(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. CI. ⁶	(11) 공개번호 특1993-0023366
C07D 471/04	(43) 공개일자 1993년12월18일
(21) 출원번호 (22) 출원일자	특 1993-0009381 1993년05월27일
(30) 우선권주장 (71) 출원인	92-136819 1992년05월28일 일본(JP) 다나베세이야꾸 가부시끼가이샤 지바따 이찌로
(72) 발명자	일본국 오오사까후 오오사까시 쥬오꾸 도쇼오마찌 3쬬메 2방 10고 야마다 고이찌로
	일본국 사이다마껭 미나미사이따마군 시라오까마찌 신시라오까 3쬬메 34반 찌 7
	히꼬따 마사따까
	일본국 사이따마껭 시끼시가시와쬬 2쬬메 16방 19고
	유라 다께시
	일본국 효오고껭 다까라즈까시 나까노쬬 7방 1고 수미레 맨션 203고
	시까노 도시로
	일본국 사이따마껭 오미야시 기따부꾸로쬬 2쬬메 385반찌
	나가사끼 마사끼
(74) 대리인	일본국 사이따마껭 우라와시 시라하따 4쬬메 1방 24-803고 이준구, 박해선

심사청구 : 없음

(54) ß-카르볼린 유도체

요약

[식중, R^1 은 수소원자, 저급 알킬기, 저급 알콕시기 또는 히드록시기를 나타내고; R^3 는 수소원자를 나타내거나 또는, R^1 및 R^3 는 결합하여 저급 알킬렌디옥시기를 나타내고; R^2 는 수소원자, 할로겐원자, 저급 알콕시기 또는 히드록시기를 나타내며; R^3 는 수소원자, 카르바모일 저급 알킬기, 저급 알킬기, 카르복시 저급 알킬기 또는 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬기를 나타내고; R^4 는 수소원자, 저급 알킬기, 카르복시 저급 알킬기, 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬기, 저급 알카노일기, 아릴카르보닐기, 저급 알칸술포닐기, 저급 알콕시카르보닐기, 아르알킬기, 포르밀기 또는 디 (저급 알킬) 술파모일기를 나타내며; R^3 는 0,1 또는 2를 나타내고; 기호*는 부제 탄소 원자를 나타낸다.]

상기 식으로 표시되는 β -카르볼린 화합물 또는 약제학적으로 허용가능한 그의 염 및 그의 제조방법을 개시한다.

명세서

[발명의 명칭]

β-카르볼린 유도체

본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & (CH_{2})_{0} & R^{3} \\
R^{5} & NHCO & N \\
N & R^{4}
\end{array}$$
(I)

[식중, R^1 은 수소원자, 저급 알킬기, 저급 알콕시기 또는 히드록시기를 나타내고; R^5 는 수소원자를 나타내거나, 또는 R^1 및 R^5 는 결합하여 저급 알킬렌 디옥기시기를 나타내고; R^2 는 수소원자, 할로겐원자, 저급 알콕시기 또는 히드록시기를 나타내며; R^3 는 수소원자, 카르바모일 저급 알킬기, 저급 알킬기, 자급 알킬기, 자금 알킬기, 다른 나타내고; 기호*는 부제 탄소원자를 나타낸다.]

상기 식으로 표시되는 β-카르볼린 화합물 또는 약제학적으로 허용가능한 그의 염.

청구항 2

제 1항에 있어서, 식 (1)의 화합물이 부제 탄소원자*를 기본으로 하는 광학 이성질체인 화합물.

청구항 3

제 1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 저급 알킬기, 저급 알콕시기 또는 히드록시기이고, R^2 가 수소원자 또는 할로겐 원자이며, R^3 가 수소원자, 저급 알킬기, 카르복시 저급알킬기 또는 저급 알콕시카르보닐 저급알킬기이며, R^4 가 수소원자, 저급 알킬기 또는 저급 알카노일기이고, R^5 가 수소원인 화합물.

청구항 4

제 3항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 저급 알콕시기이고, R^2 가 수소원자 또는 할로겐 원자이며, R^3 가 수소원자, 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬기이고, R^4 가 수소원자 또는 저급 알카노일기이며, R^5 가 수소원자 인 화합물.

청구항 5

제 4항에 있어서, R^1 은 수소원자 또는 메톡시기이고, R^2 가 수소원자 또는 불소원자이며, R^3 가 수소원자, 메틸기 또는 메톡시카르보닐 메틸기이고, R^4 가 수소원자 또는 아세틸기이며, R^5 가 수소원자인 화합물.

청구항 6

제 5항에 있어서, R^1 이 메톡시기이고 R^2 가 불소원자이며, R^3 가 메틸기이고, R^4 가 아세틸기이며, R^5 가 수소 원자인 화합물.

청구항 7

제 6항에 있어서, n이 0인 화합물.

청구항 8

$$\mathbb{R}^{\frac{1}{2}} \xrightarrow{(CH_2)_n} \mathbb{R}^{\frac{3}{2}}$$

$$\mathbb{R}^{\frac{5}{2}} \xrightarrow{(CH_2)_n} \mathbb{R}^{\frac{3}{2}}$$

[식중 R^{1} , R^{2} , R^{3} , R^{4} , R^{5} , n 및 *는 제 1항에서 정의한 바와 동일한 의미를 갖는다.]

상기 식(Ⅱ)로 표시되는 아민 화합물 또는 그의 염과 상기식 (Ⅲ)으로 표시되는 카르복실산 화합물. 그의 반응성 유도체 또느 그의 염과 반응시키고, 필요하다면 수득한 화합물을 약제학적으로 허용가능한 그의 염으로 전환시키는 것을 포함하는 제 1항 기재의 화합물(Ⅰ) 또는 그의 약제학적으로 허용가능한 염의 제조방법.

청구항 9

 R^4 가 수소원자인 화합물(I)과 저급 알카노일화제를 반응시키는 것을 포함하는 R^4 가 저급 알코노일기인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 10

 R^4 가 저급 알카노일기인 화합물(I)을 탈아실화 하는 것을 포함하는 R^4 가 수소원자인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 11

하나 이상의 R^1 및 R^2 가 저급 알콕시기인 화합물(I)을 탈알킬화하는 것을 포함하는 하나 이상의 R^1 및 R^2 가 히드록시기인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 12

하나 이상의 R^3 및 R^4 가 수소원자인 화합물(I)을 저급 알킬화제, 카르복시 저급 알킬화제 또는 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬화제와 반응시키는 것을 포함하는 하나 이상의 R^3 및 R^4 가 저급 알킬기, 카르복시 저급알킬기 또는 저급 아콕시카르보닐 저급 알킬기인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 13

하나 이상의 R^3 및 R^4 가 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬기인 화합물(I)을 가수분해 하는 것을 포함하는 하나 이상의 R^3 및 R^4 가 카르복시 저급 알킬기인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 14

하나 이상의 R^3 및 R^4 가 카르복시 저급 알킬기인 화합물(I)을 에스테르화 하는 것을 포함하는 하나 이상의 R^3 및 R^4 가 저급 알콕시카르보닐 저급 알킬기인 제 1항 기재의 화합물(I)의 제조방법.

청구항 15

통상의 약제학적으로 허용가능한 담체 또는 희석제와 혼합된 제 1항 기재의 화합불(I)의 치료학적 유효량을 함유하는 약제학적 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.