

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.³

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) 우선권주장 939/81-9 1981년 02월 12일 스위스(CH)

(71) 출원인 시바-가이기 에이지 아놀드 자일러

스위스연방 4002 바슬 클리벡 스트라세 141시바-가이기 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 휴니바흐 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

영세서

[발명의 명칭]

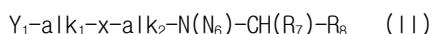
치환된 지방족 2급 아민 및 이의 염의 제조방법

[도면의 간단한 설명]

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위**청구항 1**

다음 일반식(I)의 화합물을 다음 일반식(III)의 화합물과 축합시키거나, 다음 일반식(VI)의 화합물 또는 이의 염에서 Y_3' 를 일반식 $-CH(R_2)-N(R_3)-alk_1-$ 의 그룹으로 전환시키고 X' 를 메틸렌으로 전환시키고/시키거나 Y_4' 를 일반식 $-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-$ 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 은 수소 또는 저급알킬이고

R_4 는 일반식- $aIk_1-X-aIk_2-N(R_6)-CH(R_7)-R_8$ 의 그룹이고

aIk_1 및 aIk_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 은 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,

aIk_1 및 aIk_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,

aIk_1 및 aIk_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 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 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 $-CH(R_2)-N(R_3)-aIk_1-$ 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 $-CH(R_2)-N(R_3)-aIk_2-$ 의 그룹이고

X' 는 메틸렌으로 전환될 수 있는 라디칼이고

Y_4 는 일반식 $-aIk_2-N(R_6)-CH(R_7)-$ 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 $-C(Y)-N(R_3)-aIk_1$, $-CH(R_2)N(R_3)-C(Y_6)-$, $-C(Y_5)(R_2)-N(R_3)-aIk_1-$, $-CH(R_2)-N(R_3)-aIk_1'-$, $-C(R_2)=N-aIk_1-$ 또는 $-CH(R_2)-N=aIk_1'-$ 의 그룹이고 X' 가 $-CH(Y_5)-$ 그룹 또는 $-C(Y_6)-$ 그룹이고/이거나 Y_4' 가 일반식 $-aIk_2-N(R_6)-C(Y_6)-$, $-C(Y_6)-N(R_6)-CH(R_7)-$, $-aIk_2-N(R_6)-C(Y_5)(R_7)-$, $-aIk_2'-N(R_6)-CH(R_7)-$, $aIk'=N-C(r_7)-$ 또는 $aIk'=N-CH(R_7)-$ 의 그룹이고 Y_5 가 1가 라디칼이고 Y_6 가 수소로 치환될 수 있는 2가 라디칼이고 aIk_1' 및 aIk_2' 는 Y_5 및 Y_6 중 적어도 하나로 치환된 저급알킬리딘 라디칼이고 aIk' 는 저급알킬

리디이고 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-N이중결합이 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 $Y_2'-CH(R_7)-R_8$ 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 과 R_3 과 동일한 일반식(II)의 중간물질을 Y_2 가 그룹 Y 인 일반식(III)의 화합물과 반응시키거나, 일반식 $H-N(R_3)-alk_1-X'-Y_4-R_8$ 의 화합물(IV)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_1' 가 저급 알킬리딘인 일반식 $O=alk_1'-X-Y_4-R_8$ 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 α -하이드록시-저급알킬리덴인 일반식(VI)의 중간물질을 분리시키지 않고 환원시킴을 특징으로 하고; 또는 R_7 이 R_2 와 동일하고 R_8 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 $-C(OH)(R_2)-N(R_3)-N(R_3)-alk_1-$ 또는 $-C(R_2)=N-alk_1-$ 의 그룹이고 X' 가 그룹 X 이고 Y_4 가 일반식 $-alk_2-N(R_3)-C(OH)(R_2)-$ 또는 $alk_2-N-C(R_2)-$ 의 그룹이며 R_8 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_8 이 R_1 과 동일한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해, alk_1' 가 같거나 다른 저급알킬리딘 그룹인 일반식 $O=alk_1'-X-alk_1'-O$ 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, 저급알키닐, 모노- 또는 디-하이드록시-저급알킬, 저급알콕시-저급알킬, 저급알카노일옥시-저급알킬, 3- 내지 8원 사이클로알킬, 하이드록시, 저급알콕시, 저급알케닐옥시, 저급알카노일옥시, 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 $-alk_1-X-alk_2-N(R_6)-CH(R_7)-R_8$ 의 그룹이고

alk_1 및 alk_2 는 저급알킬리덴이고

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

R_5 는 수소 또는 저급알킬이고

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

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

(단, 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 이-치환된 페닐, 또는 P-하이드록시페닐이 아니고,

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

R_2 및 R_7 이 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 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 저급알록시카보닐(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'-(α -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-(0-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.