

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07D 409/12	(11) 공개번호 특 1989-0017247
	(43) 공개일자 1989년 12월 15일
(21) 출원번호 특 1989-0007044	
(22) 출원일자 1989년 05월 25일	
(30) 우선권주장 8812342.7 1988년 05월 25일 미국(US)	
(71) 출원인 미합중국, 델라웨어 19897, 윌밍톤, 콘코드 파아크 앤드 뉴 머피로드 슈와쯔 존 안토니	
(72) 발명자 영국, 맥클레스필드, 케서, 프레스트베리, 볼린유스 10 나영환, 윤동열	
(74) 대리인 나영환, 윤동열	

심사청구 : 없음

(54) 이환식 화합물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

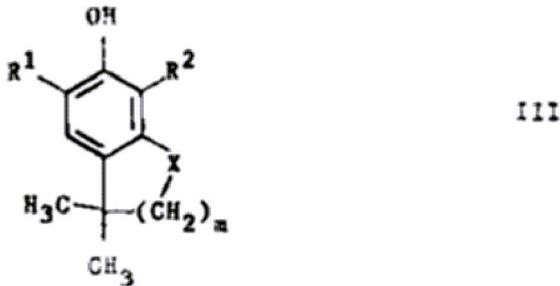
이환식 화합물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

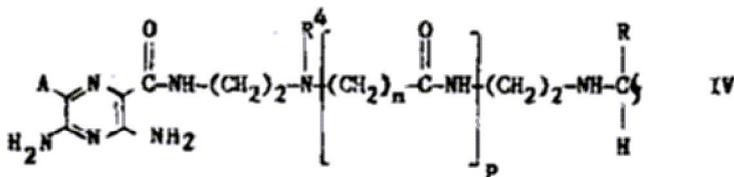
(57) 청구의 범위

청구항 1

하기식(III)의 화합물 또는 그 약학적 허용염.



상기식에서, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 중 하나는 Z가 클로로, 브로모, 요오드, 트리플루오로메틸, 메틸설포닐 또는 R<sup>10</sup>과 R<sup>11</sup>이 각각 수소 또는 (1-5C) 알킬인식 -SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>의 아미노 설포닐이고; R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 중 하나는 하기식(IV)의 그룹이고, X는 메틸렌, 산소 또는 황이고, 및 m은 1, 2 또는 3이다.



상기식에서, A는 클로로 또는 브로모이고, R<sup>4</sup>는 수소 또는 (1-5C)알킬이고, n은 1 또는 2이고, P는 0 또는 1이고, 및 R는 수소 또는 메틸이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 상기 R<sup>4</sup>, R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>이 각각 수소, 메틸, 에틸 또는 프로필인 것을 특징으로 하는 화합물.

**청구항 3**

제1항에 있어서, 상기 R<sup>4</sup>가 메틸인 것을 특징으로 하는 화합물.

**청구항 4**

제1항에 있어서, 상기 Z가 브로모인 것을 특징으로 하는 화합물.

**청구항 5**

제1항에 있어서, 상기 A가 클로로인 것을 특징으로 하는 화합물.

**청구항 6**

제2항에 있어서, 상기 R<sup>4</sup>가 메틸이고, Z가 브로모이고, A가 클로로인 것을 특징으로 하는 화합물.

**청구항 7**

제1항에 있어서, 3,5-디아미노-N-[2-[[2-[[[(6-브로모-2,3-디히드로-5-히드록시-1,1-디메틸-1H-인덴-4-일)메틸]아미노]에틸]메틸아미노]에틸]-6-클로로파라진카르복사아미드 또는 그 약학적 허용 염인 화합물.

**청구항 8**

제1항에 있어서, 3,5-디아미노-N-[2-[[2-[[[(9-브로모-2,3,4,5-테트라히드로-8-히드록시-5,5-디메틸-1-벤조제핀-7-일)메틸]아미노]에틸]메틸아미노]에틸]-6-클로로파라진카르복사아미드 또는 그 약학적 허용 염인 화합물.

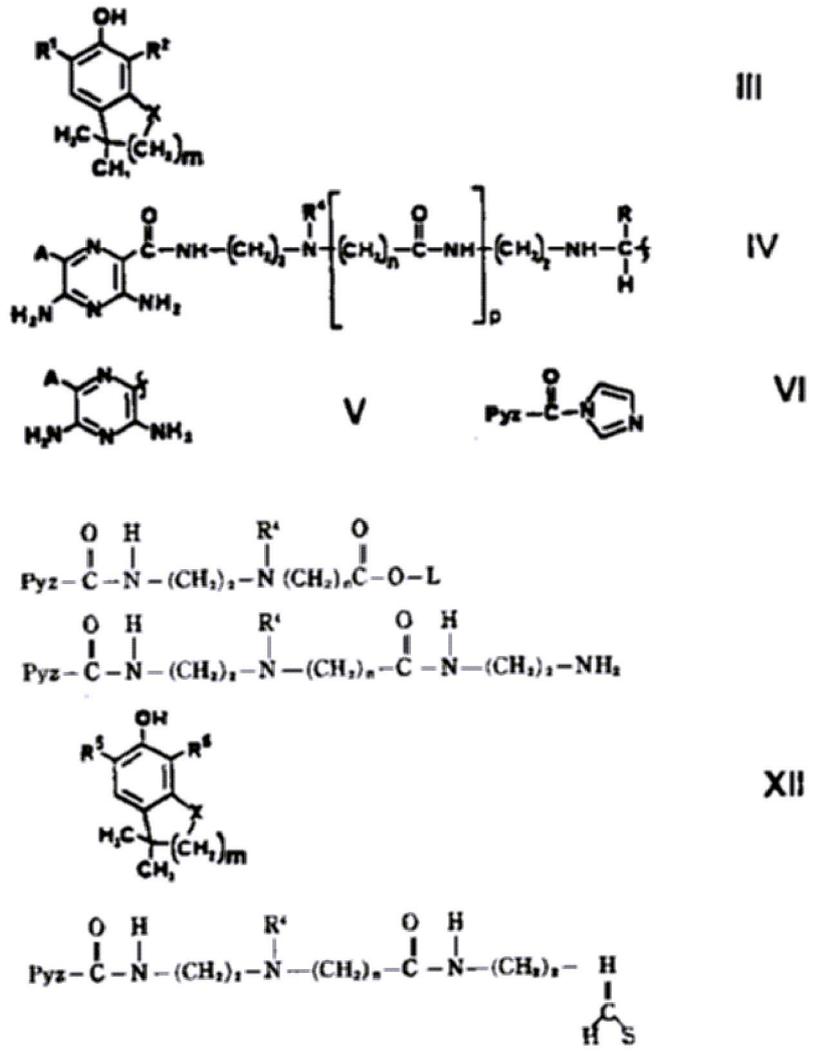
**청구항 9**

유칼레믹(eukalemic)이노제 함량을 갖는 제1항의 화합물 또는 그 약학적 허용염 및 약학적 허용 희석제 또는 담체를 포함하는 약학적 조성물.

**청구항 10**

(A) 하기식(XI)의 상응 아민을 R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 식 RCO-의 그룹을 갖는 하기식(XII)의 카르보닐 화합물로 환원적으로 알킬시키는 방법. (B) 하기식(XI)의 상응 아민을 R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 식 RCHCl-의 그룹을 갖는 하기식(XII)의 벤질 할라이드로 알킬화시키는 방법. (C) 하기식(XI)의 아민 및 식 RCHO의 알데히드를 R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지의 하나가 수소인 하기식(XII)의 화합물로 반응시키는 방법. (D) Z가 클로로, 브로모 또는 요오드인 식(III)의 화합물을 제조하기 위해, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 수소이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 하기식(IV)의 그룹을 갖는 하기식(II)의 상응 화합물을 할로겐화시키는 방법. (E) R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 하기식(IV)의 그룹이고 또한 R<sup>9</sup>가 저급알킬인 하기식(XVII)의 상응 아릴에테르를 적당한 O-디알킬화제로 O-디알킬화시키는 방법. (F) P=1인 하기식(III)의 화합물을 제조하기 위해, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 식 H<sub>2</sub>N-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-NH-CHR-의 그룹을 갖는 하기식(XII)의 상응 아민을 L이 저급알킬기인 하기식(IX)의 에스테르로 아실화시키는 방법. (G) D=1인 하기식(III)의 화합물을 제조하기 위하여, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 하기식(XVII)의 그룹을 갖는 하기식(XII)의 상응 중간체 아민을 적당한 유기금속 시약으로 처리하는 방법, 또는 (H) P=0인 하기식(III)의 화합물을 제조하기 위해, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 하나가 라디칼 Z이고, R<sup>5</sup> 및 R<sup>6</sup>의 나머지 하나가 식 H<sub>2</sub>N-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N(R<sup>4</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-NH-CHR-인 하기식(XII)의 아민을 하기식(VI)의 피라지노일 이미다졸로 아실화시키는 방법; 및 이후에 약학적 허용염이 필요한 경우 하기식(III)의 화합물을 산을 부여하는 약리학적 허용 음이온과 반응시키는 것을 특징으로 하는 제1항

내지 제9항중 어느 한 항에 기술된 하기식(III)의 화합물 또는 그 약학적 허용염을 제조하는 방법.



상기식에서, Pyz는 식(V)와 동일하며; m, n, p, A, L, X, Z, R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 보다 구체적으로 정의된 것을 제외하고는 제1항에 있어서, 정의된 바와 같다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.