

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.³
C07D 207/06
C07C 87/455

(11) 공개번호 특1983-0010065
(43) 공개일자 1983년 12월 26일

(21) 출원번호 특1982-0001506
(22) 출원일자 1982년 04월 06일
(30) 우선권주장 81-10709 1981년 04월 06일 영국(GB)
(71) 출원인 너 부츠 캄파니 피 엘시 데렉 노르만 에드먼슨
영국 노팅햄, 탄 로오드 웨스트 1
(72) 발명자 제임스 에드워드 제퍼리
영국 노팅햄, 칠웰, 그린랜드 크레센트 81
안토닌 코즈릭
영국 노팅햄, 클리프톤, 클리프톤 그로브, 호커우드 4
에릭 찰스 윌름셀스트
영국 노팅햄, 웨스트 브리지포드, 하로우로오드 117
(74) 대리인 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 치료제의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

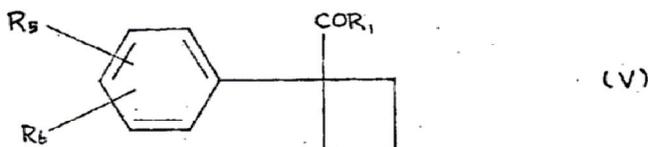
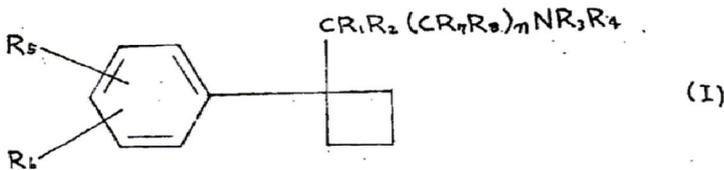
치료제의 제조방법

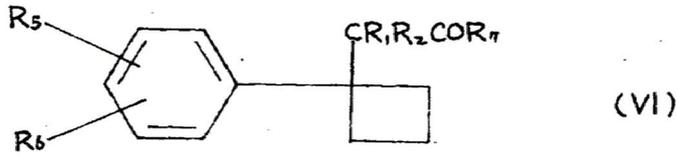
본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

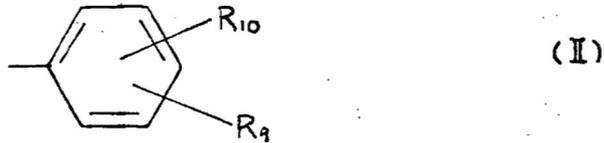
청구항 1

일반식(V)의 케톤을 환원적 아미드화하여 n=0, R₂=H, R₄=CHO 인 일반식(I)화합물을 제조하거나 일반식(VI)의 케톤 또는 알데하이드를 환원적 아미드화하여 n=1, R₄=CHO, R₆=H인 일반식(I)화합물을 제조함을 특징으로 하여 일반식(I)의 화합물 및 그의 약제학적으로 허용할 수 있는 염을 제조하는 방법.





상기식에서, $n=0$ 또는 1이며, $n=0$ 일때, R_1 은 1내지 6개의 탄소원자를 함유하는 직쇄 또는 측쇄 알킬그룹, 3내지 7개의 탄소원자를 함유하는 사이클로알킬그룹, 사이클로알킬알킬그룹, (이때 사이클로알킬그룹은 3내지 6개의 탄소원자를 함유하며 알킬그룹은 1내지 3개의 탄소원자를 함유한다). 2내지 6개의 탄소원자를 함유하는 알케닐 또는 알키닐 그룹, 또는 다음 일반식(II)의 그룹이며,

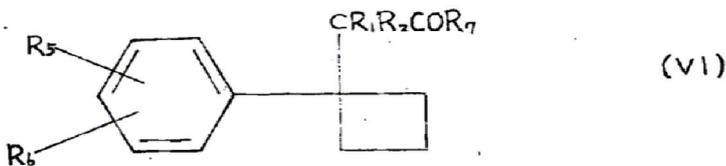
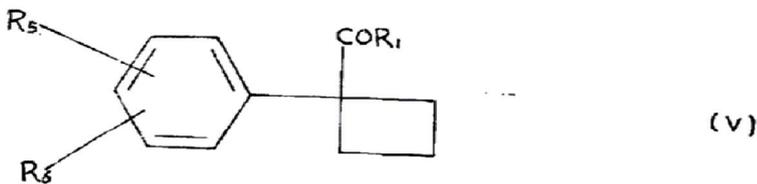
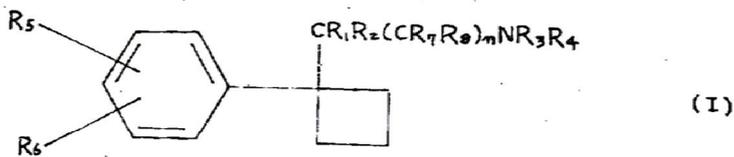


이때, R_9 와 R_{10} 은 같거나 다를 수 있으며 H, 할로 또는 1내지 3개의 탄소원자를 가지는 알콕시그룹이다.

$n=1$ 일때, R_1 은 H 또는 1내지 3개의 탄소원자를 함유하는 알킬그룹이며, R_2 는 H 또는 1내지 3개의 탄소원자를 함유하는 알킬그룹이고, R_3 와 R_4 는 같거나 다를수 있으며, H, 1내지 4개의 탄소원자를 함유하는 알케닐그룹, 3내지 6개의 탄소원자를 가지는 알키닐그룹, 환이 3내지 7개의 탄소원자를 함유한 직쇄 또는 측쇄 알킬그룹, 3내지 6개의 탄소원자를 함유하는 사이클로알킬그룹, 일반식 $R_{11}CO$ 그룹(이때 R_{11} 은 H이다)이거나, R_3 및 R_4 는 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께 환중에 5 또는 6개의 원자를 가지는 임의 치환된 헤테로사이클환을 형성하는데 이때 환은 질소원자 이외에 다른 헤테로원자를 함유할 수도 있으며; R_5 와 R_6 는 같거나 다를수 있으며, H, 할로, 트리플루오로메틸, 1내지 3개의 탄소원자를 가지는 알킬그룹, 1내지 3개의 탄소원자를 함유하는 알콕시 또는 알킬티오그룹, 페닐그룹이거나, R_5 및 R_6 는 이들이 결합된 탄소원자와 함께 하나이상의 할로그램, 1내지 4개의 탄소원자를 함유하는 알킬 또는 알콕시그룹에 의해 임의 치환된 제2의 벤젠환을 형성하거나 제2벤젠환의 치환체는 이들이 결합되어 있는 2개의 탄소원자와 함께 또 다른 벤젠환을 형성할 수 있으며, R_7 과 R_8 은 같거나 다를수 있으며, H 또는 1내지 3개의 탄소원자를 함유하는 알킬그룹이다.

청구항 2

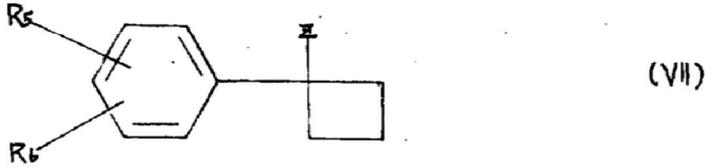
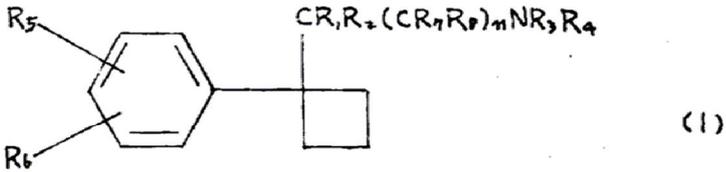
일반식(V)의 케톤을 환원적 아민화하여 $n=0$, $R_2=H$ 인 일반식(I) 화합물을 제조하거나 일반식(VI)의 케톤 또는 알데하이드를 환원적 아민화하여 $n=1$, $R_2=H$ 인 일반식(I) 화합물을 제조함을 특징으로 하여 일반식(I) 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, $n, R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7$ 및 R_8 은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 3

일반식(VII)의 화합물을 환원시킴을 특징으로 하여 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈ 은 제1항에서 정의된 바와 같고,

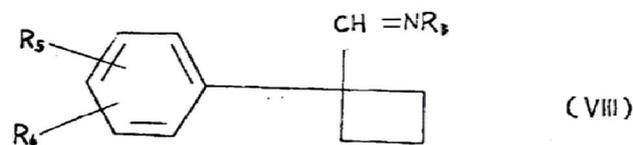
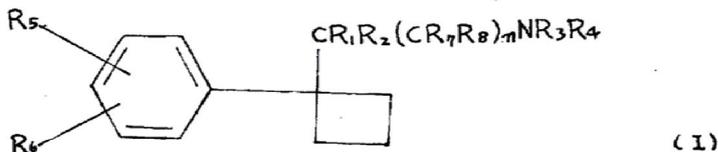
- a) Z 가 일반식 -CR₁=NOH그룹 또는)그외 에스테르 또는 에테르인 경우, n=0이고 R₂, R₃ 및 R₄가 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고,
- b) Z 가 일반식 -CR₁=NR₃의 그룹인 경우, n=0이고 R₂ 및 R₄가 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고
- c) Z 가 일반식 -CR₁=NY의 그룹(Y는 유기금속 시약으로부터 유도된 금속함유 잔기를 나타낸다)인 경우, n=0이고 R₂, R₃ 및 R₄ 가 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고
- d) Z 가 일반식 -CR₁R₂CN의 그룹인 경우, n=1이고 R₃, R₄, R₇ 및 R₈이 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고
- e) Z 가 일반식 -CR₁R₂CR₇=NOH 또는 그의 에스테르 또는 에테르인 경우, n=1이고, R₂, R₄ 및 R₈이 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고
- f) Z 가 일반식 -CR₁R₂CR₇=NR₃의 그룹인 경우 n=1이고, R₄ 및 R₈이 H인 일반식(I)의 화합물이 수득되고
- g) Z 가 일반식 -CR₁R₂CR₃CR₇=NY(Y는 유기금속 시약으로부터 유도된 금속함유잔기를 나타낸다)의 그룹인 경우, n=1이고 R₃, R₄ 및 R₈은 H인 일반식(I)의 화합물이 수득된다.
- h) Z 가 일반식 -CR₁R₂CONR₃R₄의 그룹인 경우, n=1이고 R₇ 및 R₈은 H인 일반식(I)의 화합물이 수득된다.

청구항 4

제3항에 있어서, Y가 MgBr 또는 Li임이 특징인 방법.

청구항 5

유기금속 시약을 일반식(VII)의 이민과 반응시킨후 생성물을 가수분해 시킴을 특징으로하여 n이 0인 일반식(I)화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

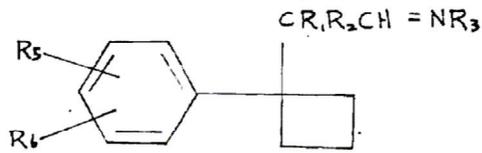
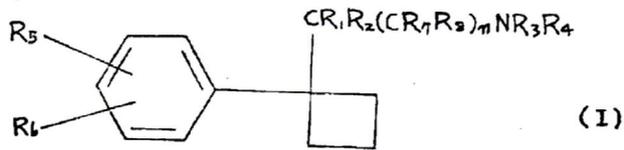
청구항 6

제5항에 있어서, 유기금속 시약이 일반식 R₁MgBr인 그리나드 시약이거나 일반식 R₁Li인 유기리튬 화합물 임이 특징인 방법.

청구항 7

유기금속 시약을 일반식(IX)의 이민과 반응시킨후 생성물을 가수분해시킴을 특징으로하여 n이 1인 일반

식(1) 화합물을 제조하는 방법.



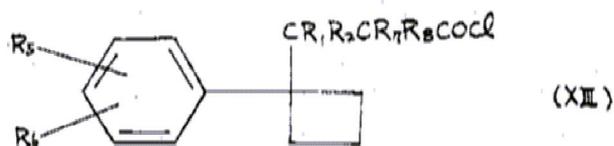
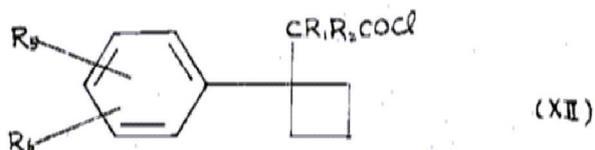
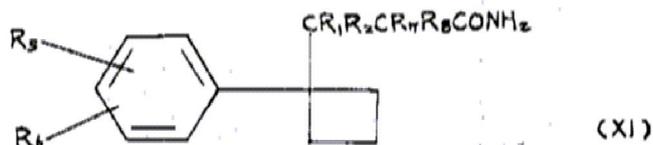
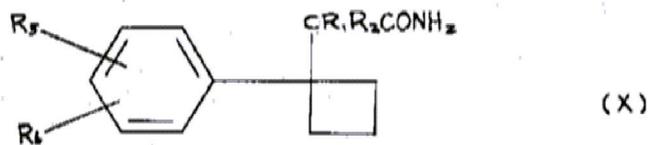
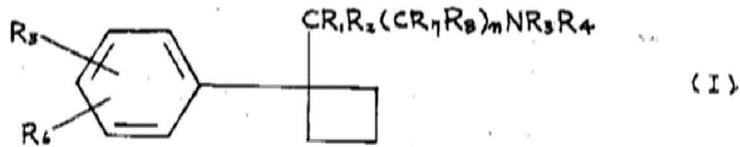
상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 8

제7항에 있어서, 유기 금속 시약이 일반식 R₇MgBr인 그리나드 시약이거나 일반식 R₇Li인 유기리튬 화합물이 특징인 방법.

청구항 9

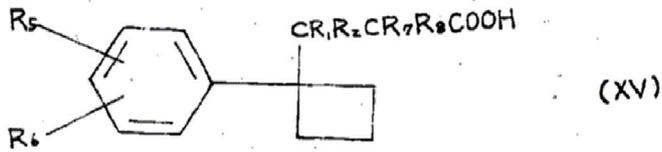
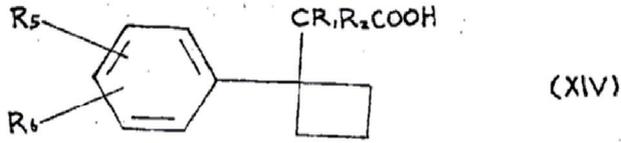
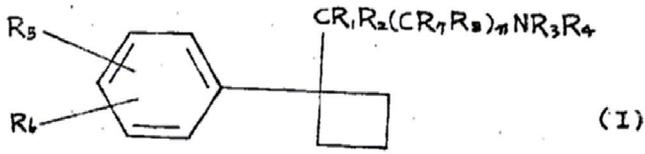
일반식(X)의 아미드를 탈카복실화적으로 전위시켜 n=0인 일반식(1)의 아민을 제조하거나, 일반식(XI)의 아미드를 탈카복실화적으로 전위시켜 n=1인 일반식(1)의 아민을 제조하거나, 나트륨 이자이드를 일반식(XII)의 산 클로라이드와 반응시켜 생성된 아실아자이드를 탈카복실화적으로 전위시켜 n=0인 일반식(1)의 아민을 제조하거나, 나트륨 이자이드를 일반식(XIII)의 산 클로라이드와 반응시켜 생성된 아실 아자이드를 탈카복실화적으로 전위시켜 n=1인 일반식(1)의 아민을 제조함을 특징으로하여 일반식(1)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 10

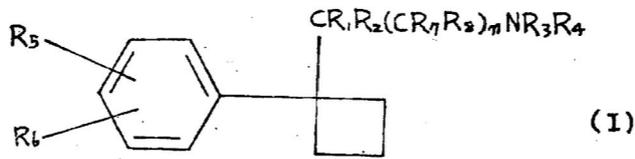
하이드라조 산을 일반식(XIV)의 카복실산과 반응시켜 n=0인 일반식(I)의 아민을 제조하거나, 하이드라조 산을 일반식(XV)의 카복실산과 반응시켜 n=1인 일반식(I)의 아민을 제조함을 특징으로 하여 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 11

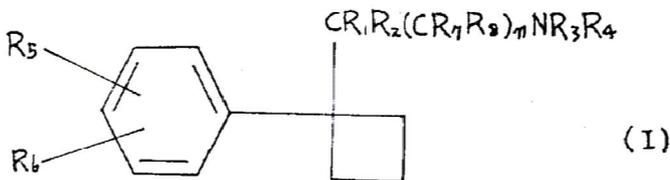
R₄가 -CHO인 일반식(I)화합물을 가수분해 시킴을 특징으로 하여 R₄가 수소인 일반식(I)화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 12

R₄가 -CHO인 일반식(I)화합물을 환원시킴을 특징으로 하여 R₄가 메틸인 일반식(I)화합물을 제조하는 방법.

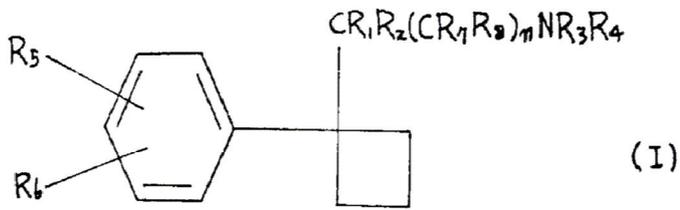


상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

청구항 13

R₃ 및 R₄중의 하나 또는 둘다 수소인 일반식(I)화합물을 목적하는 화합물로 전환시킴을 특징으로 하여

R₃ 및 R₄중의 하나 또는 둘다 수소이외의 기인 일반식 (I)화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ 및 R₈은 제1항에서 정의된 바와 같다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.