(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[3]
C07D 295/06

(11) 공개번호 특1984-0006636
(43) 공개일자 1984년12월01일

(21) 출원번호 특1983-0004818
(22) 출원일자 1983년10월12일
(30) 우선권주장 5987/82-8호 1982년10월13일 스위스(CH)
(71) 출원인 시바-가아기 에이지 아놀드 자일리, 에른스트 알테르
스위스연방 바즐 4002 클리벡 슈트라세 141
(72) 발명자 폴 · 벤크
스위스연방 알스크윌 4123 겐렌베그 7
(74) 대리인 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 페놀 유도체의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

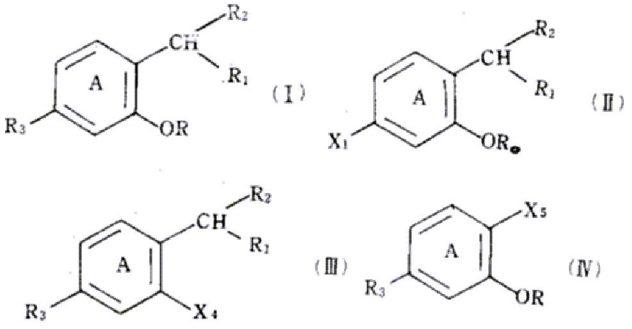
페놀 유도체의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(Ⅱ)의 화합물 또는 그의 염 또는 이성체에서 X_1을 R_3로 전환시키거나, 일반식(Ⅲ)의 화합물 또는 그의 염 또는 이성체에서 X_4를 그룹 $-OR_0$로 전환시키거나, 또는 일반식(Ⅳ) 화합물 또는 그의 염에서 X_5를 일반식 $-CH(R_2)-R_1$의 그룹으로 전환시키고, 경우에 따라 생성된 본 발명에 따르는 화합물을 본 발명에 따르는 다른 화합물로 전환시키고/시키거나, 경우에 따라 생성된 염을 본 발명에 따르는 유리화합물 또는 본 발명에 따르는 다른 염으로 전환시키고/시키거나, 경우에 따라 생성된 염형성능을 갖는 본 발명에 따르는화합물을 염으로 전환시키고/시키거나, 경우에 따라 생성된 이성체의 혼합물을 개개 이성체로 분리함을 특징으로 하여, 일반식(Ⅰ)의 페놀유도체 및 그의 염 및 이성체를 제조하는 방법.



상기 식에서,

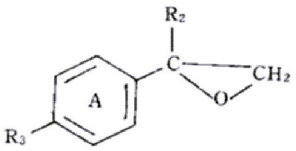
R_0는 수소 또는 아실 라디칼이고; R_1은 하이드록시메틸, 에스테르화 또는 에테르화된 하이드록시메틸, 포르밀 또는 아세탈화된 포르밀이며;R_2는 수소 또는 지방족 라디칼이고; R_3는 2개의 1가 탄화수소 라디칼 또는 한 개이상의 헤테로원자에 의해 임의 차단된 한 개의 2가 탄화수소 라디칼로 이치환된 아미노 그룹이며; 방향족환 A는 추가로 치환될 수 있으며; X_1은 R_3로 전환될 수 있는 기를 나타내고;

X_4는 그룹 $-OR_0$로 전환될 수 있는 기를 나타내며;

X_5는 일반식 $-CH(R_2)-R_1$의 그룹으로 전환될 수 있는 기를 타나낸다.

청구항 2

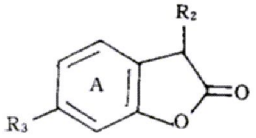
제1항에 있어서, 일반식(Ⅳ') 화합물중의 옥시란환을 루이스산의 존재하에서 개환시켜 R_1이 포르밀을 나타내는 일반식(Ⅰ)의 화합물을 생성시키고, 경우에 따라 포르밀을 아세탈화하거나 환원시켜 하이드록시메틸 R_1을 형성시키고 이것을 차례로 에스테르화하거나 특징으로 하는 방법.



(Ⅳ')

청구항 3

제1항에 있어서, 일반식(Ⅳ′)의 화합물을 환원제를 사용하여 환원시켜 R_1이 하이드록시메틸을 나타내는 일반식(Ⅰ)의 화합물을 생성시킴을 특징으로 하는 방법.



(Ⅳ)

청구항 4

제3항에 있어서, 5-클로로-3-메틸-6-모르폴리노벤조푸란-2(3H)-온을 리튬 알루미늄하이드라이드를 사용하여 환원시켜 2-(5-클로로-2-하이드록시-4-모르폴리노페닐)-프로판-1-올을 생성시킴을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제1항 내지 4항중의 어느 하나에 있어서, 공정중의 어느 단계에서 중간체로 수득될 수 있는 화합물을 출발물질로 사용하여 나머지 단계를 수행하거나 출 발물질을 염의 형태로 또는 특히 반응조건하에서 형성된 형태로 사용함을 특징으로 하는 방법.

청구항 6

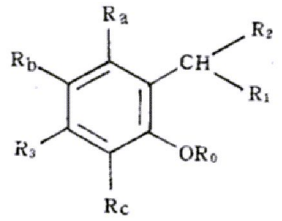
제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, R_0가 수소, 저급 알카노일 라디칼 또는 아릴-저급 알카노일 라디칼 나타내고, R_1은 하이드록시메틸 또는 카복실산에 의해 에스테르화되거나 알콜에 의해 에테르화된 하이드록시메틸, 또는 포르밀 또는 알콜에 의해 아세탈화된 포르밀을 나타내며, R_2는 비치환된 포화지 방족기를 나타내고, R_3는 2개의 1가 지방족기로 이치환된 아미노그룹 또는 아자, N-저급알킬아자, 옥사 또는 티아에 의해 임의로 차단된 한 개의 2가 지방족기로 이치환된 아미노그룹을 나타내며, 방향족환 A가 추가로 지방족기, 저급 알콕시, 저급 알킬티오, 저급 알칸설피닐, 저급 알칸설포닐, 하이드록시, 할로겐, 저급 알카노일옥시, 저급 일카노일 및/또는 니트로에 의해 일치환 또는 다치환될 수 있거나 R_3를 제외하고는 비치환될 수 있는, 일반식(Ⅰ) 화합물 또는 그의 염 또는 이성체를 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 7

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, R_0가 수소, 저급알카노일 또는 페닐 저급 알카노일(여기에서, 페닐기는 비치환되거나 저급 알킬, 하이드록시-저급 알킬, 할로-저급 알킬, 저급 알케닐, 3- 또는 4-원 저급 알킬렌, 저급 알콕시, 저급 알킬티오, 저급 알칸설피닐, 저급 알칸설포닐 및/또는 니트로에 의해 일치환 또는 다치환될 수 있다)을 나타내고, R_1은 하이드록시메틸 또는 임의치환된 저급 알칸카복실산에 의해 에스테르화 되거나 저급 알칸올에 의해 에테르화된 하이드록시메틸, 또는 포르밀 또는 저급 알칸올에 의해 아세탈화된 포르밀을 나타내며, R_2는 수소 또는 저급알킬을 나타내고, R_3는 N,N-디-저급 알킬아미노, N-사이클로-저급알킬-N-저급알킬아미노, N-저급알킬-N-페닐-저급 알킬아미노, N,N-디사이클로-저급알킬-저급알킬아미노, N-사이클로-저급알킬-N-페닐-저급알킬아미노 또는 N,N-디페닐-저급알킬아미노를 나타내거나 각 경우에 5- 내지 8-원인, 저급알킬렌아미노, 저급알케닐렌아미노, 모노아자, N′-저급알킬모노 아자, 모노옥사 또는 모노티아로 차단된 저급알킬렌아미노, 모노아자, N′-저급알킬모노아자, 모노옥사 또는 모노티아로 차단된 저급 알케닐렌아미노, 또는 한 개 또는 두 개의 오르토-융합된 벤조 시스템을 함유하는 저급 알킬렌아미노 또는 저급 알케닐렌아미노를 나타내며(여기에서, 저급알킬렌 및 저급알케닐렌은 직쇄 또는 측쇄이며 4개 내지 14개, 특히 4개 내지 7개의 탄소원자 및/또는 1개 또는 2개의 오르토 융합된 벤조시스템을 함유할 수 있고, 페닐 또는 벤조는 각각 비치환되거나 저급알킬, 하이드록시-저급알킬, 할로-저급알킬, 저급알케닐, 3- 또는 4-원 저급알킬렌, 저급알콕시, 저급알킬티오, 저급알칸설피닐, 저급알칸설포닐, 하이드록시, 할로겐, 저급알카노일옥시, 저급알카노일 및/또는 니트로에 의해 일치환 또는다치환될 수 있다), 방향족 환 A가 저급알킬, 하이드록시-저급알킬, 할로-저급알케닐, 3- 또는 4-원 저급알킬렌, 저급알콕시, 저급알킬티오, 저급알칸설피닐, 저급알칸설포닐, 하이드록시, 할로겐, 저급 알카노일옥시, 저급 알카노일 및/또는 니트로에 의해 일치환 또는 다치환될 수 있거나 R_3를 제외하고는 비치환될 수 있는, 일반식(Ⅰ) 화합물 또는 그의 염 또는 이성체를 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 8

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, 다음 일반식(Ⅰa)의 화합물 또는 그의 염 또는 이성체를 제조함을 특징으로 하는 방법.



(Ia)

상기 식에서,

R_0는 수소 또는 저급알카노일을 나타내고;

R_1은 하이드록시메틸, 저급알카노일옥시메틸, 저급알콕시메틸, 포르밀 또는 디-저급알콕시메틸을 나타내며;

R_2는 수소 또는 저급알킬을 타나내고;

R_3는 N,N-디페닐-저급알킬아미노를 나타내거나, 각 경우에 5- 내지 8-원인 저급알킬렌아미노, 저급알케닐렌아미노, 모노옥사에 의해 차단된 저급알킬렌아미노 또는 한 개의 오르토-융합된 벤조 시스템을 함유하는 저급알킬렌아미노 또는 저급알케닐렌아미노를 나타내며;

R_a,R_b 및 R_c의 각각은 독립적으로 수소, 저급알킬 또는 할로겐을 나타낸다.

청구항 9

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, R_0가 수소 또는 저급알카노일을 나타내며, R_1은 하이드록시메틸, 저급알카노일옥시메틸, 저급알콕시메틸, 포르밀 또는 디-저급알콕시메틸을 나타내고, R_2는 수소 또는 저급알킬을 나타내고, R_3는 디-저급알킬아미노, 5- 내지 8-원인 저급알킬렌아미노, 5- 내지 8-원인 저급알케닐렌아미노 또는 5- 내지 8원인 모노옥사-저급알킬렌아미노를 나타내며, R_a 및 R_c는 각각 수소를 나타내고, R_b는 할로겐을 나타내는, 일반식(Ⅰa)의 화합물 또는 그의 염 또는 이성체를 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 10

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, 2-(5-클로로-2-하이드록시-4-모르폴리페닐)-프로판-1-올을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 11

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, 2-[2-하이드록시-5-메틸-4-(피롤-1-일)-페닐]-프로판-1-올을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 12

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서, 2-[2-하이드록시-5-메틸-4-(피롤-1-일)-펜닐]-프로판을 또는 그의 이성체를 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 13

제1항 내지 5항중의 어느 하나에 있어서,

2-[5-클로로-2-하이드록시-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로판올,

2-[2-아세톡시-5-클로로-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로피온알데히드,

2-[2-아세톡시-5-클로로-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로판올,

2-[2-아세톡시-5-클로로-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로피온알데히드,

2-[5-클로로-2-하이드록시-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로피온알데히드 디에틸 아세탈,

2-[2-아세톡시-5-클로로-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-1-메톡시프로판,

2-[5-클로로-2-하이드록시-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-1-메톡시프로판,

1-아세톡시-2-[2-아세톡시-5-클로로-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-프로판,

1-아세톡시-2-[5-클로로-2-하이드록시-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-에탄,

2-[5-클로로-2-하이드록시-4-(피페리딘-1-일)-페닐]-에탄올,

2-[2-아세톡시-5-메틸-4-(피롤-1-일)-페닐]-에탄올,

2-[4-디벤질아미노-2-하이드록시-5-메틸페닐]-프로판올,

2-[4-디벤질아미노-5-메틸-2-피바로일옥시페닐]-1-피바로일옥시프로판, 또는

2-[5-메틸-2-피바로일옥시-4-(피롤-1-일)-페닐]-1-피바로일옥시프로판을 제조함을 특징으로 하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.