

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁶ C07D 257/04	(11) 공개번호 특 1997-0015580
	(43) 공개일자 1997년 04월 28일
(21) 출원번호	특 1996-0040612
(22) 출원일자	1996년 09월 18일
(30) 우선권주장	P19533975.4 1995년 09월 14일 독일(DE) 19535242.4 1995년 09월 22일 독일(DE)
(71) 출원인	메르크 파텐트 게젤샤프트 미트 베슈랭크터 하프퉁 크리스찬 플뢰미히 독일연방공화국 다름스타트 64293 프랑크푸르터 스트라세 250바이엘 악티엔 게젤샤프트 권터 슈마허, 크누트 샤우에르테
(72) 발명자	독일연방공화국 데-51368 레버쿠젠 요나스 로커스 독일연방공화국 다름스타트 64271 프랑크푸르터 스트라세 250, 메르크 카게 아아사내 볼프 마이클 독일연방공화국 다름스타트 64271 프랑크푸르터 스트라세 250, 메르크 카게 아아사내 바이에르 노르베르트 독일연방공화국 다름스타트 64271 프랑크푸르터 스트라세 250, 메르크 카게 아아사내 란쯔쉬 라인하르트 독일연방공화국 42115 부퍼탈 암 부쉬호이셴 51 스텔쨌 우베 독일연방공화국 51399 부르사이트 아돌프-콜핑-스트라세 22 아 카제르 칼 독일연방공화국 13585 베를린 아헨바흐스트라세 5
(74) 대리인	송재련, 한규환, 최규팔, 김석중

심사청구 : 없음

(54) 1- 아릴-4- 카바모일- 테트라졸리논의 제조방법

요약

본 발명은 하기 화학식 (2)의 1-아릴-테트라졸리논을 0°C 내지 150°C의 온도에서 희석제의 존재하에 포스겐(COCl₂)과 반응시키고('제1단계'), 생성된 하기 화학식 (3)의 (신규한) 1-아릴-4-클로로카보닐-테트라졸리논을 -20°C 내지 100°C의 온도에서 희석제의 존재하, 및 필요에 따라 추가의 염기성 화합물의 존재하에 화학식 (4)의 아민과 반응시킴으로써 하기 화학식 (1)의 제조활성 1-아릴-4-카바모일-테트라졸리논을 매우 우수한 수율과 고순도로 수득하는 방법에 관한 것이다 ;

상기 식에서, Ar은 임의로 치환된 아릴을 나타내며, R¹은 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알킬닐 또는 알콕시를 나타내고, R²는 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알킬닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬, 알릴, 아릴 또는 아릴알킬을 나타내거나, R¹과 함께 알칸디일을 나타낸다.

명세서

[발명의 명칭]

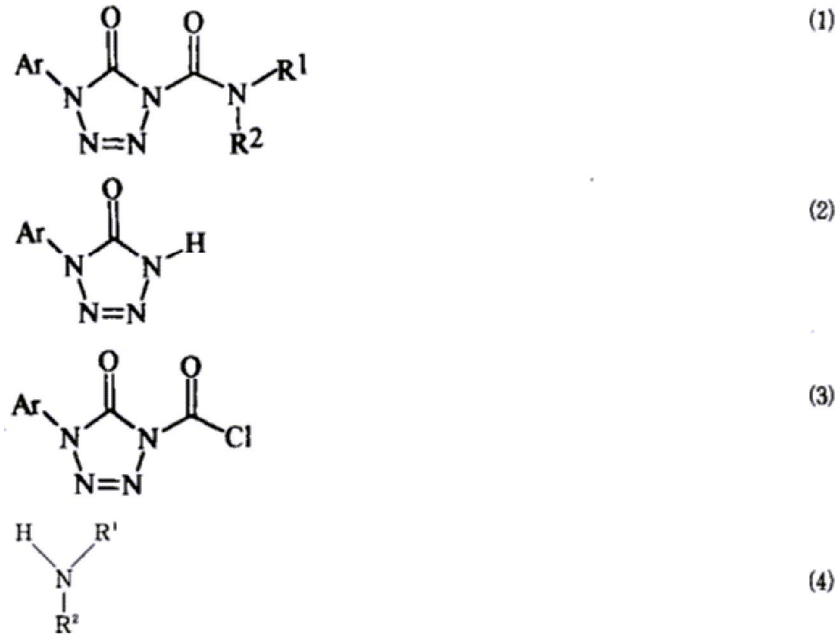
1-아릴-4-카바모일-테트라졸리논의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 화학식 (2)의 1-아릴-테트라졸리논을 0°C 내지 150°C의 온도에서 희석제의 존재하에 포스겐과 반응시키고 ('제1단계'), 생성된 하기 화학식 (3)의 1-아릴-4-클로로카보닐-테트라졸리논을, 필요에 따라 중간체의 분리과정을 거치지 않거나 거친 후에, -20°C 내지 100°C의 온도에서 희석제의 존재하, 및 필요에 따라 추가의 염기성 화합물의 존재하에 화학식 (4)의 아민과 반응시킴을 특징으로 하여 하기 화학식 (1)의 1-아릴-4-카바모일-테트라졸리논을 제조하는 방법;



상기 식에서, Ar은 임의로 치환된 아릴을 나타내며, R¹은 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알킬닐 또는 알콕시를 나타내고, R²는 각 경우에 임의로 치환된 알킬, 알케닐, 알킬닐, 사이클로알킬, 사이클로알킬, 알릴, 아릴 또는 아릴알킬을 나타내거나, R¹과 함께 알칸디일을 나타낸다.

청구항 2

제1항에 있어서, 화학식 (1), (2) 및 (3)의 화합물 각각에서 Ar은 카복실, 시아노, 카보모일, 니트로, 아미노, 하이드록실 또는 할로겐에 의해, 또는 C₁-C₄ 알콕시, C₁-C₄ 알킬티오, C₁-C₄ 알킬설피닐, C₁-C₄ 알킬설포닐, 디-(C₁-C₄ 알킬)아미노, C₁-C₄ 알킬설포닐아미노, 디-(C₁-C₄ 알킬)아미노설포닐, C₁-C₄ 알킬-카보닐, C₁-C₄ 알킬-카보닐아미노, C₁-C₄ 알콕시-카보닐, 디-(C₁-C₄ 알킬아미노)-카보닐, C₁-C₄ 알킬렌디옥시, 페닐 또는 페녹시(이들은 각 경우에 불소 및/또는 염소에 의해 임의로 치환된다)에 의해 임의로 치환된 페닐 또는 나프틸을 나타내고, 화학식 (1) 및 (4)의 화합물 각각에서 R¹은 각각 1 내지 6개의 탄소원자를 가지며, 각 경우에 시아노 또는 할로겐에 의해 임의로 치환된 알킬, 알케닐 또는 알킬닐을 나타내고, R²는 1 내지 6개의 탄소원자를 가지며 시아노 또는 할로겐에 의해 임의로 치환된 알킬을 나타내거나, 각각 2 내지 6개의 탄소원자를 가지며 각 경우에 시아노 또는 할로겐에 의해 임의로 치환된 알케닐 또는 알킬닐을 나타내거나, 각 경우에 사이클로알킬 부위에 3 내지 6개의 탄소원자 및 임의로 알킬 부위에 1 내지 2개의 탄소원자를 가지며 각 경우에 시아노, 할로겐 또는 C₁-C₄ 알킬에 의해 임의로 치환된 사이클로알킬 또는 사이클로알킬알킬을 나타내거나, 각 경우에 시아노, 니트로 또는 할로겐에 의해, 또는 C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시, C₁-C₄ 알킬티오, C₁-C₄ 알킬설피닐, C₁-C₄ 알킬설포닐, 디-(C₁-C₄ 알킬)아미노, C₁-C₄ 알킬설포닐아미노, 디-(C₁-C₄ 알킬)아미노설포닐, C₁-C₄ 알킬-카보닐 또는 C₁-C₄ 알콕시-카보닐(이들은 각 경우에 불소 및/또는 염소에 의해 임의로 치환된다)에 의해 임의로 치환된 페닐 또는 페닐-C₁-C₂ 알킬을 나타내거나, R¹과 함께 2 내지 6개의 탄소원자를 갖는 알칸디일을 나타냄을 특징으로 하는 방법.

청구항 3

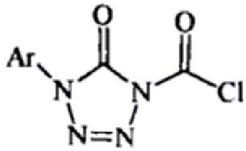
제1항에 있어서, 제1단계 공정을 50°C 내지 120°C의 온도에서 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, 제2단계 공정을 0°C 내지 80°C의 온도에서 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

하기 화학식 (3)의 1-아릴-4-클로로카보닐-테트라졸리논 ;



(3)

상기 식에서, Ar은 임의로 치환된 아릴을 나타낸다.

청구항 6

제5항 있어서, Ar이 카복실, 시아노, 카바모일, 니트로, 아미노, 하이드록실 또는 할로겐에 의해, 또는 C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시, C₁-C₄ 알킬티오, C₁-C₄-알킬설피닐, C₁-C₄ 알킬설포닐, 디-(C₁-C₂ 알킬)아미노, C₁-C₄ 알킬설포닐아미노, 디-(C₁-C₄ 알킬아미노)설포닐, C₁-C₄ 알킬-카보닐, C₁-C₄ 알킬-카보닐아미노, C₁-C₄ 알콕시-카보닐, 디-(C₁-C₄ 알킬아미노)-카보닐, C₁-C₄ 알킬렌디옥시, 페닐 또는 페녹시(이들은 각 경우에 불소 및/또는 염소에 의해 임의로 치환된다)에 의해 임의로 치환된 페닐 또는 나프틸을 나타냄을 특징으로 하는 화학식 (3)의 화합물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.