaka (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH,

(54) Title: PRODUCTION METHOD FOR COMPOUND AND COMPOUND

(54) 発明の名称: 化合物の製造方法及び化合物



(57) Abstract: Provided is a novel production method for a compound. This production method for a compound (1) represented by the following general formula (1) (in the formula, R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are independent of each other and are a fluorine atom or an organic group having a carbon number of 6 or less, and may be bonded to each other to form a cyclic structure. R<sup>3</sup> is an organic group having a carbon number of 7 or less and a carbon-carbon unsaturated bond.), wherein said production method is characterized by comprising a step (1) for reacting a compound (A) represented by the following general formula (A) (in the formula, R<sup>3</sup> is the same as previously described. X is a halogen atom.) and an amine (B) represented by the following general formula (B) (in the formula, R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are the same as previously described.) to obtain the compound (1).

(57) 要約: 新規な化合物の製造方法を提供する。下記一般式 (1) (式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。R<sup>3</sup>は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。)で表される化合物(1)を製造する方法であって、下記一般式(A): (式中、R<sup>3</sup>は、前記と同じである。Xは、ハロゲン原子である。)で表される化合物(A)と、下記一般式(B): (式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、前記と同じである。)で表されるアミン(B)とを反応させることにより、化合物(1)を得る工程(1)を含むことを特徴とする製造方法である。



KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY,  
MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,  
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT,  
QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL,  
SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類：

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))

## 明 細 書

発明の名称：化合物の製造方法及び化合物

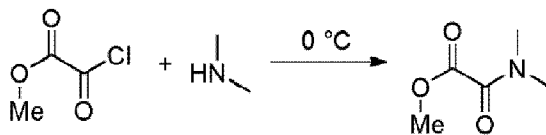
### 技術分野

[0001] 本開示は、化合物の製造方法及び化合物に関する。

### 背景技術

[0002] 特許文献1には、下記式で表される反応等が記載されている。

[化1]



### 先行技術文献

### 特許文献

[0003] 特許文献1：欧州特許出願公開第2940010号明細書

### 発明の概要

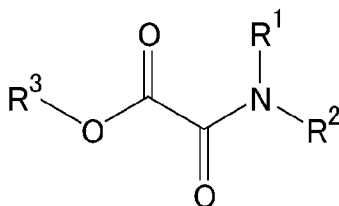
### 発明が解決しようとする課題

[0004] 本開示は、新規な化合物の製造方法及び新規な化合物を提供することを目的とする。

### 課題を解決するための手段

[0005] 本開示は、下記一般式(1)：

[化2]

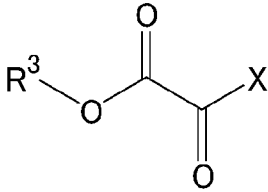


(式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。R<sup>3</sup>は、炭素-炭素不

飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。)で表される化合物(1)を製造する方法であって、

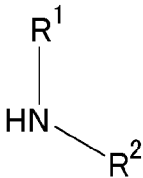
下記一般式(A)：

[化3]



(式中、R<sup>3</sup>は、前記と同じである。Xは、ハロゲン原子である。)で表される化合物(A)と、下記一般式(B)：

[化4]



(式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、前記と同じである。)で表されるアミン(B)とを反応させることにより、化合物(1)を得る工程(1)を含むことを特徴とする製造方法に関する。

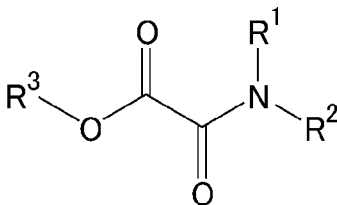
[0006] 工程(1)の反応を、塩基(但し、アミン(B)を除く)の存在下に実施することが好ましい。

[0007] R<sup>3</sup>は、炭素-炭素二重結合又は炭素-炭素三重結合を1つ含むことが好ましい。

[0008] R<sup>3</sup>は、2-プロペニル基又は2-プロピニル基であることが好ましい。

[0009] 本開示は、下記一般式(1)：

[化5]



(式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。 $R^3$ は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。)で表されることを特徴とする化合物にも関する。

### 発明の効果

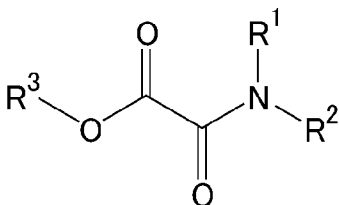
[0010] 本開示によれば、新規な化合物の製造方法及び新規な化合物を提供することができる。

### 発明を実施するための形態

[0011] 以下、本開示を具体的に説明する。

[0012] 本開示の製造方法では、下記一般式(1)：

[化6]



(式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。 $R^3$ は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。)で表される化合物(1)を製造する。

化合物(1)は新規化合物であり、本開示は化合物(1)にも関する。

[0013] 一般式(1)中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基である。

$R^1$ 及び $R^2$ としての上記有機基は、少なくとも1個の炭素原子を含む基であり、炭素原子以外の原子、例えば、水素原子、酸素原子、窒素原子、硫黄原子、ケイ素原子、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子等)等を更に有していてもよい。

上記有機基の炭素数は、1~6であることが好ましく、1~5であることがより好ましく、1~3であることが更に好ましい。

[0014] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>としての上記有機基としては、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アリール基等が挙げられ、これらの基は1つ以上の置換基を有していてもよい。

上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0015] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>としての上記アルキル基は、炭素数が1～6であることが好ましく、1～5であることがより好ましく、1～3であることが更に好ましい。上記アルキル基は、フッ素原子を有していてもよく、シアノ基等のヘテロ原子を含む基を有していてもよい。また、上記アルキル基はシクロアルキル基であってもよい。

フッ素原子を有しないアルキル基としては、メチル基(-CH<sub>3</sub>)、エチル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、プロピル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、イソプロピル基(-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)、ブチル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、*sec*-ブチル基(-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、*tert*-ブチル基(-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>)、シクロプロピル基(-CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>)、シアノメチル基(-CH<sub>2</sub>CN)等が挙げられる。なかでも、メチル基(-CH<sub>3</sub>)、エチル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、プロピル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、シアノメチル基(-CH<sub>2</sub>CN)が好ましい。

フッ素原子を有するアルキル基(フッ素化アルキル基)としては、-CF<sub>3</sub>、-CF<sub>2</sub>H、-CFH<sub>2</sub>、-CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>、-CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-CF<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>、-CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CFHCF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CFHCF<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CFHCFH<sub>2</sub>、-CF<sub>2</sub>CFHCF<sub>3</sub>、-CH(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CF(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(CF<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>等が挙げられる。なかでも、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>Hが好ましい。

上記アルキル基としては、メチル基 ( $-\text{CH}_3$ )、エチル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、シアノメチル基 ( $-\text{CH}_2\text{CN}$ )、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$  が特に好ましい。

[0016]  $\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  としての上記アルケニル基としては、1つ以上の置換基を有していてもよい炭素数2~5のアルケニル基が好ましい。上記アルケニル基の炭素数は、2~4であることが好ましい。

上記アルケニル基としては、エテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-プロペニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、1-メチルエテニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、2-プロペニル基 (アリル基、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-ブテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-メチル-1-プロペニル基 ( $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$ )、1-メチル-1-プロペニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、1-エチルエテニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、2-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、2-メチル-2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、1-メチル-2-プロペニル基 ( $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、3-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-メチレン-2-プロペニル基 ( $-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1,3-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2,3-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}_2$ )、1-メチル-1,2-プロパジエニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}=\text{CH}_2$ )、1,2-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、2-ペンテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、及び、これらの基の少なくとも1つの水素原子が置換基により置換された基が挙げられる。

[0017] 上記アルケニル基が有してもよい上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0018] 上記アルケニル基としては、なかでも、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、及び、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ ) において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基が好ましく、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ ) がより好ましい。

[0019] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>としての上記アルキニル基としては、1つ以上の置換基を有していてもよい炭素数2～6のアルキニル基が好ましい。上記アルキニル基の炭素数は、2～5であることが好ましく、2～4であることがより好ましい。上記アルキニル基としては、エチニル基(-C≡CH)、1-プロピニル基(-C≡C-CH<sub>3</sub>)、2-プロピニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡CH)、1-ブチニル基(-C≡C-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、2-ブチニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡C-CH<sub>3</sub>)、3-ブチニル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C≡CH)、1-ペンチニル基(-C≡C-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、2-ペンチニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡C-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、3-ペンチニル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C≡C-CH<sub>3</sub>)、4-ペンチニル基(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-C≡CH)、及び、これらの基の少なくとも1つの水素原子が置換基により置換された基が挙げられる。

[0020] 上記アルキニル基が有してもよい上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子、シリル基が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0021] 上記アルキニル基としては、なかでも、2-プロピニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡CH)、及び、2-プロピニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡CH)において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子又はシリル基により置換された基が好ましく、2-プロピニル基(-CH<sub>2</sub>-C≡CH)がより好ましい。

[0022] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>としての上記アリール基としては、炭素数5～7のアリール基が好ましい。上記アリール基の炭素数は、5～6であることが好ましい。上記アリール基は、6員の芳香族炭化水素環又は芳香族複素環を含むことが好ましい。

[0023] 上記アリール基としては、フェニル基、ベンジル基、トリル基、ピリジル基等が挙げられ、これらの基は1つ以上の置換基を有していてもよい。上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

上記アリール基としては、なかでも、フェニル基、ベンジル基、ピリジル基



が好ましく、フェニル基、ピリジル基がより好ましい。

[0024] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに結合して環状構造を形成してもよい。この場合、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに結合して一般式(1)中の窒素原子(一般式(1)におけるアミド結合中の窒素原子)とともに5員又は6員の複素環を形成する炭化水素基であることが好ましい。上記複素環は、非芳香族複素環であることが好ましい。また、上記複素環は、炭素数が3~5であることが好ましく、4~5であることがより好ましい。

上記炭化水素基は、構造中にO、S及びNからなる群より選択される少なくとも1種を含んでいてもよい。

[0025] 上記炭化水素基としては、一般式(1)中の窒素原子とともにピロリジン環、ピペリジン環、オキサゾリジン環、モルホリン環、チアゾリジン環、2,5-ジヒドロ-1H-ピロール環、ピロール-2,5-ジオン環、4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール環等を形成する基が挙げられる。

なかでも、一般式(1)中の窒素原子とともにピロリジン環、ピペリジン環、モルホリン環、2,5-ジヒドロ-1H-ピロール環又はピロール-2,5-ジオン環を形成する基が好ましく、一般式(1)中の窒素原子とともにピロリジン環、ピペリジン環又はモルホリン環を形成する基がより好ましい。

[0026] R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>としては、なかでも、フッ素原子を有していてもよいアルキル基、互いに結合して一般式(1)中の窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成する炭化水素基が好ましい。

[0027] 一般式(1)中、R<sup>3</sup>は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。

R<sup>3</sup>としての上記有機基は、少なくとも1つの炭素-炭素不飽和結合を含む基であり、炭素原子以外の原子、例えば、水素原子、酸素原子、窒素原子、硫黄原子、ケイ素原子、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子等)等を更に有していてもよい。

上記炭素-炭素不飽和結合は、炭素-炭素二重結合(-C=C-)、又は、

炭素-炭素三重結合 ( $-C\equiv C-$ ) であることが好ましい。

上記有機基は、炭素数が2~6であることが好ましく、2~5であることがより好ましく、2~4であることが更に好ましい。

[0028]  $R^3$ としての上記有機基としては、アルケニル基、アルキニル基、アリール基等が挙げられ、これらの基は1つ以上の置換基を有していてもよい。上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0029]  $R^3$ としての上記アルケニル基としては、1つ以上の置換基を有していてもよい炭素数2~5のアルケニル基が好ましい。

上記アルケニル基としては、エテニル基 ( $-CH=CH_2$ )、1-プロペニル基 ( $-CH=CH-CH_3$ )、1-メチルエテニル基 ( $-C(CH_3)=CH_2$ )、2-プロペニル基 (アリル基、 $-CH_2-CH=CH_2$ )、1-ブテニル基 ( $-CH=CH-CH_2CH_3$ )、2-メチル-1-プロペニル基 ( $-CH=C(CH_3)-CH_3$ )、1-メチル-1-プロペニル基 ( $-C(CH_3)=CH-CH_3$ )、1-エチルエテニル基 ( $-C(CH_2CH_3)=CH_2$ )、2-ブテニル基 ( $-CH_2-CH=CH-CH_3$ )、2-メチル-2-プロペニル基 ( $-CH_2-C(CH_3)=CH_2$ )、1-メチル-2-プロペニル基 ( $-CH(CH_3)-CH=CH_2$ )、3-ブテニル基 ( $-CH_2CH_2-CH=CH_2$ )、1-メチレン-2-プロペニル基 ( $-C(=CH_2)-CH=CH_2$ )、1,3-ブタジエニル基 ( $-CH=CH-CH=CH_2$ )、2,3-ブタジエニル基 ( $-CH_2-CH=C=CH_2$ )、1-メチル-1,2-プロパジエニル基 ( $-C(CH_3)=C=CH_2$ )、1,2-ブタジエニル基 ( $-CH=C=CH-CH_3$ )、2-ペンテニル基 ( $-CH_2-CH=CH-CH_2CH_3$ )、及び、これらの基の少なくとも1つの水素原子が置換基により置換された基が挙げられる。

[0030] 上記アルケニル基が有してもよい上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン

原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0031] 上記アルケニル基は、フッ素原子を有するアルケニル基であることも好ましい。上記フッ素原子を有するアルケニル基としては、エテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-プロペニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、1-メチルエテニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、2-プロペニル基 (アリル基、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-ブテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-メチル-1-プロペニル基 ( $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$ )、1-メチル-1-プロペニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、1-エチルエテニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、2-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、2-メチル-2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ )、1-メチル-2-プロペニル基 ( $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、3-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、1-メチレン-2-プロペニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_2)=\text{CH}-\text{CH}_2$ )、1,3-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2,3-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}_2$ )、1-メチル-1,2-ブタジエニル基 ( $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}=\text{CH}_2$ )、1,2-ブタジエニル基 ( $-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_3$ ) 及び2-ペンテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ) において、少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基が挙げられる。

[0032] 上記アルケニル基としては、なかでも、炭素-炭素二重結合を1つ含むものが好ましく、  
 エテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、3-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、並びに、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{H})-\text{CH}_3$ )、2-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ ) 及び2-ペンテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ) において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基がより好ましく、  
 エテニル基 ( $-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、2-ブテニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$ )、3-ブテニル基 ( $-\text{C}$

$\text{H}_2\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、 $-\text{CH}_2-\text{CF}=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CF}=\text{CF}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CF}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CF}=\text{CF}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{F}-\text{CF}_3$ 、及び、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_2\text{CF}_3$ が更に好ましく、

2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、 $-\text{CH}_2-\text{CF}=\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_3$ 、及び、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_2\text{CF}_3$ が特に好ましく、

2-プロペニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ )、 $-\text{CH}_2-\text{CF}=\text{CH}_2$ 及び $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CF}_3$ が最も好ましい。

[0033]  $\text{R}^3$ としての上記アルキニル基としては、1つ以上の置換基を有していてもよい炭素数2~6のアルキニル基が好ましい。

上記アルキニル基としては、エチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-プロピニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、2-プロピニル基 (プロパルギル基、 $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-ブチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-ブチニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、3-ブチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-ペンチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、3-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、4-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、及び、これらの基の少なくとも1つの水素原子が置換基により置換された基が挙げられる。

[0034] 上記アルキニル基が有してもよい上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子、シリル基が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

[0035] 上記アルキニル基は、フッ素原子を有するアルキニル基であることも好ましい。上記フッ素原子を有するアルキニル基としては、エチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-プロピニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、2-プロピニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-ブチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-ブチニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、3-ブチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、1-ペンチニル基 ( $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、2-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ )、3-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ )、4-ペンチニル基 ( $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ )、及び、これらの基の少なくとも1つの水素原子が置換基により置換された基が挙げられる。

$\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ）、3-ペンチニル基（ $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ ）及び4-ペンチニル基（ $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）において、少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基が挙げられる。

[0036] 上記アルキニル基としては、なかでも、炭素-炭素三重結合を1つ含むものが好ましく、

エチニル基（ $-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）、1-プロピニル基（ $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ ）、2-プロピニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）、1-ブチニル基（ $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ）、2-ブチニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ ）、2-ペンチニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ）、及び、これらの基において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子又はシリル基により置換された基がより好ましく、

$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{TMS}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{F}$ 、1-プロピニル基（ $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ ）、 $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CF}_3$ 、2-プロピニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）、 $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、2-プロピニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子又はシリル基により置換された基、2-ブチニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$ ）において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基、並びに、2-ペンチニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ）において少なくとも1つの水素原子がフッ素原子により置換された基が更に好ましく、

2-プロピニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）、 $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{TMS}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CF}_3$ 及び $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CF}_2\text{CF}_3$ が特に好ましく、

2-プロピニル基（ $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ ）及び $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{TMS}$ が最も好ましい。

なお、上記式中、 $-\text{TMS}$ は、トリメチルシリル基を意味する。

[0037]  $\text{R}^3$ としての上記アリール基としては、炭素数6~7のアリール基が好ましい。上記アリール基は、6員の芳香族炭化水素環を含むことが好ましい。

[0038] 上記アリール基としては、フェニル基、ベンジル基、トリル基等が挙げられ、これらの基は1つ以上の置換基を有していてもよい。

上記置換基としては、ハロゲン原子、アルキル基、フッ素化アルキル基、ヘテロ原子を含む基等が挙げられ、ハロゲン原子が好ましく、フッ素原子がより好ましい。

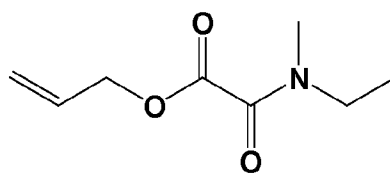
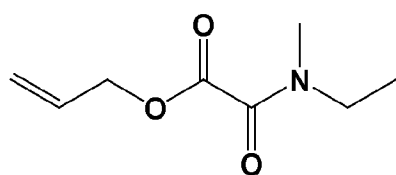
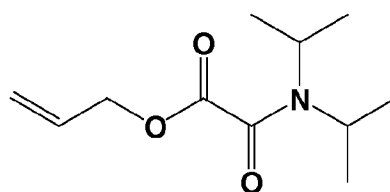
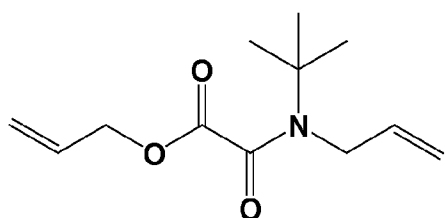
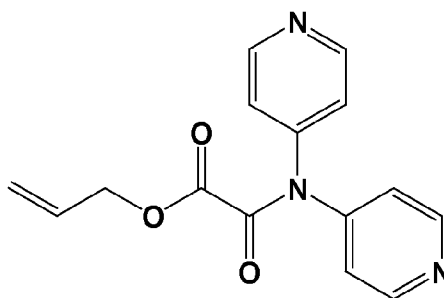
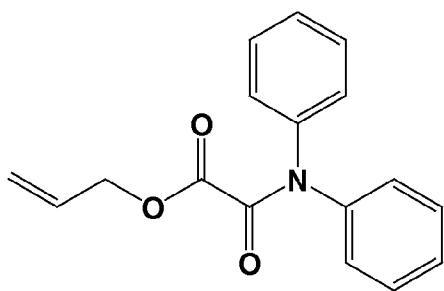
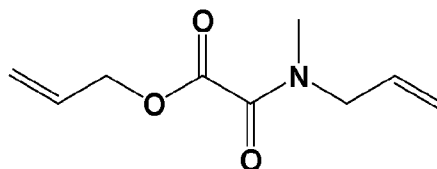
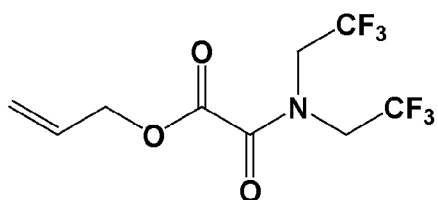
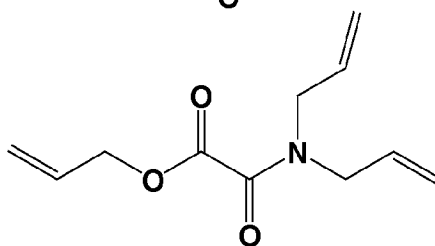
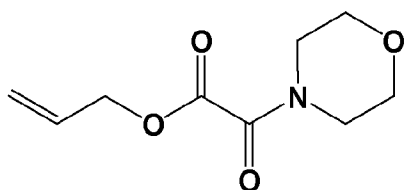
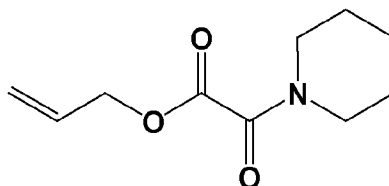
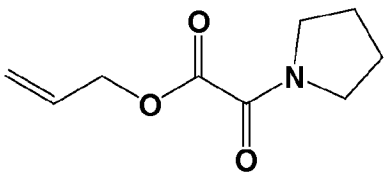
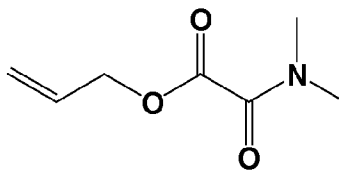
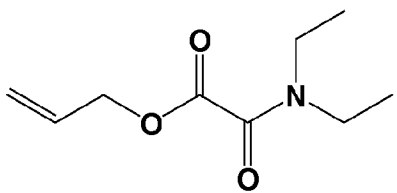
上記アリール基としては、なかでも、フェニル基、ベンジル基が好ましい。

[0039]  $R^3$ は、炭素-炭素二重結合又は炭素-炭素三重結合を1つ含むことが好ましく、炭素-炭素二重結合を1つ含む炭素数2~6のアルケニル基、又は、炭素-炭素三重結合を1つ含む炭素数2~6のアルキニル基であることがより好ましく、2-プロペニル基又は2-プロピニル基であることが更に好ましい。

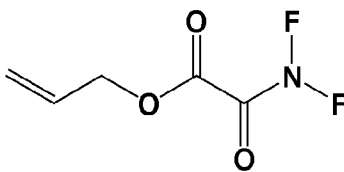
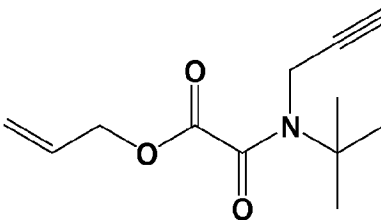
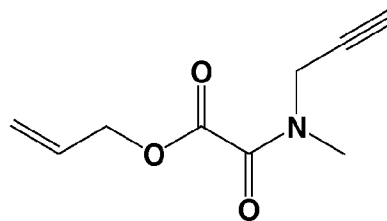
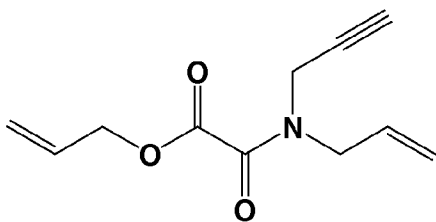
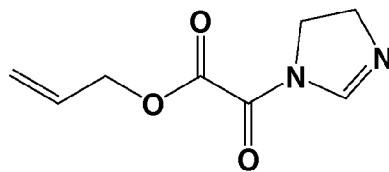
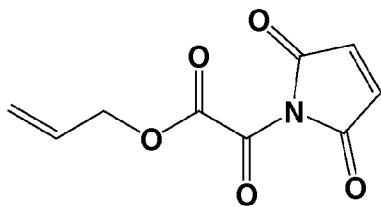
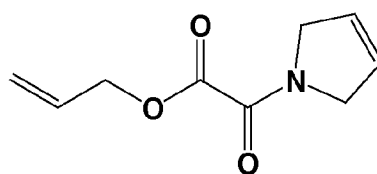
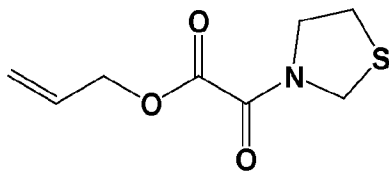
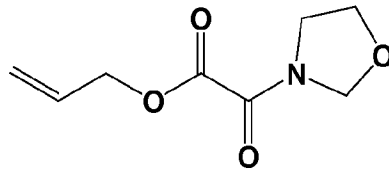
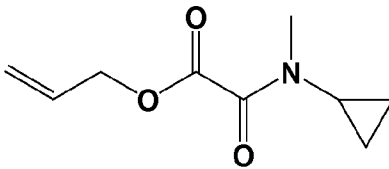
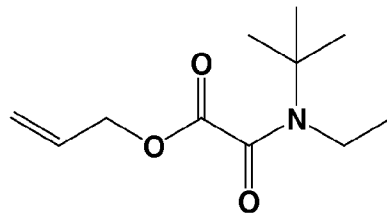
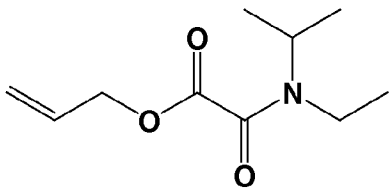
[0040] 化合物(1)としては、例えば、下記式で表される化合物が例示できる。なお、本明細書中の化合物の例示は、当該化合物の幾何異性体(存在する場合)も含むものとし、記載した具体例に限定されるものではない。

[0041]

[化7]

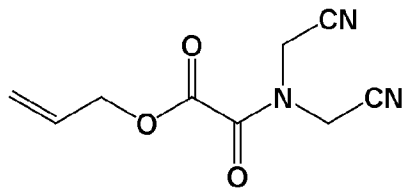
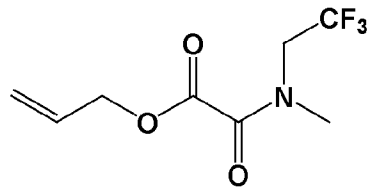
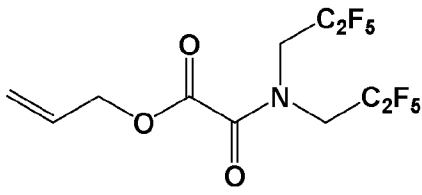


[化8]

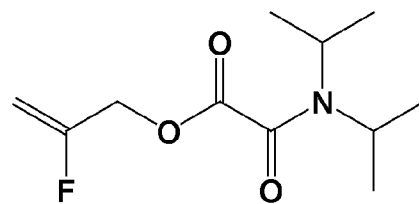
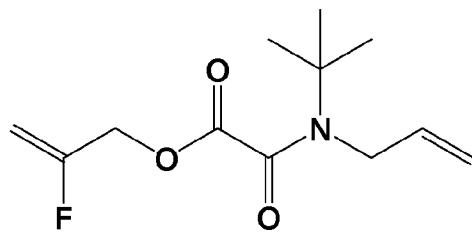
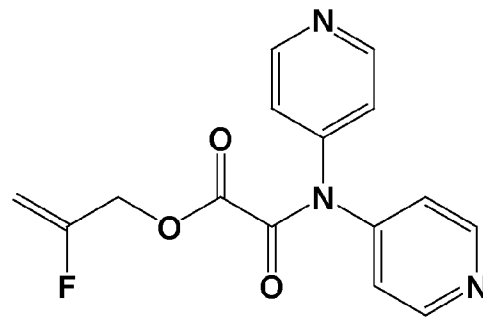
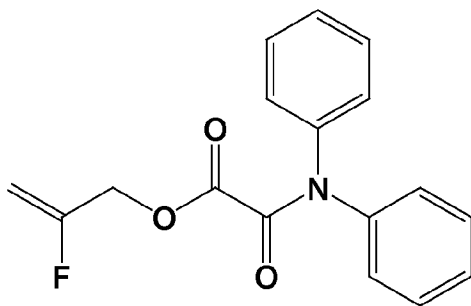
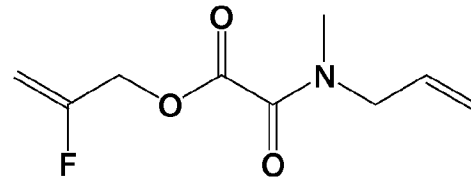
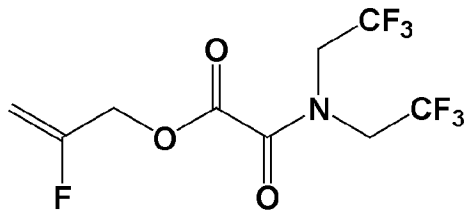
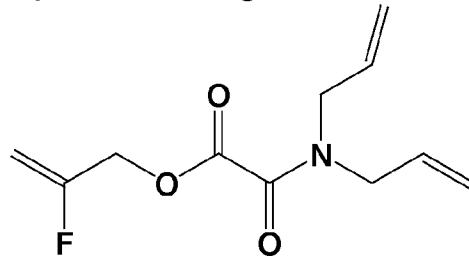
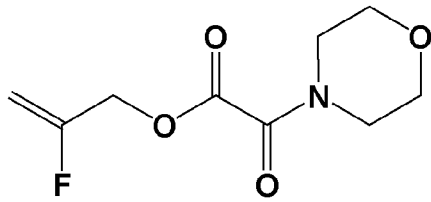
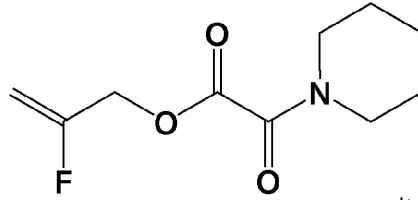
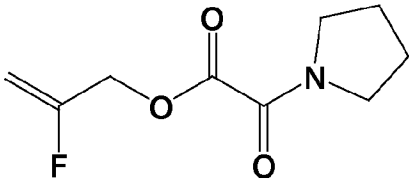
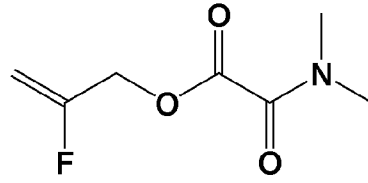
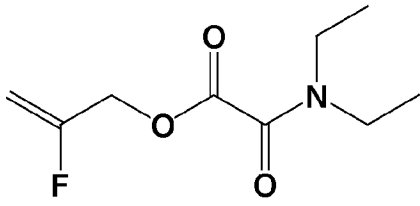




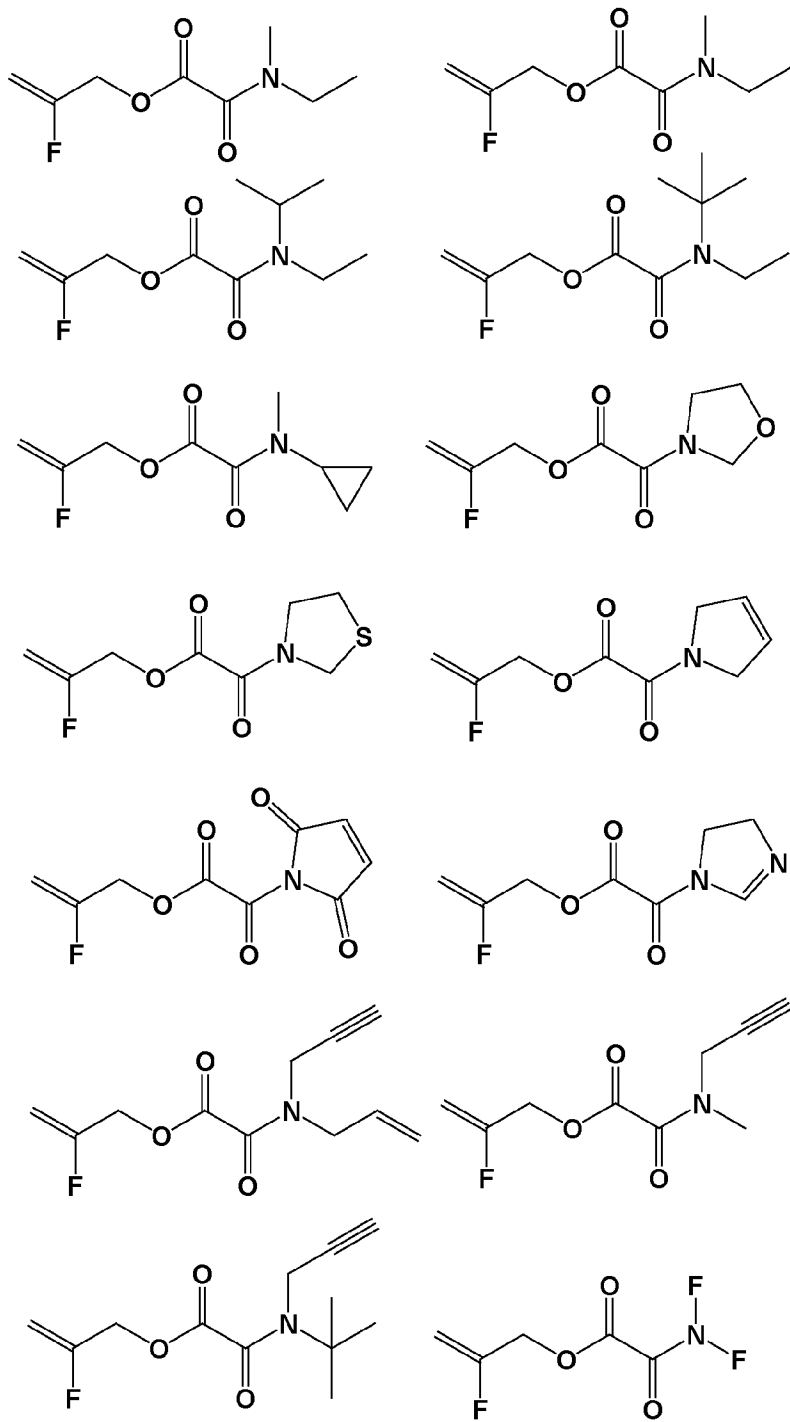
[化9]



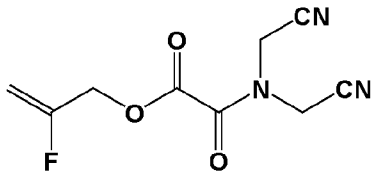
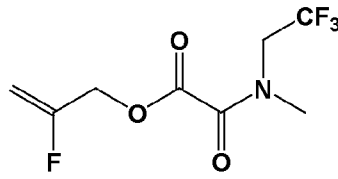
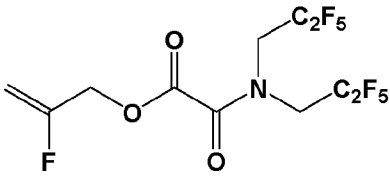
[化10]



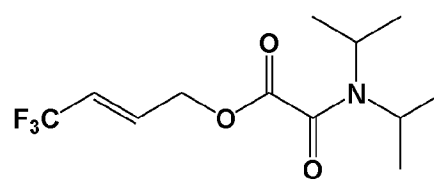
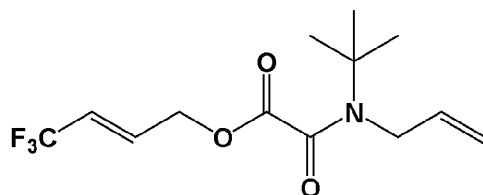
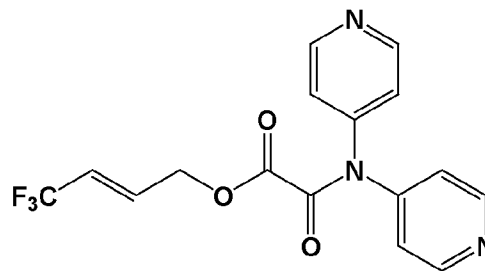
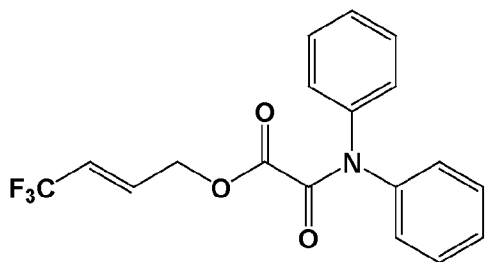
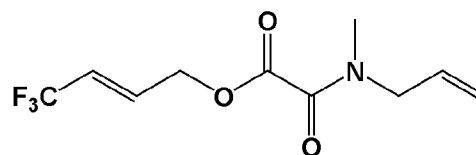
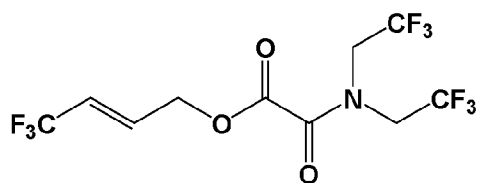
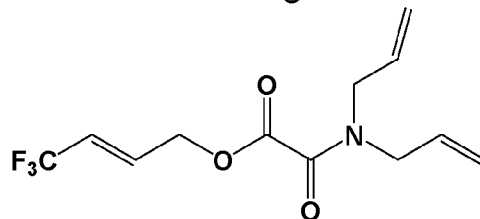
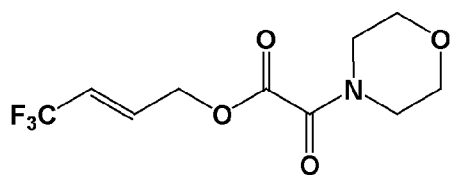
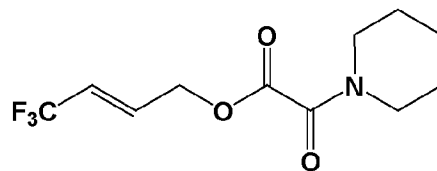
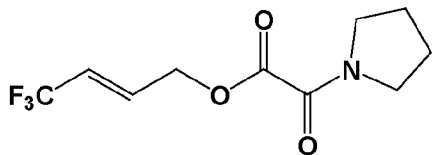
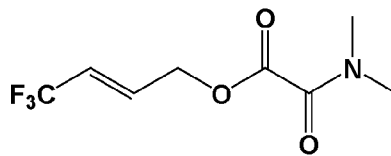
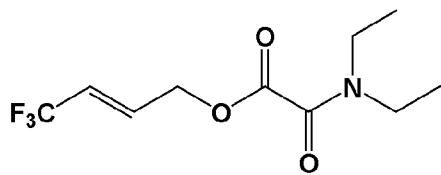
[化11]



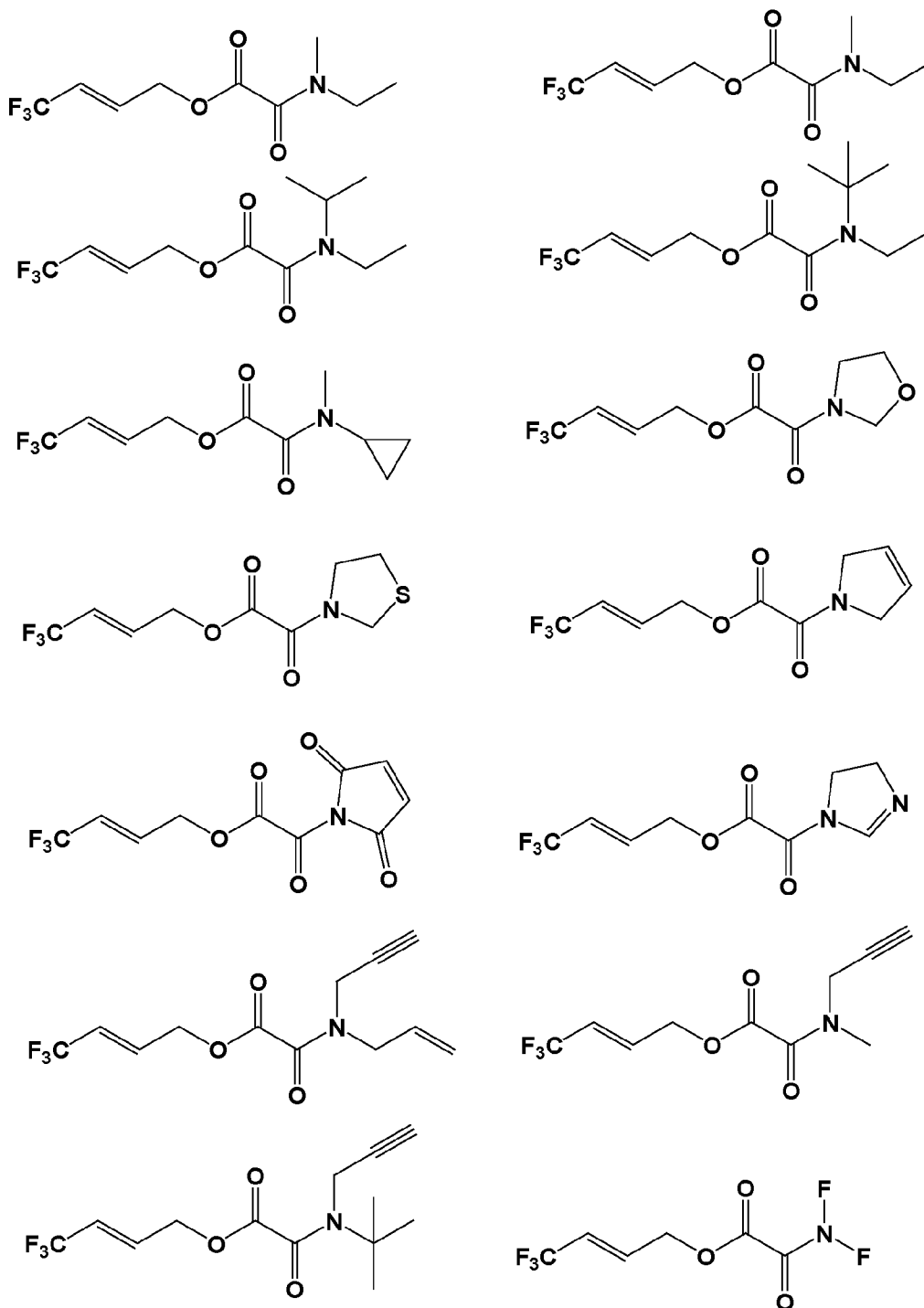
[化12]



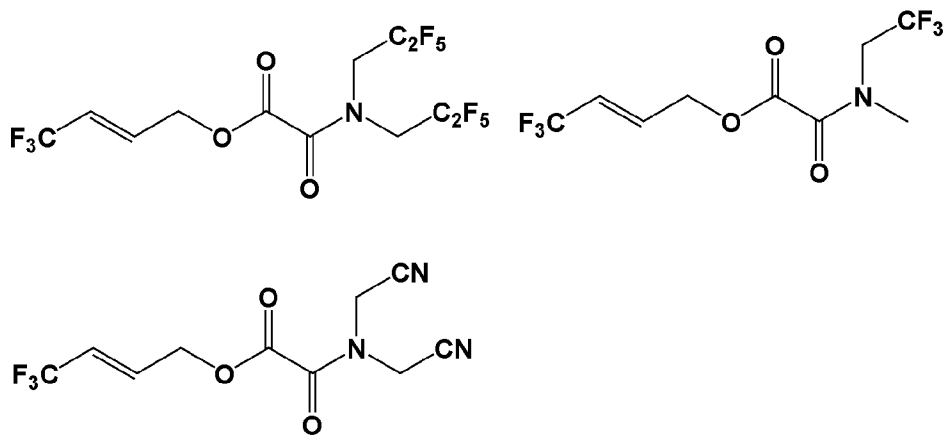
[化13]



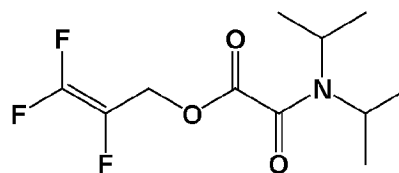
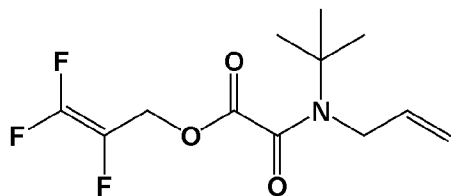
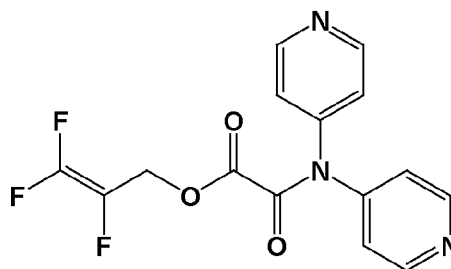
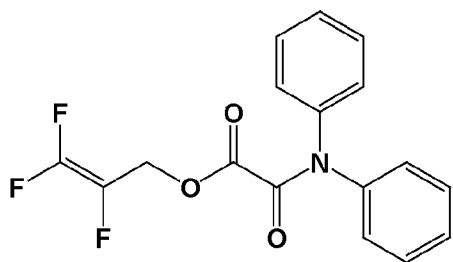
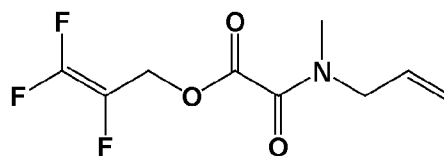
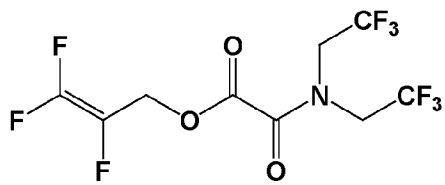
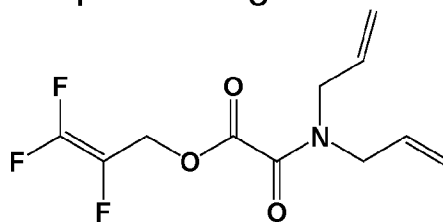
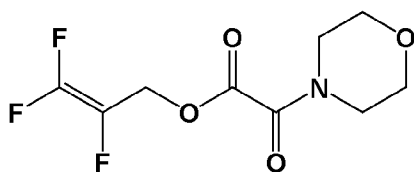
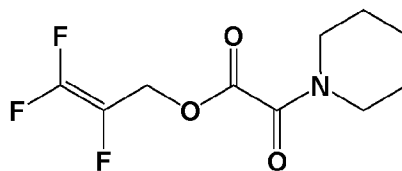
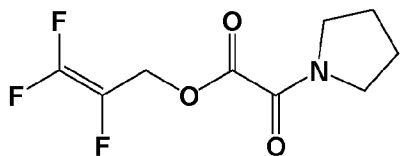
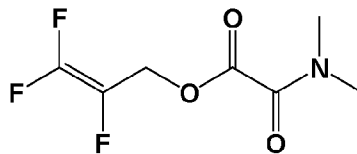
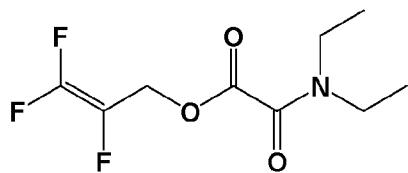
[化14]



[化15]

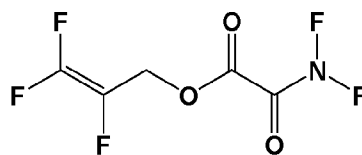
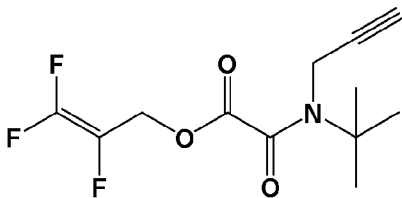
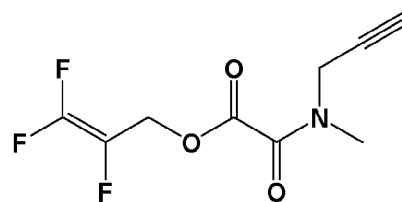
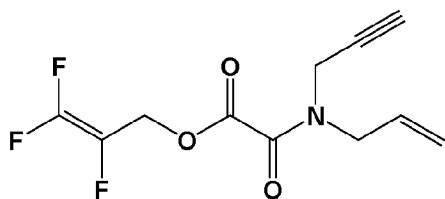
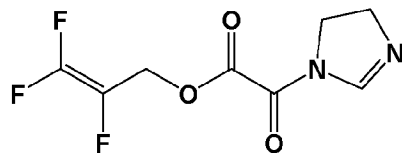
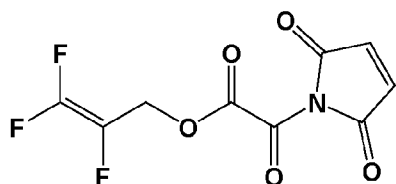
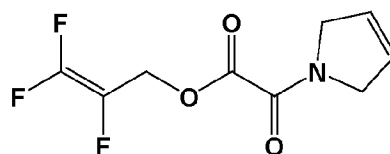
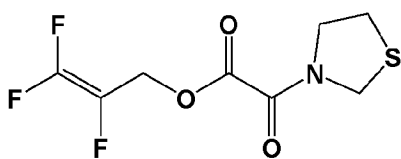
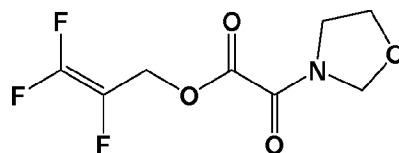
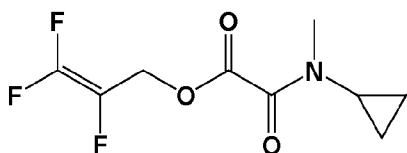
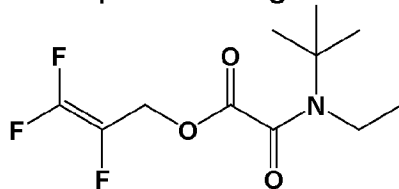
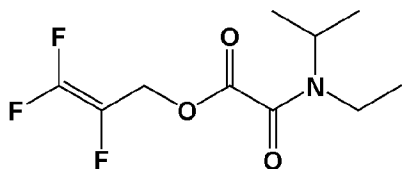
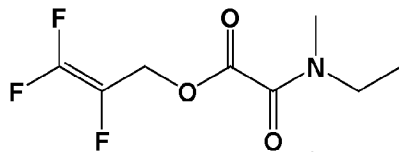
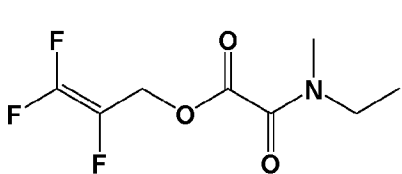


[化16]

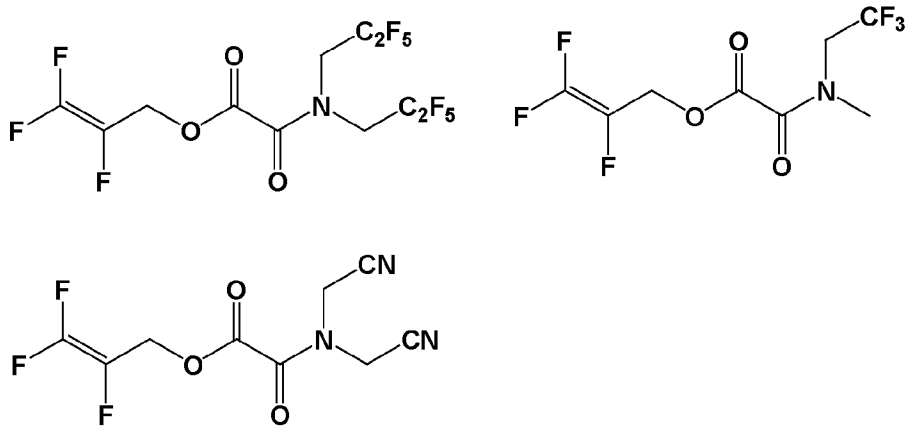




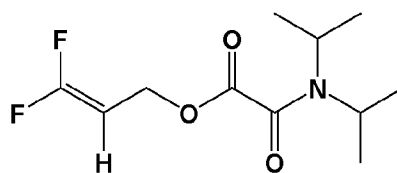
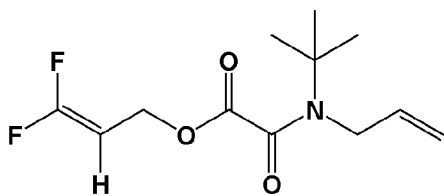
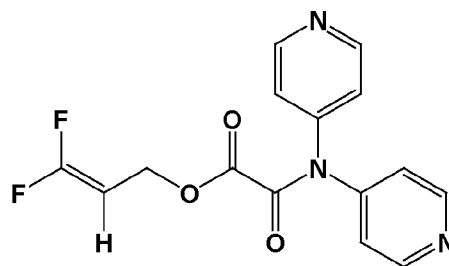
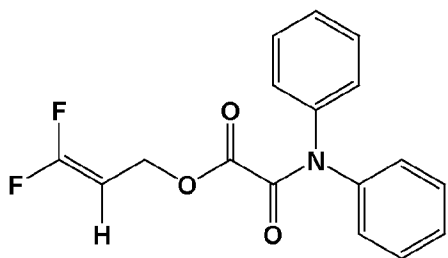
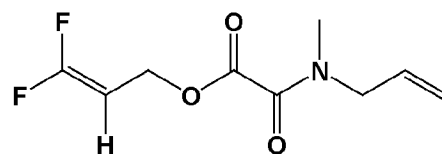
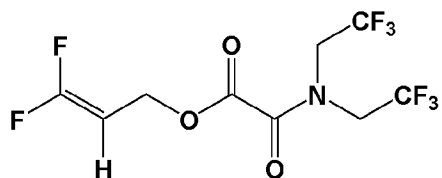
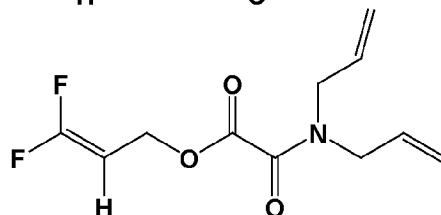
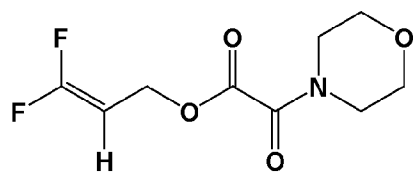
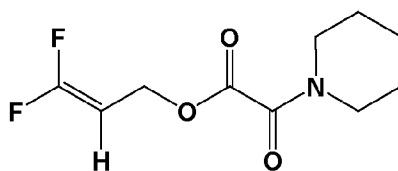
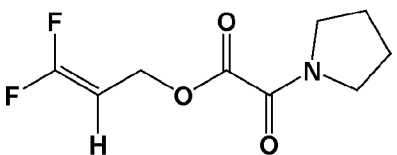
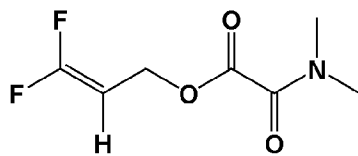
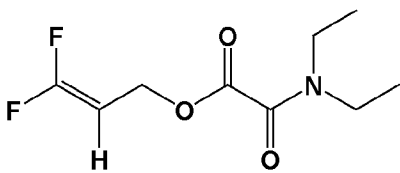
[化17]



[化18]

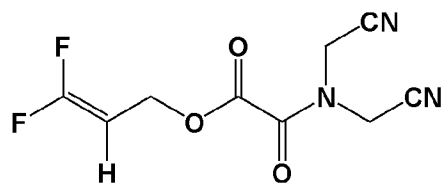
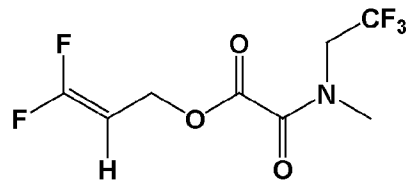
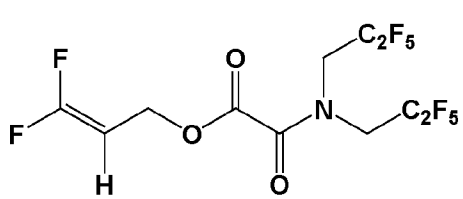


[化19]

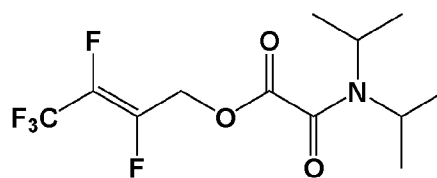
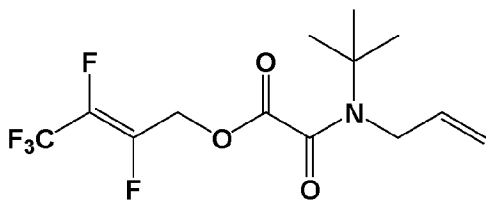
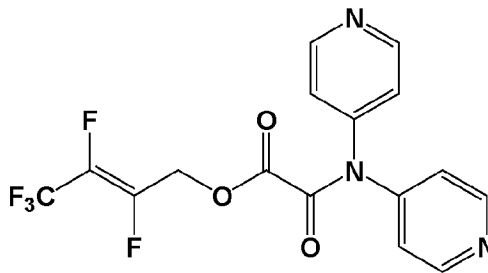
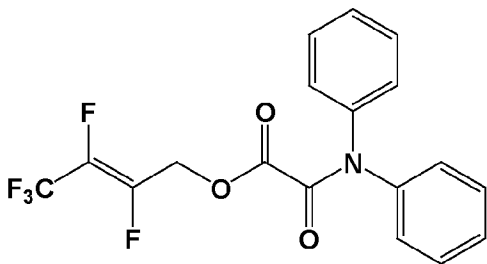
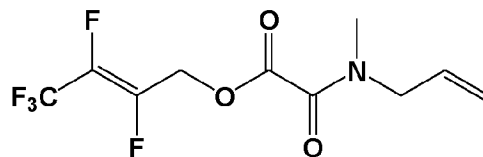
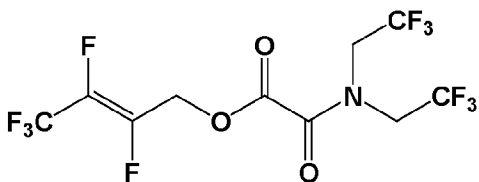
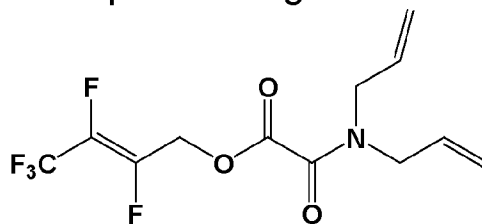
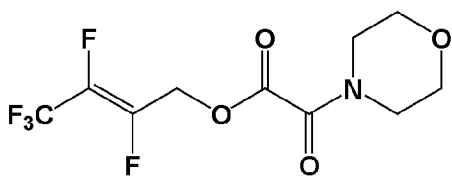
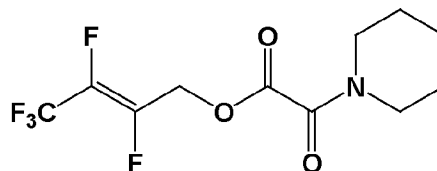
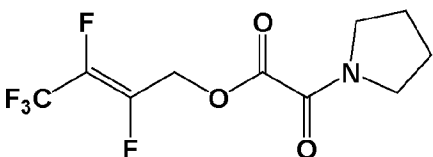
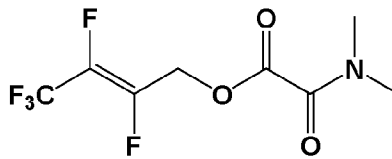
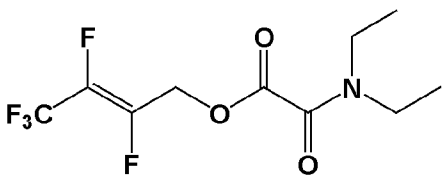




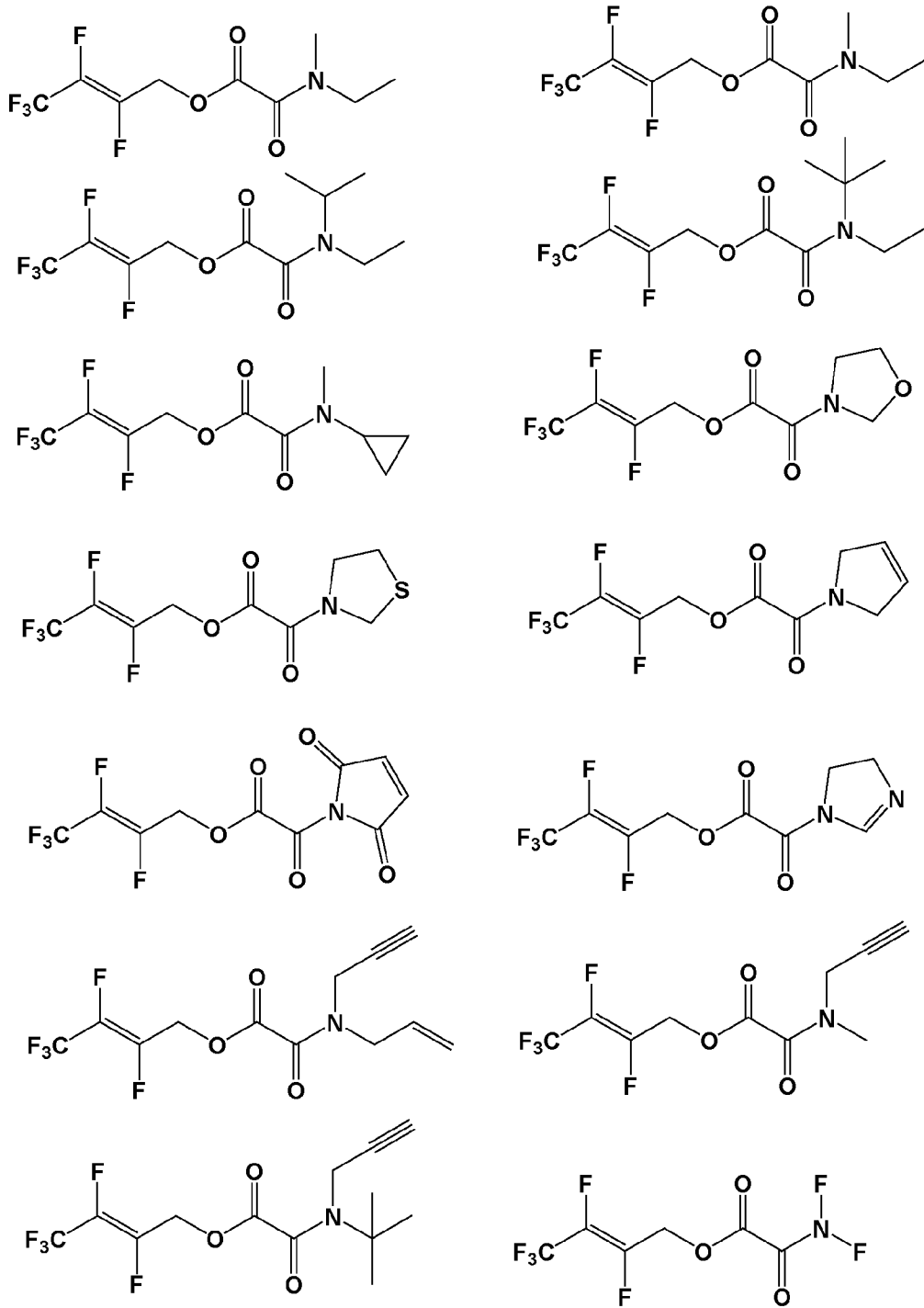
[化21]



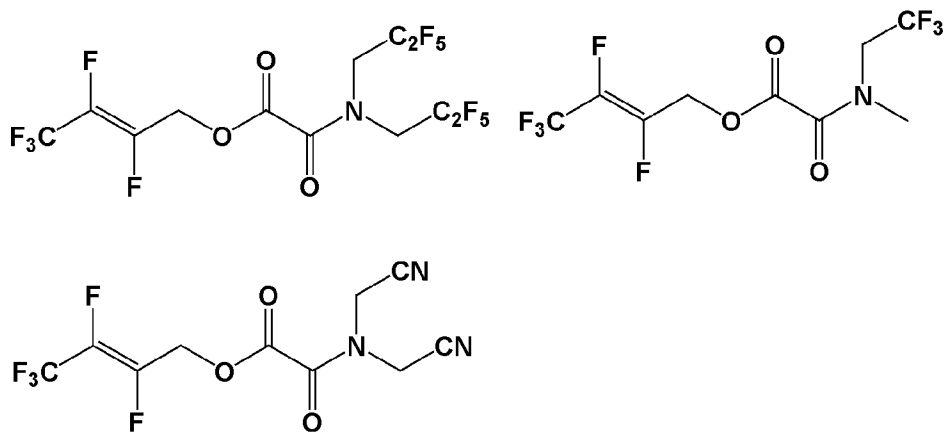
[化22]



[化23]

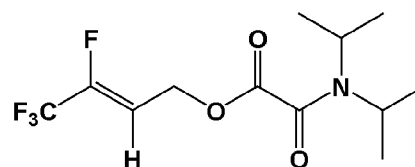
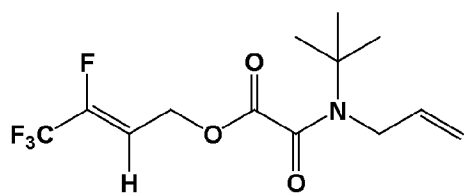
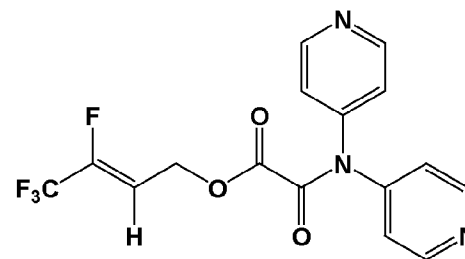
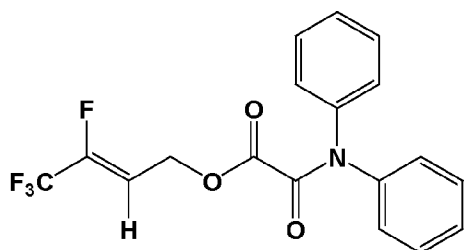
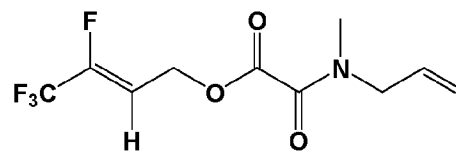
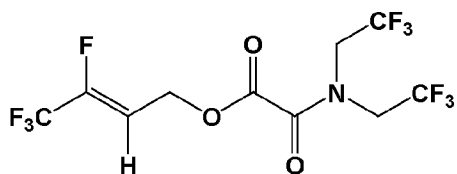
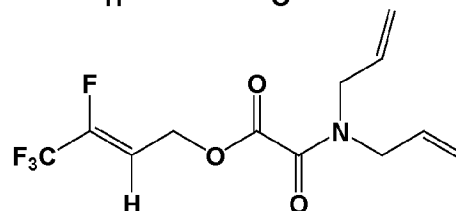
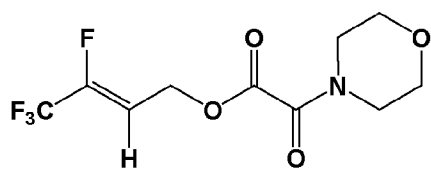
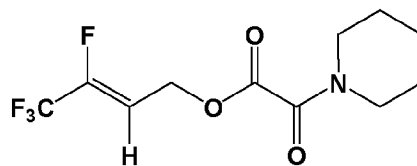
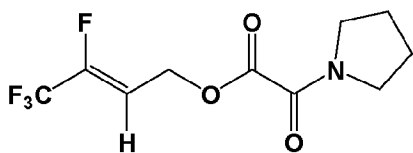
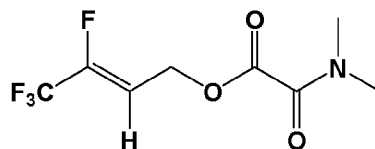
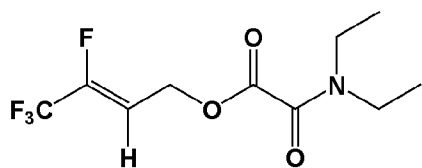


[化24]



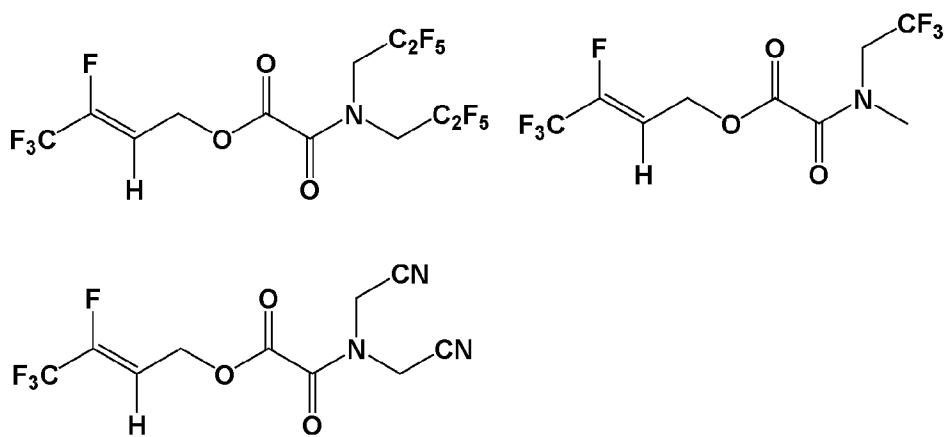


[化25]

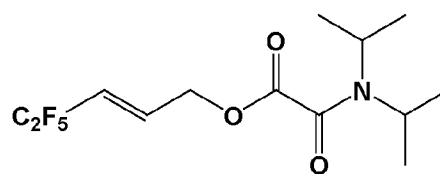
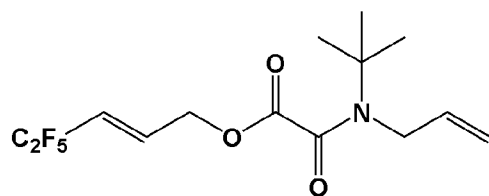
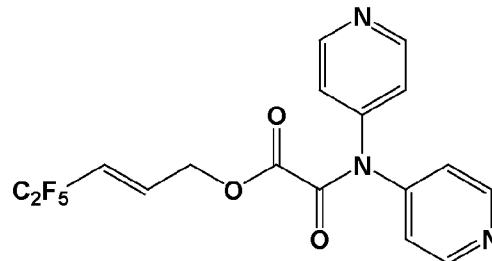
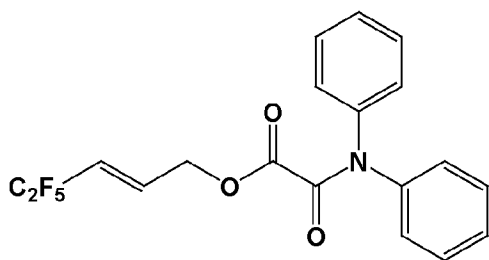
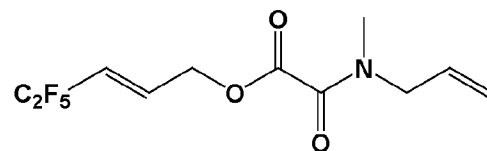
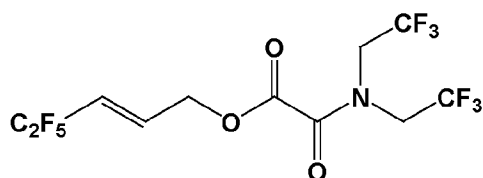
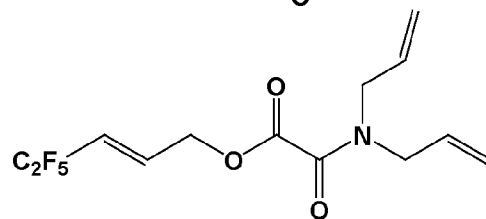
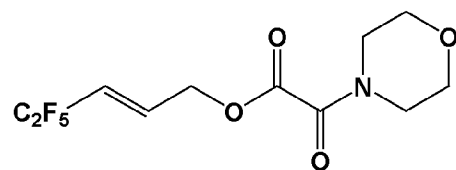
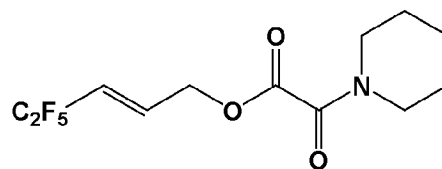
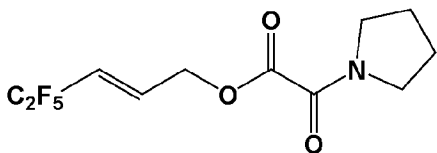
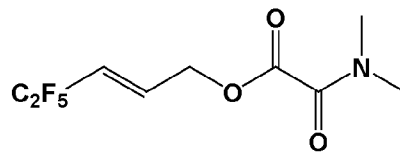
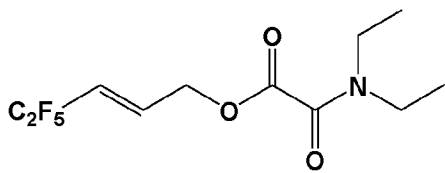




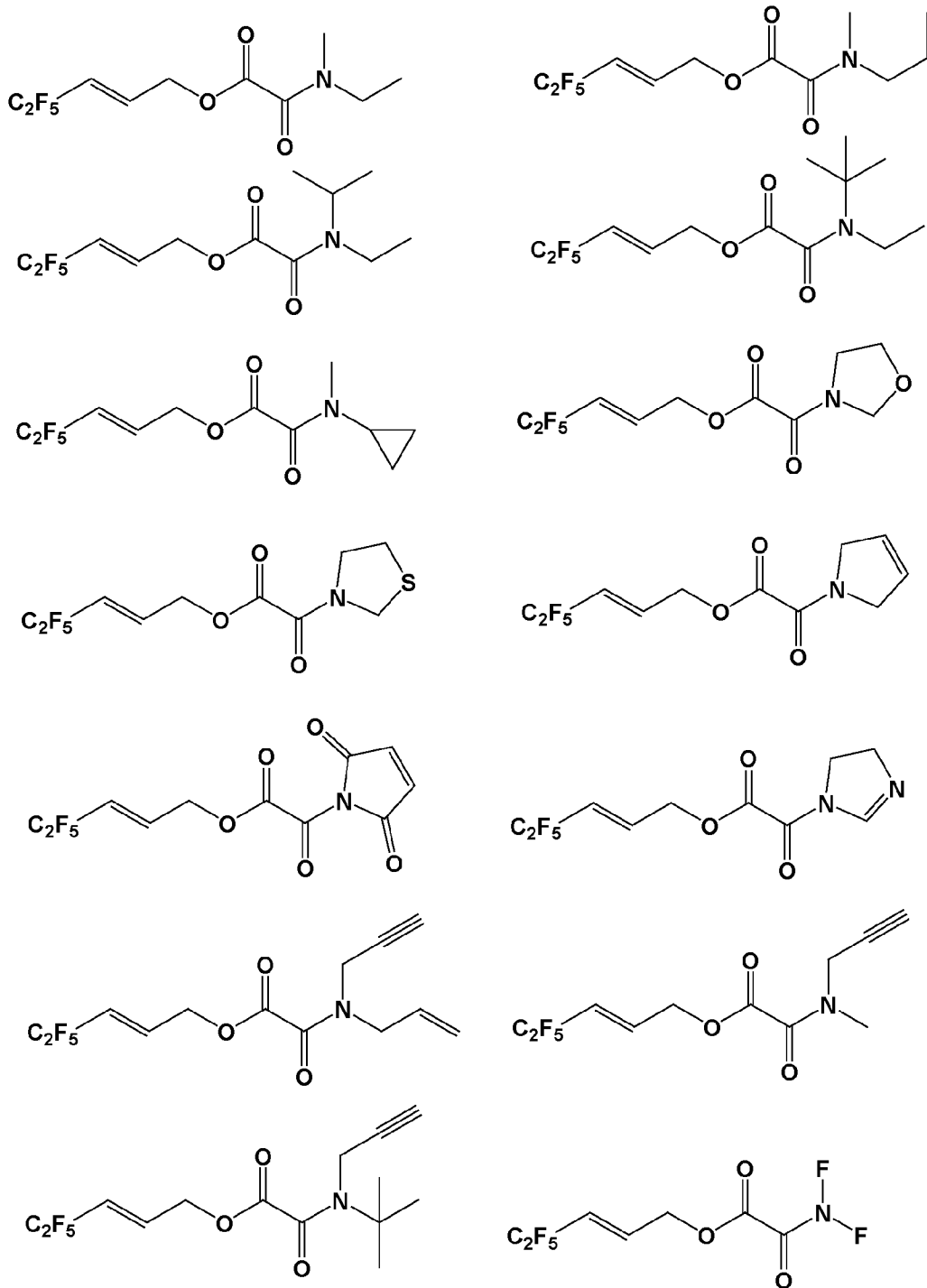
[化27]



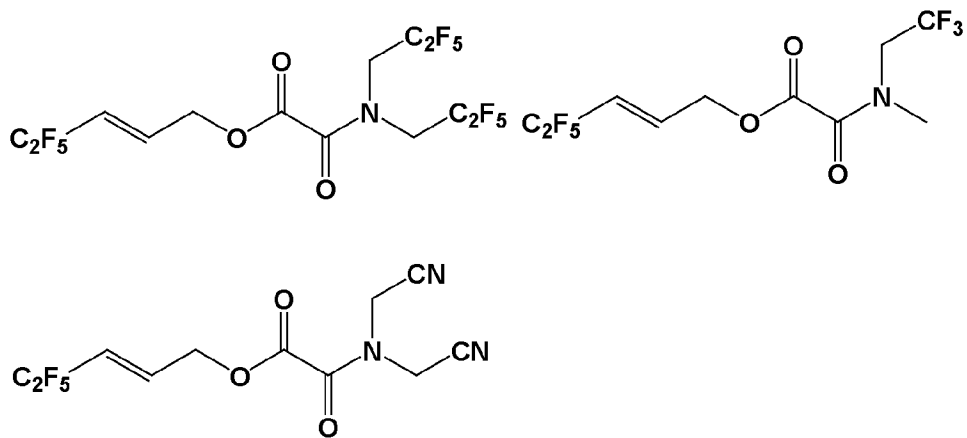
[化28]



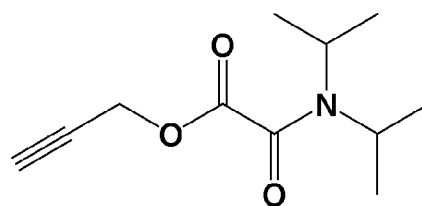
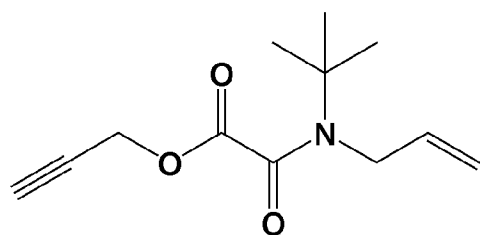
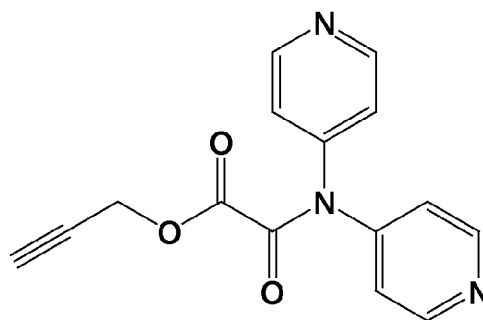
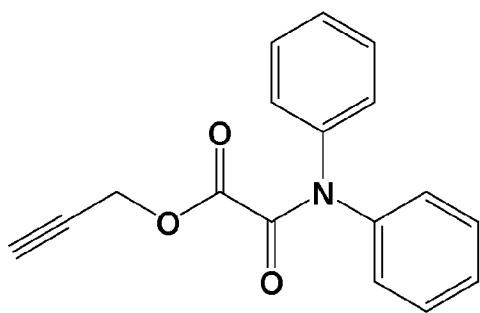
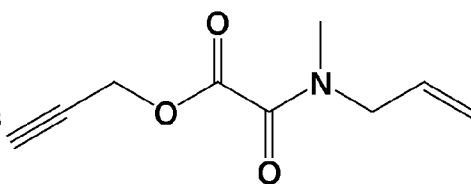
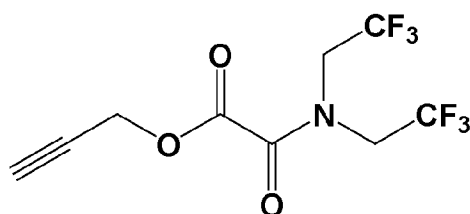
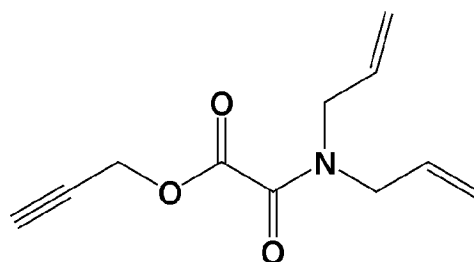
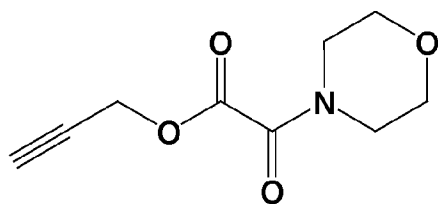
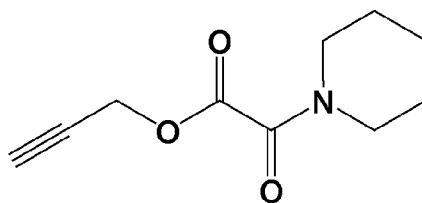
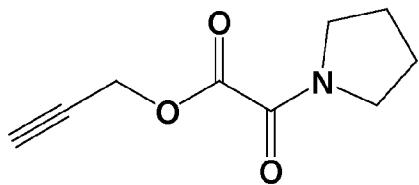
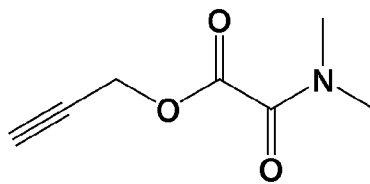
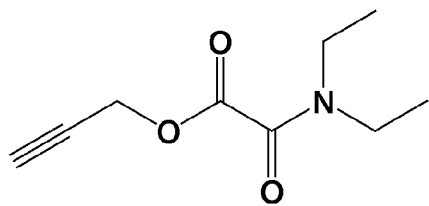
[化29]



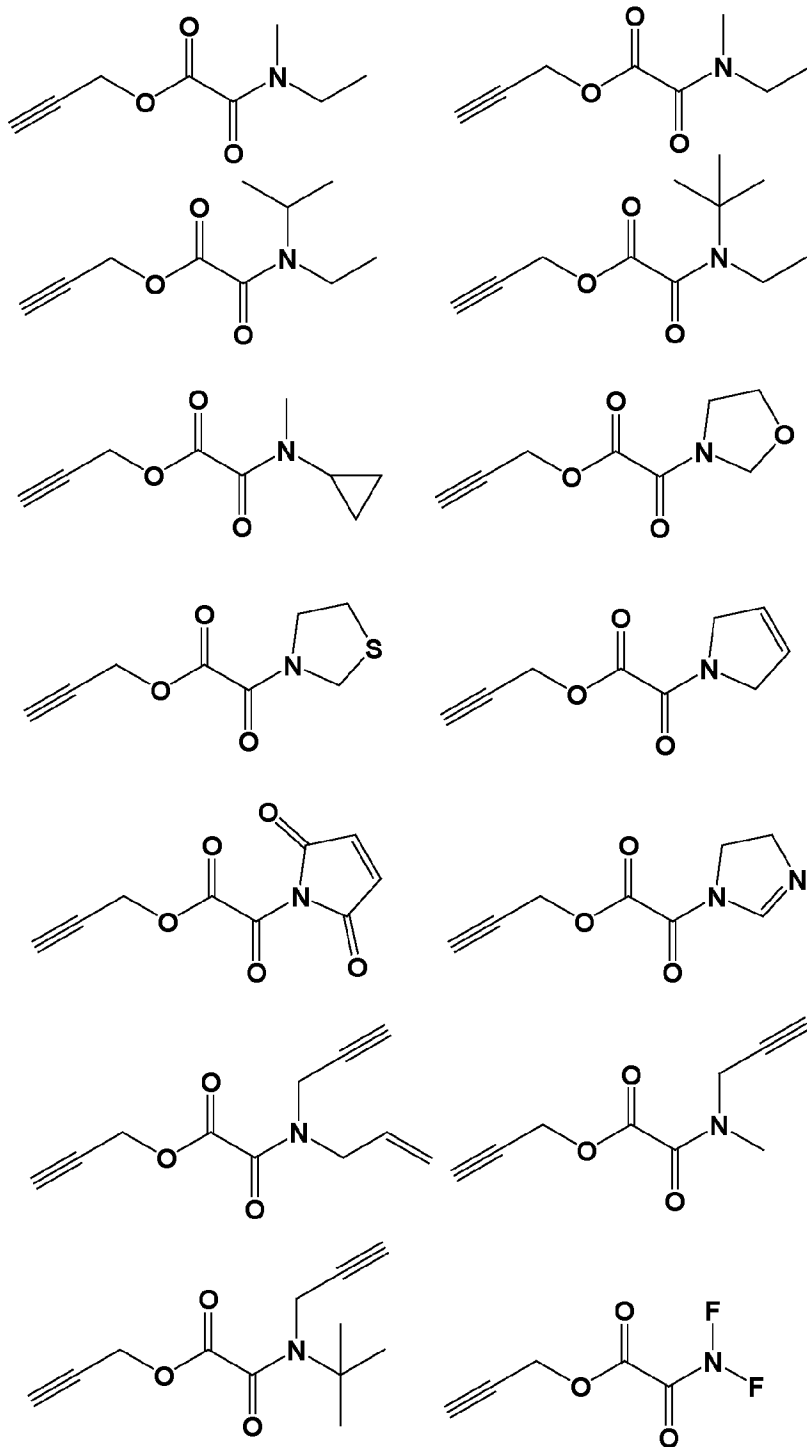
[化30]



[化31]

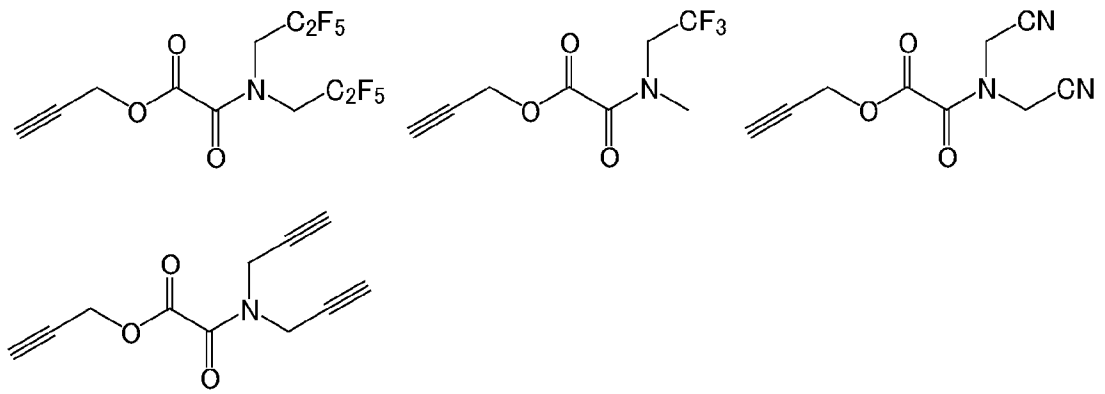


[化32]

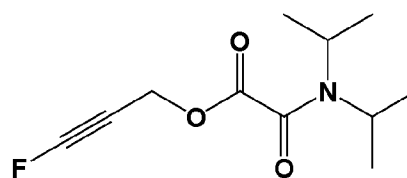
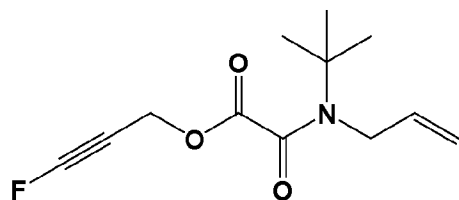
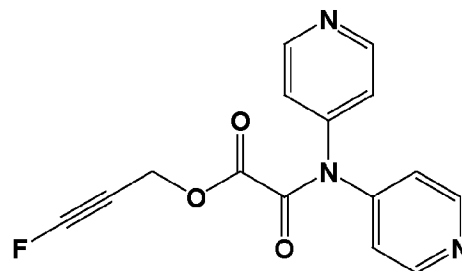
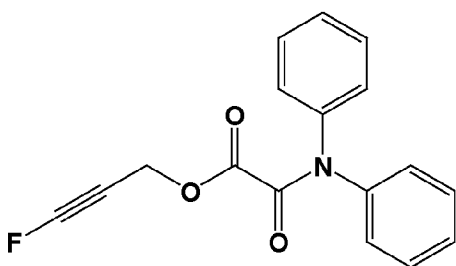
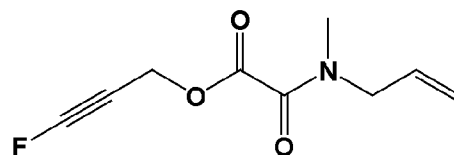
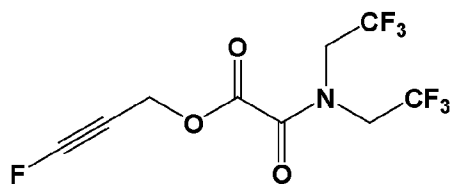
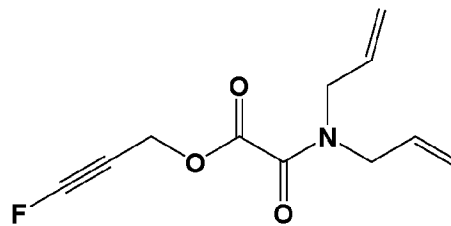
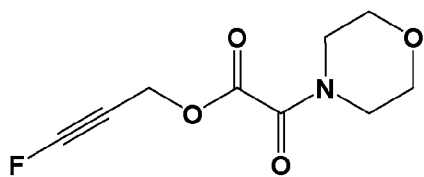
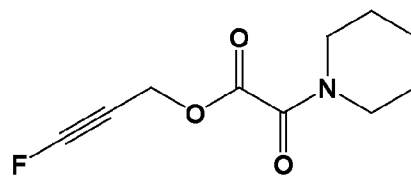
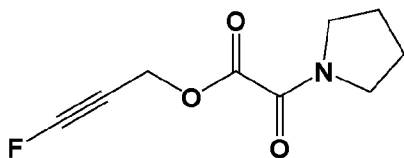
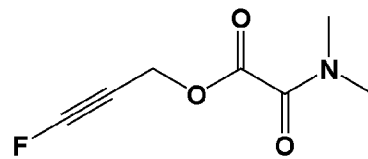
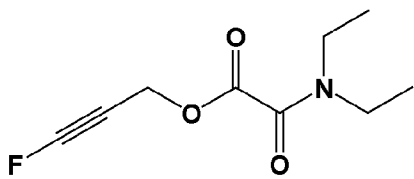




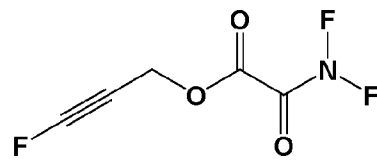
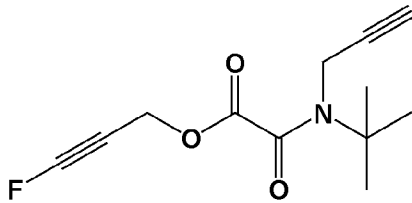
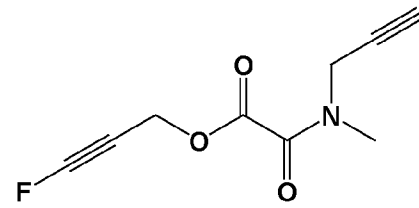
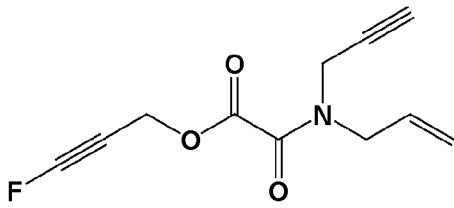
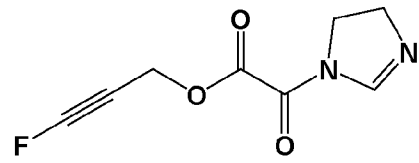
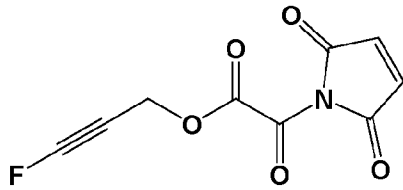
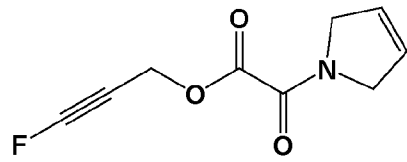
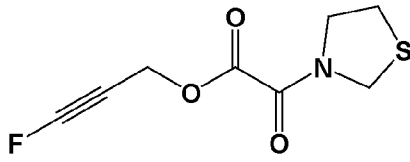
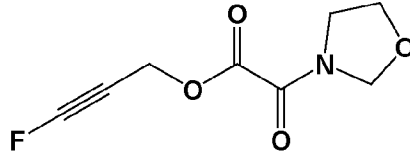
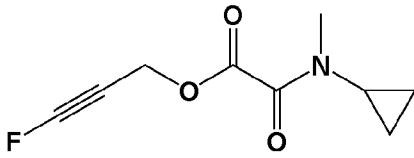
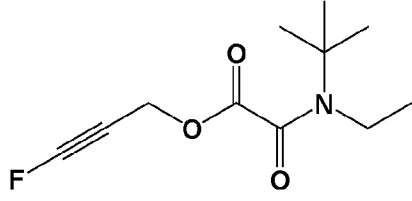
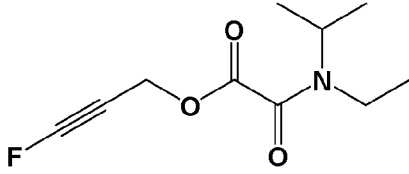
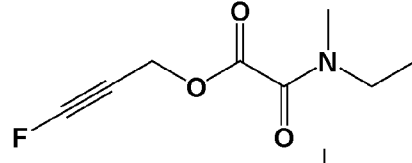
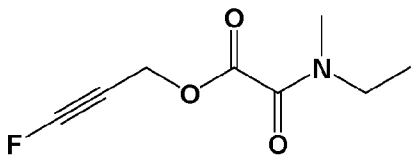
[化33]



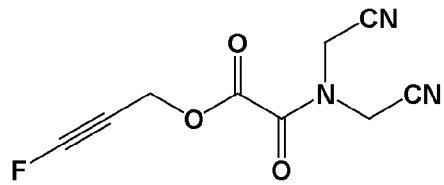
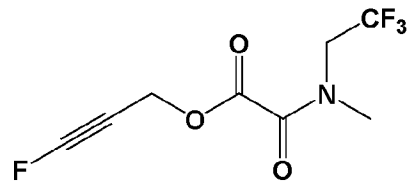
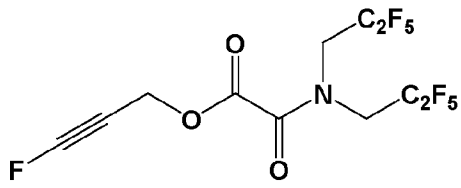
[化34]



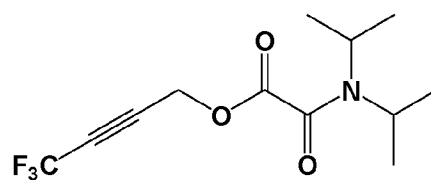
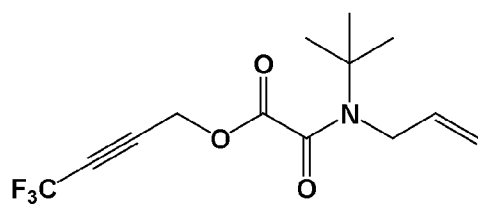
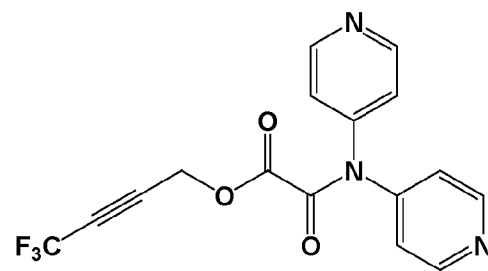
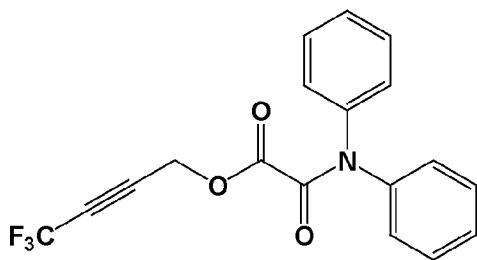
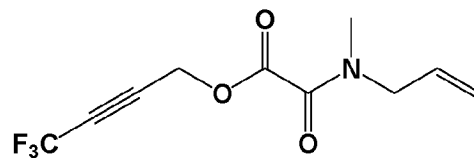
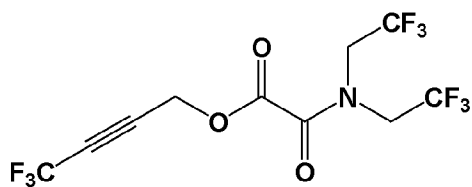
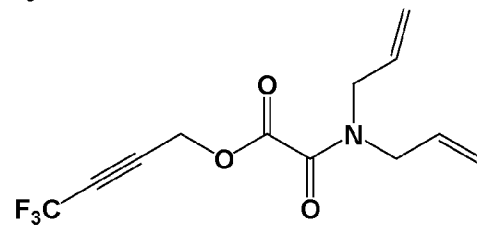
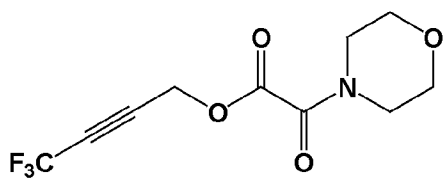
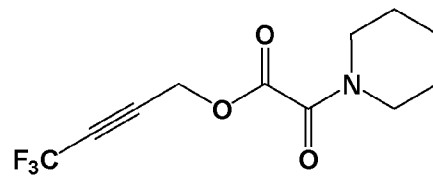
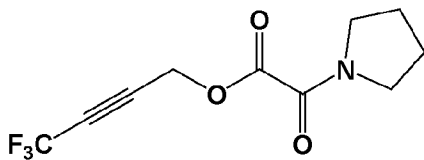
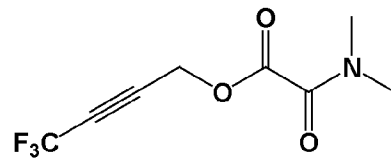
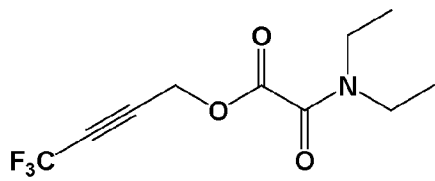
[化35]



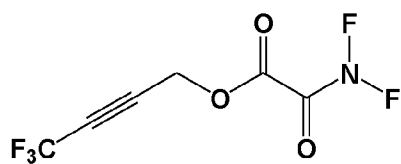
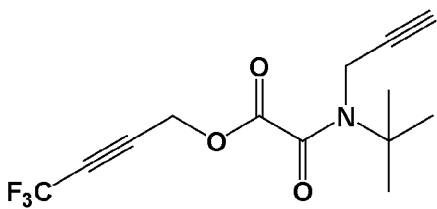
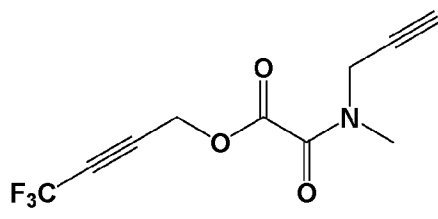
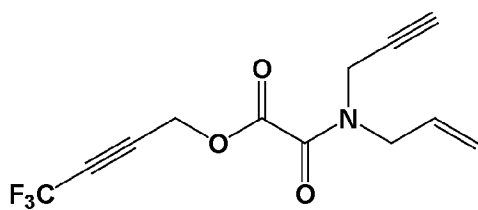
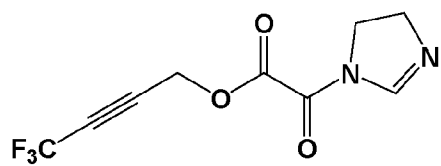
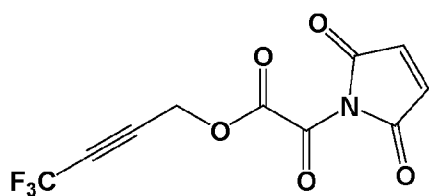
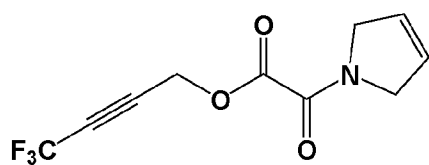
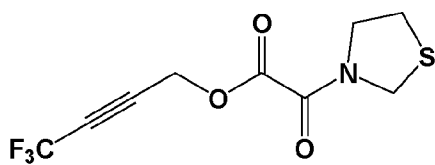
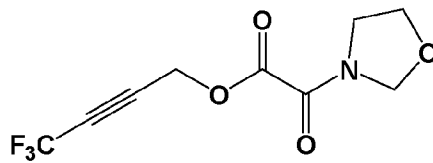
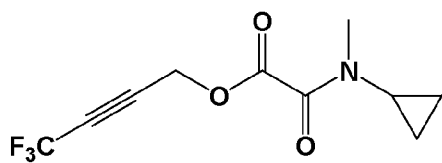
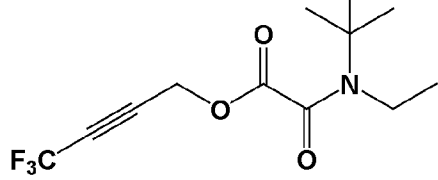
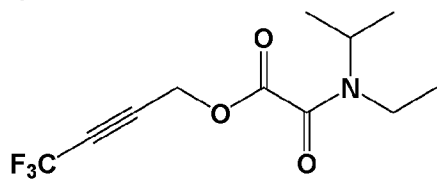
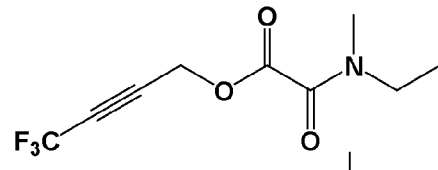
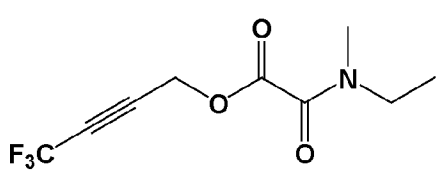
[化36]



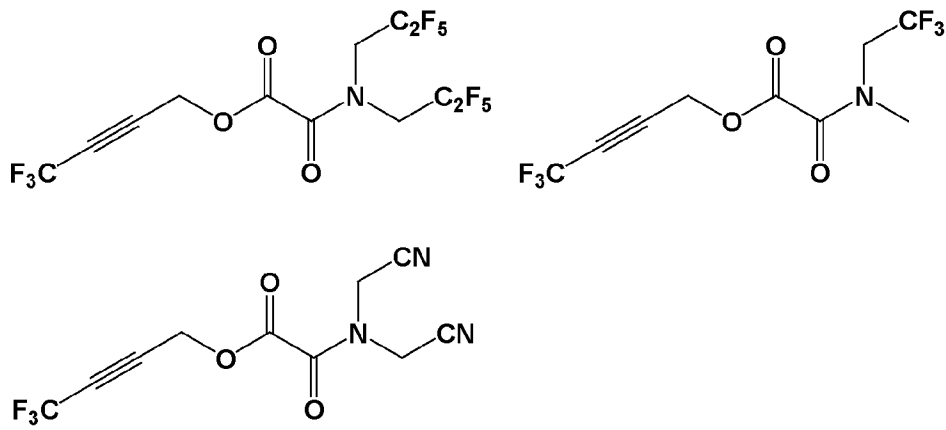
[化37]



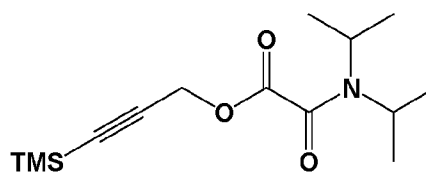
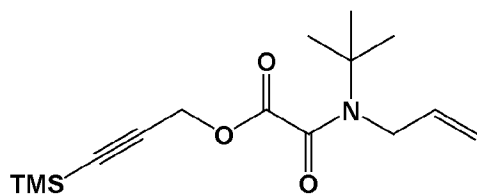
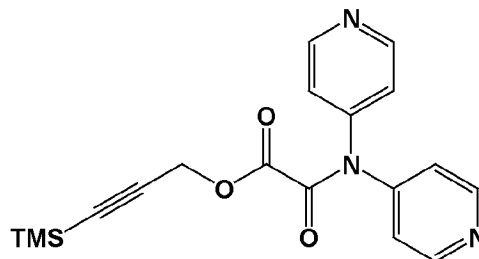
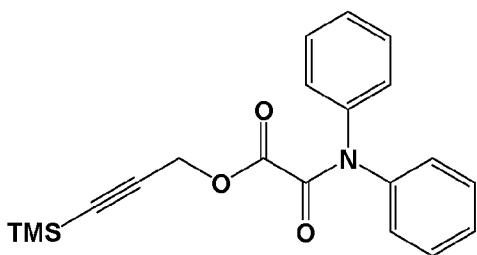
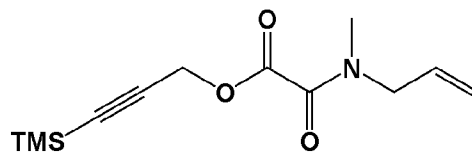
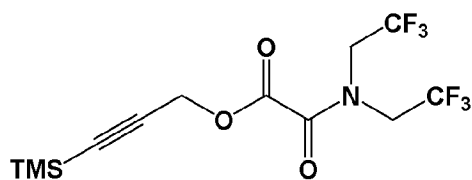
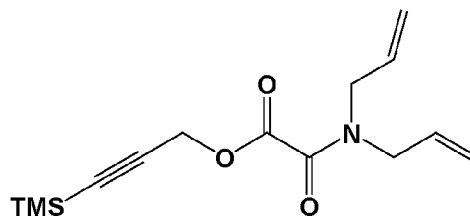
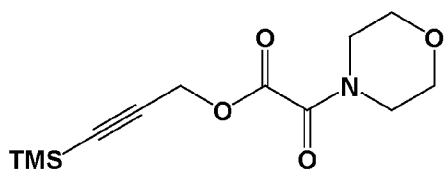
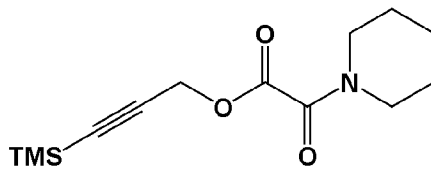
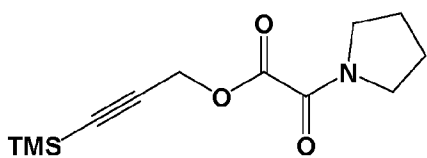
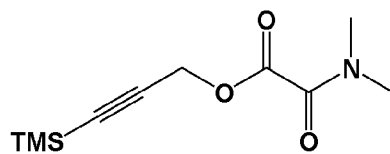
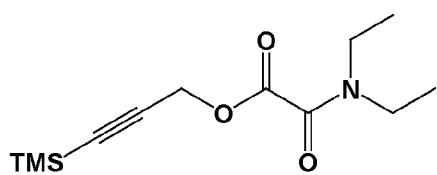
[化38]



[化39]

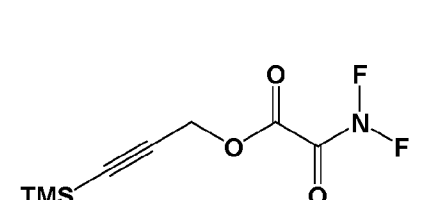
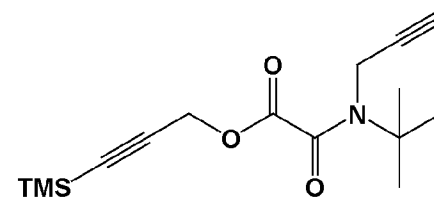
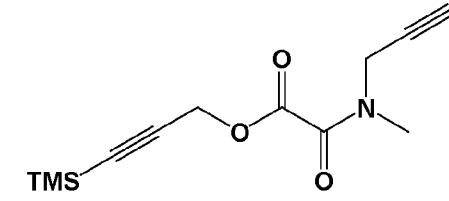
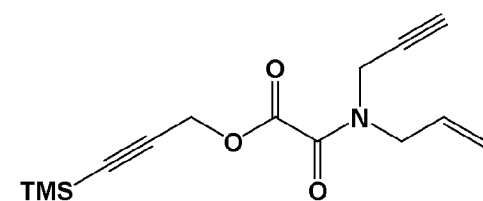
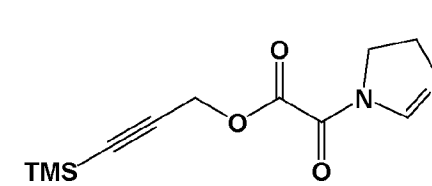
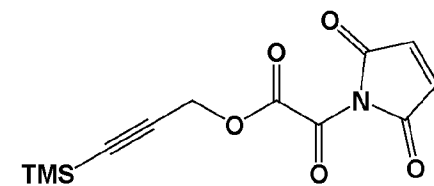
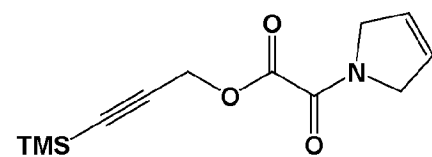
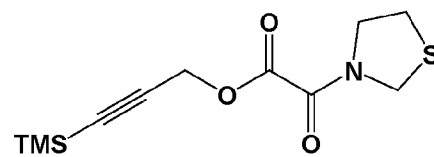
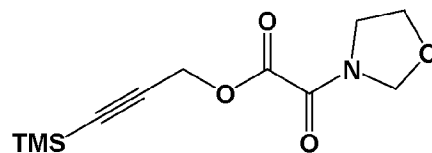
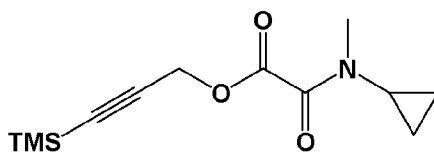
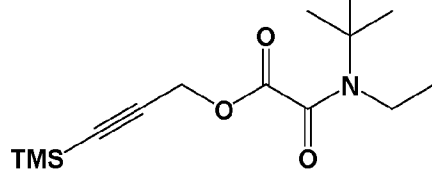
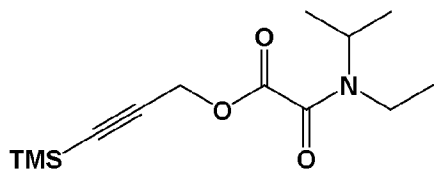
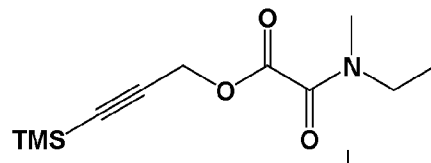
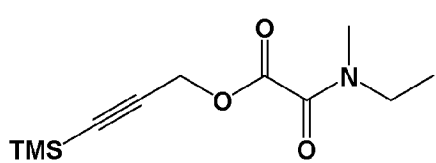


[化40]

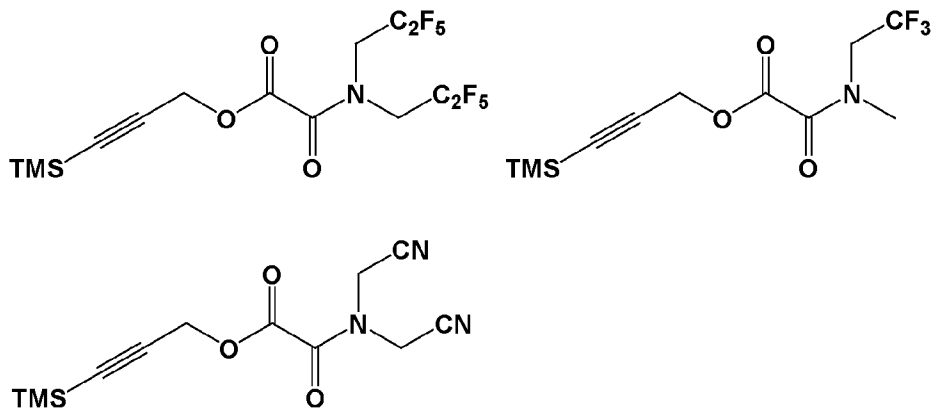




[化41]

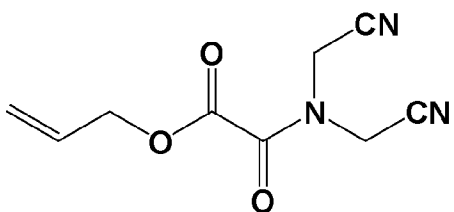
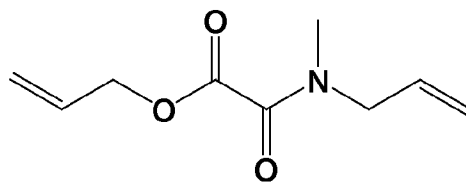
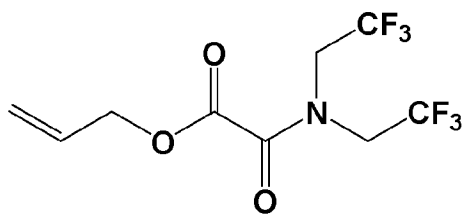
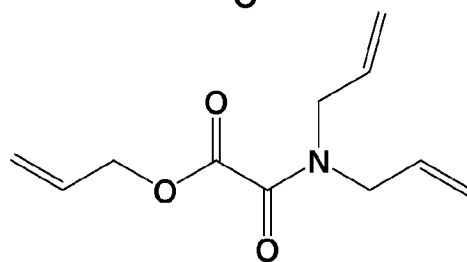
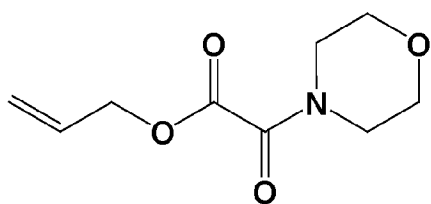
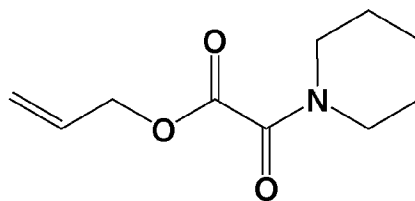
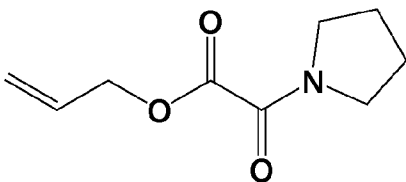
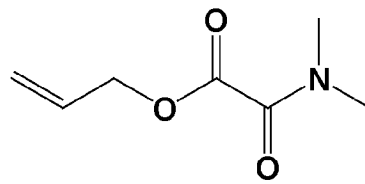
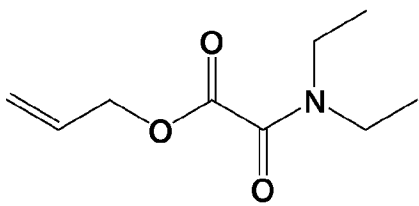


[化42]

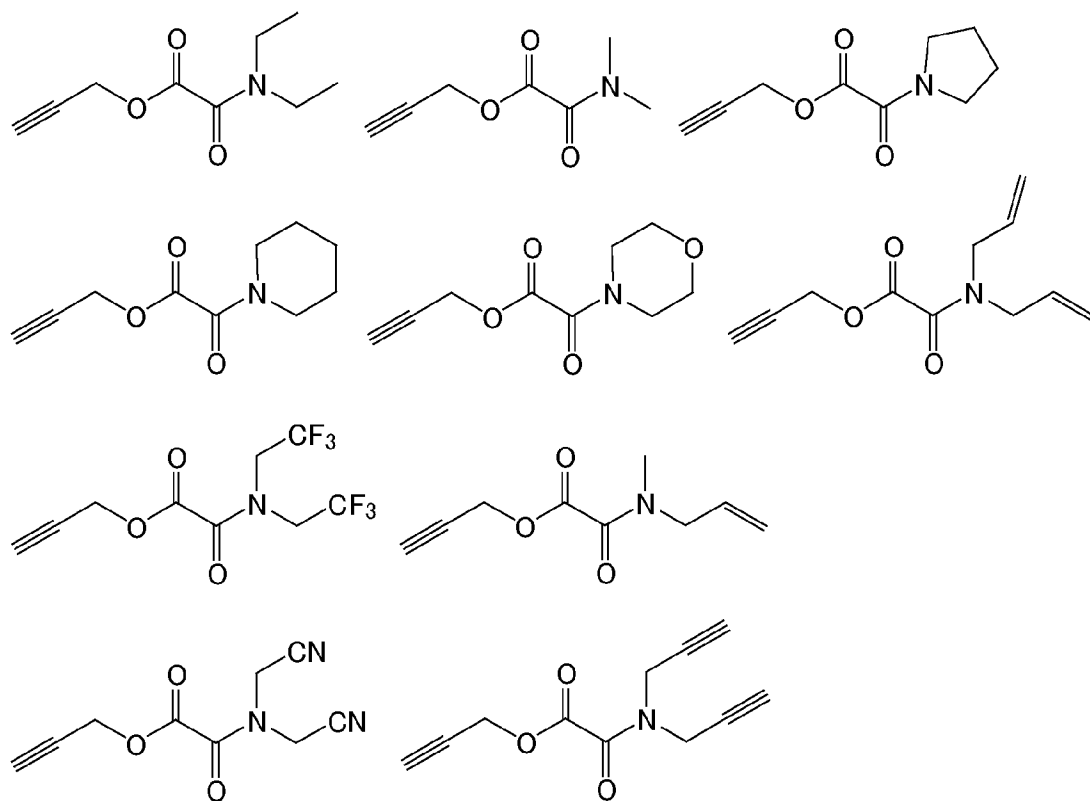


[0042] 化合物（1）としては、なかでも、下記式で表される化合物が好ましい。

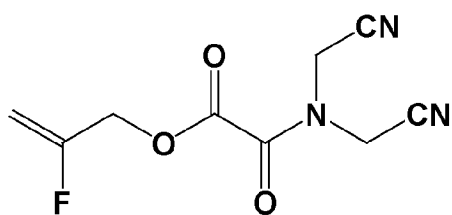
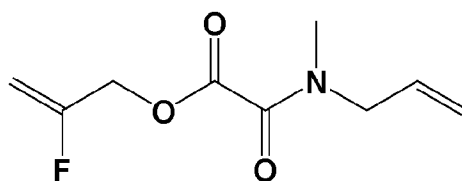
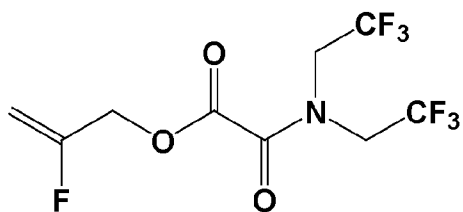
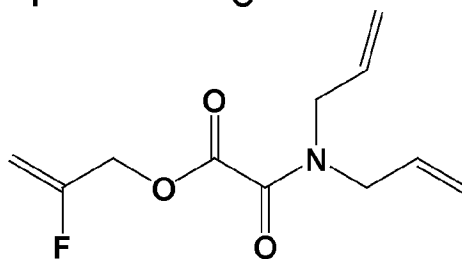
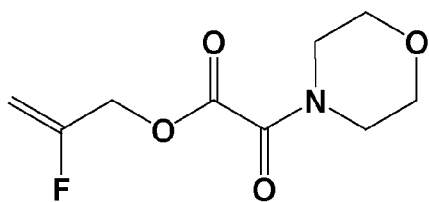
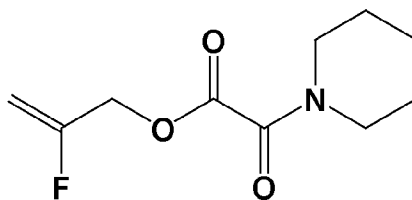
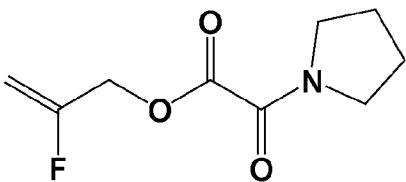
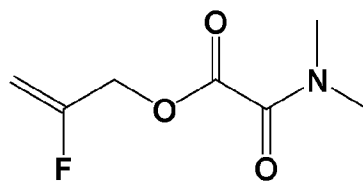
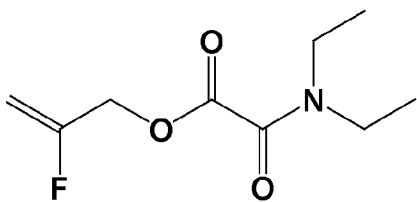
[化43]



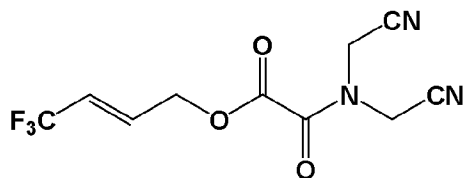
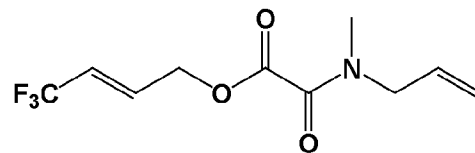
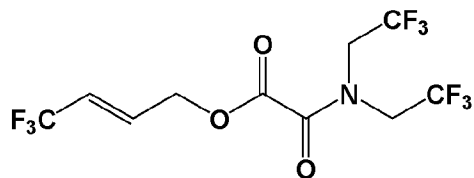
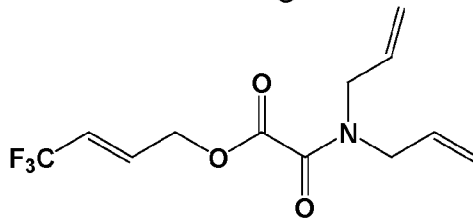
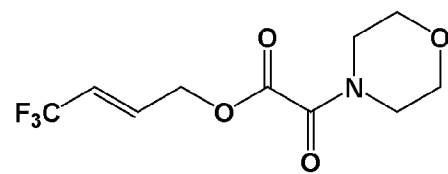
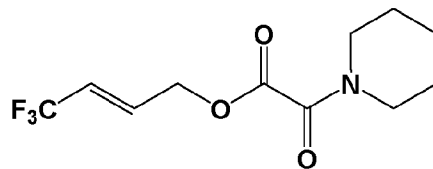
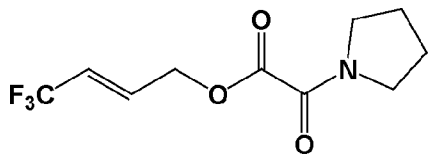
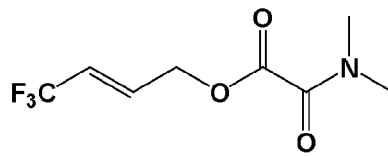
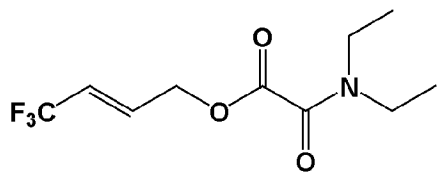
[化44]



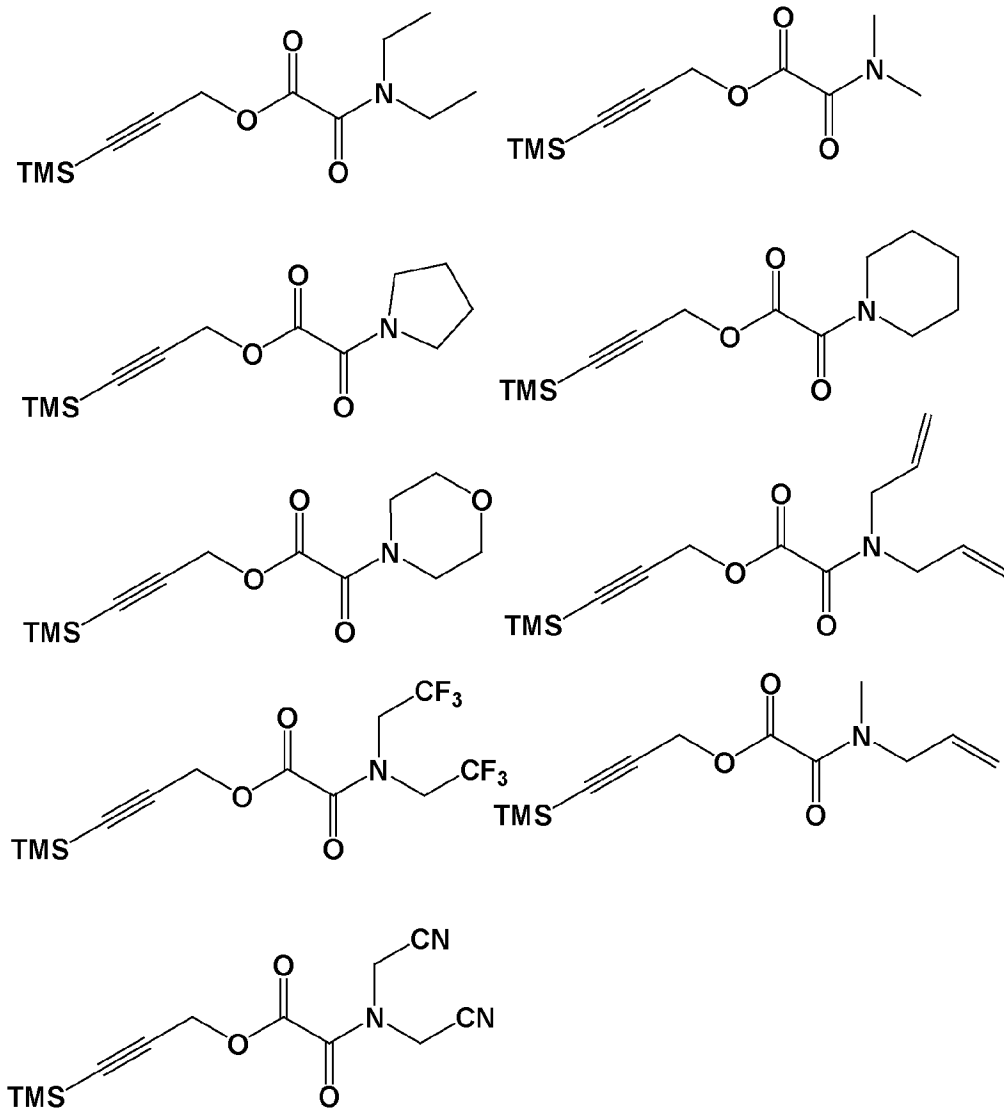
[化45]



[化46]

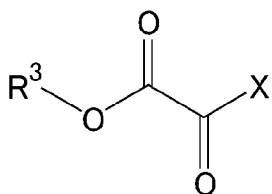


[化47]



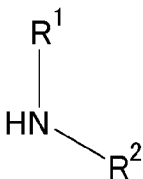
[0043] 本開示の製造方法は、下記一般式（A）：

[化48]



（式中、 $\text{R}^3$ は、上記と同じである。Xは、ハロゲン原子である。）で表される化合物（A）と、下記一般式（B）：

[化49]



(式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、上記と同じである。)で表されるアミン(B)とを反応させることにより、化合物(1)を得る工程(1)を含む。

化合物(1)のような、不飽和結合を有する化合物は、一般に、反応時に重合する可能性がある。

また、化合物(1)を合成する別手法としてエステル交換法も考えられるが、その際に、ジアミン体が生成する可能性がある(メカニズムについては、例えば、Testa, Maria Luisa; Zaballós, Elena; Zaragoza, Ramon J., *Tetrahedron*, 2012, vol. 68, 47, p. 9583-9591, 9を参照)。更に、目的物とジアミン体とを分ける際に加熱蒸留が必要となり、加熱により上述のような重合反応が起こる可能性もある。

本開示の製造方法は、工程(1)を含むことにより、驚くべきことに、ジアミン体等の副生成物が少なく、また、不飽和結合による重合反応も起こりにくく、高純度(例えばGC純度95.0%以上)の化合物(1)を製造することができる。

[0044] 一般式(A)中、Xはハロゲン原子である。上記ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられ、なかでもフッ素原子、塩素原子が好ましい。

[0045] 一般式(A)中の $R^3$ 、一般式(B)中の $R^1$ 及び $R^2$ は、一般式(1)について説明したとおりである。

[0046] 工程(1)の反応では、化合物(A)1モルに対して、アミン(B)を1.0~1.5モル使用することが好ましく、1.0~1.2モル使用することがより好ましい。

[0047] 工程(1)の反応は、塩基(但し、アミン(B)を除く)の存在下に実施す



ることが好ましい。上記塩基としては特に限定されないが、アミン（但し、アミン（B）を除く）、無機塩基等が挙げられる。

上記アミンとしては、第三級アミンやピリジン類（ピリジン及びその誘導体）が挙げられ、例えば、トリエチルアミン、トリ（*n*-プロピル）アミン、トリ（*n*-ブチル）アミン、ジイソプロピルエチルアミン、シクロヘキシルジメチルアミン、ピリジン、ルチジン、 $\gamma$ -コリジン、N,N-ジメチルアニリン、N-メチルピペリジン、N-メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン（DBU）、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン（DABCO）、4-ジメチルアミノピリジン（DMAP）、プロトンスポンジ等が挙げられる。

上記無機塩基としては、例えば、水酸化リチウム、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素リチウム、フッ化セシウム、フッ化カリウム、フッ化ナトリウム、塩化リチウム、臭化リチウム等が挙げられる。

上記塩基としては、なかでも、上記アミンが好ましく、第三級アミン及びピリジン類からなる群より選択される少なくとも1種がより好ましく、トリエチルアミン及びピリジンからなる群より選択される少なくとも1種が更に好ましい。

[0048] 上記塩基は、化合物（A）1モルに対して、1.0～1.5モル使用することが好ましく、1.0～1.2モル使用することがより好ましい。

[0049] 工程（1）の反応は、溶媒中で実施できる。上記溶媒としては、有機溶媒が好ましく、非芳香族炭化水素溶媒、芳香族炭化水素溶媒、ケトン溶媒、ハロゲン化炭化水素溶媒、エーテル溶媒、エステル溶媒、ニトリル溶媒、スルホキシド系溶媒及びアミド溶媒等が挙げられる。具体的には、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサン、デカヒドロナフタレン、*n*-デカン、イソドデカン、トリデカン等の非芳香族炭化水素溶媒；ベンゼン、

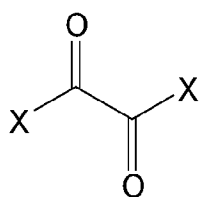
トルエン、キシレン、テトラリン、ベラトロール、ジエチルベンゼン、メチルナフタレン、ニトロベンゼン、*o*-ニトロトルエン、メシチレン、インデン、ジフェニルスルフィド等の芳香族炭化水素溶媒；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、アセトフェノン、プロピオフェノン、ジイソブチルケトン、イソホロン等のケトン溶媒；ジクロロメタン、四塩化炭素、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素溶媒；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジイソプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジグリム、フェネトール、1, 1-ジメトキシシクロヘキサン、ジイソアミルエーテル等のエーテル溶媒；酢酸エチル、酢酸イソプロピル、マロン酸ジエチル、3-メトキシ-3-メチルブチルアセテート、 $\gamma$ -ブチロラクトン、エチレンカーボネート、プロピレンカーボネート、炭酸ジメチル、 $\alpha$ -アセチル- $\gamma$ -ブチロラクトン等のエステル溶媒；アセトニトリル、ベンゾニトリル等のニトリル溶媒；ジメチルスルホキシド、スルホラン等のスルホキシド系溶媒；及びN, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、N, N-ジメチルアクリルアミド、N, N-ジメチルアセトアセトアミド、N, N-ジエチルホルムアミド、N, N-ジエチルアセトアミド等のアミド溶媒等が挙げられる。

[0050] 工程（1）の反応の温度としては、 $-78 \sim 25^{\circ}\text{C}$ が好ましく、 $-20 \sim 10^{\circ}\text{C}$ がより好ましい。

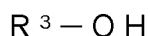
[0051] 工程（1）の反応の時間としては、0.5～24時間が好ましく、0.5～3時間がより好ましい。

[0052] 上記製造方法は、下記一般式（C）：

[化50]



(式中、Xは上記と同じである。)で表される化合物(C)と、下記一般式(D) :



(式中、R<sup>3</sup>は上記と同じである。)で表される化合物(D)とを反応させることにより、上記一般式(A)で表される化合物(A)を得る工程(2)を更に含んでもよい。

[0053] 工程(2)の反応は、公知の条件下で実施することができる。工程(2)を実施する場合は、工程(2)の後に、工程(1)を実施することが好ましい。工程(2)で得られた化合物(A)を、工程(1)の反応に用いることができる。

[0054] 上記製造方法においては、各工程の終了後、溶媒の留去、蒸留、カラムクロマトグラフィー、再結晶等により生成物を分離・精製してもよい。

[0055] 化合物(1)は新規化合物であり、医農薬化合物等の各種化学薬品、及びそれらの中間体等として好適に使用できる。

### 実施例

[0056] 次に実施例を挙げて本開示を更に詳しく説明するが、本開示はこれらの実施例のみに限定されるものではない。

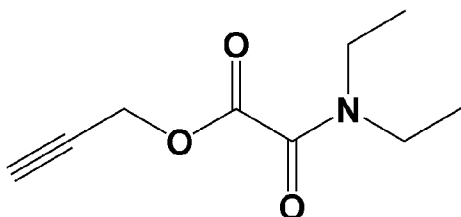
[0057] 化合物の同定及び、反応の進行度の確認はNMR測定にて実施した。

[0058] 実施例 1

<2-プロピニル(ジエチルカーバモイル) フォメートの合成>

2-プロピニル(クロロカーボニル) フォレート(1.47g、10mmol)とジクロロメタン5mlを混合し、窒素置換した後に、0℃でジエチルアミン(0.73g、10mmol)を滴下した。その溶液に、ピリジン(0.87g、11mmol)とジクロロメタン5mlを混合した溶液を滴下した。その後、室温に戻し、攪拌を行った。セライトろ過、1M塩酸水溶液で水洗、及び分液した後、同じく水で2回水洗と分液操作を行った。有機層を乾燥、濃縮することで、下記式で表される目的物1.20g(GC純度98.3%)を得た。

[化51]

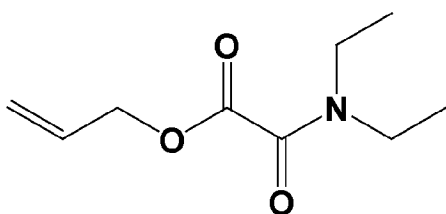


[0059] 実施例 2

<アリル（ジエチルカーバモイル） フォメートの合成>

2-プロピニル（クロロカーボニル） フォメートの代わりにアリル（クロロカーボニル） フォメートを用いること以外は実施例 1 と同様の物質で合成を行い、下記式で表される目的物 1. 21 g（GC 純度 96. 2%）を得た。

[化52]

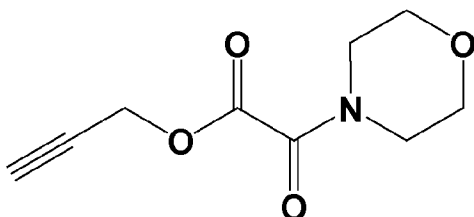


[0060] 実施例 3

<2-プロピニル-2-モルフォリノ-2-オキソアセテートの合成>

ジエチルアミンの代わりにモルフォリンを用いること以外は実施例 1 と同様の物質で合成を行い、下記式で表される目的物 1. 11 g（GC 純度 98. 0%）を得た。

[化53]



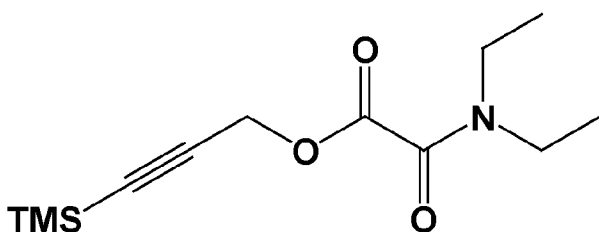
[0061] 実施例 4

<3-(トリメチルシリル)-2-プロピニル（ジエチルカーバモイル）フ

ォメートの合成>

2-プロピニル（クロロカーボニル）ォメートの代わりに3-（トリメチルシリル）-2-プロピニル（クロロカーボニル）ォメートを用いること以外は実施例1と同様の物質質量で合成を行い、下記式で表される目的物1. 30g（GC純度97.3%）を得た。

[化54]

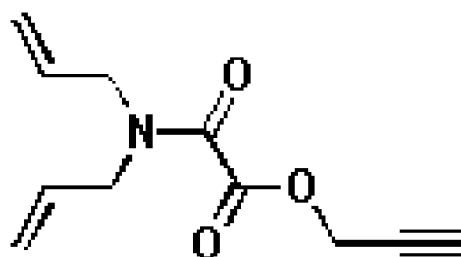


[0062] 実施例5

<2-プロピニル（ジアリルカーバモイル）ォメートの合成>

ジエチルアミンの代わりにジアリルアミンを用いること以外は実施例1と同様の物質質量で合成を行い、下記式で表される目的物1. 21g（GC純度96.2%）を得た。

[化55]

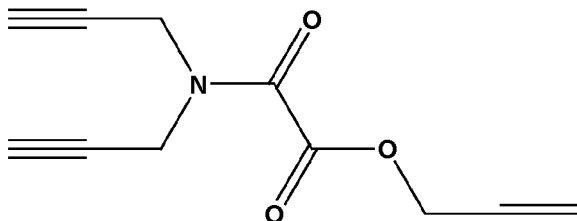


[0063] 実施例6

<2-プロピニル（ジ（2-プロピニル）カーバモイル）ォメートの合成>

ジエチルアミンの代わりにジ（2-プロピニル）アミンを用いること以外は実施例1と同様の物質質量で合成を行い、下記式で表される目的物1. 09g（GC純度95.8%）を得た。

[化56]

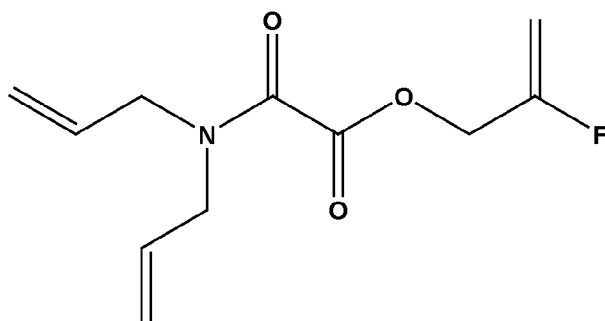


[0064] 実施例 7

<2-フルオロアリル (ジアリルカーバモイル) フォメートの合成>

2-プロピニル (クロロカーボニル) フォメートの代わりに2-フルオロアリル (クロロカーボニル) フォメートを用いること以外は実施例5と同様の物質で合成を行い、下記式で表される目的物1. 28 g (GC純度97.2%)を得た。

[化57]



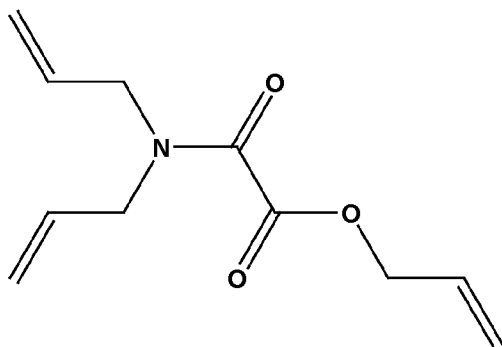
[0065] 実施例 8

<アリル (ジアリルカーバモイル) フォメートの合成>

2-プロピニル (クロロカーボニル) フォメートの代わりにをアリル (クロロカーボニル) フォメート用いること以外は実施例5と同様の物質で合成を行い、下記式で表される目的物1. 20 g (GC純度96.8%)を得た。

。

[化58]

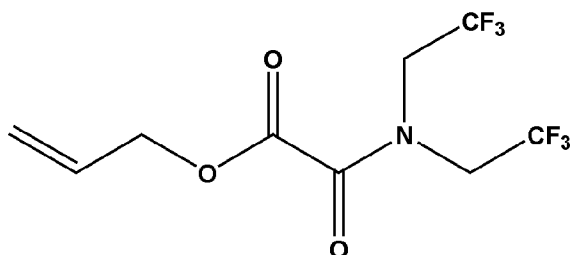


[0066] 実施例 9

<アリル（ビス（2，2，2-トリフルオロエチル）カーバモイル）フォーマートの合成>

ジアリルアミンの代わりにビス（2，2，2-トリフルオロエチル）アミンを用いること以外は実施例 2 と同様の物質質量で合成を行い、下記式で表される目的物 1. 39 g（GC 純度 96. 8%）を得た。

[化59]

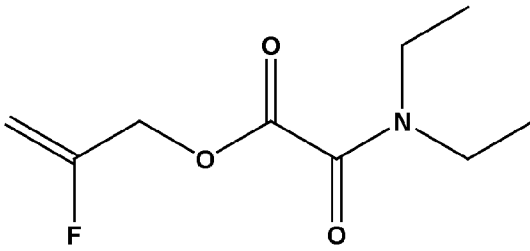


[0067] 実施例 10

<2-フルオロアリル（ジエチルカーバモイル）フォーマートの合成>

2-プロピニル（クロロカーボニル）フォーマートの代わりに2-フルオロアリル（クロロカーボニル）フォーマートを用いること以外は実施例 1 と同様の物質質量で合成を行い、下記式で表される目的物 1. 22 g（GC 純度 96. 8%）を得た。

[化60]



### 産業上の利用可能性

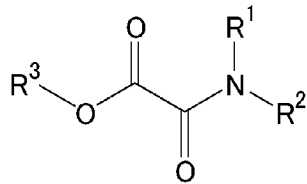
[0068] 本開示の化合物は、医農薬化合物等の各種化学薬品、及びそれらの中間体等として使用可能である。



## 請求の範囲

[請求項1] 下記一般式（1）：

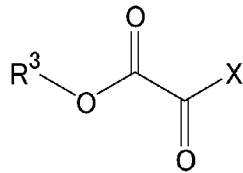
[化1]



（式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。R<sup>3</sup>は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。）で表される化合物（1）を製造する方法であって、

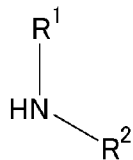
下記一般式（A）：

[化2]



（式中、R<sup>3</sup>は、前記と同じである。Xは、ハロゲン原子である。）で表される化合物（A）と、下記一般式（B）：

[化3]



（式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、前記と同じである。）で表されるアミン（B）とを反応させることにより、化合物（1）を得る工程（1）を含むことを特徴とする製造方法。

[請求項2] 工程（1）の反応を、塩基（但し、アミン（B）を除く）の存在下に実施する請求項1記載の製造方法。

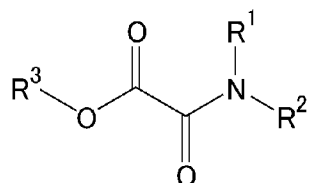
[請求項3] R<sup>3</sup>は、炭素-炭素二重結合又は炭素-炭素三重結合を1つ含む請求

項 1 又は 2 記載の製造方法。

[請求項4] R<sup>3</sup>は、2-プロペニル基又は2-プロピニル基である請求項 1、2  
又は 3 記載の製造方法。

[請求項5] 下記一般式 (1) :

[化4]



(式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに独立に、フッ素原子又は炭素数6以下の有機基であり、互いに結合して環状構造を形成してもよい。R<sup>3</sup>は、炭素-炭素不飽和結合を有する炭素数7以下の有機基である。)で表されることを特徴とする化合物。

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP2019/005765

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

Int. Cl. C07C231/02 (2006.01) i, C07C235/72 (2006.01) i, C07D295/185 (2006.01) i, C07F7/10 (2006.01) i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl. C07C231/02, C07C235/72, C07D295/185, C07F7/10

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

Published examined utility model applications of Japan 1922-1996  
 Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2019  
 Registered utility model specifications of Japan 1996-2019  
 Published registered utility model applications of Japan 1994-2019

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

CAplus/REGISTRY (STN)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2-142767 A (BASF AG.) 31 May 1990, entire text,	1-5
Y	in particular, claims, production method (a) (b), described in the page 4, upper right column to left column, examples 1.11, 1.19, 1.20, 1.24, 1.25 & EP 350693 A2 & DE 3824052 A & US 4944789 A & DE 3916364 A & CA 1331192 A	1-5
X	MCCOMBIE, Stuart W., TETRAHEDRON LETTERS, 1986, vol. 27, no. 3, pp. 305-308	1-5
X	GEHANNE, Sylvie, TETRAHEDRON LETTERS, 1994, vol. 35, no. 13, pp. 2047-2048	1-5

Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:  
 "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  
 "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date  
 "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  
 "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  
 "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed  
 "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  
 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone  
 "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art  
 "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search 18.04.2019	Date of mailing of the international search report 07.05.2019
---	--

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

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/JP2019/005765

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	US 4721523 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 26 January 1988, entire text, in particular, table A, compounds II-59, II-73, table 1, compounds 59, 73 & BR 8504403 A & ZA 8506993 A & DE 3433541 A1	5 1-4
X Y	DE 3312498 A1 (BAYER AG) 11 October 1984, entire text, in particular, compounds Nr.9, Nr.10 (Family: none)	5 1-4
X Y	NEVEUX, Muriel, TETRAHEDRON, 1993, vol. 49, no. 13, pp. 2629-2640	5 1-4
X Y	US 5385902 A (ROHM AND HAAS COMPANY) 31 January 1995, entire text, in particular, claims, table 1 compounds no. 3, 7-9, 11-21, 24 (Family: none)	5 1-4
Y	DE 1002318 B1 (CHEMISCHE FABRIK VON HEYDEN AKTIENGESELLSCHAFT) 14 February 1957, entire text (Family: none)	1-5

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07C231/02(2006.01)i, C07C235/72(2006.01)i, C07D295/185(2006.01)i, C07F7/10(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07C231/02, C07C235/72, C07D295/185, C07F7/10

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2019年
日本国実用新案登録公報	1996-2019年
日本国登録実用新案公報	1994-2019年

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

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X Y	JP 2-142767 A (ビーエーエスエフ アクチェンゲゼルシャフト) 1990.05.31, 全文、とくに特許請求の範囲、第4頁右上欄-左下欄に記載の製造 方法 (a) (b)、実施例 1.11、1.19、1.20、1.24、1.25 & EP 350693 A2 & DE 3824052 A & US 4944789 A & DE 3916364 A & CA 1331192 A	1-5 1-5
X	MCCOMBIE, Stuart W., TETRAHEDRON LETTERS, 1986, Vol.27, No.3, pp.305-308	1-5

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

\* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

18.04.2019

国際調査報告の発送日

07.05.2019

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)  
郵便番号 100-8915  
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

東 裕子

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

4 P

9709

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	GEHANNE, Sylvie, TETRAHEDRON LETTERS, 1994, Vol. 35, No. 13, pp. 2047-2048	1-5
X Y	US 4721523 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 1988. 01. 26, 全文、とくに TABLE A の化合物 II-59、化合物 II-73、TABLE 1 の化 合物 59、化合物 73 & BR 8504403 A & ZA 8506993 A & DE 3433541 A1	5 1-4
X Y	DE 3312498 A1 (BAYER AG) 1984. 10. 11, 全文、とくに化合物 Nr. 9、Nr. 10 (ファミリーなし)	5 1-4
X Y	NEVEUX, Muriel, TETRAHEDRON, 1993, Vol. 49, No. 13, pp. 2629-2640	5 1-4
X Y	US 5385902 A (ROHM AND HAAS COMPANY) 1995. 01. 31, 全文、とくに CLAIMS、TABLE 1 Compound No. 3、7-9、11-21、24 (ファミリーなし)	5 1-4
Y	DE 1002318 B1 (CHEMISCHE FABRIK VON HEYDEN AKTIENGESELLSCHAFT) 1957. 02. 14, 全文 (ファミリーなし)	1-5