(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[3]
C07D 233/32

(11) 공개번호 특1984-0004729
(43) 공개일자 1984년10월24일

(21) 출원번호 특1983-0002349
(22) 출원일자 1983년05월27일
(30) 우선권주장 383049 1982년05월28일 미국(US)
(71) 출원인 시바 가이기 에이지 아놀드 세일러, 에른스트 알테르
스위스연방 4002 바슬 클라베크쉬트라세 141
(72) 발명자 린콜론 하비 웨너
미합중국 뉴저지 07901 섬미트 라아네드 로우드 94
(74) 대리인 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 3-(우레이도시클로헥실아미노)-프로판-1,2-디올 유도체의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

3-(우레이도시클로헥실아미노)-프로판-1,2-디올 유도체의 제조방법

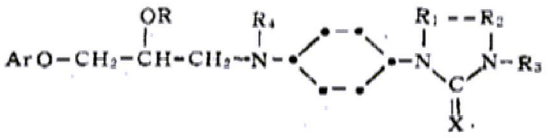
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

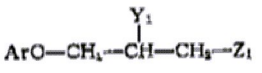
청구항 1

a) 하기 일반식(Ⅳ)의 화합물을 하기 일반식(Ⅴ)의 화합물과 축합시키거나, 또는 b) 일반식 ArOH의 화합물 또는 그의 금속염을 하기 일반식(Ⅹ)의 화합물, 또는 하기 일반식(ⅩⅠ)의 화합물과 축합시키거나, 또는 c) 하기 일반식(ⅩⅡ)의 화합물 또는 R_4가 수소인 경우 그의 토토머를 환원시키거나, 또는 d) 하기 일반식(XV)의 화합물을 환원시키거나, 또는 e) 하기 일반식(ⅩⅦ)의 화합물을 환원 시키거나, 또는 f) 하기 일반식(ⅩⅧ)의 화합물에 있어서 치환체 X_1을 수소로 치환시키거나, 또는 g) 하기 일반식(ⅩⅨ)의 시프염기를 환원시키거나, 또는 h) 하기 일반식(ⅩⅩ)는 화합물 또는 그의 염에 있어서 라디칼 Y_2를 탈리시키거나, 또는 i) 하기 일반식(ⅩⅩⅠ)의 화합물에 있어서 라디칼 Z_4를 히드록시기와 함께 수소로 전환시키고; 상기 a) 내지 i)의 모든 방법에 있어서 필요한 경우에는 방법에 관여하는 반응성기를보호시키거나, 또는 필요한 경우 방법시 또는 이후에 기를 보호된 형태로 유리시키거나, 또는 1) 하기 일반식(Ⅰ)에 있어서 RO이 알카노일 또는 아로일을 나타내는 화합물에 있어서의 이들 기 R을 수소로 전환시키거나, 또는 2) 일반식(Ⅰ)에 있어서 RO이 알카노일 또는 아로일을 나타내는 화합물을 제조하고저 할 경우에는 수소를이들 기로 전환시키거나 또는 3) 일반식 (Ⅰ)에 있어서 R_4가 저급알킬을 나타내는 화합물을 제조하고저 할 경우에는 저급 알킬기를 R_4가 수소인 화합물에 제조하고저 할 경우에는 치환체가 알케닐 또는 알키닐인 화합물을 환원시키거나, 또는 6) 일반식(Ⅰ)에 있어서 Ar의 치환체가 카바모일인 화합물을 제조하고자 할 경우에는 치환체가 시아노인 화합물을 카바모일 치환체를 갖는 화합물로 전환시키거나, 또는 7) 일반식(Ⅰ)에 있어서 기 Ar이 히드록시 또는 히드록시-저급알킬 치환체를 함유하는 화합물을 제조하고 저 할 경우에는 이들 기가 보호된 형태로 화합물을 유리 형태로 전환시키거나, 또는 8) 일반식(Ⅰ)에 있어서 기 Ar 이 저급알킬술포닐아미노 치환체를 갖는 화합물을 제조하고저 할 경우에는 아미노치환체를 갖는 화합물을 저급알킬술포닐아미노 치환체를 갖는 화합물로 전환시키거나, 또는 9) 일반식(Ⅰ)에 있어서 기 Ar 이 저급알콕시, 저급알케닐옥시 또는 저급시클로알킬-저급알콕시 치환체를 갖는 화합물을 제조하고저 할 경우에는 히드록시 치환체를 전술한 기들로 전환시키거나, 또는 10) 일반식(Ⅰ)에 있어서 X가 황원자를 나타내는 화합물을 제조하고자 할 경우에는 X가 산소인 화합물을 전술한 화합물을 전환시키며, 11) 필요에 따라서는 일반식(Ⅰ)의 생성 화합물을 본 발명에 따른 화합물로 전환시키거나, 또는 필요에 따라서는 생성되는 유리 화합물을 염으로 또는 생성염을 유리화합물 또는 다른 염으로 전환시키거나, 또는 필요에 따라서는 수득되는 이성체 또는 라세메이트의 혼합물을 단일이성체 또는 라세메이트로 분할하거나, 또는 수독되는 라세메이트를그의 광학 대장체로 분할시킴을 특징으로 하는 일반식(Ⅰ)의 3

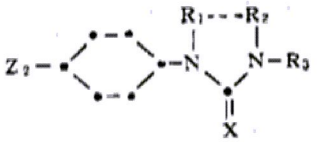
-(우레이도 시클로헥실아미노)프로판-1,2-디올 유도체의 제조방법.



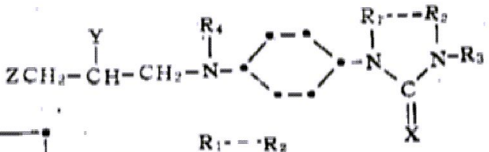
(I)



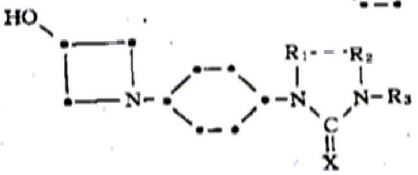
(IV)



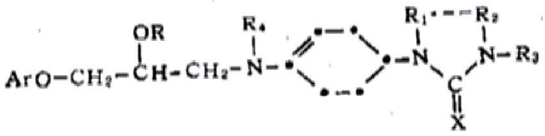
(V)



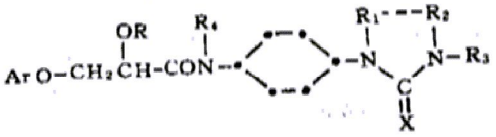
(X)



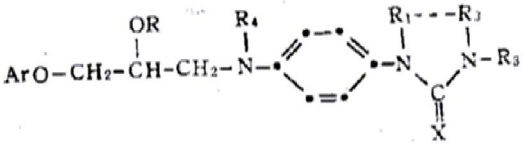
(XI)



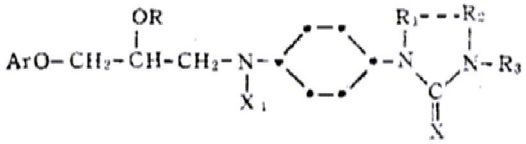
(XII)



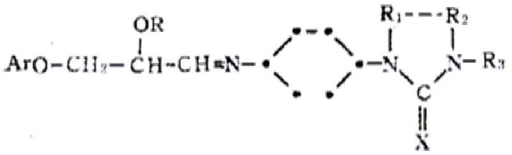
(XV)



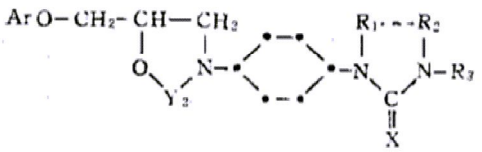
(XVII)



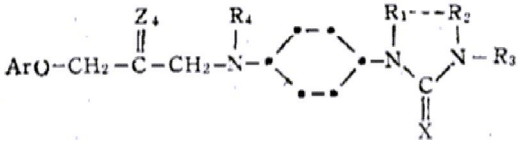
(XVIII)



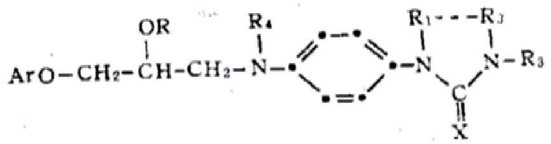
(XIX)



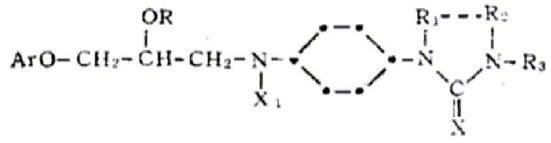
(XX)



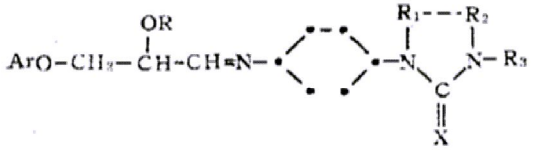
(XXI)



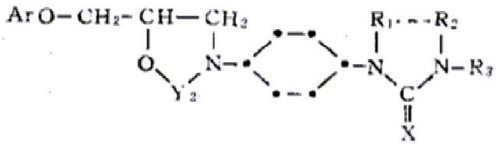
(XVII)



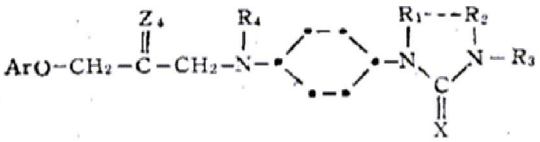
(XVIII)



(XIX)



(XX)



(XXI)

상기 식들에 있어서,

Ar은 (1환식 또는 임의의 부분 수소화된 2환식의) 탄소환식 또는 복소환식의 임의의 치환된 방향족기를 나타내고,

R는 수소, 알카노일 또는 아로일을나타내며,

R_1과 R_2는 서로 무관한게 수소 또는 저급알킬을 나타내거나, 또는 R_1과 R_2는 함께 취하여 2 내지 4개의 탄소원자들이 부착된 2개의 질소원자들을 분리하는 탄소원자수 2 내지 7개의 알킬렌을 나타내며;

R_3와 R_4는 서로 무관하게 수소 또는 저급알킬을 나타내며,

X는 옥소(O) 또는 티오(S)를 나타내며,

Z_1과 Z_2 중 하나는 반응성의 에스테르화된 히드록시기를 나타내고, 다른 하나는 NHR_4를 나타내며,

Y_1는 히드록시, 알카노일옥시 또는 아로일옥시를 나타내거나, Y_1과 Z_1은 함께 취하여 에폭시기를 나타내며, Z_2는 아미노기 NHR_4를 나타내며,

Z는 반응성이 에스테르화된 히드록시를 나타내며,

Y는 OR를 나타내거나, Z 및 Y는 함께 취하여 에폭시기를 형성하며,

X_1는 수소원자로 치환될 수 있는 탈리성 기를 나타내며,

Y_2는 2개의 수소원자로 치환될 수 있는 2가의 기를 나타내며,

Z_4는 기 OZ_5(Z_5는 탈리성기임)와 함께 수소원자를 나타내거나 또는 산소원자를 나타낸다.

청구항 2

제1항에 있어서, 일반식(Ⅰ)중 Ar 이 임의의 치환된〔페닐, 피리딜, 나프틸,테트라히드로나프틸, 3,4-디히드로-1(2H)-나프탈레논, 3,4-디히드로-2(1H)-퀴놀른, 3,4-디히드로-1(2H)-이소퀴놀론, 인돌릴 또는 1,2,5-티아디아졸릴을 나타내고, 다른 부호들은 제1항에서 정의한 바와 같은 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 3

제1항에 있어서, 일반식(Ⅰ)중 Ar 이 1-나프틸, 1(2H)-옥소-3,4-디히드로나프트-5-일, 5,6, 7,8-테트라히드-리시-6,7-스디히드록시나프트-1-일, 4-인돌릴, 3,4-디히드로-2(1H)-퀴놀론-5-일, 3-시아노-2-피리딜, 4-(4-모르폴리닐)-1,2,5-티아디아졸-3-일을 나타내고, 다른 부호들은 제1항에서 정의한 바와 같은 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 4

제1항에 있어서, 일반식(Ⅰ)중 Ar이 페닐, 또는 저급(알킬, 알케닐, 알키닐,알카노일, 모노-또는 디-

알킬아미노, 알카노일아미노, 알킬설포닐아미노, 알콕시카보닐, 알킬술파모일, 알킬카바모일, 알콕시, 알킬티오, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 알케닐옥시 및 알키닐옥시), 히드록시, 시아노, 할로, 피롤릴, 아미노, 5 내지 7원(알킬렌, 옥사알킬렌, 티아알킬렌) 이미노, 벤질옥시, 페닐 5 내지 7원 시클로알킬, 카바모일, 술파모일, 및 3 내지 7월 시클로알킬-, 페닐-, 히드록시-, 저급알콕시, 저급알콕시카보닐아미노-, 저급알킬티오-저급알킬설피닐-저급알킬설포닐-및 카바모일-치환된(저급알킬 및 저급알콕시)로 이루어지는 그룹에서 선택되는 1 내지 3개로 치환된 페닐을 나타내고, R은 수소, 저급알카노일 또는 아로일을 나타내며, R_1과 R_2는 수소 또는 저급알킬을 나타내거나, 또는 R_1과 R_2는 함께 취하여 탄소원자수 2 내지 5개의 알킬렌을 나타내며, R_3와 R_4는 수소 또는 저급알킬을 나타내며, X는 0 또는 S를 나타내는 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 5

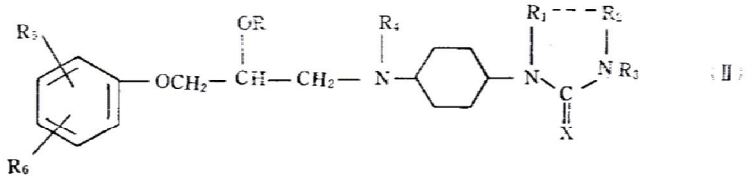
제1항에 있어서, 일반식(Ⅰ)중 Ar이 제2항에서 정의한 바와 같고, R이 수소를 나타내며, R_1과 R_2가 함께 취하여 5-, 6- 또는 7-원 환을 형성하기 위한 탄소원자수 2 내지 4개의 알킬렌을 나타내며, R_3와 R_4가 수소 또는 저급알킬을 나타내며, X가 0 또는 S를 나타내는 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 6

제1항에 있어서, 일반식(Ⅰ)중 Ar 이 제4항에서 정의한 바와 같고, 다른 부호들은 제5항에서 정의한바와 같은 화합물 및 그의 염의 제조방법.

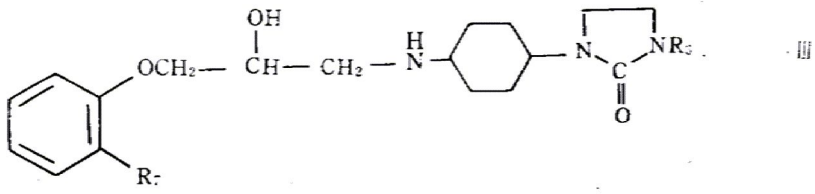
청구항 7

제1항에 있어서, 하기 일반식(Ⅱ)중 R이 수소 또는 저급알카노일을 나타내고, R_1과 R_2가 수소를 나타내거나, 또는 R_1과 R_2가 함께 취하여 탄소원자수 2 내지 4개의 비측쇄알킬렌을 나타내며, R_3와 R_4가 서로 무관하게 수소 또는 저급알킬을 나타내며, R_5와 R_6가 각각 서로 무관하게 수소,저급(알킬, 알케닐 또는 알키닐), 저급(알콕시, 알케닐옥시 또는 알키닐옥시), 히드록시, 시아노, 할로, 아미노, 저급(모노닐), 모르폴리노, 1- 또는 2-피롤릴, 페닐, 5 내지 7월 시클로알킬, 저급알카노일, 저급알콕시카보닐, 카바모일 또는 설파모일을 나타내며, R_6가 또한 탄소원자수 3 내지 6의 시클로알킬, 페닐, 저급알콕시, 히드록시, 저급알콕시카보닐아미노, 저급알킬-(티오, 설피닐 및 설피닐) 및 카바모일로 이루어지는 그룹에서 선택되는 어느하나에 의해 치환된 저급(알킬 또는 알콕시)를 나타내며, X가 0 또는 S를 나타내는 화합물 및 그의 염의 제조방법.



청구항 8

제1항에 있어서, 하기 일반식(Ⅲ)중 R_3가 수소 또는 저급알킬을 나타내고, R_7이 시아노, 저급알콕시카보닐, 피롤릴,모르폴리노, 탄소원자수 3 내지 6개의 알케닐옥시, 탄소원자수 3 내지 6개의 알키닐옥시 또는 시클로프로필로 치환된 탄소원자수 1 내지 3개의 알콕시를 나타내는 화합물 및 그의 염의 제조방법.



청구항 9

제1항에 있어서, 제5,6,7 또는 8항중 2개의 1,4-시클로헥실렌 치환체가 시스위치에 있는 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 10

제1항에 있어서, 제8항에 도시한 일반식(Ⅱ)중 히드록시기를 갖는 탄소원자가 S-배열상에 있는 화합물 및 그의 염의 제조방법.

청구항 11

제1항에 있어서, 제8항에 도시한 일반식(Ⅲ)중 R_3가 수소를 나타내고, R_7 이아릴옥시, 프로파르길옥시 또는 시클로프로필 메톡시를 나타내는 화합물, 그의 입체이성체 또는 대장체 및 그의 염의 제조방법.

청구항 12

제1항에 있어서, 시스-1-(4-〔3-0-알릴옥시페녹시)-2-히드록시프로필아미노〕-시클로헥실)-2-

이미다졸리디논 또는 그의 염의 제조방법.

청구항 13

제1항에 있어서, 시스-1-(4-〔3-0-시클로프로필메톡시펜옥시)-2-히드록시프로필아미노〕-시클로헥실)-2-이미다졸리디논, 그의 S-대장체 또는 그의 염의 제조방법.

청구항 14

제1항에 있어서, 시스-1-(4-〔3-0-피롤릴펜옥시)-2-히드록시프로필아미노〕-시클로헥실)-2-이미다졸리디논 또는 그의 염의 제조방법.

※참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.