

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.³
C07D 499/00

(11) 공개번호 특1984-0004434

(43) 공개일자 1984년 10월 15일

(21) 출원번호 특 1983-0001450

(22) 출원일자 1983년 04월 07일

(30) 우선권주장 8210410 1982년04월08일 영국(GB)

(71) 출원인 마르미탈리아 카를로 에르바 에스. 피. 에이 지오르기오 오를란도

이탈리아공화국 24-20159 밀란 비아 시. 임보나티

(72) 발명자 마르코 알페지아니

이탈리아공화국 2-밀란 비아 톨메쑈

(74) 대리인 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 치환된 페넨유도체의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

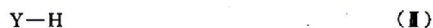
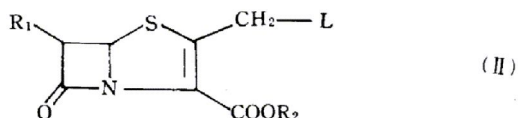
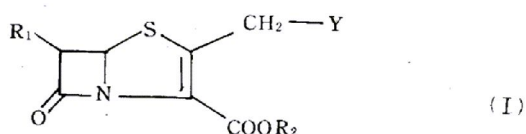
치환된 페넨유도체의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않음

(57) 청구의 범위

청구항 1

다음 일반식(II)의 화합물을 다음 일반식(III)의 화합물, 또는 그의 염 또는 이들의 반응성 유도체와 반응시키고, 경우에 따라 생성된 일반식(I)의 화합물을 일반식(I)의 다른 화합물로 전환시키며, 또는 경우에 따라 일반식(I)의 유리 화합물을 그의 염으로 전환시키거나, 경우에 따라 그의 염으로부터 일반식(I)의 유리 화합물을 생성시키며, 또는 경우에 따라 일반식(I)의 이성체의 혼합물을 단일 이성체로 분리시킴을 특징으로 하여, 다음 일반식(I)의 화합물 및 그의 약제학적으로 또는 수의과학적으로 무독한 염을 제조하는 방법.



상기식에서,

R₁은 수소 또는 유기 그룹이며;

R₂는 수소 또는 카복시 보호 그룹이고;

Y는 a) 그룹-S-Het [여기에서, Het는 O, S 및 N중에서 선택된 적어도 하나의 헤테로원자를 함유하는 임의 치환된 포화 또는 불포화헤테로사이클릭환이다];

b) 포르밀옥시 또는 C_2 내지 C_6 카복실릭-아실옥시 그룹 [여기에서, 아실 그룹은 비치환되거나 할로겐 C_2 내지 C_6 카복실릭-아실, 아미노, 하이드록시 또는 머캅토로 치환될 수 있으며, 여기에서 아미노, 하이드

록시 및 머캅토 그룹은 임의로 보호된 형태일 수 있다];

c) 할로겐, 포르밀, C_2 내지 C_6 아실, 아미노, 하이드록시 및 머캅토 [여기에서, 아미노, 하이드록시 및 머캅토 그룹은 임의로 보호된 형태일 수 있다.] 중에서 선택된 하나 또는 그 이상의 치환체로 임의 치환된 C_1 내지 C_{12} -알콕시 또는 C_1 내지 C_{12} 알킬티오 그룹;

d) 임의 치환된 피리딜 그룹; 또는

e) 아지도이며;

L은 염소, 브롬 또는 유리 또는 활성 하이드록시 그룹이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 일반식(II) 화합물중의 활성하이드록시 그룹 L이 반응성 에스테르 또는 반응성 복합체 또는 반응성 아세탈의 형태로 활성화된 하이드록시 그룹인 방법.

청구항 3

제2항에 있어서, 반응성 에스테르가 설폰산 또는 인산 또는 카복실산과의 에스테르인 방법.

청구항 4

제2항에 있어서, 반응성 복합체가 3가 인의 도도체와 아조디카복실산의 C_1 내지 C_6 알킬 에스테르로 이루어진 복합체인 방법.

청구항 5

제2항에 있어서, 반응성 아세탈이 L이 하이드록시인 일반식(II)의 화합물과 네오펜틸 알콜 및 디메틸포름아미드 사이의 혼합 아세탈인 방법.

청구항 6

제1항에 있어서, 일반식(III) 화합물의 반응성 유도체가 Y가 그룹 -S-Hes인 일반식(III) 화합물 중의 하나이며, 그의 디설파이드 Het-S-S-Het와 3가 인의 아릴 또는 C_1 내지 C_6 알킬 유도체 사이의 복합체인 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, 일반식(III) 화합물의 반응성 유도체가 Y가 가포르밀옥시 또는 카복실릭- C_2 내지 C_6 아실 옥시인 일반식(III) 화합물 중의 하나이며, 할라이드 또는 상응하는 카복실산의 무수물 또는 혼합 무수물인 방법.

청구항 8

제1항에 있어서, L이 염소 또는 브롬, 또는 설폰산이나 인산과의 반응성 에스테르 형태로 활성화된 하이드록시 그룹인 일반식(II)의 화합물을 일반식(III)의 화합물 또는 그의 염과 반응시킴을 특징으로 하여 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, L이 카복실산과의 반응성 에스테르 형태로, 또는 반응성 복합체의 형태로, 또는 반응성 아세탈의 형태로 활성화된 하이드록시 그룹인 일반식(II)의 화합물을 Y가 -S-Het 또는 C_1 내지 C_{12} 알킬티오인 일반식(III)의 화합물 또는 그의 염과 반응시킴을 특징으로 하여, Y가 제1항에서 정의한 바와 같은 그룹-S-Het 또는 C_1 내지 C_{12} 알킬티오그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.

청구항 10

제1항에 있어서, L이 유리 하이드록시 그룹인 일반식(II)의 화합물을 Y가 -S-Het인 일반식(III)화합물의 반응성 유도체와 반응시킴을 특징으로 하여, Y가 그룹 -S-Het인 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.

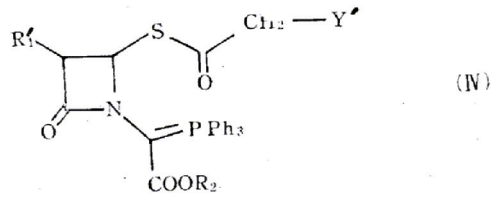
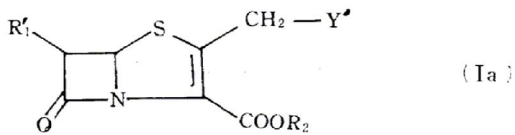
청구항 11

제1항에 있어서, L이 유리 하이드록시 그룹인 일반식(II)의 화합물을 Y가 포르밀 옥시 또는 카복실릭 C_2 내지 C_6 아실옥시 그룹인 일반식(III) 화합물의 반응성 유도체와 반응시킴을 특징으로 하여, Y가 포르밀옥시 또는 카복실릭- C_2 내지 C_6 아실옥시 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.

청구항 12

다음 일반식(IV)의 화합물을 폐환시키고, 경우에 따라 생성된 일반식(Ia)의 화합물을 일반식(Ia)의 다른 화합물로 전환시키며, 또는 경우에 따라 일반식(Ia)의 유리 화합물을 그의 염으로 전환시키거나 그의 염으로부터 일반식(Ia)의 유리 화합물을 생성시키고, 또는 경우에 따라 일반식(Ia)의 이성체의 혼합물을 단일 이성체로 분리시킴을 특징으로 하여, 다음 일반식(Ia)의 화합물 및 그의 약제학적으로 또

는 수의과적으로 무독한 염을 제조하는 방법.



상기식에서,

R₁'는 유리 또는 보호된 하이드록시에 의해 치환된 C₁ 내지 C₆ 알킬 그룹이며;

R₂는 수소 또는 카복시 보호 그룹이고;

Y'는 1)의 임의 치환된 피리딜 그룹; 또는,

2) 그룹 -S-alk-NH₂ [여기에서, alk는 C₁ 내지 C₃ 알킬렌이다.]; 또는

3) 그룹 -S-Het'이며, 여기에서 Het'는

a) 비치환되거나(a') C₂ 내지 C₆ 알킬, (6') 임의로 형성된 카복시 그룹에 의해 치환된 C₁ 내지 C₃ 알

킬, (c') 임의로 염형성된 카복시메틸티오 그룹 및 (d') 그룹 $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}'' \end{array}$ [여기에서, R' 및 R''는 각
각 독립적으로 수소 또는 C₁ 내지 C₃ 알킬이다.] 중에서 선택된 치환체로 치환된 1,3,4-티아디아졸릴;

b) C₁ 내지 C₆ 알킬 그룹으로 임의 치환된 1,2,3-티아디아졸릴;

c) C₁ 내지 C₆ 알킬 그룹으로 치환된 1,2,3-트리아졸릴;

d) 그룹 $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}'' \end{array}$ [여기에서, R' 및 R''는 상기 정의한 바와 같다.]로 임의 치환된 1,2,4-트리아졸릴;

e) C₁ 내지 C₆ 알킬 그룹으로 임의 치환된 1,3,4-트리아졸릴;

f) C₁ 내지 C₆ 알킬 그룹으로 임의 치환된 이미다졸릴;

g) (a') $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}'' \end{array}$ [여기에서, R' 및 R''는 상기 정의한 바와 같다.], (b') 비치환된 C₁ 내지 C₆ 알킬
및 (c') 임의로 염형성된 카복시 그룹으로 치환된 C₁ 내지 C₃-알킬 중에서 선택된 하나 또는 그 이상의
치환체로 임의 치환된 티아졸릴;

h) (a') 비치환된 C₁ 내지 C₆ 알킬, 또는 (b')(i) 임의로 염형성된 카복시, (ii) 임의로 염형성된 설포

또는 설포아미노, (iii) 시아노, (iv) 카바모일, (v) $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}'' \end{array}$ [여기에서, R' 및 R''는 상기 정의한 바
와 같다.] 및 (vi) 테트라졸릴 중에서 선택된 치환체에 의한 치환된 C₁ 내지 C₃-알킬로 치환된 테트라졸
릴;

i) C₁ 내지 C₆ 알킬 또는 C₁ 내지 C₆ 알콕시 그룹으로 치환된 피라지닐;

1) C₁ 내지 C₃ 알킬 그룹으로 임의 치환된 5-옥소-6-하이드록시-2,6-디하이드로-1,2,4-트리아지닐 및 5-
옥소-6-하이드록시-4,5-디하이드로-1,2,4-트리아지닐; 또는

m) (a') 임의로 염형성된 카복시 그룹 또는 (b') 그룹 $\begin{array}{c} \text{R}' \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}'' \end{array}$ [여기에서, R'' 및 R'는 상기 정의한
바와 같다.]로 임의 치환된 테트라졸로-피리다지닐이고;

단, Y'가 그룹 -S-Het' [여기에서, Het'는 1위치에서 C₁ 내지 C₁ 알킬로 치환된 1,2,3,4-테트라졸-5-
일이다] 이면, R₁'는 α-하이드록시-이소프로필이 아니며;

ph는 페닐이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.