

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
C07D 213/79

(11) 공개번호 특1998-0002026
(43) 공개일자 1998년03월30일

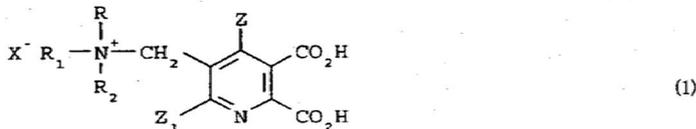
(21) 출원번호 특1997-0023491
(22) 출원일자 1997년06월07일
(30) 우선권주장 8/661,206 1996년06월10일 미국(US)
(71) 출원인 아메리칸 사이아나미드 캠페니 윌리엄 에이취, 캘너
미합중국 뉴저지 07940 매디슨 화이브 지럴다 팜즈
(72) 발명자 우, 웬-슈
미합중국 뉴저지 08648 로렌스빌 페더럴 씨티 로드 212
(74) 대리인 차윤근

심사청구 : 없음

(54) [(5,6-디카복시-3-피리딜)메틸]암모늄 할라이드의 제조 방법

요약

화학식(1)의 [(5,6-디카복시-3-피리딜)메틸]암모늄 할라이드의 제조 방법을 제공한다.



[(5,6-디카복시-3-피리딜)메틸]암모늄 할라이드는 제조제 5-(알콕시메틸)-2-(2-이미다졸린-2-일)-니코틴산, 에스테르 및 염의 제조에서 중간체로서 유용하다.

명세서

[발명의 명칭]

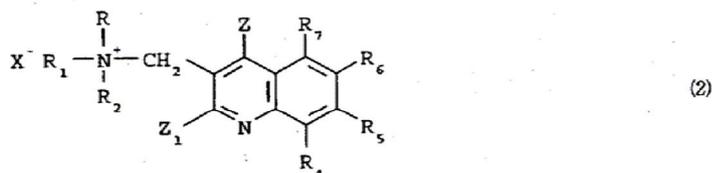
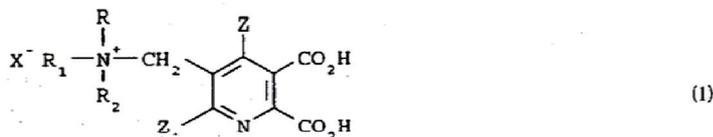
[(5,6-디카복시-3-피리딜)메틸]암모늄 할라이드의 제조 방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

화학식(2)의 치환된 (3-퀴놀릴메틸)암모늄 할라이드, 이의 N-옥사이드 및 이의 산 부가 염을 수성 염기의 존재하에서 과산화수소로 산화시키는 것을 포함하는, 화학식(1)의 [(5,6-디카복시-3-피리딜)메틸]암모늄 할라이드의 제조 방법.



상기 식에서, R, R₁ 및 R₂는 각각 독립적으로 C₁-C₄알킬이고, R 및 R₂이 함께는 O, S 또는 NR₃에 의해 임의로 개입된 5원 또는 6원 환을 형성할 수 있으며, R₃은 C₁-C₄알킬이며, X는 Cl, Br 또는 I이며, Z는 수소 또는 할로겐이며, Z₁은 수소, 할로겐, 시아노 또는 니트로이며, R₄, R₅, R₆ 및 R₇은 각각 독립적으로

수소, 하이드록시, 니트로, $OC(O)R_8$, 할로겐, NR_9R_{10} , C_1-C_4 알콕시, SO_3H , SO_2Cl 또는 SH 이며, 단, R_4 , R_5 , R_6 및 R_7 중 하나는 수소 또는 할로겐이 아니며, R_8 은 C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 알콕시, 페닐 또는 $NR_{11}R_{12}$ 이며, R_9 , R_{10} , R_{11} 및 R_{12} 는 각각 독립적으로 수소, C_1-C_4 알킬 또는 페닐이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R , R_1 및 R_2 는 각각 독립적으로 C_1-C_4 알킬이고, X 는 Cl 또는 Br 이며, Z 및 Z_1 은 수소이며, R_4 , R_5 , R_6 및 R_7 중 적어도 하나는 하이드록시, 니트로 또는 $OC(O)R_8$ 이며, R_8 은 C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 알콕시 또는 페닐인 방법.

청구항 3

제2항에 있어서, R , R_1 및 R_2 는 메틸이고, X 는 Br 이며, R_5 , R_6 , R_7 , Z 및 Z_1 은 수소이며, R_4 는 하이드록시, 니트로 또는 $OC(O)R_8$ 이며, R_8 은 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 알콕시인 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, 과산화수소가 화학식(2)의 치환된 (3-퀴놀릴메틸)암모늄 할라이드에 대하여 약 8 내지 60몰 당량의 존재하는 방법.

청구항 5

제1항에 있어서, 수성 염기가 화학식(2)의 치환된 (3-퀴놀릴메틸)암모늄 할라이드에 대하여 적어도 약 1몰 당량의 존재하는 방법.

청구항 6

제5항에 있어서, 수성 염기가 약 4 내지 10몰 당량의 양으로 존재하는 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, 수성 염기가 수성 수산화나트륨 또는 수성 수산화칼륨인 방법.

청구항 8

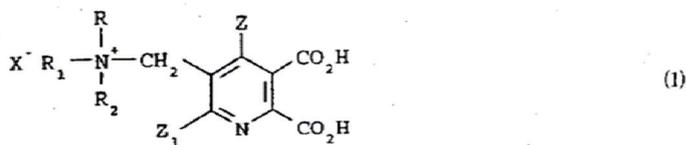
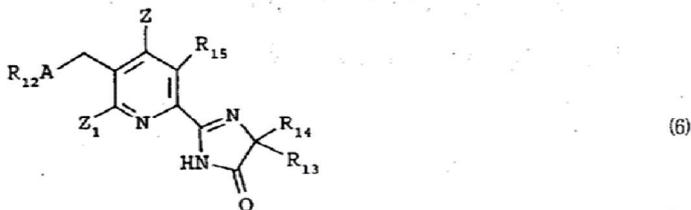
제1항에 있어서, 화학식(2)의 치환된 (3-퀴놀릴메틸)암모늄 할라이드를 약 $50^\circ C$ 내지 $100^\circ C$ 의 온도에서 수성 염기의 존재하에서 과산화수소로 산화시키는 방법.

청구항 9

제8항에 있어서, 온도가 약 $75^\circ C$ 내지 $95^\circ C$ 인 방법.

청구항 10

(a) 화학식(1)의 화합물을 제조하고, (b) 화학식(1)의 화합물을 화학식(6)의 화합물로 전환시키는 것을 포함하는 화학식(6)의 제조제 이미다졸리논 화합물 ; 및 R_{13} 및 R_{14} 가 상이한 치환체일때 이의 광학 이성체의 제조 방법.



상기식에서, Z , Z_1 , R , R_1 , R_2 및 X 는 제1항에서 정의한 바와 같고, A 는 0 또는 S 이며, R_{12} 는 1 내지 3개의 C_1-C_4 알킬 그룹 또는 할로겐 원자로 임의로 치환된 페닐로 임의로 치환된 C_1-C_4 알킬이거나, 1 내지 3개의 C_1-C_4 알킬 그룹 또는 할로겐 원자로 임의로 치환된 페닐이며, R_{13} 은 C_1-C_4 알킬이며, R_{14} 는 C_1-C_4 알킬, C_3-C_6 시클로알킬이거나 R_{13} 및 R_{14} 가 이들의 부착된 원자와 함께일때는 메틸로 임의로 치환된 C_3-C_6 시클로알킬 그룹이며, R_{15} 는 수소, 디저급알킬이미노, C_1-C_3 알콕시, 할로겐, 하이드록시, C_3-C_6 시클로알킬, 벤질옥시, 퓨릴, 페닐, 할로페닐, 저급 알킬페닐, 저급 알콕시페닐, 니트로페닐, 카복실, 저급알콕시카보닐, 시아노 또는 트리저급알킬암모늄으로 이루어진 그룹 중 하나로 임의로 치환된 C_1-C_{12} 알킬, C_1-C_3 알콕시, 페닐, 할로겐 또는 저급알콕시카보닐 중 하나로 또는 2개의 C_1-C_3 알콕시 그룹 또는 2개의 할로겐 그룹

로 임의로 치환된 C₃-C₁₂알케닐, 1개 또는 2개의 C₁-C₃알킬 그룹으로 임의로 치환된 C₃-C₆시클로알킬 또는 양이온이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.