

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
C07D 471/04

(11) 공개번호 특 1995-0008511
(43) 공개일자 1995년 04월 17일

(21) 출원번호 특 1994-0023448
(22) 출원일자 1994년 09월 15일

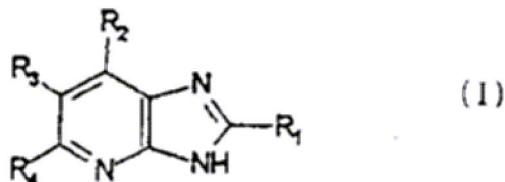
(30) 우선권주장 93-2815 1993년 09월 17일 스위스(CH)
(71) 출원인 론자 리미티드 비트 라우버, 베르너 그라우빌러
스위스연방 체하-4002 바젤
(72) 발명자 게르하르트 스툽키
스위스연방 (칸톤 발리스) 브릭 글리스 3902 쉬피탈베크 9
르네 임빙켈리트
스위스연방 (칸톤 발리스) 브릭 글리스 3902 클로스터베크 1
(74) 대리인 이준구, 박해선

심사청구 : 없음

(54) 이미다조피리딘 유도체의 제조방법

요약

본 발명은 하기 일반식(I)의 이미다조피리딘을 제조하는 신규의 방법에 관한 것이다.



(상기 식에서, 라디칼 R₁ 내지 R₄는 명세서의 정의와 같다.)

본 방법의 중요 단계는, 하기 일반식(V)의 아미딘을 하기 일반식(VI)의 1,3-디카르보닐 화합물과 고리화 반응시키는 것이다.



이미다조피리딘은 안지오텐신II 길항 물질에 제조에 중요한 중간 물질이다.

명세서

[발명의 명칭]

이미다조피리딘 유도체의 제조방법

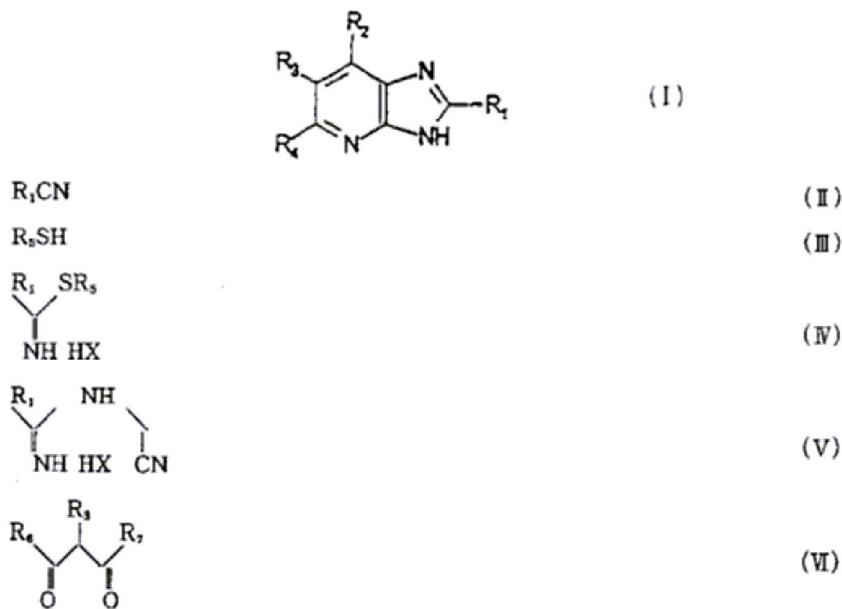
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(II)의 니트릴을 수소 할라이드의 존재하에서 하기 일반식(III)의 티올과 반응시키어 하기 일반식(IV)의 티오아미데이트 히드로할라이드를 수득하고, 이것을 아미노아세트니트릴과 반응시키어 하기 일반식(V)의 아미딘을 수득하고, 이것을 염기의 존재하에서 최종적으로 하기 일반식(VI)의 1,3-디카르보닐 화합물과 고리화 반응시키어 하기 일반식(I)의 최종 생성물을 수득하는 것을 특징으로 하는 하기 일

반식(I)의 최종 생성물을 수득하는 것을 특징으로 하는 일반식(I)의 이미다조피리딘 유도체의 제조 방법.



(상기 식들에서, R_1 은 알킬, 시클로알킬, 아릴 또는 아르알킬기이거나, 헤테로고리 라디칼이고, R_2 및 R_4 는 동일하거나 상이하고, 수소, 히드록시, 시아노, 알킬, 시클로알킬, 아릴 또는 아르알킬기이거나, 알카노일 또는 알콕시카르보닐기이고, R_3 는 수소, 알킬, 아릴 또는 아르알킬기이거나, 할로겐 원자이고, R_5 는 알킬, 아릴 또는 아르알킬이고, R_6 및 R_7 는 동일하거나 상이하고, 수소 또는 알킬, 아릴, 아르알킬, 알콕시 또는 알콕시카르보닐이고, X 는 할로겐 원자이다.)

청구항 2

제1항에 있어서, 상기 일반식(IV)의 티오이미데이트 히드로할라이드가 단리되지 않는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 3

제1항에 있어서, 상기 일반식(IV)의 티오이미데이트 히드로할라이드를 수득하기 위한 반응이 수소 클로리드 존재하에 $0^{\circ}C$ 내지 실온의 반응 온도에서 불활성 용매의 첨가 또는 비첨가로 수행되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 일반식(V)의 아미딘을 수득하기 위한 반응이 $0^{\circ}C$ 내지 각 용매의 환류 온도에서 수행되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, 고리화 반응에 사용된 염기가 무기 또는 유기 염기인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 6

제5항에 있어서, 고리화 반응에 사용된 염기가 저급 지방족 알콜 종의 알칼리 금속 알콕시드, 또는 알킬리금속 히드록시드인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 7

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, 고리화 반응이 $0^{\circ}C$ 내지 환류 온도에서 불활성 용매의 존재 또는 부재하에서 수행되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 8

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, 아미노아세토니트릴이 염기에 의하여 아미노아세토니트릴의 염으로부터 유리되는 것을 특징으로 하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

