

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07D 233/56	(11) 공개번호 특 1987-0003075
	(43) 공개일자 1987년 04월 14일
(21) 출원번호	특 1986-0007932
(22) 출원일자	1986년 09월 23일
(30) 우선권주장	P3533824.5 1985년 09월 23일 독일(DE) P3541429.4 1985년 11월 23일 독일(DE) P3627656.1 1986년 08월 14일 독일(DE) P3628545.5 1986년 08월 22일 독일(DE)
(71) 출원인	책스트 아크티엔게젤샤프트 하인리히 벡커 독일연방공화국 데 6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 45 책스트 아크티엔게젤샤프트 베른하르트 벡크
(72) 발명자	독일연방공화국 데 6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 45 헤르베르트 지겔 독일연방공화국 데 6238 호프하임 암 타우누스 10 아암 알텐 비른바움 클라우스-디터 캄페 독일연방공화국 데 6232 바드 조덴 암 타우누스 1암 레스타이히 한스 게오르그 알페르만 독일연방공화국 데 6240 코니히스타인/타우누스 10암 아이크코프 헤르만 요제프 게르하르투스 독일연방공화국 데 6238 호프하임 암 타우누스 바폴데르베그 4 파트리키아 우징거 독일연방공화국 데 6239 에프스타인/타우누스 하우프트스트라세 54 울리히 샤흐트 독일연방공화국 데 6238 호프하임 암 타우누스 핑켄베그 12 마르그레트 레벤 독일연방공화국 데 6233 켈크하임(타우누스)브레스-라우어 스트라세 43 볼프강 라에테르 독일연방공화국 데 6072 드라이아이히 팔켄스타인 스트라세 6 발터 디트마르 독일연방공화국 데 6238 호프하임 암 타우누스 올란트스트라세 10 부르크하르트 자흐제 독일연방공화국 데 6233 켈크하임(타우누스) 안데어 지겔라이 30
(74) 대리인	이병호

심사청구 : 없음

(54) 아릴알킬아졸의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

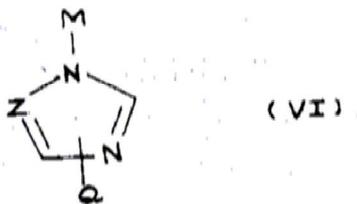
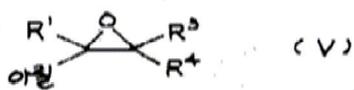
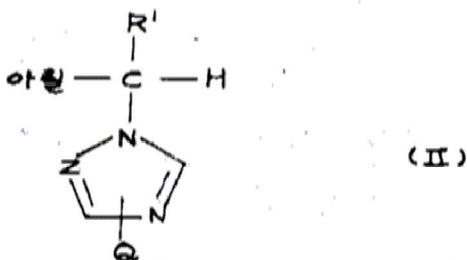
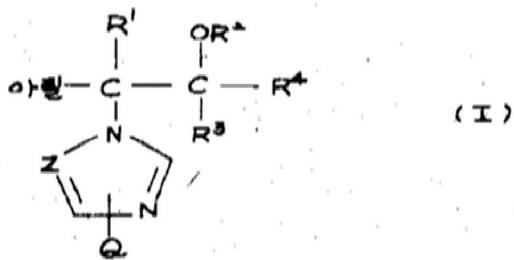
아릴알킬아졸의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

- (a) 1 또는 2 당량의 강염기를 일반식(II)의 아릴메틸아졸에 가한 다음, 생성물을 먼저 일반식(III)의 카보닐 화합물과 반응시키고, 이어서 양성자성 산 또는 일반식(IV)의 알킬 할라이드와 반응시켜 일반식(I)의 화합물을 수득하거나;
- (b) 일반식(V)의 옥시란을 일반식(VI)의 화합물과 반응시킨 다음, 생성물을 양성자성 산 또는 일반식(IV)의 알킬 할라이드와 반응시키거나;
- (c) 상기의 공정(a) 또는 (b)에서 제조한 일반식(I)의 화합물의 경우, 일반식(I)의 아릴라디칼에 존재하는 치환체 X 또는 V를 공지한 방법으로 상이한 치환체 X 또는 V로 전환시키고, 경우에 따라, 공정(a), (b) 또는 (c)에서 수득한 일반식(I)의 화합물을 유기 또는 무기산을 사용하여 이들 화합물의 산 부가염으로 전환시키고, 경우에 따라, 공정(a), (d) 또는 (c)에서 수득한 화합물을 그의 입체 이성체 및/또는 광학적 활성 거울상 이성체로 분리시킴을 특징으로 하여 일반식(I)의 화합물 및 그의 생리학적으로 허용되는 산 부가염 및 이들 화합물의 입체 이성체 및 광학적 활성 거울상 이성체를 제조하는 방법.

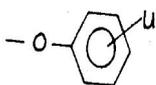


상기식에서,



아릴은 라디칼

[여기에서, X는 H(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 페닐, 불소, 염소, 브롬, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-



C<sub>4</sub>)-알콕시

(여기에서, u는 CH<sub>3</sub>, F, Cl 또는 OCH<sub>3</sub>), (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오, -NR<sup>5</sup> {여기에서, R<sup>5</sup>은

동일 또는 상이하며, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이거나, 질소원자와 함께 피롤리딘, 피페리딘 또는 모르폴린 라디칼을 나타낸다} 또는 CF<sub>3</sub>이거나, 비치환되거나 페닐라디칼에 하나 또는 두개의 치환체 {이 치환체는 동일 또는 상이하며, 불소, 염소, OCH<sub>3</sub>, OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬이다}를 함유하는 벤질옥시그룹이고; Y는 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 불소, 염소, 브롬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오이거나; X와 Y가 2,3-또는 3,4-위치에서 함께 -(CH<sub>2</sub>)<sub>L</sub>-쇄(여기에서, L은 3 또는 4이다), -O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-또는 -O-CH<sub>2</sub>-O-를 나타내고; W는 H, CH<sub>3</sub> 또는 OCH<sub>3</sub> 이다}이거나, 비치환되거나 u 및/또는 v [여기에서 u는 상기에서 정의한 바와 같고; V는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 페닐, 불소, 염소, 브롬 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오, -NR<sup>5</sup><sub>2</sub> {여기에서, R<sup>5</sup>은 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이거나, 질소원자와 함께 피롤리딘, 또 모르폴린 라디칼을 나타낸다}, 벤질옥시 또는 CF<sub>3</sub>이다}로 치환된 1 또는 2-나프틸 라디칼이고;

Z는 CH 또는 NO이고;

R<sup>1</sup> 및 Q는 H 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이고,

R<sup>2</sup>은 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-알케닐 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-알키닐이고;

R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>은 동일 또는 상이하며, H 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬이거나, 비치환되거나 3개 이하의 치환체 {이들 치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, Br, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시, -OC<sub>6</sub>H<sub>5</sub> 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오이다}를 함유하는 기타의 탄화 수소 라디칼이거나;

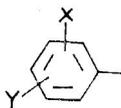
R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>은 함께 비치환되거나 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, OCH<sub>3</sub> 또는 페닐로 치환되며 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환 [이는 비치환되거나, 2개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다}를 함유한다]을 융합된 형태로 함유하는 (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 (여기에서, m은 2 내지 11이다)를 나타내거나; 하나의 이중 결합을 함유하는 상응하는 탄화수소쇄 [이는 벤젠환을 함유하지 않거나, 비치환되거나 2개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다}를 함유하는 1 또는 2개의 벤젠환을 융합된 형태로 함유한다]를 나타내거나; 또는 비치환되거나, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub> 또는 페닐로 치환되며, 단일 또는 다중 브릿지된(bridged)-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 [여기에서, m은 4 또는 5이고, 이 쇠는 1 내지 5개의 브릿지 탄소원자를 함유하는데, 브릿지 탄소원자는 다시 브릿지될 수 있고, 하나의 브릿지는 C-C 이중 결합을 함유하지 않거나 하나의 C-C 이중결합을 함유하며, 단일 또는 다중 브릿지된 (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄는 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환 {이는 비치환되거나 2개 이하의 치환체(치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다)를 함유한다]을 융합된 형태로 함유한다]를 나타내고;

Hal은 염소, 브롬 또는 요오드이고;

M은 수소이거나, 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서,



아릴이 라이칼 [여기에서, X는 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 페닐, F, Cl, Br, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 3-CF<sub>3</sub> 또는 벤질 옥시그룹이고; Y는 H, CH<sub>3</sub>, Cl 또는 OCH<sub>3</sub>이다}이거나, 비치환되거나 V {여기에서 V는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, Cl, Br, OH 또는 OCH<sub>3</sub>이다}로 치환된 2-나프틸라디칼이고;

Z는 CH이고;

Q가 H, CH<sub>3</sub> 또는 C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>이고;

R<sup>1</sup>이 H 또는 CH<sub>3</sub>이고;

R<sup>2</sup>은 H이고;

R<sup>3</sup>이 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-알케닐, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알케닐, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알케닐, (C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬리덴-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알케닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알킬리덴-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬 또는 (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알케닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이거나, 3개 이하의 동일 또는 상이한 치환체(치환체는 F, Cl, Br, CH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub> 이다)를 함유하는 환상 탄화수소 라디칼이거나, 또는 비치환되거나 2개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, OCH<sub>3</sub>, OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬이다}를 함유하는 1 또는 2개의 융합된 벤젠환을 함유하는 전술한 환상 탄화수소라디칼이거나, 또는 비치환되거나 페닐라디칼에 3개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하며, F, Cl, Br, (C<sub>1</sub>-

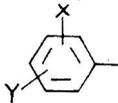
C<sub>4</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> 또는 OC<sub>6</sub>H<sub>5</sub> 이다}를 함유하는 페닐 또는 페닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬그룹이거나, 또는 비치환되거나 2개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하하며, F, Cl, Br, OCH<sub>3</sub>, OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬이다}를 함유하는 나프틸그룹이고;

R<sup>4</sup>이 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)-알케닐 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-사이클로알킬이거나, 페닐, 페닐-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 나프틸 또는 나프틸-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬 그룹 [이들 그룹은 비치환되거나, 페닐라디칼 또는 나프틸라디칼에 2개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하하며, F, Cl, Br, OCH<sub>3</sub>, OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다}를 함유한다]이거나;

R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>은 함께 비치환되거나 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬 또는 페닐로 치환되며 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환 [이는 비치환되거나, 하나의 치환체 {치환체는 F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다}를 함유한다]을 융합된 형태로 함유하는(2개의 융합된 벤젠환의 경우, 치환체는 동일 또는 상이하) -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 (여기에서, m은 4 내지 11이다)를 나타내거나; 하나의 이중 결합을 함유하는 이 유형의 탄화수소쇄 [이는 벤젠환을 함유하지 않거나, 비치환되거나 하나의 치환체 {치환체는 F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이다}를 함유하는 1 또는 2개의 벤젠환을 융합된 형태로 함유하는데, 2개의 융합된 벤젠환의 경우, 치환체는 동일 또는 상이하}를 나타내거나; 또는 비치환되거나, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, OCH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>로 치환되며, 단일 또는 다중 브릿지된 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 (여기에서, m은 4 내지 5이고, 이 쇠는 1 내지 5개의 브릿지 탄소원자를 함유하는데, 브릿지 탄소원자는 다시 브릿지될 수 있고, 하나의 브릿지는 C-C 이중결합을 함유하지 않거나 하나의 C-C 이중결합을 함유하며, 단일 또는 다중 브릿지된 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄는 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환을 융합된 형태로 함유한다]를 나타내는 방법.

**청구항 3**

제1항 또는 제2항에 있어서,



아릴이 라디칼 [여기에서, X는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 페닐, F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시이고; Y는 H, CH<sub>3</sub>, Cl 또는 CH<sub>3</sub>이며; 6-위치는 하상 비치환된다]이거나, 비치환되거나 Br 또는 Cl로 모노치환된 2-나프틸라디칼이고;

Z는 CH이고;

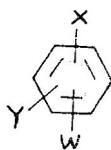
Q가 R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>은 H이고;

R<sup>3</sup>이 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알킬, (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알케닐 또는 (C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)-폴리사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이거나, 하나의 치환체 또는 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체(치환체는 Cl, Br, CH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>이다)를 함유하는 환상 탄화수소라디칼이거나, 또는 1 또는 2개의 융합된 벤젠환을 함유하는 전술한 환상 탄화수소 라디칼이거나, 또는 비치환되거나 페닐라디칼에 3개 이하의 치환체 {치환체는 동일 또는 상이하하며, F, Cl, Br, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬티오, OC<sub>6</sub>H<sub>5</sub> 또는 C<sub>6</sub>H<sub>5</sub> 이다}를 함유하는 페닐 또는 페닐 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬그룹이거나, 또는 비치환되거나, Cl, Br, OCH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>3</sub>로 치환된 나프틸 그룹이고;

R<sup>4</sup>이 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 사이클로펜틸, 사이클로헥실 또는 사이클로프로필이거나;

R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>은 함께 -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-쇄 (여기에서, n은 4 내지 7이고, 이 쇠는 비치환된 CH<sub>3</sub> 또는 C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>로 치환되며, 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환을 융합된 형태로 함유한다]를 나타내거나, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 [여기에서 m은 4 또는 5이며, 이 쇠는 비치환되거나 CH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>로 치환되고, 단일 또는 다중 브릿지되며, 1 내지 5개의 브릿지 탄소원자를 함유하는데, 브릿지 탄소원자는 다시 브릿지될 수 있고, 하나의 브릿지는 C-C 이중결합을 함유하지 않거나, 하나의 C-C 이중결합을 함유하며, 단일 또는 다중 브릿지된 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄는 벤젠환을 함유하지 않거나 1 또는 2개의 벤젠환을 융합된 형태로 함유한다]를 나타내는 방법.

**청구항 4**



제1항에 있어서, 아릴이 라디칼 (여기에서, W는 수소이고; X 및 Y는 수소, F, Cl 또는 Br이다)이고; Q, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>이 수소이고; R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>이 함께 H이고; (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-쇄 (여기에서, n은 4 내지 6이다) 또는 브릿지된 (H<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-쇄 [여기에서 m은 4 또는 5이고, 이 쇠는 1 내지 5개의 브릿지 탄소원자를 함유한다]를

형성하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.