

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C07C 87/28  
C07C 101/24

(11) 공개번호 특 1983-0008984  
(43) 공개일자 1983년 12월 16일

(21) 출원번호	특 1982-0000615
(22) 출원일자	1982년 02월 12일
(30) 우선권 주장	939/81-9 1981년 02월 12일 스위스(CH)
(71) 출원인	시바-가이키 에이지 아놀드 자일러
	스위스연방 4002 바슬 클리벡 스트라세 141 시바-가이키 에이지 에른스트 알레르
(72) 발명자	스위스연방 4002 바슬 클리벡 스트라세 141 칼 부허
	스위스연방 4054 바슬 빌란드플라츠 2 막스 마터
	스위스연방 4052 바슬 린덴베크 3 베른하르트 브루너
	스위스연방 3626 휘니바흐 제가르텐 알프레드 프레이
	스위스연방 3600 툰 오베레 하우프트가세 8
(74) 대리인	이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 치환된 지방족 2급 아민 및 이의 염의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

치환된 지방족 2급 아민 및 이의 염의 제조방법

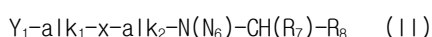
[도면의 간단한 설명]

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

다음 일반식(II)의 화합물을 다음 일반식(III)의 화합물과 축합시키거나, 다음 일반식(VI)의 화합물 또는 이의 염에서 Y<sub>3</sub>'를 일반식 -CH(R<sub>2</sub>)-N(R<sub>3</sub>)-alk<sub>1</sub>-의 그룹으로 전환시키고 X'를 메틸렌으로 전환시키고/시키거나 Y<sub>4</sub>'를 일반식 -alk<sub>2</sub>-N(R<sub>6</sub>)-CH(R<sub>7</sub>)-의 그룹으로 전환시키고, 필요한 경우 수득된 이성체 혼합물을 분리시키고, 필요한 경우 수득된 화합물을 다른 일반식(I) 화합물로 전환시키고/시키거나, 필요한 경우 수득된 유리화합물을 염으로 전환시키거나 수득된 염을 유리화합물 또는 다른 염으로 전환시켜 다음 일반식(I)의 화합물 및 이의 염을 제조하는 방법.



상기 일반식에서

$R_1$ 은 비치환 또는 치환된 페닐이고

$R_2$ 는 수소, 저급알킬, 비치환 또는 치환된 페닐, 또는 유리 또는 에스테르화된 카복시이고

$R_3$ 는 수소 또는 저급알킬이고

$R_4$ 는 일반식  $-alk_1-X-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-R_8$ 의 그룹이고

$alk_1$  및  $alk_2$ 는 저급알킬리덴이고

$X$ 는 직접결합, 메틸렌 또는 비치환 또는 치환된 페닐렌이고

$R_6$ 는 수소이거나  $R_3$ 가 수소일 경우 저급알킬 또는 비치환 또는 치환된 페닐-저급알킬일 수 있고

$R_7$ 는 수소, 저급알킬, 비치환 또는 치환된 페닐, 또는 유리 또는 에스테르화된 카복시이고

$R_8$ 은 비치환 또는 치환된 페닐이며

(단,  $X$ 가 비치환 또는 치환된 페닐렌인 일반식(I)화합물에서

$R_2, R_3, R_6$  및  $R_7$ 이 수소 또는 저급알킬인 경우

$R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 비치환 또는 N-치환아미노알콕시페닐이 아니고,

$alk_1$  및  $alk_2$ 가 메틸렌이고  $X$ 가 메틸렌 또는 직접결합인 일반식(I)화합물에서,

$R_2, R_3, R_6$  및  $R_7$ 이 수소인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 비치환된 페닐, 또는 메톡시 및/또는 염소로 일-또는 이치환된 페닐, 또는 P-하이드록시 페닐이 아니고,

$alk_1$  및  $alk_2$ 가 메틸렌이고  $X$ 가 직접결합인 일반식(I)화합물에서,

$R_2$  및  $R_7$ 가 모두 수소이거나 모두 비치환된 페닐이거나, 모두 메틸이거나  $R_2$ 가 메틸이고  $R_7$ 이 수소인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 비치환된 페닐이 아니거나

$R_3$  및  $R_6$ 중 적어도 하나는 수소가 아니고,

$R_2, R_3, R_6$  및  $R_7$ 이 수소이고  $X$ 가 메틸렌인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 은 비치환된 페닐이 아니거나 3-, 4-, 5- 및/또는 6-위치에서 이소프로필, 메톡시, 하이드록시, 염소, 디에틸아미노, 디메틸아미노 및/또는 니트로로 일-, 이-, 삼-, 또는 사-치환된 페닐이 아니고,

$R_2, R_3, R_6$  및  $R_7$ 이 수소이고  $X$ 가 직접결합인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 은 P-아닐리노, P-하이드록시페닐 또는 P-메틸페닐이 아니고,

$R_2$  및  $R_7$ 이 수소이고  $R_3$  및  $R_6$ 가 수소 또는 저급알킬이며

$X$ 가 메틸렌 또는 직접 결합인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 은 P-아미노페녹시페닐 또는 P-니트로페녹시페닐이 아니다.)

$Y_1$  및  $Y_2$  중 하나는 친핵치환가능 그룹  $Y$ 이고 다른 하나는  $-N(R_3)-H$ 그룹이고

$Y_3$ 는 일반식  $-CH(R_2)-N(R_3)-alk_1-$ 의 그룹으로 전환될 수 있는 라디칼  $Y_3'$ 이고

$X'$ 는 그룹  $X$ 이거나, 메틸렌으로 전환될 수 있는 라디칼  $X'$ 이거나

$Y_3$ 는 일반식  $-CH(R_2)-N(R_3)-alk_2-$ 의 그룹이고

$X'$ 는 메틸렌으로 전환될 수 있는 라디칼이고

$Y_4$ 는 일반식  $-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-$ 그룹이거나 이 그룹으로 전환될 수 있는 라디칼  $Y_4'$ 이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서,  $Y$ 가 반응성 에스테르화 하이드록시(예 : 할로겐)인 일반식(II) 또는 (III) 화합물, 또는  $Y_3'$ 가 일반식  $-C(=Y)-N(R_3)-alk_1-$ ,  $-CH(R_2)N(R_3)-C(=Y_6)-$ ,  $-C(Y_5)(R_2)-N(R_3)-alk_1-$ ,  $-CH(R_2)-N(R_3)-alk_1'-$ ,  $-C(R_2)=N-alk_1-$  또는  $-CH(R_2)-N=alk_1'-$ 의 그룹이고  $X'$ 가  $-CH(Y_5)-$ 그룹 또는  $-C(=Y_6)-$ 그룹이고/이거나  $Y_4'$ 가 일반식  $-alk_2-N(R_6)-C(=Y_6)-$ ,  $-C(=Y_6)-N(R_6)-CH(R_7)-$ ,  $-alk_2-N(R_6)-C(Y_5)(R_7)-$ ,  $-alk_2'-N(R_6)-CH(R_7)-$ ,  $alk_1'=N-C(R_7)-$  또는  $alk_1'=N-CH(R_7)-$ 의 그룹이고  $Y_5$ 가 1가 라디칼이고  $Y_6$ 가 수소로 치환될 수 있는 2가 라디칼이고  $alk_1'$  및  $alk_2'$ 는  $Y_5$  및  $Y_6$  중 적어도 하나로 치환된 저급알킬리덴 라디칼이고  $alk_1'$ 는 저급알킬

리딘이고  $Y_5$ 는 변형되지 않거나 기능적으로 변형된 하이드록시 또는 메르캅토 그룹이고  $Y_6$ 는 옥소, 또는 이중결합을 통해 결합된, 기능적으로 변형된 옥소인 일반식(IV)의 화합물을 출발물질로서 사용하는 방법.

### 청구항 3

제1항에 있어서,  $Y_3$ 가 일반식  $-C(=O)-N(R_3)-alk_1$  또는  $-CH(R_2)-N(R_3)-C(=O)-$ 의 그룹이고  $Y_4$ 가  $-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-$ ,  $alk_2-N(R_6)-C(=O)-$  또는  $-C(=O)-N(R_6)-CH(R_7)-$ 의 그룹이며 옥소그룹이 메틸렌으로 환원된 일반식(VI)의 화합물; 또는  $Y_3$ 가 일반식  $-C(R_2)=N-alk_1-$ 의 그룹이고  $Y_4$ 가 일반식  $-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-$  또는  $-alk_2-N=C(R_7)-$ 의 그룹이며 C-N 이중결합이 환원된 일반식(VI)의 화합물; 또는  $R_6$ 가  $R_3$ 와 동일하고  $alk_2$ 가  $alk_1$ 과 동일한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해,  $Y_2'$ 가 할로겐인 일반식  $Y_2'-CH(R_7)-R_6$ 의 화합물(V)을  $Y_1$  및  $Y_1'$ 가 각각  $-N(R_3)-H$ 그룹이고  $alk_2$ 가  $alk_1$ 과 동일한 일반식  $Y_1-alk_1-X-alk_2-Y_1'$ 의 화합물(IV)과 반응시키고 과량의 일반식(V)화합물을 분리, 제거한 후 생성된  $Y_1$ 이  $H-N(R_3)-$ 그룹이고  $alk_2$ 가  $alk_1$ 과 동일하며  $R_6$ 와  $R_3$ 가 동일한 일반식(II)의 중간물질을  $Y_2$ 가 그룹 Y인 일반식(III)의 화합물과 반응시키거나, 일반식  $H-N(R_3)-alk_1-X'-Y_4-R_6$ 의 화합물(VIII)을 환원조건하에 일반식  $(R_1)(R_2)C(=O)$ 의 화합물(VIII)과 반응시키거나,  $Y_2$ 가  $-N(R_3)-H$  그룹인 일반식(III)의 화합물을  $alk'$ 가 저급 알킬리딘인 일반식  $O=alk'-X-Y_4-R_6$ 의 화합물(XIV)과 반응시키고 생성된,  $Y_3$ 가 일반식  $-C(OH)(R_2)-N(R_3)-alk_1-$  또는  $-CH(R_2)-N(R_3)-alk_1-$ 의 그룹이고  $alk_1'$ 이  $\alpha$ -하이드록시-저급알킬리덴인 일반식(VI)의 중간물질을 분리시키지 않고 환원시킴을 특징으로 하고; 또는  $R_7$ 이  $R_2$ 와 동일하고  $R_6$ 이  $R_1$ 과 동일한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해,  $Y_1$ 이  $-N(R_3)-H$ 그룹이고  $Y_2$ 가  $-N(R_6)-H$  그룹인 일반식  $Y_1-alk_1-X-alk_2-Y_2$ 의 화합물(IV)을 환원조건하에 일반식  $(R_1)(R_2)C(=O)$ 의 화합물(XIII) 2배몰량과 반응시키고 생성된,  $Y_3$ 가 일반식  $-C(OH)(R_2)-N(R_3)-N(R_6)-alk_1-$  또는  $-C(R_2)=N-alk_1-$ 의 그룹이고  $X'$ 가 그룹 X이고  $Y_4$ 가 일반식  $-alk_2-N(R_6)-C(OH)(R_2)-$  또는  $alk_2-N-C(R_2)-$ 의 그룹이며  $R_6$ 이  $R_1$ 과 동일한 일반식(VI)의 중간물질을 분리시키지 않고 환원시킴을 특징으로 하고; 또는  $R_6$ 가  $R_3$ 와 동일하고  $R_7$ 이  $R_2$ 와 동일하며  $R_6$ 이  $R_1$ 과 동일한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해,  $alk'$ 가 같거나 다른 저급알킬리딘 그룹인 일반식  $O=alk'-X-alk'-O$ 의 화합물(XV)을 환원조건하에  $Y_2$ 가  $-N(R_3)-H$  그룹인 일반식  $R_1-CH(R_2)-Y_2$ 의 화합물(III) 2배몰량과 반응시키고 생성된 일반식(VI)의 중간물질을 분리시키지 않고 환원시킴을 특징으로 하는 방법.

### 청구항 4

제1 내지 3항중 하나에 있어서, 기의 정의가 다음과 같은 일반식(VI)의 화합물, 일반식(II) 및 (III)의 화합물, 일반식(V) 및 (VI)의 화합물, 일반식(VII) 및 (XIII)의 화합물, 일반식(III) 및 (XIV)의 화합물 또는 일반식(IV) 및 (XIII)의 화합물을 출발물질로서 사용하는 방법 :

$R_1$ 은 비치환된 페닐; 또는 저급알킬, 저급알케닐, 저급알킬닐, 모노- 또는 디-하이드록시-저급알킬, 저급알콕시-저급알킬, 저급알카노일옥시-저급알킬, 3- 내지 8원 사이클로알킬, 하이드록시, 저급알콕시, 저급알케닐옥시, 저급알킬닐옥시, 모노- 또는 디-하이드록시-저급알콕시, 저급알콕시-저급알콕시 근접한 탄소원자에 결합된 저급알킬렌디옥시(또는 저급알킬리덴디옥시), 원자번호 35이하의 할로겐, 저급알카노일옥시, 아미노, 모노- 또는 디-저급알킬아미노 및/또는 모노 또는 디-저급알카노일아미노로 치환된 페닐이고

$R_2$ 는 수소, 저급알킬, 비치환된 페닐;  $R_1$ 에 기술된 바와 같이 치환된 페닐; 저급알콕시카보닐, 또는 3 내지 8원 사이클로알콕시 카보닐이고

$R_3$ 는 수소, 저급알킬이고

$R_4$ 는 일반식  $-alk_1-X-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-R_6$ 의 그룹이고

$alk_1$  및  $alk_2$ 는 저급알킬리덴이고

X는 메틸렌, 직접 결합, 비치환된 페닐렌; 또는 저급알킬, 저급알콕시, 할로겐 및/또는 트리플루오로 메틸로 치환된 페닐렌이고

$R_6$ 는 수소 또는 저급알킬이고

$R_7$ 는 수소, 저급알킬, 비치환된 페닐,  $R_2$ 에서 기술한 바와 같이 치환된 페닐, 저급알콕시카보닐, 또는 3원 내지 8원 사이클로알콕시카보닐이고,

$R_6$ 은 비치환된 페닐 또는  $R_1$ 에서 기술한 바와 같이 치환된 페닐이며

(단,  $alk_1$  및  $alk_2$ 가 메틸렌이고 X가 메틸렌 또는 직접결합인 일반식(I)화합물에서,

$R_2, R_3, R_6$  및  $R_7$ 이 수소인 경우,

$R_1$  및  $R_6$ 중 적어도 하나는 비치환된 페닐, 또는 메톡시 및/또는 염소로 일- 또는 이-치환된 페닐, 또는 P-하이드록시페닐이 아니고,

$alk_1$  및  $alk_2$ 가 메틸렌이고 X가 직접 결합인 일반식(I)화합물에서,

$R_2$  및  $R_7$ 이 모두 수소이거나 모두 비치환된 페닐이거나 모두 메틸이거나  $R_2$ 가 에틸이고  $R_7$ 이 수소인 경우,  
 $R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 비치환된 페닐이 아니거나  $R_3$  및  $R_6$ 중 적어도 하나는 수소가 아니고,  
 $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_6$  및  $R_7$ 이 수소이고  $X$ 가 메틸렌인 경우,  
 $R_1$  및  $R_8$ 은 비치환된 페닐, 또는 3-, 4-, 5- 및/또는 6-위치에서 이소프로필, 메톡시, 하이드록시, 염소, 디에틸아미노 및/또는 디메틸아미노로 일-, 이-, 삼- 또는 사치환된 페닐이 아니고,  
 $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_6$  및  $R_7$ 이 수소이고  $X$ 가 직접 결합인 경우,  
 $R_1$  및  $R_8$ 은 P-아닐리노, P-하이드록시페닐 또는 P-메틸페닐이 아니다.)  
 $Y_1$ ,  $Y_2$  및  $X'$ 는 제1 또는 3항에서 정의한 바와 같고  
 $Y$ 는 제1 또는 2항에서 정의한 바와 같고  
 $Y_3$  및  $Y_4$ 는 제1, 2 또는 3항에서 정의한 바와 같고  
 $Y_1'$ ,  $Y_2'$  및  $alk$ 는 일반식(I) 화합물을 생성할 수 있도록 제3항에서 정의한 바와 같고  
 $R_1, R_2, R_3, R_4, alk_1, alk_2$ ,  $X$ ,  $R_6$ ,  $R_7$  및  $R_8$ 은 전술한 바와 같다.

## 청구항 5

제1 내지 3항중 하나에 있어서, 기의 정의가 다음과 같은 일반식(VI)의 화합물, 일반식(II) 및 (III)의 화합물, 일반식(V) 및 (IV)의 화합물, 일반식(VII) 및 (XIII)의 화합물, 일반식(III) 및 (XIV)의 화합물, 또는 일반식(IV) 및 (XII)의 화합물을 출발물질로서 사용하는 방법.

$R_1$ 은 비치환된 페닐; 또는 탄소수 4이하의 저급알킬(예 : 메틸) 및/또는 원자번호 35이하의 할로겐(예 : 염소)으로 치환된 페닐이고

$R_2$ 는 수소, 비치환된 페닐; 또는  $R_1$ 에 기술된 바와 같이 치환된 페닐이고

$R_3$ 는 수소, 탄소수 4까지의 저급알킬(예 : 메틸)이고

$R_4$ 는  $-CH_2-X-CH_2-R_5$ 의 그룹이고

$X$ 는 메틸렌, 직접결합 또는 비치환된 페닐렌이고

$R_5$ 는 아미노 또는 일반식  $-N(R_6)-CH(R_7)-R_8$ 의 치환된 아미노이고

$R_6$ 는 수소이거나,  $R_3$ 가 수소일 경우 탄소수 4이하의 저급알킬(예 : 메틸)일 수 있고,

$R_7$ 은 수소, 탄소수 4이하의 저급알킬(예 : 메틸), 비치환된 페닐,  $R_1$ 에서 기술한 바와 같이 치환된 페닐, 알킬부위가 탄소수 4이하인 저급알콕시카보닐(예 : 메톡시카보닐)이고

$R_8$ 은 비치환된 페닐 또는  $R_1$ 에서 기술한 바와 같이 치환된 페닐이며

(단,  $X$ 가 메틸렌 또는 직접결합인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 비치환된 페닐, 또는 염소로 일- 또는 이-치환된 페닐이 아니거나

$R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_6$  및  $R_7$  중 적어도 하나는 수소가 아니고,

$R_2$  및  $R_7$ 이 모두 수소이거나 모두 비치환된 페닐이거나  $X$ 가 직접 결합인 경우,

$R_1$  및  $R_8$  중 적어도 하나는 비치환된 페닐이 아니거나

$R_3$  및  $R_6$ 중 적어도 하나는 수소가 아니고,

$R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_6$  및  $R_7$ 이 수소이고  $X$ 가 메틸렌인 경우,

$R_1$  및  $R_8$ 중 적어도 하나는 P-메틸페닐이 아니고, 또한 비치환된 페닐, 또는 3-, 4-, 5- 및/또는 6-위치에서 이소프로필 및/또는 염소로 일-, 이-, 삼- 또는 사-치환된 페닐이 아니다.)

$Y$ ,  $Y_2$  및  $X'$ 는 제1 또는 3항에서 정의한 바와 같고

$Y$ 는 제1 또는 2항에서 정의한 바와 같고

$Y_3$  및  $Y_4$ 는 제1, 2 또는 3항에서 정의한 바와 같고

$Y_1'$ ,  $Y_2'$  및  $alk'$ 는 일반식(I) 화합물을 생성할 수 있도록 제3항에서 정의한 바와 같고

$R_1, R_2, R_3, R_4, alk_1, alk_2$ ,  $X$ ,  $R_6$ ,  $R_7$  및  $R_8$ 은 전술한 바와 같다.

#### 청구항 6

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-비스-(디페닐메틸)-1,3-프로필렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 7

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-비스-(디페닐메틸)-p-크실렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 8

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N-디페닐메틸-N'-(1-페닐에틸)-에틸렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 9

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N-디페닐메틸-N'-( $\alpha$ -메톡시카보닐벤질)-에틸렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 10

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-비스-(디페닐메틸)-m-크실렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 11

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-비스-(디페닐메틸)-m-크실렌디아민 및 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 12

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-디-(O-메틸벤질)-에틸렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 13

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-디벤질-N-메틸-에틸렌디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

#### 청구항 14

제1 내지 3항중 하나에 있어서, N,N'-디벤질-N'-디페닐메틸-에틸렌 디아민 또는 이의 산부가염을 제조하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.