



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
C07C 209/62 (2006.01)
C07C 211/29 (2006.01)
C07C 271/18 (2006.01)
C07C 269/04 (2006.01)
C07C 231/12 (2006.01)
C07C 233/31 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2005123690/04, 26.12.2003

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
26.12.2003(30) Конвенционный приоритет:
26.12.2002 JP 2002-376272

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2006

(45) Опубликовано: 27.07.2009 Бюл. № 21

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: CHEUK-MAN LEE et al.
«[(Aminomethyl)aryloxy]acetic acid Esters. A new
Class of High-Ceiling Diuretics. 1. Effects of
Nitrogen and Aromatic Nuclear Substitution», J.
of Medicinal Chemistry, 1984, v.27, No.12,
p.1579-1578. WO 01/10825 A1, 15.02.2001.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 26.07.2005(86) Заявка РСТ:
JP 03/016995 (26.12.2003)(87) Публикация РСТ:
WO 2004/058681 (15.07.2004)

Адрес для переписки:
103735, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент", пат.пов. А.П.Агуреву

(72) Автор(ы):

ИТО Акинори (JP),
ОХАСИ Хидеаки (JP),
МАГАРИБУТИ Кагетомо (JP)

(73) Патентообладатель(и):

ИХАРА КЕМИКАЛ ИНДАСТРИ КО.,
ЛТД. (JP)

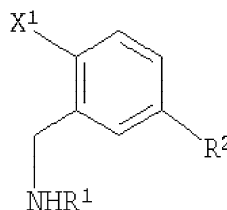
RU 2 362 766 C2

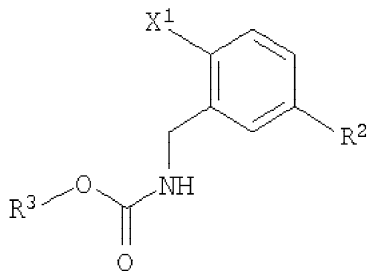
RU 2 362 766 C2

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНОГО БЕНЗИЛАМИНА И ПРОИЗВОДНОЕ АЦИЛБЕНЗИЛАМИНА

(57) Реферат:

Изобретение относится к новому
улучшенному способу получения производного
бензиламина общей формулы (3) и способу
получения из последнего карбаматного
производного общей формулы (6)

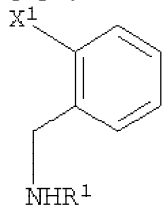




(6)

где X^1 представляет собой атом галогена, а R^1 представляет собой ацильную группу, выбранную из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильной

группы и ароматической ацильной группы, R^3 представляет алкильную группу. Способы включают взаимодействие бензильного производного общей формулы (1) с галогенацильным соединением общей формулы (2)



(1)

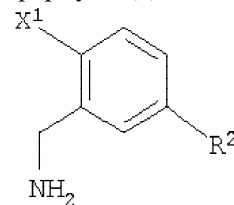
R^2-X^2

(2)

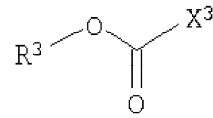
где X^2 представляет собой атом галогена, а R^2 представляет собой ацильную группу, выбранную из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильной

группы и ароматической ацильной группы, в присутствии кислоты Льюиса. Из полученного соединения общей формулы (3) получают карбаматное производное общей формулы (6). Для этого соединение общей формулы (3) подвергают гидролизу с получением аминопроизводного общей формулы (4),

которое затем подвергают взаимодействию с эфиром галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5)

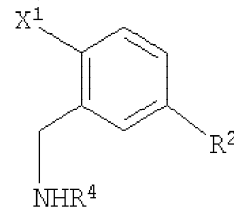


(4)



(5)

где X^1 и R^2 определены выше, X^3 представляет собой атом галогена, а R^3 представляет собой алкильную группу, в присутствии основания. Изобретение также относится к новым производным ацилбензиламина общей формулы (7)



(7)

где X^1 представляет собой атом галогена, каждый из R^2 и R^4 независимо представляет собой C_1 - C_7 -линейную или разветвленную алифатическую ацильную группу, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильную группу и R^4 дополнительно может означать атом водорода. Производные бензиламина формулы (3) и формулы (7) могут быть использованы в качестве промежуточных продуктов для получения сельскохозяйственного или садового бактерицида на основе карбамата формулы (6). 3 н. и 2 з.п. ф-лы, 1 табл.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
C07C 209/62 (2006.01)
C07C 211/29 (2006.01)
C07C 271/18 (2006.01)
C07C 269/04 (2006.01)
C07C 231/12 (2006.01)
C07C 233/31 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION(21), (22) Application: **2005123690/04, 26.12.2003**(24) Effective date for property rights:
26.12.2003(30) Priority:
26.12.2002 JP 2002-376272(43) Application published: **20.01.2006**(45) Date of publication: **27.07.2009 Bull. 21**(85) Commencement of national phase: **26.07.2005**(86) PCT application:
JP 03/016995 (26.12.2003)(87) PCT publication:
WO 2004/058681 (15.07.2004)Mail address:
**103735, Moskva, ul. Il'inka, 5/2, OOO
"Sojuzpatent", pat.pov. A.P.Agureevu**

(72) Inventor(s):

**ITO Akinori (JP),
OKhASI Khideaki (JP),
MAGARIBUTI Kagetomo (JP)**

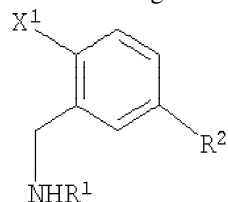
(73) Proprietor(s):

IKhARA KEMIKAL INDASTRI KO., LTD. (JP)**(54) METHOD OF OBTAINING BENZYLAMINE DERIVATIVE AND ACYLBENZYLAMINE DERIVATIVE**

(57) Abstract:

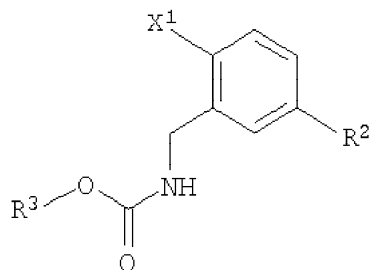
FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to novel improved method of obtaining benzylamine derivative of general formula (3)



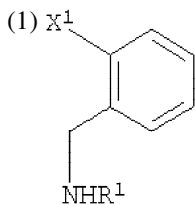
(3)

and method of obtaining from the latter of carbamate derivative of general formula (6)



(6),

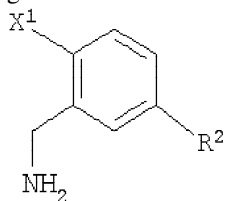
where X^1 represents halogen atom and R^1 represents acyl group selected from C_1 - C_7 -linear or branched aliphatic acyl group, C_3 - C_6 -cycloalkylcarbonyl group, and aromatic acyl group, R^3 represents alkyl group. Methods include interaction of benzyl derivative of general formula



(1)

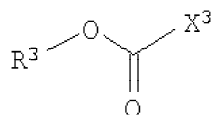
with halogen compound of general formula (2):

R^2-X^2 (2) where X^2 represents halogen atom, and R^2 represents acyl group selected from C_1-C_7 -linear or branched aliphatic acyl group, C_3-C_6 -cycloalkylcarbonyl group, and aromatic acyl group, in presence of Lewis acid. From obtained compound of general formula (3) carbamate derivative of general formula (6) is obtained. For this purpose compound of general formula (3) is subjected to hydrolysis obtaining aminoderivative of general formula (4)



(4),

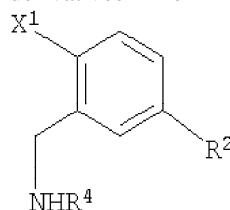
which is further subjected to interaction with ester of halogen-formic acid of general formula (5)



where X^1 and

(5),

R^2 are determined above, X^3 represents halogen atom, and R^3 represents alkyl group, in presence of base. Invention also relates to novel acylbenzylamine derivatives of general formula (7):



(7),

where X^1 represents halogen atom, each of R^2 and R^4 independently represents C_1-C_7 -linear or branched aliphatic acyl group, C_3-C_6 -cycloalkylcarbonyl group, and R can additionally represent hydrogen atom. Benzylamine derivatives of formula (3) and formula (7) can be used as intermediate products for obtaining agricultural or garden bactericide based on formula (6) carbamate.

EFFECT: elaboration of improved method of obtaining benzylamine derivative.

5 cl, 1 tbl, 3 ex

R U 2 3 6 2 7 6 6 C 2

R U 2 3 6 2 7 6 6 C 2

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к способу получения производного бензиламина, к способу получения карбаматного производного через указанный способ и к полезному промежуточному продукту в способе получения карбаматного производного. Производное бензиламина, полученное с помощью настоящего изобретения, служит в качестве промежуточного продукта, который полезен для получения основанного на карбамате сельскохозяйственного или садового бактерицида.

Уровень техники

В качестве способа получения основанного на карбамате сельскохозяйственного или садового бактерицида до настоящего времени, например, был известен (i) способ получения бактерицида, который включает взаимодействие карбаматного производного, представленного общей формулой (6), приведенной далее в настоящем описании, с гидроксиламином или его производным (смотри способ получения 1 в описании к патенту 1), и (ii) способ получения бактерицида, который включает галогенирование производного толуола с получением α -галогензамещенного производного толуола, взаимодействие с цианатом калия с получением, таким образом, карбаматного производного толуола, введение нитрогруппы и превращение нитрогруппы в аминогруппу с последующим диазотированием и с последующей реакцией с оксимом (смотри химическую формулу 11 и способ получения 5 в патенте 1).

Среди этих способов (i) и (ii) способ (i) является предпочтительным в промышленном производстве с точки зрения безопасности, потому что он проводится без диазотирования, в дополнение к выходу, безопасности реакции и легкости работы и операций (смотри способ по примерам 3 и 6 в патенте 1).

Карбаматное производное общей формулы (6), приведенной ниже, используемое в способе (i), получают известным способом, например способом, включающим галогенирование производного толуола, имеющего ацильную группу, с получением α -галогензамещенного производного толуола, имеющего ацильную группу, и взаимодействием с цианатом калия с получением, таким образом, карбаматного производного толуола (смотри химическую формулу 8 в патенте 1), или способом, включающим галогенирование производного толуола, имеющего алкоксикарбонильную группу, с получением α -галогензамещенного производного толуола, имеющего алкоксикарбонильную группу, взаимодействие с цианатом калия с введением, таким образом, карбаматной группы и превращение алкоксикарбонильной группы, как функциональной группы, в ацильную группу (смотри химическую формулу 9 в патенте 1).

Однако в соответствии с ранее разработанным способом, описанным в патенте 1 [химическая формула 8], из-за низкой региоселективности в случае введения в ядро ацильной группы образуется изомер по положению, получаемый в качестве побочного продукта при получении производного толуола, имеющего ацильную группу в качестве сырого продукта, что, таким образом, не позволяет избежать снижения выхода целевого производного толуола, имеющего ацильную группу. Также последний способ, описанный в патенте 1 [химическая формула 9], имеет проблему, заключающуюся в том, что каждая стадия требует сравнительно много времени на проведение, а сама карбаматная группа подвергается действию жестких условий в присутствии кислоты или основания, таким образом, карбаматная группа не может быть стабильно сохранена, и она разлагается в реакционных условиях. Кроме того,

как требуется для любого способа, следует повысить недостаточный выход по всем стадиям в расчете на сырье.

[1]: опубликованная заявка Японии, не прошедшая экспертизу (Kokai) No. 2001-106666.

Следовательно, требуется решить вышеуказанные проблемы предшествующего уровня техники и разработать способ и новое промежуточное соединение, которое является полезным для получения нового карбаматного производного.

Раскрытие изобретения

Задачей настоящего изобретения является решение проблем предшествующего уровня техники и разработка способа, который является полезным для получения карбаматного производного.

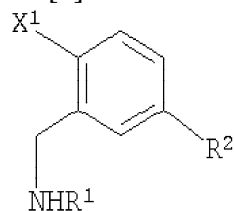
Задачей настоящего изобретения является решение проблем предшествующего уровня техники и разработка промежуточного продукта, который является полезным для получения карбаматного производного.

Было изучено и обнаружено, что когда ацильная группа вводится в бензильное соединение (производное бензила), имеющее защищенную аминогруппу, ацильная группа неожиданно вводится с высокой региоселективностью, и получается новое производное бензиламина.

Изобретатели настоящего изобретения провели дополнительные исследования на основании описанного выше открытия и обнаружили, что карбаматное производное общей формулы (6), описанное ниже, может быть получено, в основном, без образования изомера, когда новое производное бензиламина реагирует с эфиром галогенмуравьиной кислоты после снятия защиты с аминогруппы гидролизом, и также обнаружили, что такой способ чрезвычайно полезен, поскольку позволяет добиться желаемого усовершенствования вышеуказанного предшествующего уровня техники. Таким образом, настоящее изобретение было завершено.

Настоящее изобретение включает, например, следующие аспекты с [1] по [25].

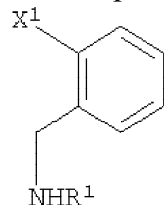
[1] Способ получения производного бензиламина общей формулы (3)



(3)

где X^1 , R^1 и R^2 определены ниже,

который включает взаимодействие бензильного производного общей формулы (1)



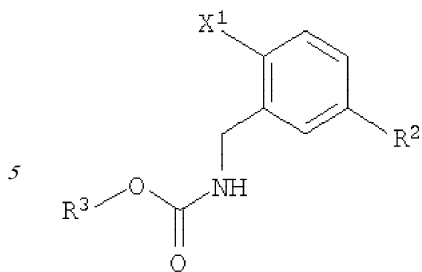
(1)

где X^1 представляет собой атом галогена, а R^1 представляет собой ацильную группу, с галогенацильным соединением общей формулы (2)

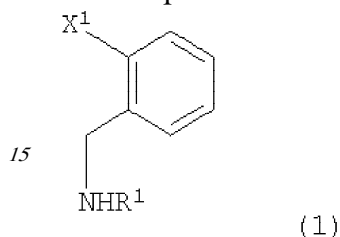


где X^2 представляет собой атом галогена, а R^2 представляет собой ацильную группу, в присутствии кислоты Льюиса.

[2] Способ получения карбаматного производного общей формулы (6)

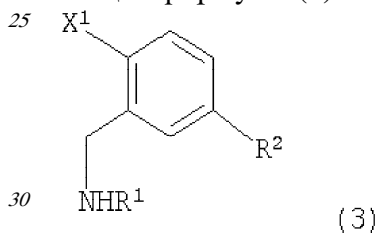


10 где X^1 , R^2 и R^3 определены ниже,
 который включает взаимодействие бензильного производного общей формулы (1)

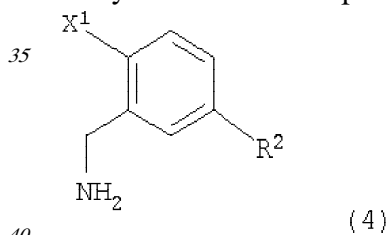


20 где X^1 представляет собой атом галогена, а R^1 представляет собой ацильную
 группу, с галогенацильным соединением общей формулы (2)
 R^2-X^2 (2)

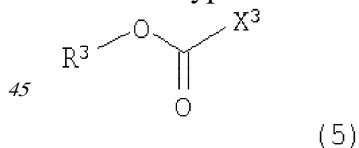
25 где X^2 представляет собой атом галогена, а R^2 представляет собой ацильную
 группу, в присутствии кислоты Льюиса с получением производного бензиламина
 общей формулы (3)



35 где X^1 , R^1 и R^2 определены выше, гидролиз производного бензиламина с
 получением аминопроизводного общей формулы (4)

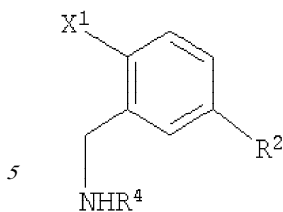


45 где X^1 и R^2 определены выше, и взаимодействие аминопроизводного с эфиром
 галогенмуравьиной кислоты, представленным общей формулой (5)



где X^3 представляет собой атом галогена, а R^3 представляет собой алкильную
 группу, в присутствии основания.

50 [3] Производное ацилбензиламина общей формулы (7)



(7)

где X^1 представляет собой атом галогена, R^2 представляет собой ацильную группу, а R^4 представляет собой атом водорода или ацильную группу.

10 [4] Способ получения производного бензиламина согласно [1], где X^1 представляет собой атом хлора.

[5] Способ получения производного бензиламина согласно [1], где R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу.

15 [6] Способ получения производного бензиламина согласно [1], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу.

[7] Способ получения производного бензиламина согласно [1], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода.

[8] Способ получения производного бензиламина согласно [1], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой ацетильную группу.

25 [9] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 представляет собой атом хлора.

[10] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу.

30 [11] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу.

[12] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода.

35 [13] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой ацетильную группу.

[14] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^2 представляет собой атом хлора.

40 [15] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где R^2 представляет собой алифатическую ацильную группу.

[16] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^2 представляет собой атом хлора и R^2 представляет собой алифатическую ацильную группу.

45 [17] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^2 представляет собой атом хлора и R^2 представляет собой алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода.

50 [18] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^2 представляет собой атом хлора и R^2 представляет собой ацетильную группу.

[19] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 и X^2

являются атомами хлора, а R^1 и R^2 представляют собой алифатические ацильные группы, имеющие от 1 до 7 атомов углерода.

5 [20] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 и X^2 являются атомами хлора, а R^1 и R^2 представляют собой ацетильные группы.

[21] Способ получения карбаматного производного согласно [2], где X^1 и X^2 являются атомами хлора, R^1 и R^2 представляют собой ацетильные группы и основанием является карбонат калия.

10 [22] Способ получения производного ацилбензиламина согласно [3], где X^1 представляет собой атом хлора и R^1 представляет собой алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода.

15 [23] Способ получения производного ацилбензиламина согласно [3], где X^1 представляет собой атом хлора и R^2 представляет собой алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода.

[24] Способ получения производного ацилбензиламина согласно [3], где X^1 представляет собой атом хлора, а R^1 и R^2 представляют собой алифатические ацильные группы, имеющие от 1 до 7 атомов углерода.

20 [25] Способ получения производного ацилбензиламина согласно [3], где X^1 представляет собой атом хлора, а R^1 и R^2 представляют собой ацетильные группы.

Способ [1] характеризуется тем, что ацильная группа (R^2) с высокой селективностью вводится в положение (5-положение) соединения общей формулы (3) (это высокая региоселективность по положению) в реакции бензильного производного общей формулы (1) с галогенацильным соединением общей формулы (2), и, таким образом, изомер по положению, по существу, не образуется в качестве побочного продукта. Следовательно, способ чрезвычайно полезен для промышленного получения целевого продукта. Карбаматное производное общей формулы (6) является соединением, которое полезно в качестве промежуточного продукта для получения указанного выше бактерицида на основе карбамата (смотри опубликованную заявку Японии, не прошедшую экспертизу (Kokai) No. 2001-106666).

30 В реакции бензильного производного общей формулы (1) с галогенацильным соединением общей формулы (2) может быть получено производное бензиламина (3), где R^2 вводится в целевое 5-положение, в количестве, соответствующем площади пика на газовой хроматограмме (ГХ) в процентном выражении предпочтительно, по меньшей мере, 15 и более предпочтительно от около 45 до 50% в случае, когда общая ГХ-площадь по отношению к соединению, в котором R^2 введено в положение, отличное от 5-положения, составляет 1.

Осуществление изобретения

Настоящее изобретение будет здесь описано в деталях. В следующем описании части и проценты, которые указывают количественное соотношение, являются массовым, если другое не определено.

(Настоящее изобретение [1])

Сначала будет описан способ настоящего изобретения [1].

50 Способ [1] настоящего изобретения представляет собой способ получения производного бензиламина общей формулы (3), включающий взаимодействие бензильного производного общей формулы (1) с галогенацильным соединением, представленным общей формулой (2), в присутствии кислоты Льюиса. Способ характеризуется тем, что ацильная группа с высокой селективностью в этой реакции

вводится в положение (5-положение) соединения общей формулы (3) и является полезным при промышленном использовании.

Например, ацильная группа в качестве группы R^1 в общей формуле (1) может быть алифатической ацильной группой, алициклической ацильной группой или ароматической ацильной группой.

(Алифатическая ацильная группа)

Алифатическая ацильная группа (R^1) может быть или линейной алифатической ацильной группой, или разветвленной алифатической ацильной группой, а также может содержать ненасыщенную связь в алифатическом остатке или может быть замещена алициклической группой, такой как алициклическая алкильная группа.

Алициклическая ацильная группа включает, например, линейную или разветвленную алифатическую ацильную группу, имеющую от 1 до 7 атомов углерода (например, число атомов углерода обозначается аббревиатурой " C_1-C_7 " в таком случае), и конкретные примеры ее включают формильную группу, ацетильную группу, пропионильную группу, 2-пропионильную группу, бутирильную группу, изобутирильную группу, пентаноильную группу, гексаноильную группу, аллилкарбонильную группу и циклогексилметилкарбонильную группу.

(Алициклическая ацильная группа)

Алициклическая группа (R^1) может содержать ненасыщенную связь в алициклическом остатке. Такая алициклическая ацильная группа включает, например, C_3-C_6 циклоалкилкарбонильные группы, и конкретные их примеры включают циклопропилкарбонильную группу, циклопентилкарбонильную группу, циклогексилкарбонильную группу и 1-циклогексенилкарбонильную группу.

(Ароматическая ацильная группа)

Ароматическая ацильная группа (R^1) может быть замещена алкильной или алкоксильной группой. Такая ароматическая ацильная группа включает, например, ароматические ацильные группы, такие как бензоильная группа, 4-метилбензоильная группа и 4-метоксибензоильная группа.

Группа R^1 бензильного производного общей формулы (1) является предпочтительно алифатической ацильной группой, более предпочтительно C_1-C_7 алифатической ацильной группой и наиболее предпочтительно ацетильной группой, с точки зрения выхода целевого продукта в реакции с галогенацильным соединением общей формулы (2) и реакционной способности в последующем процессе.

(том галогена)

X^1 в общей формуле (1) представляет собой атом галогена, и его конкретные примеры включают атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

(Примеры бензильного производного)

Примеры бензильного производного общей формулы (1) включают N-[(2-хлорфенил)метил]ацетамид, N-[(2-бромфенил)метил]ацетамид, N-[(2-фторфенил)метил]ацетамид, N-[(2-хлорфенил)метил]пропанамид, N-[(2-бромфенил)метил]пропанамид, N-[(2-фторфенил)метил]пропанамид, N-[(2-хлорфенил)метил]-2-метилпропанамид, N-[(2-бромфенил)метил]-2-метилпропанамид, N-[(2-фторфенил)метил]-2-метилпропанамид, N-[(2-хлорфенил)метил]-2-метилбутанамид, N-[(2-бромфенил)метил]-2-метилбутанамид, N-[(2-фторфенил)метил]-2-метилбутанамид, N-[(2-хлорфенил)метил]бензамид,

N-[(2-бромфенил)метил]бензамид и N-[(2-фторфенил)метил]бензамид.

Эти бензильные производные общей формулы (1) являются известными соединениями или соединениями, которые могут быть синтезированы путем взаимодействия соответствующего соединения 2-галогенбензиламина с

(Ацильная группа)

Например, ацильная группа (R^2) в общей формуле (2) предпочтительно является алифатической ацильной группой, алициклической ацильной группой или

(Алифатическая ацильная группа)

Алифатическая ацильная группа (R^2) может быть или линейной алифатической ацильной группой или разветвленной алифатической ацильной группой, а также может содержать ненасыщенную связь в алифатическом остатке или может быть замещена алициклической группой, такой как алициклическая алкильная группа. Такая алифатическая ацильная группа включает, например, C_1 - C_7 линейные или разветвленные алифатические ацильные группы, и конкретные примеры их включают формильную группу, ацетильную группу, пропионильную группу, 2-пропионильную группу, бутирильную группу, изобутирильную группу, пентаноильную группу, гексаноильную группу, аллилкарбонильную группу и циклогексилметилкарбонильную группу.

(Алициклическая ацильная группа)

Алициклическая группа (R^2) может содержать ненасыщенную связь в алициклическом остатке. Такая алициклическая ацильная группа включает, например, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильные группы, и конкретные их примеры включают циклопропилкарбонильную группу, циклопентилкарбонильную группу, циклогексилкарбонильную группу и 1-циклогексенилкарбонильную группу.

Ароматическая ацильная группа (R^2) может быть замещена алкильной или алкоксильной группой. Такая ароматическая ацильная группа включает, например, ароматические ацильные группы, такие как бензоильная группа, 4-метилбензоильная группа и 4-метоксибензоильная группа.

Группа R^2 галогенацильного соединения общей формулы (2) является предпочтительно алифатической ацильной группой, более предпочтительно C_1 - C_7 алифатической ацильной группой и наиболее предпочтительно ацетильной группой, с точки зрения выхода целевого продукта.

(Атом галогена)

X^2 в общей формуле (2) представляет собой атом галогена, и его конкретные примеры включают атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

(Примеры галогенацильных соединений)

Примеры галогенацильных соединений, представленных общей формулой (2), включают ацетилхлорид, ацетилбромид, пропионилхлорид, бутирилхлорид, изобутирилхлорид, валерилхлорид, изовалерилхлорид, трет-бутилацетилхлорид и 2-этилбутирилхлорид.

Галогенацильное соединение общей формулы (2) является известным соединением или оно может быть синтезировано, например, путем хлорирования соответствующей карбоновой кислоты тионилхлоридом.

(Количества)

Количество галогенацильного соединения общей формулы (2), реагирующего с 1

модем бензильного соединения общей формулы (1), конкретно не ограничено. Количество галогенацильного соединения обычно лежит в интервале от 1,0 до 2,0 моль, предпочтительно от 1,0 до 1,5 моль и более предпочтительно от 1,0 до 1,2 моль.

(Кислота Льюиса)

5 В настоящем изобретении указанная выше реакция проводится в присутствии кислоты Льюиса. Примеры кислоты Льюиса, используемой в реакции, включают галоиды металлов, такие как хлорид алюминия ($AlCl_3$), хлорид цинка ($ZnCl_2$) и хлорид железа(III) ($FeCl_3$). Среди этих галоидов металлов предпочтительным является
10 использование хлорида алюминия ($AlCl_3$). Количество кислоты Льюиса, используемое в реакции, лежит в интервале от 2,0 до 5,0 моль, предпочтительно от 2,5 до 3,0 моль, в расчете на 1 моль бензильного соединения общей формулы (1).

(Растворитель)

15 Реакция может быть проведена с или без использования растворителя. Растворитель, который может быть использован в реакции, может быть любым растворителем, который в значительной степени не ингибирует реакцию. Примеры растворителей включают ароматические углеводороды, которые могут быть
20 замещенными, по крайней мере, одной нитрогруппой или галогеном, такие как нитробензол, дихлорбензол и трихлорбензол; галогенированными алифатическими углеводородами, такими как дихлорметан, дихлорэтан и хлороформ. Среди этих растворителей галогенированные алифатические углеводороды являются
25 предпочтительными. Эти растворители могут быть использованы сами по себе или как смесь растворителей в любом соотношении при смешивании.

Количество растворителя может быть таким, чтобы обеспечивать достаточное перемешивание реакционной системы и обычно лежит в интервале от 0,1 до 2,0 л, предпочтительно от 0,3 до 1,0 л и более предпочтительно от 0,3 до 0,8 л, в пересчете на 1 моль соединения бензиламина общей формулы (1).

30 (Температура и время реакции)

Температура реакции может лежать в интервале от 20°C до температуры отгонки используемого растворителя, предпочтительно от 30 до 80°C и более предпочтительно от 40 до 60°C.

35 Время реакции конкретно не ограничено, но предпочтительно составляет от 6 до 24 часов, с точки зрения ингибирования процесса образования побочных продуктов.

(Производное бензиламина)

Производное бензиламина общей формулы (3), полученное с помощью реакции, является соединением, которое полезно в качестве промежуточного продукта,
40 используемого для получения различных соединений (например, карбаматного производного общей формулы (6)).

(Настоящее изобретение [2])

Далее будет описано изобретение [2].

45 Настоящее изобретение [2] направлено на способ получения карбаматного производного общей формулы (6) способом настоящего изобретения [1]. Согласно этому способу производное бензиламина общей формулы (3) получают при взаимодействии бензильного соединения общей формулы (1) с галогенацильным соединением общей формулы (2) в присутствии кислоты Льюиса и карбаматное
50 производное общей формулы (6) получают при взаимодействии аминсоединения общей формулы (4), получаемого гидролизом производного бензиламина общей формулы (3), с эфиром галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5) в присутствии основания.

Производное бензиламина общей формулы (3) получают тем же самым способом, что и в случае [1].

(Гидролиз)

5 Далее будет описано получение производного амина общей формулы (4) с помощью гидролиза производного бензиламина общей формулы (3), полученного в настоящем изобретении [1].

Способ гидролиза производного бензиламина общей формулы (4) конкретно не ограничивается, но предпочтительно проводится с использованием кислоты
10 Бренстеда с точки зрения легкости проведения.

(Кислота Бренстеда)

Примеры кислоты Бренстеда, которые могут быть использованы в реакции гидролиза, включают алифатические карбоновые кислоты, которые могут быть
15 замещены галогеном, такие как уксусная кислота, пропионовая кислота и трифторуксусная кислота, и минеральные кислоты, такие как серная кислота и соляная кислота. Среди этих кислот минеральные кислоты являются предпочтительными, а серная кислота особенно предпочтительна. Более конкретно, реакция может быть проведена при использовании от 20 до 80%, предпочтительно
20 от 40 до 80%, серной кислоты. Количество кислоты Бренстеда, используемое в реакции, лежит в интервале от 2,0 до 3,0 моль в пересчете на 1 моль ацильного производного общей формулы (3).

(Вода)

Количество воды, используемое в реакции, может быть, по меньшей мере,
25 стехиометрическим количеством и конкретно, по меньшей мере, 1 моль в пересчете на 1 моль производного бензиламина общей формулы (3).

(Растворитель)

Реакция может быть проведена с или без использования растворителя.
30 Растворитель, который может быть использован в реакции, может быть любым растворителем, который в значительной степени не ингибирует реакцию. Примеры растворителей включают ароматические углеводороды, которые могут быть замещенными, по крайней мере, одной C_1 - C_6 алкильной группой или галогеном, такие
35 как толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол и трихлорбензол. Среди этих растворителей трихлорбензол является предпочтительным. Эти растворители могут быть использованы сами по себе или в виде смеси растворителей в любом соотношении при смешивании. Количество растворителя может быть таким, чтобы обеспечивать достаточное перемешивание для смешения реакционной системы и
40 обычно лежит в интервале от 0,05 до 0,5 л, предпочтительно от 0,1 до 0,3 л и более предпочтительно от 0,1 до 0,2 л, в пересчете на 1 моль соединения бензиламина общей формулы (3).

(Температура и время реакции)

Температура реакции может находиться в интервале от 70°C до температуры
45 отгонки используемого растворителя, предпочтительно от 80 до 130°C и более предпочтительно от 100 до 110°C.

Время реакции конкретно не ограничено, но предпочтительно от 5 до 15 часов, с точки зрения ингибирования образования побочных продуктов.

50 (Реакция получения карбаматного производного)

Далее будет описана реакция аминопроизводного общей формулы (4), полученного реакцией с эфиром галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5), для получения карбаматного производного общей формулы (6).

(Эфир галогенмуравьиной кислоты)

R^3 в эфире галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5) является алкильной группой. Например, алкильная группа является предпочтительно линейной или разветвленной C_1 - C_7 алкильной группой, такой как метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, н-пентильная группа или н-гексильная группа.

(Атом галогена)

X^3 в общей формуле (5) представляет собой атом галогена, и его конкретные примеры включают атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

(Эфир галогенмуравьиной кислоты)

Таким образом, конкретные примеры эфира галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5), который может быть использован в реакции, включают метиловый эфир хлормуравьиной кислоты, этиловый эфир хлормуравьиной кислоты, н-пропиловый эфир хлормуравьиной кислоты, изопропиловый эфир хлормуравьиной кислоты, н-бутиловый эфир хлормуравьиной кислоты и изобутиловый эфир хлормуравьиной кислоты.

Эфир галогенмуравьиной кислоты, представленный общей формулой (5), является известным соединением (следовательно, также может быть получен с помощью известной реакции, если необходимо).

Реакция между аминокислотой общей формулы (4) и эфиром галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5) происходит при любом молярном соотношении. Количество эфира галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5) обычно лежит в интервале от 1,0 до 2,0 моль, предпочтительно от 1,0 до 1,5 моль и более предпочтительно от 1,0 до 1,2 моль в пересчете на 1 моль аминокислоты общей формулы (4).

(Основание)

Реакция проходит с использованием основания. Примеры основания, которое может быть использовано в реакции, включают органические основания, типичными представителями которых служат третичные амины, такие как триэтиламин и диизопропиламин; карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат калия и карбонат натрия, и гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид калия и гидроксид натрия. Основание предпочтительно является карбонатом щелочного металла и особенно предпочтительно карбонатом калия. Количество основания, используемого в реакции, обычно лежит в интервале от 1,0 до 3,0 моль и предпочтительно от 1,1 до 1,5 моль в пересчете на 1 моль аминокислоты общей формулы (4).

(Растворитель)

Реакция может быть успешно проведена с или без использования растворителя. Растворитель, который может быть использован в реакции, может быть любым растворителем, который в значительной степени не ингибирует реакцию. Примеры растворителей включают ароматические углеводороды, которые могут быть замещенными, по меньшей мере, одной алкильной группой или галогеном, такие как толуол, ксилол и хлорбензол; галогенированные алифатические углеводороды, такие как дихлорметан и хлороформ; эфиры уксусной кислоты, такие как ацетат, этилацетат и бутилацетат; апротонные полярные растворители, такие как диметилформамид, диметилацетамид, N-метилпирролидон, тетраметилмочевина и гексаметилфосфотриамид (НМРА), и растворители на основе простых эфиров, такие

как диэтиловый эфир, тетрагидрофуран (ТНФ) и диоксан.

Среди этих растворителей ароматические углеводороды являются предпочтительными, и толуол является особенно предпочтительным. Эти растворители могут быть использованы сами по себе или как смесь растворителей в любом соотношении при смешивании. Количество растворителя может быть таким, чтобы обеспечивать достаточное перемешивание реакционной системы, и обычно лежит в интервале от 0,5 до 1,0 л в пересчете на 1 моль аминопроизводного общей формулы (4).

(Температура и время реакции)

Температура реакции может лежать в интервале от 0°C до температуры отгонки используемого растворителя, предпочтительно от 10 до 80°C и более предпочтительно от 20 до 60°C.

Время реакции конкретно не ограничено, но предпочтительно составляет от 0,5 до 6 часов с точки зрения ингибирования образования побочных продуктов.

(Карбаматное производное)

Карбаматное производное общей формулы (6), полученное согласно настоящему изобретению [2], является соединением, которое полезно в качестве промежуточного продукта, используемого для получения различных агрохимических препаратов, например, на основе карбамата (особенно бактерицида).

(Защищенное по аминогруппе замещенное соединение)

Различные защищенные по аминогруппе замещенные соединения также могут быть получены путем взаимодействия аминопроизводного общей формулы (4), полученного, как описано выше, с известными реагентами, используемыми, в основном, для защиты аминогруппы (например, эфир муравьиной кислоты, такие как бензиловый эфир хлормуравьиной кислоты и ди-трет-бутилдикарбонат; галогенангидриды кислот, такие как хлорангидрид пропионовой кислоты; галогенированный алкил, такой как хлорэтил, и 2-(трет-бутоксикарбонилоксиимино)-2-фенилацетонитрил).

Примеры защищенного по аминогруппе замещенного соединения включают различные защищенные по аминогруппе замещенные соединения, в которых аминогруппа защищена известной защитной группой, например:

(i) защитная группа уретанового типа (R=Вос группа (трет-бутоксикарбонил), Cbz группа (бензилоксикарбонил), Cbz (OMe) группа (n-метоксибензилоксикарбонил), Cbz (Cl) группа (n-хлорбензилоксикарбонил) или Cbz (NO₂) группа

(n-нитробензилоксикарбонил),

(ii) защитная группа ацильного типа (формильная группа, ацетильная группа, пропионильная группа, бутрильная группа, пентинильная группа или гексенильная группа в соединении (1) настоящего изобретения, или

(iii) защитная группа алкильного типа (C₁-C₆ линейная или разветвленная алкильная группа, такая как метильная группа, этильная группа, n-пропильная группа, изопропильная группа, n-бутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, n-пентильная группа или n-гексильная группа).

Защищенное по аминогруппе замещенное соединение может быть синтезировано уже известным способом.

(Настоящее изобретение [3])

Соединением согласно [3] настоящего изобретения является производное ацилбензиламина общей формулы (7).

(Производное ацилбензиламина)

Производное ацилбензиламина общей формулы (6), согласно [3] настоящему изобретению, включает производное бензиламина общей формулы (3) и аминокпроизводное общей формулы (4), которые получены в [1] и [2] настоящего изобретения. Как описано выше, эти производные являются соединениями, которые
5 полезны в качестве исходного продукта для получения карбаматного производного общей формулы (6), служащего в качестве промежуточного продукта, используемого для получения различных соединений (соединения на основе карбамата, о которых известно, что они полезны в качестве агрохимических препаратов).

(Заместители)

В общей формуле (7) заместитель X^1 представляет собой атом галогена, например атом фтора, атом хлора, атом брома или атом йода.

В общей формуле (7) заместитель R^4 представляет собой атом водорода или ту же самую ацильную группу, что и R^2 . Та же самая ацильная группа, что и R^2 , может
15 быть, например, алифатической ацильной группой, алициклической ацильной группой или ароматической ацильной группой.

(Алифатическая ацильная группа)

Алифатическая ацильная группа (R^4) может быть или линейной алифатической ацильной группой, или разветвленной алифатической ацильной группой.

Алифатическая ацильная группа может содержать ненасыщенную связь в алифатическом остатке или также может быть замещена алициклической группой, такой как алициклическая алкильная группа. Примеры алифатической ацильной
25 группы включают C_1 - C_7 линейные или разветвленные алифатические ацильные группы, например, формильную группу, ацетильную группу, пропионильную группу, 2-пропионильную группу, бутирильную группу, изобутирильную группу, пентаноильную группу, гексаноильную группу, аллилкарбонильную группу и циклогексилметилкарбонильную группу.

(Алициклическая ацильная группа)

Алициклическая группа (R^4) может содержать ненасыщенную связь в алифатическом остатке. Примеры алициклической ацильной группы включают C_3 - C_6
35 циклоалкилкарбонильные группы, например циклопропилкарбонильную группу, циклопентилкарбонильную группу, циклогексилкарбонильную группу и 1-циклогексенилкарбонильную группу.

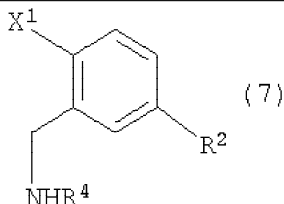
(Ароматическая ацильная группа)

Ароматическая ацильная группа (R^4) может быть замещена алкильной или алкоксильной группой. Примеры ароматической ацильной группы включают,
40 например, бензоильную группу, 4-метилбензоильную группу и 4-метоксибензоильную группу.

(Конкретные примеры соединения настоящего изобретения)

Конкретные примеры соединения настоящего изобретения, которые имеют
45 заместители X^1 , R^2 и R^4 , включают, но не ограничиваются ими, те, которые представлены в таблице. На номер соединения ссылаются в последующем описании. Аббревиатуры в таблице имеют следующие значения: Ac - ацетильная группа, Prn - пропионильная группа.

50



5

10

15

20

Номер соединения	X ¹	R ²	R ⁴
1	Cl	Ac	H
2	Cl	Prn	H
3	Cl	Ac	Ac
4	Cl	Prn	Ac
5	Cl	Ac	Prn
6	Cl	Prn	Prn
7	Br	Ac	H
8	Br	Prn	H
9	Br	Ac	Ac
10	Br	Prn	Ac
11	Br	Ac	Prn
12	Br	Prn	Prn
13	F	Ac	H
14	F	Prn	H
15	F	Ac	Ac
16	F	Prn	Ac
17	F	Ac	Prn
18	F	Prn	Prn

25

Примеры предпочтительного промежуточного соединения для карбаматного производного (6), которое применяется в качестве промежуточного соединения для сельскохозяйственного или садового бактерицида, включает соединение 1, в котором

30

X¹ представляет собой Cl, R² представляет собой Ac (ацетильную группу) и R⁴ представляет собой H (атом водорода), и соединение 3, в котором X¹ представляет собой Cl (атом хлора), R² представляет собой Ac (ацетильную группу) и R⁴ представляет собой Ac (ацетильную группу).

ПРИМЕРЫ

35

Способ получения соединения настоящего изобретения будет описан в деталях с помощью примеров, но настоящее изобретение не ограничивается этими примерами. В последующем описании чистота была выражена по площади пиков в процентах, полученных при газовой хроматографии (ГХ).

40

Пример 1

1) Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]ацетамида (соединение номер 3, изобретение согласно [1])

45

36,7 г (0,2 моль) N-[(2-хлорфенил)метил]ацетамида растворяли в 60 мл дихлорметана и добавляли 80,0 г (0,6 моль) хлорида алюминия при 5-30°C в течение 30 минут, затем добавляли 31,4 г (0,4 моль) ацетилхлорида по каплям при такой же температуре в течение 30 минут.

50

Смесь выдерживали при комнатной температуре в течение одного часа, нагревали до температуры отгонки в течение 15 минут и затем выдерживали в условиях кипячения с обратным холодильником 12 часов. После завершения реакции полученный реакционный раствор выливали в воду и экстрагировали три раза 50 мл толуола, затем растворитель отгоняли дистилляцией при пониженном давлении. После охлаждения осадка выпавшие кристаллы отделяли фильтрацией, промывали толуолом

и сушили, получая 24,5 г (выход 54,3%, чистота 99,4%) целевого соединения (температура плавления от 93,1 до 93,7°C).

^1H -ЯМР ($\text{CHCl}_3 - d_1$, 300 МГц) $\delta=2.0$ (s, 3H, NHCOCH_3), 2.6 (s, 3H, Ph-COCH_3), 4.6 (d, 2H, CH_2 , $J=6.0$ Гц), 6.1 (уширенный, s, 1H, NHCOCH_3), 7.5 (d, 1H, Ph кольцо, $J=8.2$ Гц), 7.8 (dd, 1H, Ph кольцо, $J=2.2$ 8.2 Гц), 8.0 (d, 1H, Ph кольцо, $J=2.2$ Гц).

МС (ГХ-МС) $m/e = 225$ (M^+), 190 (основание).

Пример 2

1) Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды (А). Получение 1-[3-(аминометил)-4-хлорфенил]этан-1-он (соединение номер 1) (изобретение согласно [6])

20,0 г (0,089 моль) N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]ацетамида, полученного в примере 1, растворяли в 55 г 50% серной кислоты, далее нагревали до температуры отгонки в течение более 30 минут и дополнительно выдерживали в условиях кипячения с обратным холодильником в течение 15 часов.

После завершения реакции полученный реакционный раствор выливали в воду и добавляли 45 мл толуола, затем водный раствор делали основным с помощью 25% гидроксида натрия ($\text{pH} = \text{около } 12,0$). После двойной экстракции 45 мл толуола растворитель отгоняли дистилляцией при пониженном давлении. После охлаждения осадка выпавшие кристаллы отделяли фильтрацией, получая, по существу, с количественным выходом названное соединение (чистота 99,2%).

МС (ГХ-МС) $m/e = 182$ ($\text{M}^+ - 1$), 140 (основание).

(В). Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды (изобретение согласно [7])

17,1 г (0,089 моль) 1-[3-(аминометил)-4-хлорфенил]этан-1-он, полученного в примере 2(А), растворяли в 44,3 мл толуола и затем загружали (смешивали) с 14,7 г (0,107 моль) карбоната калия, далее по каплям добавляли 9,2 г (0,098 моль) метилхлоркарбоната при 5-20°C в течение более 30 минут и дополнительно выдерживали при комнатной температуре в течение 3 часов.

После завершения реакции полученный реакционный раствор выливали в воду и растворитель отгоняли дистилляцией при пониженном давлении. После охлаждения осадка выпавшие кристаллы отделяли фильтрацией, промывали толуолом и сушили, получая 19,3 г (выход 90,2%, чистота 99,8%) целевого соединения (температура плавления 108,1°C).

^1H -ЯМР ($\text{CHCl}_3 - d_1$, 300 МГц) $\delta=2.6$ (s, 3H, Ph-COCH_3), 3.7 (s, 3H, COOCH_3), 4.5 (d, 2H, CH_2 , $J=6.3$ Гц), 5.3 (уширенный, s, 1H, NH), 7.5 (d, 1H, Ph кольцо, $J=8.3$ Гц), 7.8 (dd, 1H, Ph кольцо, $J=2.1$ 8.3 Гц), 8.0 (s, 1H, Ph кольцо).

МС (ГХ-МС) $m/e = 241$ (M^+), 206 (основание).

Пример 3

1) Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды (А). Получение N-[(2-хлорфенил)метил]ацетамида, общая формула (1)

42,8 кг (0,3 кмоль) (2-хлорфенил)метиламина растворяли в 118,3 кг дихлорметана и добавляли по каплям 32,2 кг (0,315 кмоль) уксусного ангидрида при 20-40°C в течение 1,5 часов, затем выдерживали при комнатной температуре течение 30 минут.

После завершения реакции добавляли 60 кг воды и по каплям 55,2 кг водного раствора 25% гидроксида натрия при 20-40°C в течение 20 минут. Органический слой отделяли и получали 169,9 кг дихлорметанового раствора N-[(2-хлорфенил)метил]ацетамида.

(В). Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]ацетамида (соединение номер 3) (изобретение согласно [1])

К 169,9 кг дихлорметанового раствора N-[(2-хлорфенил)метил]ацетамида, полученного в примере 3(А), добавляли 47,1 кг (0,6 моль) ацетилхлорида и 108,0 кг (0,81 кмоль) хлорида алюминия при 15-30°C в течение 1,5 часа. Затем дихлорметан отгоняли при нормальном давлении до тех пор, пока температура не достигала 50°C в течение 2 часов, смесь выдерживали в течение 6 часов (целевой продукт: другие позиционные изомеры = 76,75%; 1,65%; ГХ площадь в %). После завершения реакции полученный раствор по каплям добавляли к 450 кг воды при 15-35°C в течение 2 часов. Раствор экстрагировали дважды 90 кг дихлорметана и 40 кг дихлорметана с получением 199,8 кг дихлорметанового раствора N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]ацетамида.

(С). Получение 1-[3-(аминометил)-4-хлорфенил]этан-1-она (соединение номер 1) (изобретение согласно [6])

К 199,8 кг дихлорметанового раствора N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]ацетамида, полученного в примере 3(В), добавляли 90 кг воды и 46 кг (0,45 кмоль) 98% серной кислоты. Дихлорметан отгоняли при нормальном давлении в течение 1,5 часов до тех пор, пока внутренняя температура не достигала 100°C, затем выдерживали в течение 6 часов. После завершения реакции реакционный раствор охладили до 50°C в течение 20 минут и добавили 90 кг воды и 105 кг толуола. После охлаждения добавили по каплям 212 кг водного 25% раствора гидроксида натрия при 15-25°C в течение 2,5 часов. После нагревания до 40°C в течение 30 минут органический слой отделили и получили раствор 1-[3-(аминометил)-4-хлорфенил]этан-1-она в толуоле.

(D). Получение N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды (изобретение согласно [7])

К толуольному раствору 1-[3-(аминометил)-4-хлорфенил]этан-1-она, полученного в примере 3(С), добавляли 180 кг воды и 47,5 кг карбоната калия (0,33 кмоль), затем смешивали, по каплям добавляли 28,4 кг (0,3 кмоль) метилхлоркарбоната при 15-25°C в течение одного часа и дополнительно выдерживали при комнатной температуре в течение одного часа. После завершения реакции реакционный раствор нагревали до 60°C в течение 30 минут и отделяли органический слой. К полученному в результате толуольному раствору N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды добавляли 150 кг воды и толуол отгоняли при нормальном давлении в течение 2 часов. Осадок охлаждали до 50°C в течение 30 минут и добавляли 39 кг толуола, потом охлаждали до 10°C в течение 1,5 часов. Выпавшие кристаллы сушили, получая 49,1 кг (выход 67,7% в пересчете на (2-хлорфенил)метиламин, чистота 94,5%) N-[(5-ацетил-2-хлорфенил)метил]метоксикарбоксамиды.

Промышленная применимость

Как описано выше, согласно настоящему изобретению проблемы предшествующего уровня техники решены и обеспечен способ, который полезен для получения карбаматного производного.

Согласно настоящему изобретению, например, обеспечены способ получения производного бензиламина общей формулы (3), который является полезным при получении карбаматного производного общей формулы (6), в качестве полезного промежуточного продукта для производства сельскохозяйственного или садового бактерицида на основе карбамата, способ получения карбаматного производного общей формулы (6) и новое промежуточное соединение.

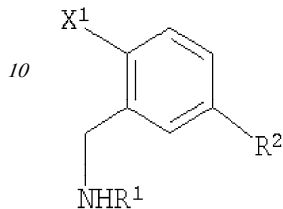
Согласно настоящему изобретению, например, обеспечивается карбаматное

производное общей формулы (6) в качестве полезного промежуточного продукта для производства бактерицида на основе карбамата с хорошим выходом и чистотой путем простой операции. Следовательно, способ настоящего изобретения имеет особенно высокую ценность для промышленного производства.

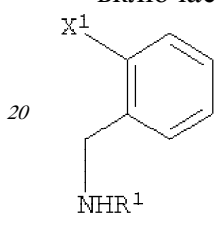
5

Формула изобретения

1. Способ получения производного бензиламина общей формулы (3)



15 где X^1 , R^1 и R^2 определены ниже, который включает взаимодействие бензильного производного общей формулы (1)

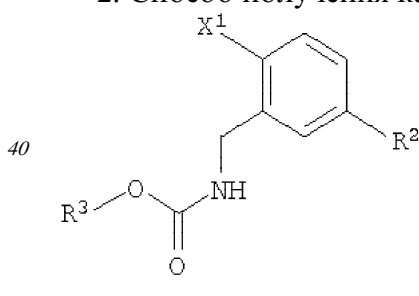


25 где X^1 представляет собой атом галогена, а R^1 представляет собой ацильную группу, выбранную из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильной группы, и ароматической ацильной группы, с галогенацильным соединением общей формулы (2):

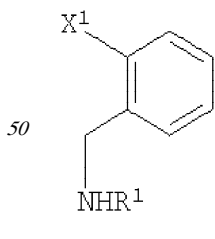


где X^2 представляет собой атом галогена, а R^2 представляет собой ацильную группу, выбранную из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильной группы, и ароматической ацильной группы, в присутствии кислоты Льюиса.

2. Способ получения карбаматного производного общей формулы (6)



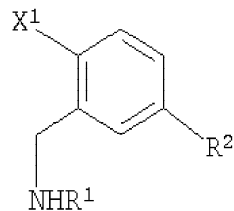
45 где X^1 , R^2 и R^3 определены ниже, который включает взаимодействие бензильного производного общей формулы (1)



где X^1 представляет собой атом галогена, а R^1 представляет собой ацильную группу, выбранную как указано в п.1, с галогенацильным соединением общей формулы (2):

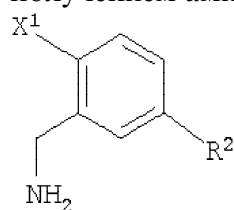


где X^2 представляет собой атом галогена, а R^2 представляет собой ацильную группу, как указано в п.1, в присутствии кислоты Льюиса с получением производного бензиламина общей формулы (3)



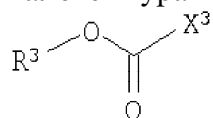
(3)

где X^1 , R^1 и R^2 определены выше, гидролиз производного бензиламина с получением аминопроизводного общей формулы (4):



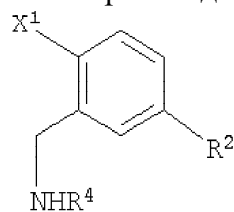
(4)

где X^1 и R^2 определены выше, и взаимодействие аминопроизводного с эфиром галогенмуравьиной кислоты общей формулы (5)



(5)

3. Производное ацилбензиламина общей формулы (7)



(7)

где X^1 представляет собой атом галогена, каждый из R^2 и R^4 независимо представляет собой C_1 - C_7 -линейную или разветвленную алифатическую ацильную группу, C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильную группу, и R^4 дополнительно может означать атом водорода.

4. Производное ацилбензиламина по п.3,

где R^2 представляет собой ацильную группу, выбранную из группы, состоящей из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы и C_3 - C_6 -циклоалкилкарбонильной группы, а R^4 представляет собой атом водорода.

5. Производное ацилбензиламина по п.3,

где каждый из R^2 и R^4 независимо представляет собой ацильную группу, выбранную из группы, состоящей из C_1 - C_7 -линейной или разветвленной алифатической ацильной группы.