

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.³

C07D 321/10

(11) 공개번호 특 1984-0005729

(43) 공개일자 1984년 11월 16일

(21) 출원번호 특 1983-0003853
(22) 출원일자 1983년 08월 18일

(30) 우선권주장 410155 1982년 08월 20일 미국(US)
(71) 출원인 퀄스트-러셀파마슈티칼 인코포레이티드 마크 이. 가로트
미합중국 뉴저지 08876 소머빌 루트 202-206 노스
(72) 발명자 레이몬드 더블. 코슬리, 쥬니어
미합중국 뉴저지 08876 브리지워터 세덜 브룩로드 659
(74) 대리인 이병호, 김성기

심사청구 : 없음**(54) 스피로 [2H-1, 4-벤조디옥세핀-3(5H)4'-피페리딘 및 3'-피롤리디노] 화합물의 제조방법****요약**

내용 없음

대표도**도 1****명세서**

[발명의 명칭]

스피로 [2H-1, 4-벤조디옥세핀-3(5H)4'-피페리딘 및 3'-피롤리디노] 화합물의 제조방법

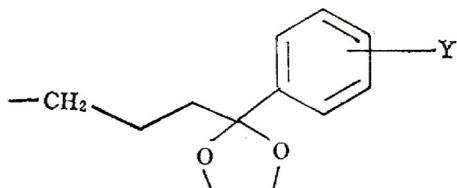
[도면의 간단한 설명]

제1도는 및 제2도는 본 발명 화합물의 합성 개요도.

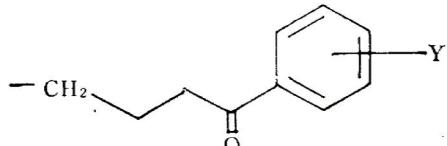
본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위**청구항 1**

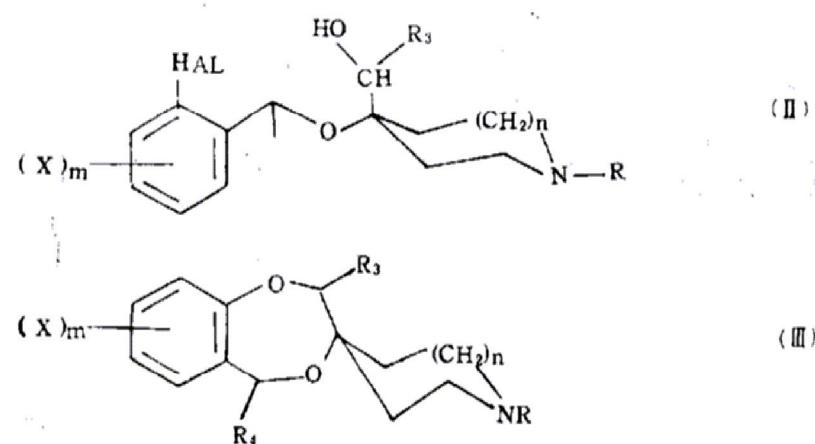
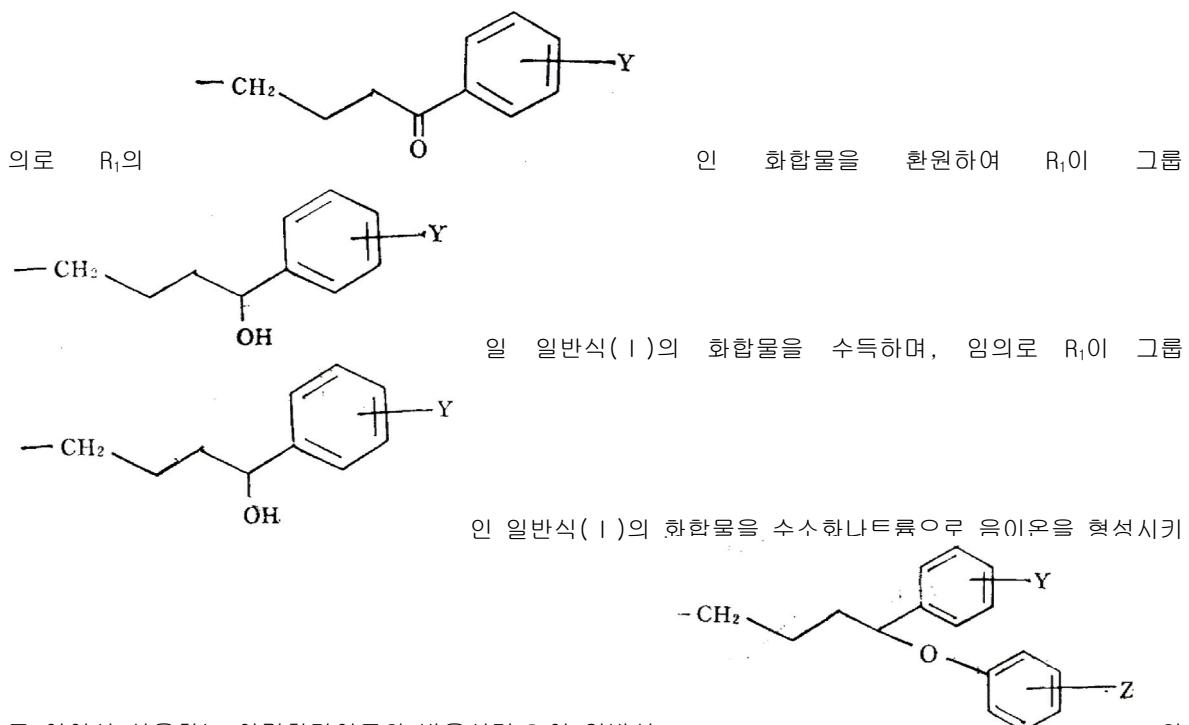
다음 일반식(II)의 화합물을 실온내지 환경온도에서 염기 및 용매 존재하에 폐환시켜 다음 일반식(III)의 화합물을 수득하고, 임의로 R₁이 메틸 또는 벤질인 일반식(III)의 화합물을 알킬 클로로포르메이트 와 반응시키고 이어서 염기로 가수분해시켜 R₁이 수소인 일반식(III)의 화합물로 전환시키거나, 또는 촉매적 수소화로 일반식(III)의 화합물에서 벤질그룹을 제거하거나, 또는 R₁이 아실인 일반식(III)화합물을 임의로 가수분해시켜, R₁이 수소인 일반식(III)의 화합물을 수득하며, 피페리딘 질소를 치환된 알킬-, 알케닐- 또는 알키닐 할라이드 또는 설포네이트 에스테러로 알킬화시켜 치환체 R₁을 R₁이 수소인 일반식(III)의 화합

물에 도임하고, 임의로 R₁이 그룹

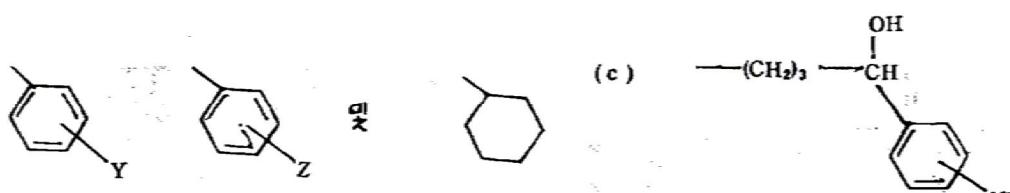
인 일반식(I)의 화합물을

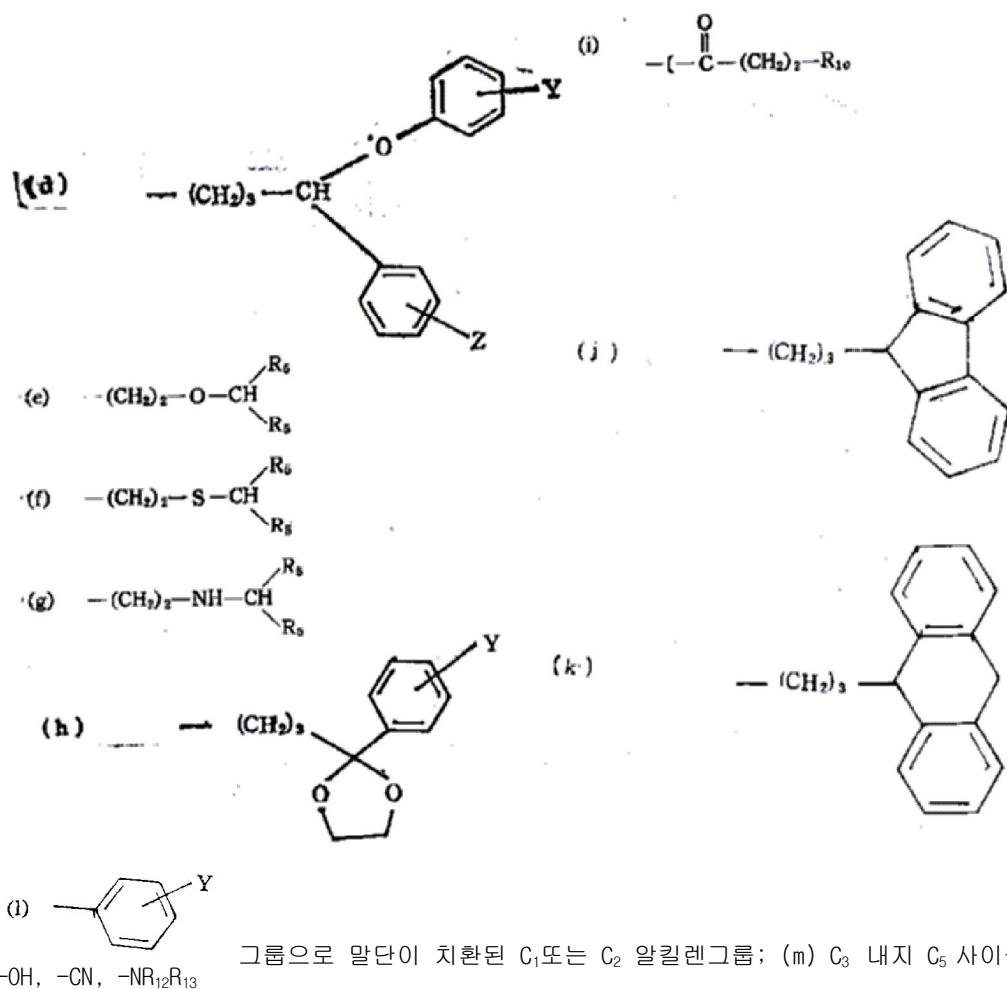
가수분해하여 R₁이 그룹

인 일반식(I)화합물을 생성하고, 임

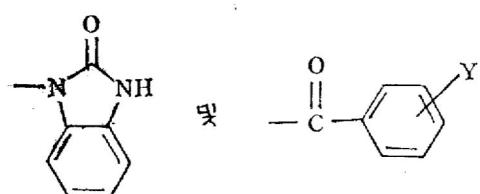
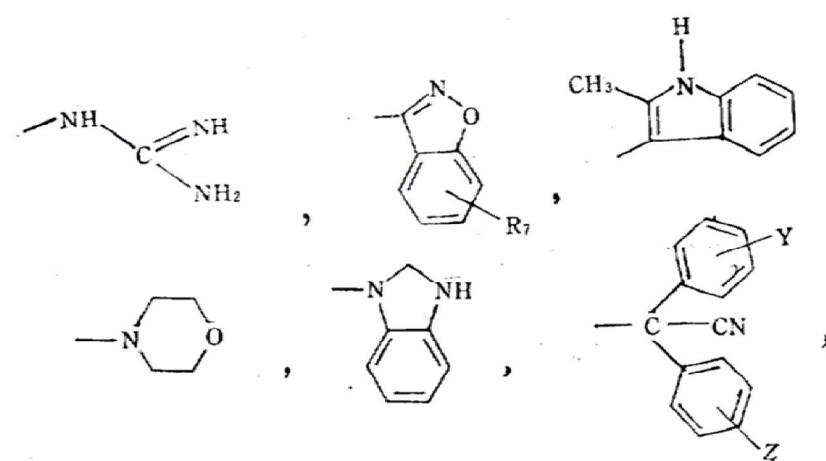


상기식에서, m 은 0, 1 또는 2이고; n 은 0 또는 1이고; R_1 은 (a) C_1-C_5 측쇄 또는 직쇄알킬그룹; (b) 말단이 치환된 C_1-C_5 측쇄 또는 직쇄 알케닐그룹 또는 말단이 치환된 C_4 알키닐그룹(여기에서 말단 치환체는 다음 그룹에서 독립적으로 선택한 일 또는 이치환체이다.)

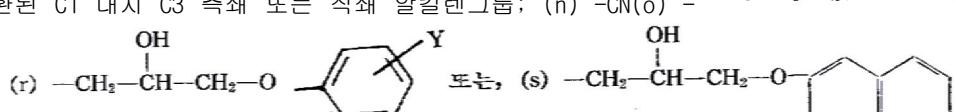




그룹으로 말단이 치환된 C₁ 또는 C₂ 알킬렌그룹; (m) C₃ 내지 C₅ 사이클릭알킬 그룹,
 $-\text{OH}$, $-\text{CN}$, $-\text{NR}_{12}\text{R}_{13}$

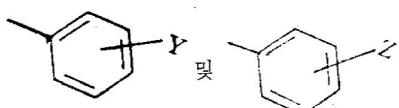


으로 구성된 그룹에서 선택한 하나의 치환체로 말단이 치환된 C₁ 내지 C₃ 측쇄 또는 직쇄 알킬렌그룹; (n) $-\text{CN}(o)$ - $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$; (p) $-\text{CNR}_{12}\text{R}_{13}$ (q) $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}_8$;



경우 수소이거나, n=1인 경우 C₁-C₃ 직쇄 알킬그룹이고; R₅ 치환제는 각각 독립적으로 다음 그룹에서

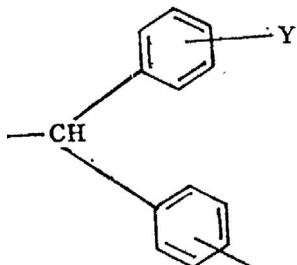
선택하여;



X는 Cl, F, Br, I, -NO₂, CF₃, -NR₆R₇, C₁-C₆ 측쇄



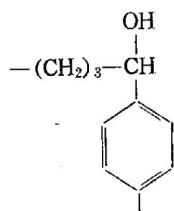
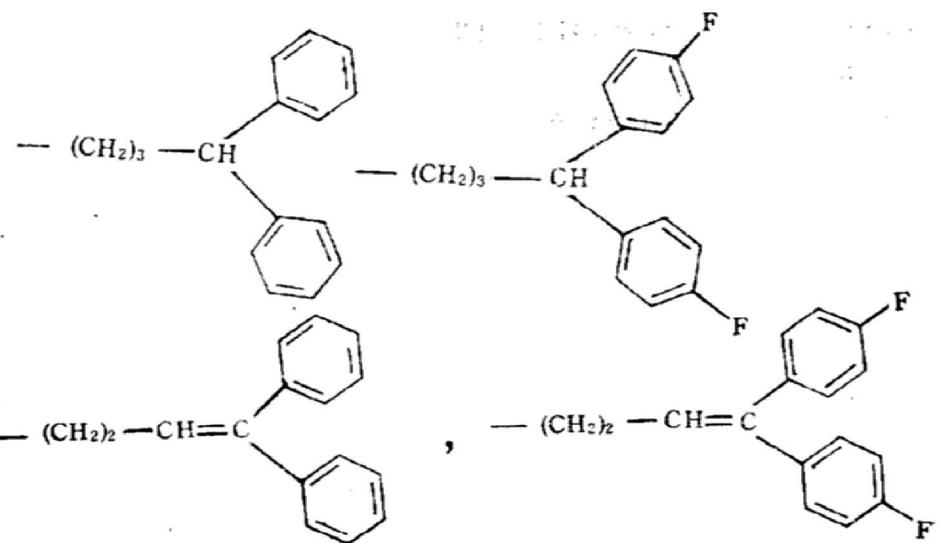
또는 직쇄알킬, -CN, -O-R₆, -SR₇, SO₃R₇, -NHCO-R₈, -SO₂R₉ 또는 -SOR₉ [여기에서 R₆는 수소 또는 C₁-C₆ 직쇄 알킬그룹이고; R₇은 수소 또는 C₁-C₆ 직쇄 알킬그룹이며; R₈은 C₁-C₆ 직쇄 또는 측쇄알킬그룹이고; R₉는 C₁-C₆ 직쇄 알킬그룹이다.] 이고, 이때 m=2인 경우 X-치환체는 단지 동일하며, X는 Cl, F, Br, I, C₁-C₆ 측쇄 또는 직쇄알킬 또는 -O-R₆그룹에서 선택하며; Y 및 Z는 동일하거나 상이하며, 독립적으로 h, Cl, F, Br, I, -NO₂, CF₃, C₁-C₄ 직쇄 알킬, C₁-C₄ 직쇄알킬을 함유한 알콕시, 아실 또는 는



NH₂ 이고; R₁₀은 NH₂ 이며; R₁₂ 및 R₁₃은 동일하거나 상이하며, 독립적으로 수소, 메틸 및 에틸그룹에서 선택하고; HAL은 염소 또는 불소이며; R은 수소, 메틸, 아실 또는 벤질이다.

청구항 2

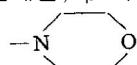
제1항에 있어서, R₂ 및 R₄가 수소이고, n이 10이고, m이 10이고, R₁이 다음식인 일반식(I)화합물의 제조방법.



또는

청구항 3

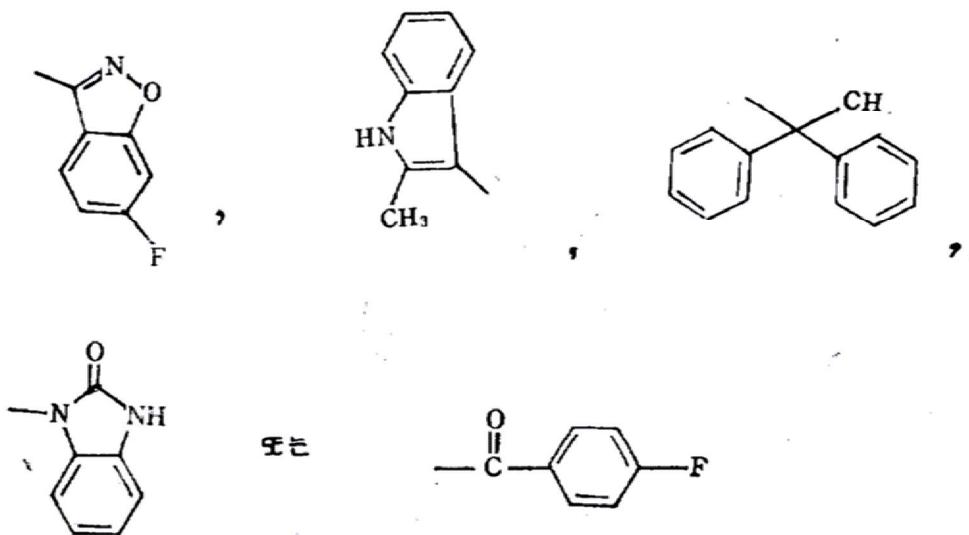
제1항에 있어서, R₄가 수소이고, n이 1이며, m은 10이고, R₁은 펜틸, 페닐에틸, 시아노메틸, 시아노에틸, 하이드록시에틸, 아미노에틸, 아미노프로필, 사이클로프로필케틸, p-니트로페닐에틸, p-아미노페닐



에틸 또는 2-N, N-디메틸아미노에틸그룹 또는, 구아니디노 또는

0으로 만단이 치환된 에틸

렌 그룹 또는 다음식의 그룹으로 말단이 치환된 직쇄 프로필렌그룹; 또는 $-\text{CN}$, 또는 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NHCH}_3$ 또는 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_3$ 이며, R_3 는 H 또는 $-\text{CH}_3$ 이고; X 는 H , Cl , F 또는 Br 인 일반식(I)의 화합물 및 그의 약제학적으로 허용되는 염의 제조방법.



※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면

도면 1

