

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07D 487/04	(11) 공개번호 특1991-0000736
	(43) 공개일자 1991년01월30일
(21) 출원번호	특1990-0008757
(22) 출원일자	1990년06월14일
(30) 우선권주장	150910/89 1989년06월14일 일본(JP) 242975/89 1989년09월18일 일본(JP) 92391/90 1990년04월06일 일본(JP)
(71) 출원인	다께다야구힙고오교 가부시끼가이샤 우메모토 요시마사
(72) 발명자	일본국 오오사까시 쥬오꾸 도쇼오마찌 2쫘메 3방 6고 아끼모토 히로시 일본국 효오고켁 고오베시 히가시나다꾸 모리끼따마찌 6쫘메 4방 25고 히다까 다께노리 일본국 효오고켁 다까라즈까시 나까야마사쓰끼다이 6쫘메 1방 22-302고 미와 데쓰오 일본국 효오고켁 고오베시 나다꾸 야하따쫘 2쫘메 10방 11-203고
(74) 대리인	이준구, 김승호

심사청구 : 없음

(54) 피롤로피리미딘의 제조방법 및 그의 중간체

요약

내용 없음

명세서

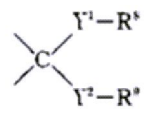
[발명의 명칭]

피롤로피리미딘의 제조방법 및 그의 중간체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

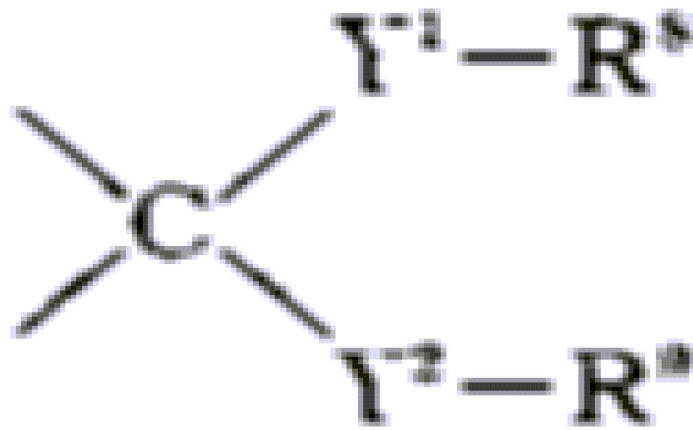
(57) 청구의 범위

청구항 1



하기 일반식(II)의 화합물중의 기 $\begin{array}{c} Y^1-R^8 \\ \diagdown \quad \diagup \\ C \\ \diagup \quad \diagdown \\ Y^2-R^9 \end{array}$ 를 카르보닐기로 재생시키는 반응 도중이나 재생 반응 후에 하기 일반식(III)의 화합물 또는 그의 염을 폐한 반응시켜서 피롤로 [2, 3-d] 피리미딘 고리를 형성한 다음, 필요에 따라서는 고리(A)의 피롤 고리를 피롤린 고리로 환원시키거나/시키고 R⁴의 OR⁵(R⁵는 하기 정의된 바와 같다)를 NHCH(COOR⁶)CH₂CH₂COOR⁷(R⁶와 R⁷은 하기 정의된 바와 같다)으로 전환시킴을 특징

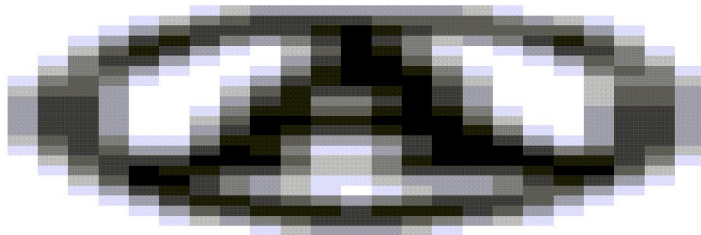
으로 하여, 하기 일반식(I)의 화합물 또는 그의 염을 제조하는 방법.



[상기 식중, 고리(A)는 수소화될 수 있는 피롤 고리이고; X는 아미노, 히드록실 또는 메르캅토기이며; R¹, R² 및 R³는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 수소 또는 치환될 수 있는 알킬, 알케닐 또는 알킬닐기이고; R⁴는 OR⁵ 또는 NHCH(COOR⁶)CH₂CH₂COOR⁷(여기서, R⁵는 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이고, R⁶와 R⁷은 각각 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이다)이며; n은 1~4의 정수이고; Y¹ 및 Y²는 각각 산소 또는 황 원자이며; R⁸ 및 R⁹는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 치환될 수 있는 탄화수소기이다].

청구항 2

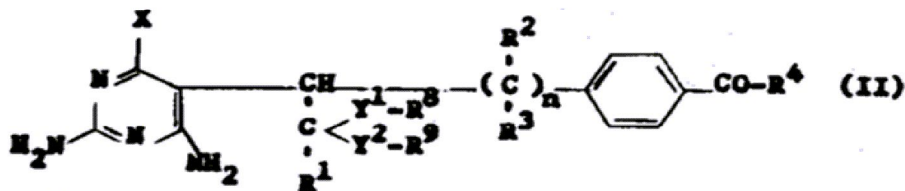
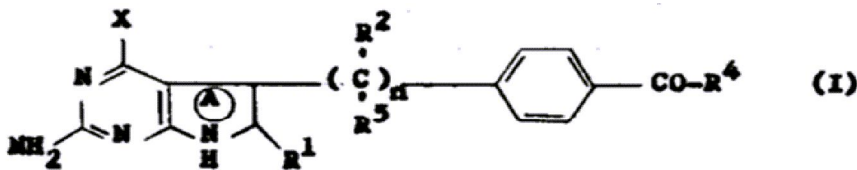
하기 일반식(II)의 화합물 또는 그의 염.



[상기 식중, X, Y¹, Y², R¹, R², R³, R⁴, R⁸, R⁹ 및 n은 제1항에 정의된 바와 동일하다].

청구항 3

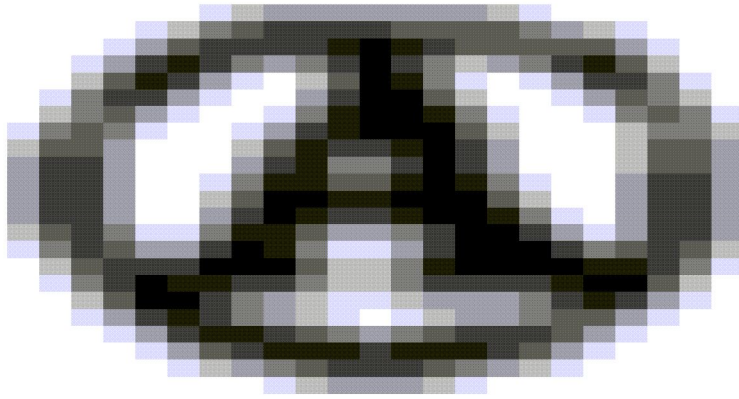
제1항에 있어서 (i) 하기 일반식(II)의 화합물 또는 그의 염을 촉매적으로 환원시키거나, (ii) 하기 화합물(II) 또는 그의 염을 산 또는 금속염과 접촉시키거나, (iii) 하기 화합물(II) 또는 그의 염을 산화제와 반응시키는 것을 특징으로 하여, 하기 일반식(I-I)의 화합물 또는 그의 염을 제조하는 방법.



[상기 식중, X는 아미노, 히드록실 또는 메르캅토기이며; R¹, R² 및 R³는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 수소 또는 치환될 수 있는 알킬, 알케닐 또는 알킬닐기이고; R⁴는 OR⁵ 또는 NHCH(COOR⁶)CH₂CH₂COOR⁷(여기서, R⁵는 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이고, R⁶와 R⁷은 각각 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이다)이며; n은 1~4의 정수이고; R⁸ 및 R⁹는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 치환될 수 있는 탄화수소기이며; Y¹ 및 Y²는 각각 산소 또는 황 원자이다].

청구항 4

제1항에 있어서, 하기 일반식(II)의 화합물 또는 그의 염을 산과 접촉시킴을 특징으로 하여, 하기 일반식(I-1)의 화합물 또는 그의 염을 제조하는 방법.



[상기 식중, X는 아미노, 히드록실 또는 메르캅토기이고; R^1 , R^2 및 R^3 는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 수소 또는 치환될 수 있는 알킬, 알케닐 또는 알킬닐기이고; R^4 는 OR^5 또는 $NHCH(COOR^6)CH_2CH_2COOR^7$ (여기서, R^5 는 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이고, R^6 와 R^7 은 각각 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이다)이며; n은 1~4의 정수이고; R^8 및 R^9 는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 치환될 수 있는 탄화수소기이며 ; Y^1 및 Y^2 는 각각 산소 또는 황 원자이다] .

청구항 5

제4항에 있어서, 화합물을 산과 접촉시키는 반응을 수-함유 유기 용매중에서 실시하는 방법.

청구항 6

제5항에 있어서, 수-함유 유기 용매가 알콜, 아세트산 에스테르, 에테르, 케톤, 아마이드, 술폰시드 또는 니트릴과 물의 혼합물인 방법.

청구항 7

제4항에 있어서, 산이 무기산인 방법.

청구항 8

제4항에 있어서, R^1 , R^2 및 R^3 가 각각 수소 원자인 방법.

청구항 9

제4항에 있어서, Y^1 및 Y^2 가 모두 산소 원자인 방법.

청구항 10

제4항에 있어서, R^8 및 R^9 가 각각 C_{1-3} 알킬기인 방법.

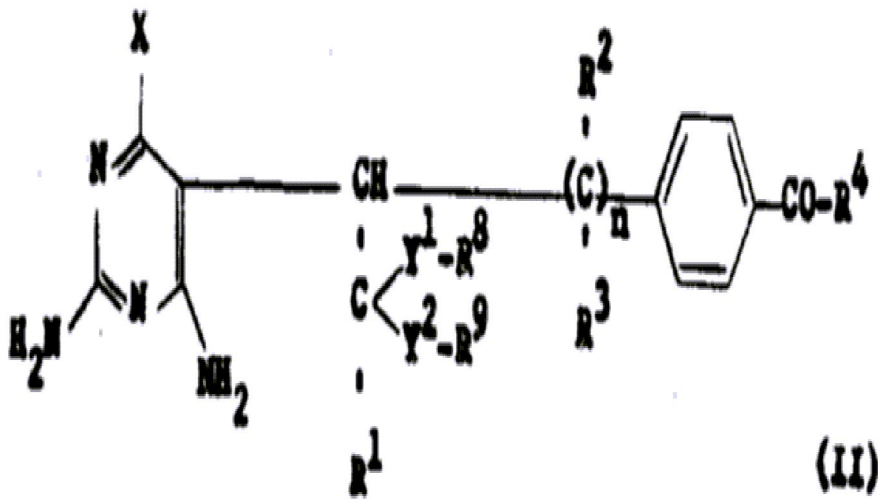
청구항 11

제4항에 있어서, R^5 , R^6 및 R^7 가 각각 C_{1-5} 알킬기 또는 벤질기인 방법.

청구항 12

하기 일반식(V)의 화합물을 구아니딘 또는 그의 염과 반응시킴을 특징으로 하여, 하기 일반식(II)의 화

합물 또는 그의 염을 제조하는 방법.



[상기 식중, X는 아미노, 히드록실 또는 메르캅토기이며; R¹, R² 및 R³는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 수소 또는 치환될 수 있는 알킬, 알케닐 또는 알키닐기이고; R⁴는 OR⁵ 또는 NHCH(COOR⁶)CH₂CH₂COOR⁷ (여기서, R⁵는 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이고, R⁶와 R⁷은 각각 수소 또는 치환될 수 있는 탄화수소기이다)이며; n은 1~4의 정수이고 R⁸ 및 R⁹는 서로 동일 또는 상이하며, 각각 치환될 수 있는 탄화수소기이며; Y¹ 및 Y²는 각각 산소 또는 황 원자며; E는 CN, COOR¹⁰, CSOR¹⁰ 또는 CSSR¹⁰ (여기서, R¹⁰은 치환될 수 있는 탄화수소기이다)이다].

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.