

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C07D 321/10

(11) 공개번호 특1984-0005729  
(43) 공개일자 1984년11월16일

(21) 출원번호	특1983-0003853
(22) 출원일자	1983년08월18일
(30) 우선권주장	410155 1982년08월20일 미국(US)
(71) 출원인	헥스트-러셀파마슈티칼 인코포레이티드 마크 이. 가로트
(72) 발명자	미합중국 뉴저지 08876 소머빌 루트 202-206 노스 레이몬드 더블. 코슬리, 주니어
(74) 대리인	미합중국 뉴저지 08876 브리지워터 세덜 브룩로드 659 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

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

요약

내용 없음

대표도

도1

명세서

[발명의 명칭]

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

[도면의 간단한 설명]

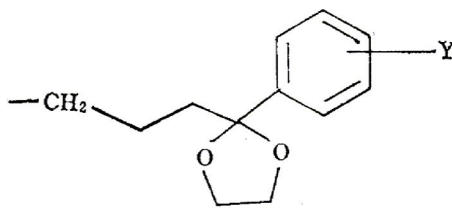
제1도는 및 제2도는 본 발명 화합물의 합성 개요도.

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

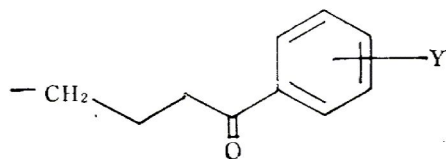
청구항 1

다음 일반식(II)의 화합물을 실온내지 환류온도에서 염기 및 용매 존재하에 폐환시켜 다음 일반식(III)의 화합물을 수득하고, 임의로 R<sub>0</sub>이 메틸 또는 벤질인 일반식(III)의 화합물을 알킬 클로로포르메이트와 반응시키고 이어서 염기로 가수분해시켜 R<sub>0</sub>이 수소인 일반식(III)의 화합물로 전환시키거나, 또는 촉매적 수소화로 일반식(III)의 화합물에서 벤질그룹을 제거하거나, 또는 R<sub>0</sub>이 아실인 일반식(III)화합물을 임의로 가수분해시켜, R<sub>0</sub>이 수소인 일반식(III)의 화합물을 수득하며, 피페리딘 질소를 치환된 알킬-, 알케닐- 또는 알키닐 할라이드 또는 설포네이트 에스테르로 알킬화시켜 치환체 R<sub>1</sub>을 R<sub>0</sub>이 수소인 일반식(III)의 화합



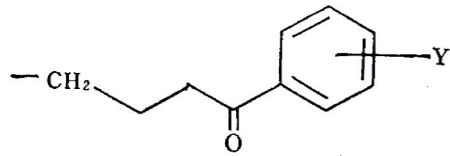
물에 도입하고, 임의로 R<sub>1</sub>이 그룹

인 일반식(I)의 화합물을



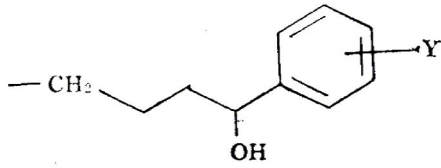
가수분해하여 R<sub>1</sub>이 그룹

인 일반식(I)화합물을 생성하고, 임

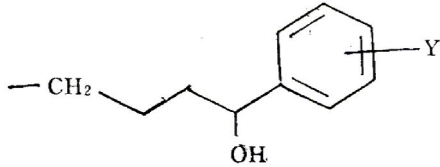


의로  $R_1$ 의

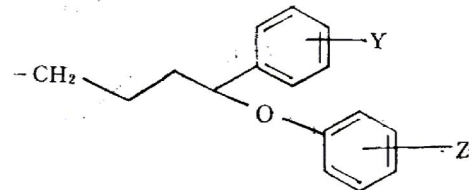
인 화합물을 환원하여  $R_1$ 이 그룹



일 일반식 (I)의 화합물을 수득하며, 임의로  $R_1$ 이 그룹



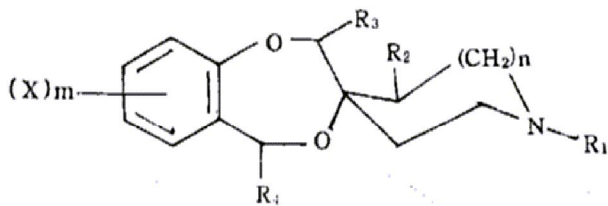
인 일반식 (I)의 화합물을 수소화나트륨으로 음이온을 형성시키



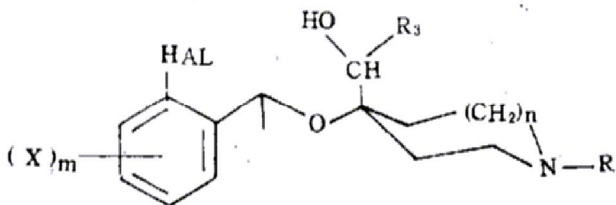
고 이어서 상응하는 아릴할라이드와 반응시켜  $R_1$ 이 일반식

의

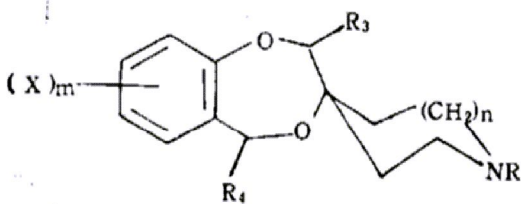
치환체를 함유하는 에테르인 일반식 (I)의 화합물로 전환시키고 그의 약제학적으로 허용되는 염을 제조함을 특징으로 하여 다음 일반식 (I) 및 그의 약제학적으로 허용되는 염, 그의 광학적 및 기하학적 이성체의 제조방법.



(I)

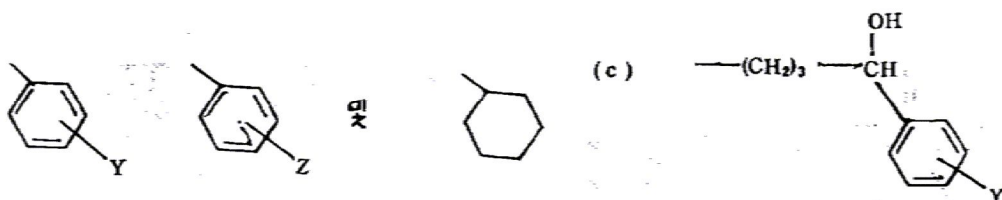


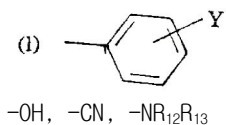
(II)



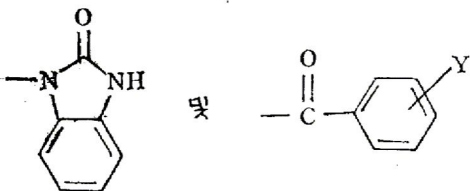
(III)

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



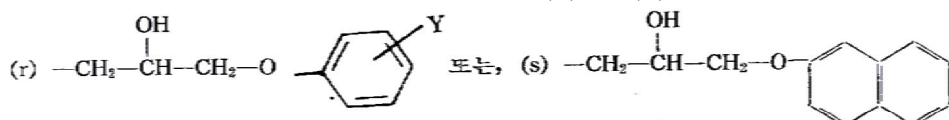


그룹으로 말단이 치환된 C<sub>1</sub> 또는 C<sub>2</sub> 알킬렌그룹; (m) C<sub>3</sub> 내지 C<sub>5</sub> 사이클릭알킬 그룹,



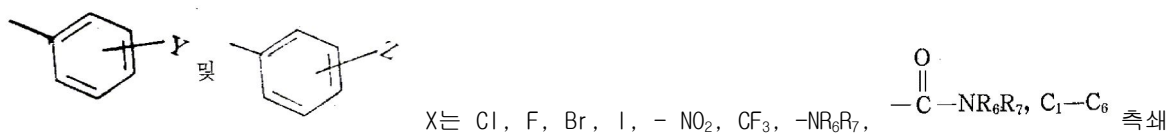
으로 구성된 그룹에서 선택한 하나의 치환체로 말다이 치

환된 C1 내지 C3 측쇄 또는 직쇄 알킬렌그룹; (n)  $-\text{CN}(\text{o})-$   $-\text{C}(\text{NH})=\text{COR}_8$ ; (p)  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{12}\text{R}_{13}$ ; (q)  $-\text{C}(\text{O})-\text{R}_8$ ;

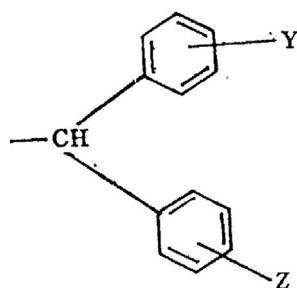



경우 수소이거나,  $n=1$  인 경우  $C_1-C_3$  직쇄 알킬그룹이고 ;  $R_5$  치환제는 각각 독립적으로 다음 그룹에서

선택하며;



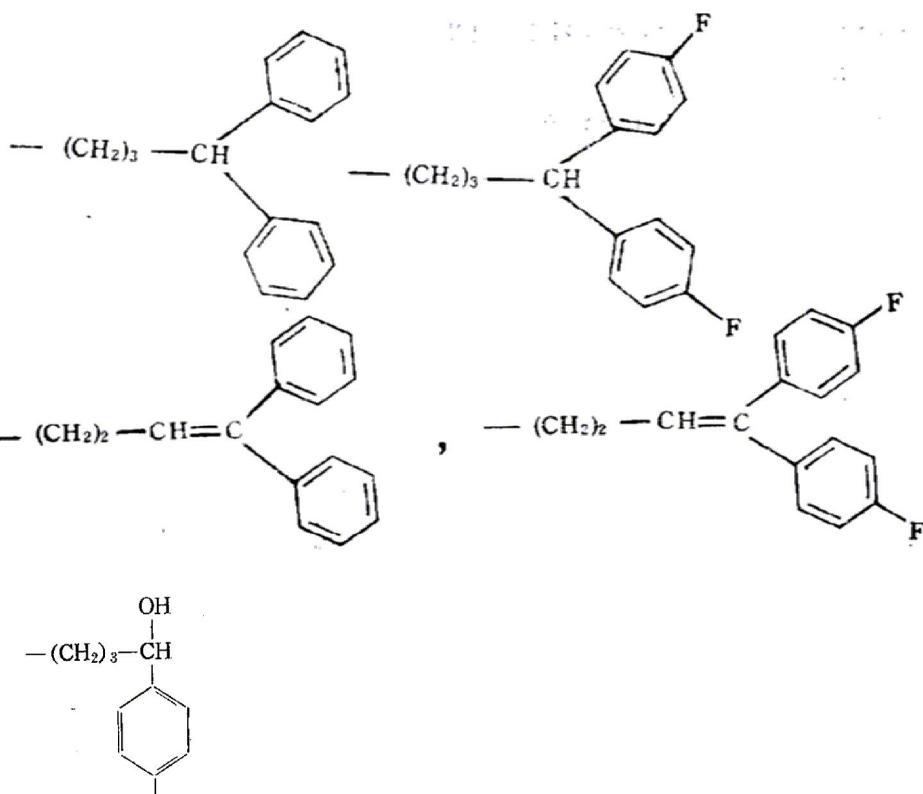
또는 직쇄알킬, -CN, -O-R<sub>6</sub>, -SR<sub>7</sub>, SO<sub>3</sub>R<sub>7</sub>,  $\text{--}\overset{\text{O}}{\underset{\text{||}}{\text{C}}}\text{--R}_8$ , -NHCO-R<sub>8</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sub>9</sub> 또는 -SOR<sub>9</sub> [여기에서 R<sub>6</sub>는 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 직쇄 알킬그룹이고; R<sub>7</sub>은 수소 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 직쇄 알킬그룹이며; R<sub>8</sub>은 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 직쇄 또는 측쇄알킬 그룹이고; R<sub>9</sub>는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 직쇄 알킬그룹이다.] 이고, 이때 m=2인 경우 X-치환체는 단지 동일하며, X는 Cl, F, Br, I, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 측쇄 또는 직쇄알킬 또는 -OR<sub>6</sub>그룹에서 선택하며; Y 및 Z는 동일하거나 상이하며, 독립적으로 h, Cl, F, Br, I, -NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 직쇄 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 직쇄알킬을 함유한 알콕시, 아실 또는 는



NH<sub>2</sub> 이고 ; R<sub>10</sub> 은  이며; R<sub>12</sub> 및 R<sub>13</sub> 은 동일하거나 상이하며, 독립적으로 수소, 메틸 및 에틸그룹에서 선택하고; HAL은 염소 또는 불소이며; R은 수소, 메틸, 아실 또는 벤질이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서, R<sub>2</sub> 및 R<sub>4</sub>가 수소이고, n이 1이고, m이 1이고, R<sub>1</sub>이 다음식인 일반식(1) 화합물의 제조 방법.



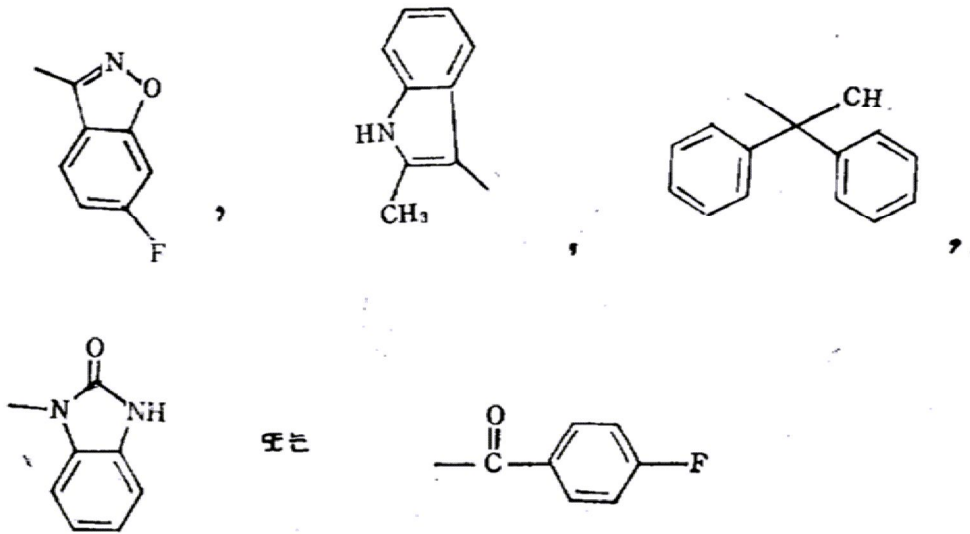
또는

## 청구항 3

제1항에 있어서, R<sub>4</sub>가 수소이고, n이 1이며, m은 1이고, R<sub>1</sub>은 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 -CN, 또는  $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NHCH}_3 \end{array}$  또는  $\begin{array}{c} \text{NH} \\ | \\ -\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$ 이며, R<sub>3</sub>는 H 또는 -CH<sub>3</sub>이고; X는 H, Cl, F 또는 Br인 일반식(1)의 화합물 및 그의 약제학적으로 허용되는 염의 제조방법.



※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면

도면1

