

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07D 498/06	(11) 공개번호 특1991-0000744	(43) 공개일자 1991년01월30일
(21) 출원번호 특1990-0008392		
(22) 출원일자 1990년06월08일		
(30) 우선권주장 364420 1989년06월09일 미국(US)		
(71) 출원인 미합중국 뉴저지 08876 서머빌 루트 202-206 노스 그레고리 마이클 슈츠케	도널드 알. 토르센	
(72) 발명자 미합중국 뉴저지 08873 서머셋 세다브룩 드라이브 47 이병호, 최달용		
(74) 대리인		

심사청구 : 없음

(54) 4, 5, 5a, 6- 테트라하이드로-3H- 이속사졸로[5, 4, 3, -k1] 아크리딘 유도체, 이의 제조 방법 및 약제로서의 이의 용도

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

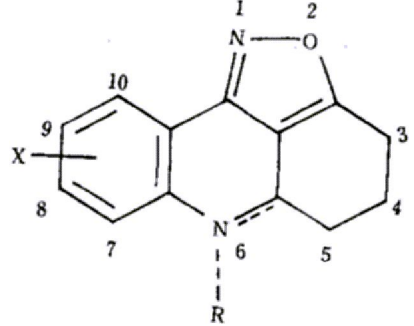
4, 5, 5a, 6-테트라하이드로-3H-이속사졸로[5,4,3-k1]아크리딘 유도체, 이의 제조방법 및 약제로서의 이의 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

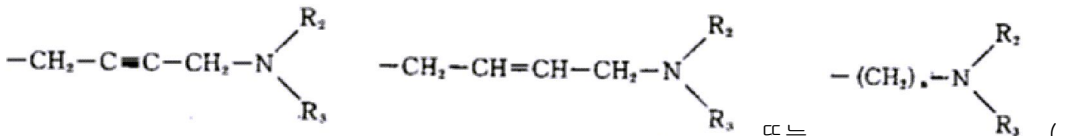
청구항 1

일반식(1)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 산 부가염.

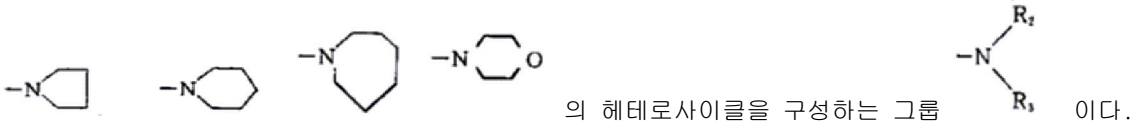


상기식에서, X는 수소, 저급 알킬, 저급알콕시, 할로겐 또는 트리플루오로메틸이고, R은 존재할 경우 수

소, 저급알킬, 알릴, 아릴 저급 알킬.  $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{Cl}$  또는  $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}-\text{R}_1$  [여기서, R<sub>1</sub>은 저급알킬, -



CH<sub>2</sub>C=CH, 여기서, n은 2, 3 또는 4이고 R<sub>2</sub> 및 R<sub>3</sub>는 독립적으로 저급알킬이다)]이거나 전체로서 구조식



**청구항 2**

제1항에 있어서, X가 수소인 화합물.

**청구항 3**

제2항에 있어서, R1이 부재이거나 수소, 알릴, 벤질, 플루오로벤질, 또는 구조식  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{Cl} \end{matrix}$  또는  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  (여기서, R1은 상기에서 정의한 바와 같다)의 그룹인 화합물.

**청구항 4**

제3항에 있어서, 그룹  $\begin{matrix} \text{R}_2 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}_3 \end{matrix}$  가 전체로서 구조식 또는 의 헤테로사이클인 화합물.

**청구항 5**

제1항에 있어서, 4, 5-디하이드로-3H-이속사졸로 [5, 4, 3-k1] 아크리딘인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 산 부가염.

**청구항 6**

제1항에 있어서, 4, 5, 5a, 6-테트라하이드로-3H-이속사졸로 [5, 4, 3-k1] 아크리딘인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 산 부가염.

**청구항 7**

제1항에 있어서, 6-에틸아미노카보닐-4, 5, 5a, 6-테트라하이드로-3H-이속사졸로 [5, 4, 3-k1] 아크리딘인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 산 부가염.

**청구항 8**

제1항에 있어서, N-[2-(4-모르폴리닐)틸-4, 5, 5a, 6-테트라하이드로-3H-이속사졸로 [5, 4, 3-k1] 아크리딘-6-카복사미드인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 산 부가염.

**청구항 9**

활성성분으로서 제1항에 따른 화합물 및 이의 적합한 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

**청구항 10**

진통 및/또는 기억 증진 활성을 갖는 약제를 제조하기 위한 제1항에 따른 화합물의 용도.

**청구항 11**

a) 일반식(II)의 화합물을 구조식 HN3의 하이드라조산과 양성자산 존재하 반응시켜 일반식(Ia)의 화합물을 수득하고, b) 임의로 일반식(Ia)의 화합물을 NaCNBH4와 반응시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 수소인 일반식(I)의 화합물을 수득하며, c) 임의로 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 수소인 일반식(I)의 화합물과 일반식(c)의 화합물을 반응시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 저급알킬, 알릴 또는 아릴저급알킬인 일반식(I)의 화합물을 수득하고, d) 임의로 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 수소인 일반식(I)의 화합물을 포스겐과 반응시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 COCl인 일반식(I)의 화합물을 수득하며, e) 임의로 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 -COO인 일반식(I)의 화합물을 일반식(d)의 아민 또는 일반식(e)의 이소시아네이트와 반응시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 -CONHR1(여기서, R1은 상기에서 정의한 바와 같다)인 일반식(I)의 화합물을 수득하고, f) 임의로 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 -CO-NH-CH2-C=CH인 일반식(I)의 화합물을 포름알데하이드 및 일반식(f)의

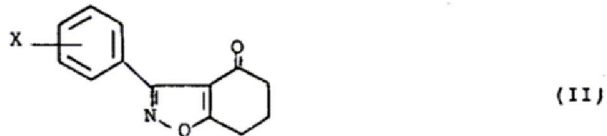
2급 아민과 반응시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 그룹  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  (여기서, R1은  $\begin{matrix} \text{R}_2 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}_3 \end{matrix}$  이다)인 일반식(I)의 화합물을 수득하며, g) 임의로 X는 상기에서 정의한

바와 같고 R은  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  [여기서, R<sub>1</sub>은  $-\text{CH}_2-\text{C} \begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{CH}_2 \end{matrix}$  여기서, R<sub>2</sub> 및 R<sub>3</sub>은 상기에서 정의한 바와 같다)이다] 인 일반식(1)의 화합물을 적당한 촉매 존재하 수소화 알루미늄 리튬 또는 수소를

사용하여 환원시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고 R은 그룹  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  (여기서, R<sub>1</sub>은  $-\text{CH}_2-\text{C} \begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{CH}_2 \end{matrix}$  이다)인 일반식(1)의 화합물을 수득하고, h) 임의로 X는 상기에서 정의한

바와 같고, R은 그룹  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  [여기서, R<sub>1</sub>은  $-\text{CH}_2-\text{C} \begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{CH}_2 \end{matrix}$  (여기서, R<sub>2</sub> 및 R<sub>3</sub>는 상기에서 정의한 바와 같다)이다] 인 일반식(1)의 화합물을 촉매적으로 수소화시켜 X는 상기에서 정의한 바와 같고

R은 그룹  $\begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{R}_1 \end{matrix}$  [여기서, R<sub>1</sub>은  $-\text{CH}_2-\text{C} \begin{matrix} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{CH}_2 \end{matrix}$  이다] 인 일반식(1)의 화합물을 수득함을 특징으로 하여, 제1항에 따른 화합물을 제조하는 방법.



- RHal (c)
- H<sub>2</sub>N-R<sub>1</sub> (d)
- R<sub>1</sub>NCO (e)
- $\begin{matrix} \text{R}_2 \\ \diagup \\ \text{HN} \\ \diagdown \\ \text{R}_3 \end{matrix}$  (f)

상기식에서, X는 상기에서 정의한 바와 같고, R은 저급알킬, 알릴 또는 아릴저급알킬이며, Hal은 염소

또는 브롬이고, R<sub>1</sub>은 저급알킬,  $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$  또는 일반식(1)에서 정의한 바와 같다)이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.