

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

| | |
|---|---|
| (51) Int. Cl. ⁴ C07D 413/04 | (11) 공개번호 특 1987-0002135 |
| | (43) 공개일자 1987년 03월 30일 |
| (21) 출원번호 | 특 1985-0006093 |
| (22) 출원일자 | 1985년 08월 23일 |
| (30) 우선권주장 | P3431152.1 1984년 08월 24일 독일(DE) |
| (71) 출원인 | 카셀라 아크티엔 게젤샤프트 우르바흐, 오이크너 독일연방공화국 데-6000 프랑크푸르트 암 마인 61 하나우어 란트스트라세 526 |
| (72) 발명자 | 칼 쉘나핑거 독일연방공화국 8755 알제나우 홀룬데르베크 8 헬무트 본 독일연방공화국 6369 쉘벡 크란츠베르그링 11 피에로 아. 마르토라나 독일연방공화국 6380 바트 홀부르크 카이저 프리트리히-프로메나드 108 롤프-에버하르트 니쯔 독일연방공화국 6000 프랑크푸르트 60 하인리히-빙게머-베그 64 |
| (74) 대리인 | 이병호, 최달용 |

심사청구 : 없음

(54) 광학적 활성, 치환된 1,4-디히드로피리딘의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

광학적 활성, 치환된 1,4-디히드로피리딘의 제조방법

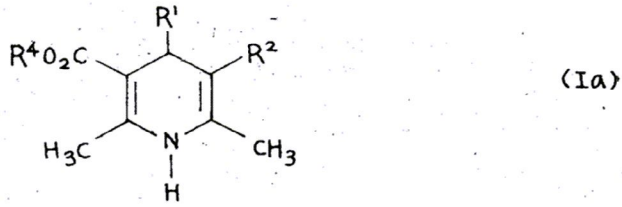
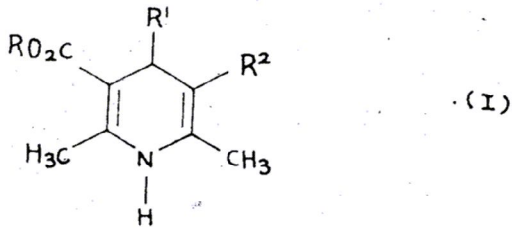
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

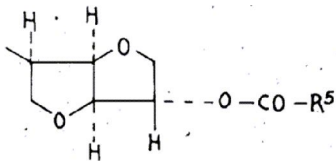
청구항 1

a) 하기 일반식(III)의 일리덴 화합물 1몰을 하기 일반식(IV)의 3-아미노크로톤 산 에스테르 1몰과 반응시키거나, b) 하기 일반식(V)의 알데히드 1몰, 하기 일반식(IV)의 3-아미노크로톤 산 에스테르 1몰 및 하기 일반식(VI)의 케톤 1몰을 서로 반응시키거나, c) 하기 일반식(III)의 일리덴 화합물 1몰, 하기 일반식(VII)의 아세트아세트산 에스테르 1몰 및 암모니아(NH₃) 1몰을 서로 반응시키거나, d) 하기 일반식(VIII)의 일리덴 화합물 1몰을 하기 일반식(IX)의 엔아민 1몰과 반응시키거나, (e) 하기 일반식(V)의 알데히드 1몰과, 하기 일반식(VII)의 아세트아세트산 에스테르 1몰, 하기 일반식(VI)의 케톤 1몰 및 암모니아(NH₃) 1몰을 서로 반응시키거나, f) 하기 일반식(V)의 알데히드 1몰, 하기 일반식(VII)의 아세트아세트산 에스테르 1몰 및 하기 일반식(IX')의 엔아민 1몰을 서로 반응시키고, 수득된 부분입체 이성체 혼합물로부터 광학적 활성 화합물을 분리하고, 필요시 수득된 광학 활성 화합물을 산부기염으로 전환시킴을 특징으로 하는, 하기 일반식(Ia)의 광학적 활성, 치환된 1,4-디히드로피리딘 및 이의 산

부가염의 제조방법.



상기식에서, R¹은 탄소수 1 내지 4의 알킬, 탄소수 1 내지 4의 알콕시, 할로겐, 트리플루오로메틸, 니트로 또는 시아노로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 피리딜 또는 티에닐라디칼을 나타내거나, 할로겐, 니트로, 시아노, 트리플루오로메틸, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 페닐을 나타내고, R²은 O, N, NH 또는 S로부터 선택된 2개 이상의 헤테로-원자그룹 또는 헤테로-원자와 1개이상의 이중결합을 가지며, 탄소수 1 내지 4개의 알킬, 탄소수 1 내지 4의 알킬티오, 총 탄소수 7 내지 9의 아르알킬, 총탄소수 2 내지 5의 알콕시알킬, 탄소수 5 또는 6의 시클로알킬, 아미노카르보닐메틸티오, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐 또는 페닐로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 5-원 환의 라디칼을 나타내며, R⁴는 라디칼(R)-CH(CH₃)CO₂R⁵, (S)-CH(CH₃)CO₂R₅ 또는 일반식



의 라디칼을 나타내며, R⁵는 탄소수 1 내지 6의 알킬을 나타낸다.

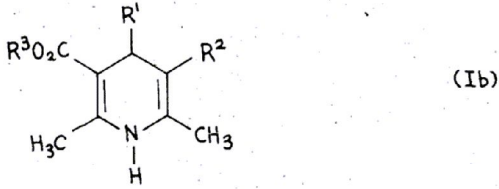
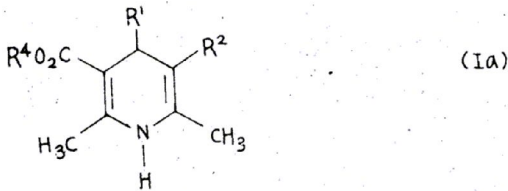
청구항 2

제1항에 있어서, 생성된 부분입체이성체 혼합물을 재결정시켜 주생성물로서 존재하는 광학 이성체를 분리하고, 필요시 이를 산부가염으로 전환시킴을 특징으로 하는 방법.

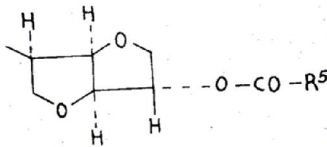
청구항 3

하기 일반식(Ia)의 광학적 활성 화합물을 일반식 R³OH(여기서 R³는 하기에서 정의되는 바와 같다)의 알코올로 에스테르교환 반응시키고, 필요시, 생성화합물을 산부가염으로 전환시킴을 특징으로 하는, 하기 일

반식(1b)의 광학적 활성, 치환된 1,4-디히드로피리딘 및 이의 산부가 화합물의 제조방법.



상기식에서, R¹은 탄소수 1 내지 4의 알킬, 탄소수 1 내지 4의 알콕시, 할로겐, 트리플루오로메틸, 니트로 또는 시아노로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 피리딜 또는 티에틸 라디칼을 나타내거나, 할로겐, 니트로, 시아노, 트리플루오로메틸, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 페닐을 나타내고, R²는 O, N, O 또는 S로부터 선택된 2개 이상의 헤테로-원자그룹 또는 헤테로-원자와 1개 이상의 이중결합을 가지며, 탄소수 1 내지 4의 알킬, 탄소수 1 내지 4의 알킬티오, 총 탄소수 7 내지 9의 아르알킬, 총탄소수 2 내지 5의 알콕시알킬, 탄소수 5 또는 6의 시클로알킬, 아미노카르보닐메틸티오, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐 또는 페닐로부터 선택된 1 또는 2개의 동일 또는 상이한 치환체를 가질 수 있는 5-원 환의 라디칼을 나타내며, R³는 탄소수 1 내지 6의 알킬, 탄소수 3 내지 8의 알콕시알킬, 총탄소수 4 내지 9의 디알킬아미노알킬, 총탄소수 10 내지 14의 N-아르알킬-N-알킬-아미노알킬 또는 탄소수 5 또는 6의 시클로알킬을 나타내고, R⁴는 라디칼(R)-CH-(CH₃)CO₂R⁵, (S)-CH(CH₃)CO₂R⁵ 또는 일반식



의 라디칼을 나타내며, R⁵는 탄소수 1 내지 6의 알킬을 나타낸다.

청구항 4

제3항에 있어서, 에스테르교환 반응을, 리튬이소프로테올레이트, 나트륨 이소프로테올레이트 또는 칼륨 이소프로테올레이트의 존재하에 이소프로테올을 사용하여 수행하거나; 리튬 2-메톡시-에탄올레이트, 나트륨 2-메톡시-에탄올레이트 또는 칼륨 2-메톡시-에탄올레이트의 존재하에 2-메톡시에탄올을 사용하여 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제3항에 있어서, 광학적 활성형, 바람직하게는 광학적 활성 좌회전 형의 이소프로필 1,4-디히드로-2,6-디메틸-4-(2,3-디클로로페닐)-5-(1,3,4-옥사디아졸-2-일)-피리딘-3-카르복실레이트의 제조방법.

청구항 6

제3항에 있어서, 광학 활성 좌회전 형의 2-메톡시-에틸 1,4-디히드로-2,6-디메틸-4-(2,3-디클로로페닐)-5-(1,3,4-옥사디아졸-2-일)-피리딘-3-카르복실레이트의 제조방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.