

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ³ C07D 401/04	(11) 공개번호 (43) 공개일자	특1984-0009097 1984년 12월 24일
(21) 출원번호	특1984-0002657	
(22) 출원일자	1984년 05월 16일	
(30) 우선권주장	495367 1983년 05월 17일 미국(US)	
(71) 출원인	시바-가이키 에이지 아놀드 자일러, 에른스트 알테르 스위스연방 4002 바슬 콜라이벡스트라세 141	
(72) 발명자	해리스 버트 렌프로우	
(74) 대리인	미합중국 뉴욕 10994 웨스트 니악 스톤헛지 드라이브 12 이병호	

심사청구 : 없음

(54) 2-헥테로 아릴-인돌의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]
2-헥테로 아릴-인돌의 제조방법

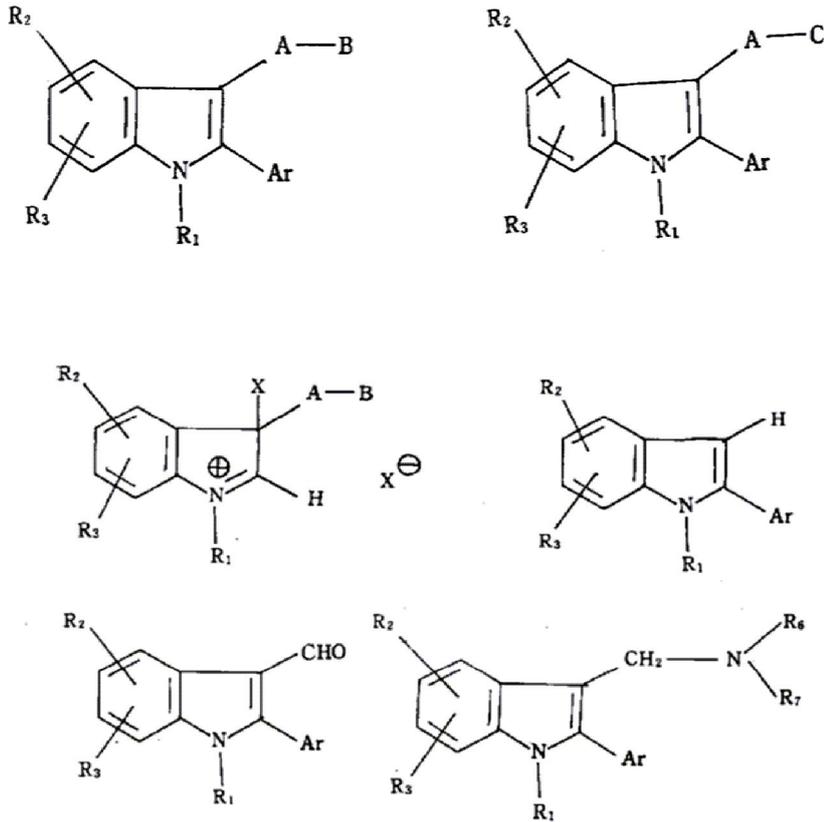
본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(IV)의 화합물을 일반식ArH(여기에서 Ar은 후술함)또는 그의 반응성 금속 유도체와 축합시키고 필요시 R₁이 수소인 일반식(I)의 화합물을 알킬화시켜 R₁이 저급알킬인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, 일반식(V)의 화합물을 그의 반응성 금속유도체로서 일반식(VI)의 화합물의 반응성 작용유도체와 축합시키고, 필요시 R₁이 수소인 일반식(I)의 화합물을 알킬화시켜 R₁이 저급 알킬인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, 일반식(VII)의 화합물을 폐환시키거나, 일반식(VIII)의 화합물을 폐환시키거나, A가 일케닐렌인 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해 위티히 반응조건하에서 일반식(V) 화합물의 3-프로필 유도체인 일반식(Va)의 화합물을 일반식(VII)화합물의 알리드와 축합시키거나, A가 저급 알킬렌-(티오 또는 옥시)-저급 알킬렌 또는 저급 알켈렌-(티오 또는 옥시)-페닐렌인 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해 일반식(V)화합물의 3-(이치환된 아미노 메틸)유도체인 일반식(Vb)의 화합물을 일반식(VIII)의 화합물 또는 그의 반응성 알카리금속 또는 알모늄 유도체, 또는 R₅'가 히드록시 또는 티올이고 A'는 저급 알킬렌이며 B가 카복시인 일반식(VIII)화합물의 탁론 또는 티오락톤과 반응시키거나, 체인 A의 정의 내에서 임의로 체인 A를 증가시키면서 일반식(I_a)의 화합물을 일반식(I)의 화합물로 전환시키거나, 알킬렌 체인 A를 후술한 바와 같은 수의 탄소원자를 가진 알킬렌으로 증가시키면서 임의로 방해되는 반응성 그룹을 일시적으로 보호시키면서 일반식(I^{*})또는 (I_a^{*})의 화합물(여기에서 화합물 각각은 일반식(I)또는 (I_a)의 화합물과 동일하지만 A가 탄소수 1 내지 2의 알킬렌이다)을 일반식(I)의 화합물로 전환시키고/거나, 필요시 생성된 일반식(I)의 화합물을 다른 일반식(I)의 화합물로 전환시키고/거나, 필요시 생성된 일반의 화합물을 염으로 전환시키거나, 염을 유리화합물 또는 다른 염으로 전환시키고 필요시 수득된 이성체 또는 라세메이트의 혼합물을 단일 이성체 또는 라세메이트의 혼합물을 단일 이성체 또는 라세메이트로 분할시키고 필요시 수득된 라세메이트를 광학적 대장체로 분할시킴을 특징으로 하여 일반식(I)의 2-(피

리딜 및 이미다졸릴)-인들, 그의 이미다졸릴 및 피리딜 N-옥사이드 및 그의 염을 제조하는 방법.



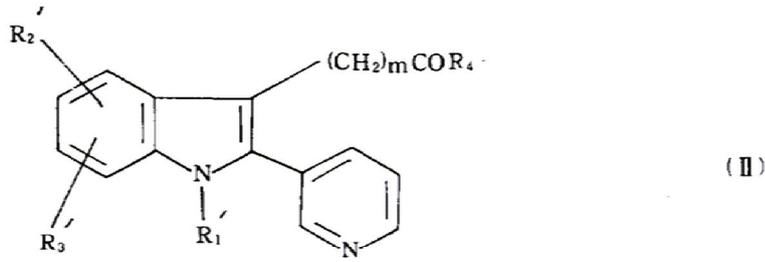
상기식에서, R₁은 수소 또는 저급알킬이고 Ar은 각각 저급 알킬, 카복시, 저급 알콕시카보닐 또는 카바모일로 치환되거나 비치환된 3-피리딜 또는 1-이미다졸릴이며, R₂ 및 R₃는 서로 무관하게 수소, 저급알킬, 할로겐, 트리플루오로메틸, 히드록시, 저급 알콕시, 카복시 저급알콜, 저급 알콕시카보닐 저급알킬, 카복시 저급알콕시카보닐, 또는 저급 알킬-(티오, 설퍼닐 또는 설포닐)이거나, R₂ 및 R₃가 인접된 탄소원자상에서 함께 저급 알킬렌디옥시이고, A는 그룹 B로부터 인돌핵을 분리시키는 탄소원자의 수가 3내지 12인 3내지 12탄소원자의 알킬렌, 2내지 12 탄소원자의 알케닐렌, 2내지 12탄소원자의 알키닐렌, 저급 알킬렌 페닐렌-저급(알칼렌 또는 알케닐렌), 저급 알킬렌페닐렌, 저급 알킬렌-(티오 또는 옥시)-저급 알킬렌, 저급 알킬렌-(티오 또는 옥시)-페닐렌 또는 저급 알킬렌페닐렌-(티오 또는 옥시)-저급 알킬렌이며, B는 카복시, 에스테르와된 카복시, 카바모일, 모노-또는 디-저급 알킬카바모일, 히드록시불틸, 시아노, 히드록시카바모일, 5-테트라졸릴 또는 프로밀이며, A'는 예를 들면 A에 대해 정의된 바와 같은 알킬렌이지만 탄소원자 하나가 감소된 체인이며, A''는 저급알킬렌 또는 페닐렌이고 R₅는 디알킬포스노 또는 트리아릴포스포늄 라디칼이며, R₅'는 히드록시 또는 티올이고, R₆ 및 R₇은 각각 저급 알킬이며, C는 B와는 다르며 B로 전환시킬수 있는 그룹이고, X는 할로겐이며, 일반식(VII)의 화합물에서 Ar은 일반식(I)에서 정의된 바와 같이 치환된 3-피리딜 또는 3-피리딜이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R₁이 수소 또는 저급 알킬이고, Ar은 3-피리딜, 1-이미다졸릴, 저급알킬로 치환된 3-피리딜, 또는 저급 알킬로 치환된 1-이미다졸릴이며, R₂ 및 R₃는 서로 무관하게 수소, 저급 알킬, 할로겐, 트리플루오로메틸, 히드록시, 저급 알콕시 또는 저급 알킬리오이거나 R₂ 및 R₃가 인접한 탄소원자상에서 함께 저급 알킬렌디옥시이며, A는 탄소수 4내지 12의 알킬렌, 각각 탄소수 7내지 10의 저급(알킬렌페닐렌, 알킬렌-티오-페닐렌 또는 알킬렌-옥시-페닐렌)이고, B는 카복시, 저급 알콕시카보닐, 카바모일, 시아노, 히드록시카바모일, 5-테트라졸릴 또는 히드록시불틸인 일반식(I)의 화합물 및 그의 염을 제조하는 방법으로 하는 방법.

청구항 3

제1항에 있어서, 일반식(II)의 화합물 및 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.



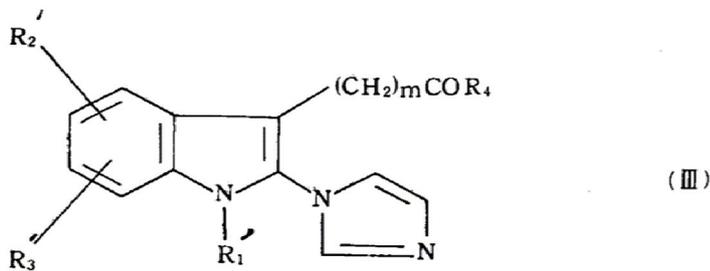
상기식에서, R₁'는 수소 또는 저급 알킬이고, R₂' 및 R₃'는 서로 무관하게 수소, 저급알킬, 할로겐, 트리플루오로메틸, 히드록시, 저급 알킬티오 또는 저급 알콕시이거나 R₂' 및 R₃'가 인접된 탄소원자상에서 함께 불틸렌 디옥시이며, m은 4내지 12의 정수이고, R₄는 수소, 저급 알콕시 또는 아미노이다.

청구항 4

제3항에 있어서, R₁'는 수소 또는 저급 알킬이고, R₂'는 수소 또는 할로겐이며, R₃'는 수소이고, m은 4내지 8의 정수이며, R₄는 히드록시, 저급 알콕시 또는 아미노인 일반식(II)의 화합물 및 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제1항에 있어서, 일반식(III)의 화합물 및 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.



상기식에서, R₁'는 수소 또는 저급 알킬이고, R₂' 및 R₃'는 서로 무관하게 수소, 저급알킬, 할로겐, 트리플루오로메틸, 히드록시, 저급 알킬티오 또는 저급 알콕시이거나, R₂' 및 R₃'가 인접된 탄소원자상에서 함께 불틸렌 디옥시를 나타내고, m은 3내지 12의 정수이며, R₄는 히드록시, 저급 알콕시 또는 아미노이다.

청구항 6

제5항에 있어서 R₁'가 수소 또는 저급 알킬이고 R₂'가 수소 또는 할로겐이며 R₃'가 수소이고 m은 4내지 8의 정수이며 R₄가 히드록시, 저급 알콕시 또는 아미노인 일반식(III)의 화합물 및 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조하는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, 3-(5-카복시펜틸)-2-(3-피리딜)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 8

제1항에 있어서, 3-(5-카복시펜틸)-1-메틸-2-(3-피리딜)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, 5-히드록시-2-(3-피리딜)-3-(5-카복시펜틸)-인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 10

제1항에 있어서 3-(5-카복시펜틸)-5-클로로-2-(3-피리딜)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 11

제1항에 있어서 3-(5-카복시펜틸)-5-클로로-1-메틸-2-(3-피리딜)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 12

제1항에 있어서 2-(1-이미다졸릴)-3-(3-카복시프로필)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 13

제1항에 있어서 2-(1-이미졸릴)-3-(5-카복시펜틸)인들 또는 그의 약제학적으로 무독한 염을 제조함을 특징으로 하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.