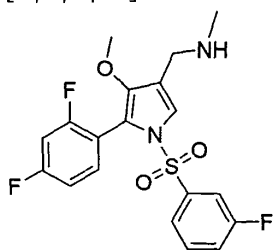


【청구의 범위】

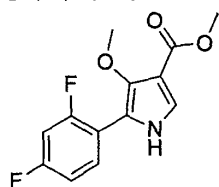
【청구항 1】

- 1) 하기 화학식 2로 표시되는 화합물과, 하기 화학식 3으로 표시되는 화합물을 반응시켜, 하기 화학식 4로 표시되는 화합물을 제조하는 단계;
- 5 2) 하기 화학식 4로 표시되는 화합물과 수소화붕소나트륨을 반응시켜, 하기 화학식 5로 표시되는 화합물을 제조하는 단계;
- 3) 하기 화학식 5로 표시되는 화합물과 산화제를 반응시켜, 하기 화학식 6으로 표시되는 화합물을 제조하는 단계; 및
- 4) 하기 화학식 6으로 표시되는 화합물과 메틸아민을 반응시켜
- 10 중간체를 생성하고, 환원제를 가하여 상기 중간체를 하기 화학식 1로 표시되는 화합물로 전환시키는 단계;를 포함하는,
- 4-메톡시 피롤 유도체의 제조 방법:

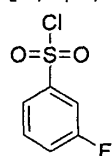
[화학식 1]



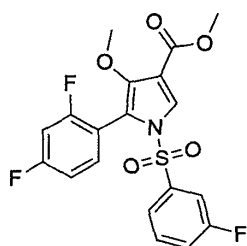
15 [화학식 2]



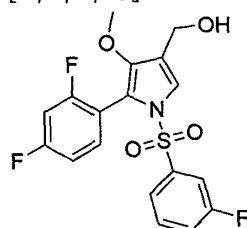
[화학식 3]



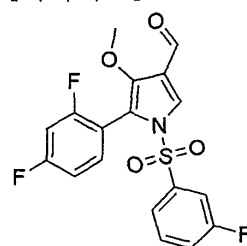
[화학식 4]



[화학식 5]



[화학식 6]



5

【청구항 2】

제1항에 있어서,

상기 단계 1은 염기 및 4-(다이메틸아미노)-피리딘 존재 하에

10 수행되는 것인, 제조 방법.

【청구항 3】

제2항에 있어서,

상기 단계 1의 염기는 N, N-다이아이소프로필에틸아민, 트리에틸아민,

15 다이소프로필아민, 디소프로필에틸아민, 탄산칼륨, 탄산수소칼륨,

탄산나트륨, 탄산수소나트륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬,

메틸산나트륨, 부티르산칼륨, 탄산세슘, 또는 이들 중 2 이상의 혼합물인

것인, 제조 방법.

【청구항 4】

제1항에 있어서,
상기 단계 1에서, 상기 화학식 2로 표시되는 화합물 및 상기 화학식
5 3으로 표시되는 화합물의 몰비는 10:1 내지 1:10인, 제조 방법.

【청구항 5】

제1항에 있어서,
상기 단계 1의 반응 용매는 아세토니트릴, 테트라하이드로퓨란,
10 염화메틸렌, 메탄올, 에탄올, 프로판올, 아이소-프로판올, 부탄올, 터트-
부탄올, 또는 이들 중 2 이상의 혼합물인, 제조 방법.

【청구항 6】

제1항에 있어서,
15 상기 단계 1의 반응 온도는 10 내지 35 °C인, 제조 방법.

【청구항 7】

제1항에 있어서,
상기 단계 2는 염화아연 및 다이메틸아닐린의 존재 하에 수행되는
20 것인, 제조 방법.

【청구항 8】

제7항에 있어서,
상기 단계 2에서, 상기 화학식 4로 표시되는 화합물 및 상기
25 염화아연의 몰비가 10:1 내지 1:10을 만족함과 동시에, 상기 화학식 4로
표시되는 화합물 및 상기 다이메틸아닐린의 몰비가 10:1 내지 1:10을
만족하도록 혼합하여, 상기 단계 2의 반응에 사용하는 것인, 제조 방법.

【청구항 9】

제1항에 있어서,

상기 단계 2의 반응 용매는 다이메틸아세트아마이드,
테트라하이드로퓨란, 다이메틸설폭사이드, 톨루엔, 메탄올,
다이클로로메탄, 또는 이들 중 2 이상의 혼합물인, 제조 방법.

5

【청구항 10】

제1항에 있어서,

상기 단계 2의 반응 온도는 -15 내지 80 °C인, 제조 방법.

10 【청구항 11】

제1항에 있어서,

상기 단계 3의 산화는,

¹⁾(다이아세톡시요오드)벤젠, 아이오딘, 요오드벤젠 다이클로라이드,
아이오도실벤젠, 및 트리클로로이소시아누릭산 중에서 선택되는 1종의

15 산화제;

²⁾(2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-일)옥실, 4-아세트아미도-2,2,6,6-
테트라메틸피페리딘 1-옥실, 4-하이드록시-2,2,6,6-테트라메틸피페리딘 1-
옥실, 4-메타크릴로일옥시-2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-옥실, 4-옥소-
2,2,6,6-테트라메틸-1-피페리디닐옥시, 4-아미노-2,2,6,6-

20 테트라메틸피페리딘-1-옥실, 4-카르복시-2,2,6,6-테트라메틸피페리딘 1-
옥실, 4-하이드록시-2,2,6,6-테트라메틸피페리딘 1-옥실 벤조에이트, 4-(2-
아이오도아세트아미도)-2,2,6,6-테트라메틸-1-피페리디닐옥시, 4-
말레이미도-2,2,6,6-테트라메틸-1-피페리디닐옥시, 4-이소티오시아나토-
2,2,6,6-테트라메틸피페리딘 1-옥실, 4-메톡시-2,2,6,6-테트라메틸-1-
25 피페리디닐옥시, 및 4-포스포노옥시-2,2,6,6-테트라메틸-1-피페리디닐옥시
중에서 선택되는 1종의 촉매; 또는

상기 1) 중에서 선택되는 1종의 산화제 및 2) 중에서 선택되는 1종의
촉매의 혼합물;의 존재 하에 수행되는 것인, 제조 방법.

【청구항 12】

제12항에 있어서,

상기 단계 3의 산화는 (다이아세톡시요오드)벤젠 및 상기 (2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-일)옥실의 혼합물의 존재 하에 수행되고,

- 5 상기 (다이아세톡시요오드)벤젠 및 상기 (2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-일)옥실의 혼합물은, 상기 화학식 5로 표시되는 화합물 및 상기 (다이아세톡시요오드)벤젠의 몰비가 10:1 내지 1:10을 만족함과 동시에, 상기 화학식 5로 표시되는 화합물 및 상기 (2,2,6,6-테트라메틸피페리딘-1-일)옥실의 몰비가 10:1 내지 1:10을 만족하도록
10 혼합된 것인, 제조 방법.

【청구항 13】

제1항에 있어서,

- 상기 단계 3의 반응 용매는 다이클로로메탄, 다이클로로에탄,
15 아세트니트릴, 에틸아세테이트, 메탄올, 톨루엔, 다이메틸포름아미드, 다이메틸설폭사이드, 테트라하이드로퓨란 또는 이들 중 2 이상의 혼합물인, 제조 방법.

【청구항 14】

- 20 제1항에 있어서,

상기 단계 3의 반응 온도는 10 내지 40 °C인, 제조 방법.

【청구항 15】

제1항에 있어서,

- 25 상기 단계 4의 반응 용매는 메탄올, 에탄올, 아이소프로판올, 다이클로로메탄, 다이클로로에탄, 테트라하이드로퓨란, 에틸아세테이트, 다이메틸 에테르, 아세트니트릴 또는 이들 중 2 이상의 혼합물인, 제조 방법.

【청구항 16】

제1항에 있어서,

상기 단계 4에서, 상기 화학식 6으로 표시되는 화합물 및 상기 메틸아민의 반응 온도는, 10 내지 30°C인, 제조 방법

5

【청구항 17】

제1항에 있어서,

상기 단계 4의 환원제는, 수소화붕소나트륨,

나트륨시아노보로하이드리드, 나트륨 트리아세톡시보로하이드라이드, 또는

10 이들 중 2 이상의 혼합물인, 제조 방법.

【청구항 18】

제1항에 있어서,

상기 단계 4에서, 상기 환원제 및 중간체의 반응 온도는 -5 내지

15 10°C인, 제조 방법.

【청구항 19】

제1항에 있어서,

상기 단계 4에서, 상기 화학식 6으로 표시되는 화합물 및 상기

20 메틸아민의 몰비는 10:1 내지 1:10 이고, 상기 화학식 6으로 표시되는 화합물 및 상기 환원제의 몰비는 10:1 내지 1:10인, 제조 방법.

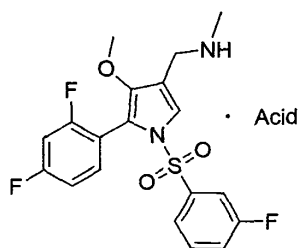
【청구항 20】

제1항에 있어서,

25 상기 단계 4 이후에,

5) 상기 화학식 1로 표시되는 화합물에 산을 가하여, 하기 상기 화학식 1-1로 표시되는 산성 염을 제조하는 단계;를 더 포함하는, 제조 방법:

[화학식 1-1]



【청구항 21】

제20항에 있어서,

- 5 상기 단계 5는, 상기 화학식 1로 표시되는 화합물에 유기 용매;를 공급한 뒤 산 또는 이의 유기 용매와의 혼합 용액;을 공급하여, 상기 화학식 1-1로 표시되는 산성 염을 결정화하는 단계를 포함하는 것인, 제조 방법.

10 【청구항 22】

제21항에 있어서,

상기 결정화 온도는 -15 내지 20 °C인, 제조 방법.