(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07D 401/12

(11) 공개번호 특1991-0015565
(43) 공개일자 1991년09월30일

(21) 출원번호 특1990-0002285
(22) 출원일자 1990년02월23일

(30) 우선권주장 19562A/89 1989년02월24일 이탈리아(IT)
(71) 출원인 발레아스 에스.피.에이
이탈리아공화국 밀라노 20133 비아 발리스네리 10
(72) 발명자 버길리오 베르나레기
이탈리아공화국 콜로그노 몬제세 21-20093 비알레 피아베
화우스토 보니화시오
이탈리아공화국 밀란 24-20127 비아 에스.에이.사울리
마우리지노 화노
이탈리아공화국 브레소 7-20091 비아 델 몰리노
루시아노 트라벨라
이탈리아공화국 피에베 델 카이로 35-27037 비아 벤조 벤조니
지안도메니코 바띠겔리
이탈리아공화국 바레기오 2-20010 비아 아이 마기오
다비데 몬타그나
이탈리아공화국 밀란 2-20159 비아 쟈코포 달 버메
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 헤테로사이클릭 알케닐산의 테트라졸 아미드 유도체 및 이들의 항알레르기성 물질로서의 용도

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

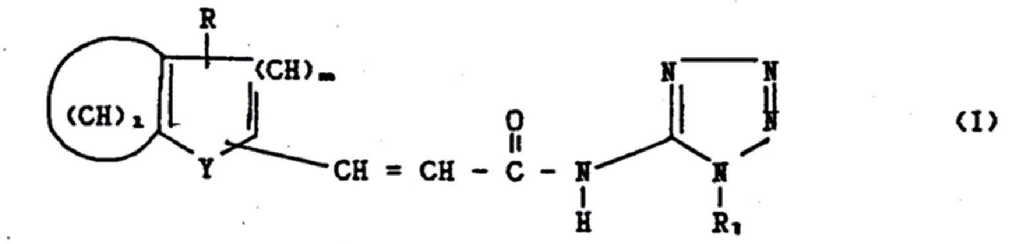
헤테로사이클릭 알케닐산의 테트라졸 아미드 유도체 및 이들의 항알레르기성 물질로서의 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(Ⅰ)의 헤테로사이클릭 알케닐산의 테트라졸 아미드 유도체.



(I)

상기식에서, m은 1 또는 2이고, Y는 m이 1일경우 NH, O 또는 S이며, m이 2일경우 N이고, ℓ은 0 또는 4이며, R은 H, C_{1-4} 알킬, Cl, Br, CF_3, CH_2OCOCH_2, 또는 OCH_2-Ph이고, R_1은 H, 알카리금속 또는 알카리토금속이며, 알케닐쇄의 이중결합은 트랜스 또는 시스 배위이고, 가능한 벤젠환은 비지환되거나 치환된다.

청구항 2

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-메틸-(2-티에닐)]]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 3

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-메틸-(2-티에닐)]]-아크릴아미드 트랜스 이성체 나트륨염인 유도체.

청구항 4

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(2-티에닐)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 5

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[5-브로모-(2-티에닐)]]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 6

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(3-티에닐)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 7

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-에틸-(3-티에닐)]]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 8

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(2-피롤)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 9

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(2-피리딜)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 10

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[6-클로로-2-피리딜)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 11

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(3-피리딜)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 12

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(4-피리딜)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 13

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(2-푸릴)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 14

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-메틸-(2-푸릴)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 15

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(3-인돌릴)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 16

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(2-퀴놀릴)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 17

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-(4-퀴놀릴)]-아크릴아미드 트랜스 이성체인 유도체.

청구항 18

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-메틸-(2-티에닐)]-아크릴아미드 시스 이성체인 유도체.

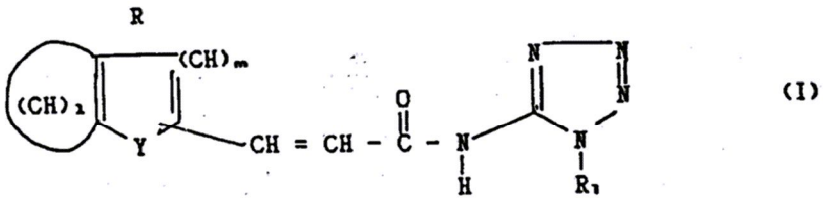
청구항 19

제1항에 있어서, N-1H-테트라졸-5-일-[3-[5-메틸-(2-푸릴)]-아크릴아미드 시스 이성체인 유도체.

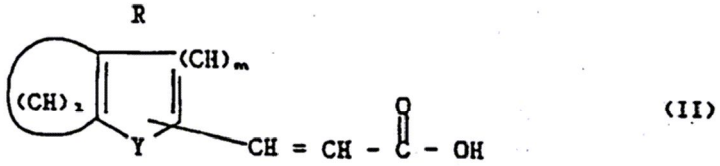
청구항 20

a)일반식(Ⅱ)의 헤테로사이클릭 알케닐산을 제조하고, b)일반식(Ⅱ)의 산을 5-아미노테트라졸과 직접 반응시켜 R_1이 H인 일반식(Ⅰ)을 수득하거나, 일반식(Ⅱ)의 산을 일반식(ⅩⅡ)의 개개 클로라이드로 전환시키며, c)언금된 클로라이드(ⅩⅡ)를 5-아미노테트라졸과 반응시켜 R_1이 H인 일반식(Ⅰ)을 수득하고, d)R_1이 H인 생성물(Ⅰ)을 가능하게 염화시킴을 특징으로 하여, 일반식(Ⅰ)의 테트라졸 아미드 유도체를 제조

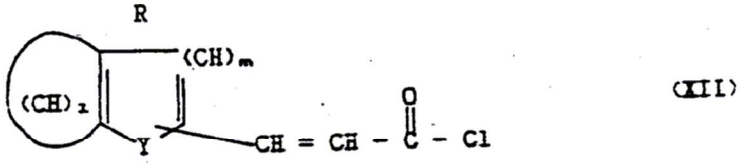
하는 방법.



(I)



(II)



(III)

상기식에서, m은 1 또는 2이고, Y는 m이 1일경우 NH, O 또는 S이며, m이 2일경우 N이고, ℓ은 0 또는 4이며, R은 H, C_{1-4} 알킬, Cl, Br, CF_3, CH_2OCOCH_3, 또는 OCH_2-Ph이고, R_1은 H, 알카리금속 또는 알카리토금속이며, 알케닐 쇄의 이중결합은 트랜스 또는 시스 배위이고, 가능한 벤젠환은 비지환되거나 치환된다.

청구항 21

제20항에 있어서, m이 1이고 알케닐 쇄의 이중결합이 트랜스 배위인 일반식(II)의 산은 알데하이드(III)를 피페리딘의 존재하에서 말론산으로 처리시켜 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 22

제21항에 있어서, 언급된 제조공정은 무수 피리딘중에서 일반식(III)에 대한 말론산의 몰비를 2 내지 2.5로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 23

제21항에 있어서, 언급된 제조공정은 80 내지 100℃의 온도에서 2 내지 8시간동안 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 24

제20항에 있어서, m이 1이고 알케닐 쇄의 이중결합이 트랜스 배위인 일반식(II)의 산은 알데하이드(III)을 아세트산 무수물 및 알카리성 아세테이트로 처리하여 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 25

제24항에 있어서, 언급된 제조공정은 일반식(III)에 대한 알카리성 아세테이트의 몰비를 1 내지 1.5로 수행하고 일반식(III)에 대한 아세트산 무수물의 몰비를 1.2내지 2로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 26

제24항항에 있어서, 언급된 제조공정은 90 내지 190℃의 온도에서 2 내지 7시간동안 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 27

제20항에 있어서, m이 2이고, ℓ이 0 또는 4이며, 알케닐 쇄의 이중결합이 트랜스 배위인 일반식(II)의 산은 메틸 유도체(V)를 Cl_3CCHO로 처리한 다음 가수분해시켜 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 28

제27항에 있어서, 언급된 처리공정은 일반식(V)에 대한 Cl_3CCHO의 몰비를 0.8 내지 1.5로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 29

제27항에 있어서, 언급된 제조공정은 60 내지 100℃의 온도에서 2 내지 40시간동안 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 30

제27항에 있어서, 언급된 제조공정은 40 내지 80℃의 온도에서 1 내지 4시간동안 과량의 알코올 KOH로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 31

제20항에 있어서, m이 1이고 알케닐 쇄의 이중결합이 시스 배위인 일반식(Ⅱ)의 산은 알데하이드(Ⅲ)을 말론산의 메틸 또는 에틸 모노에스테르로 처리하고 수득된 에스테르를 광화학 이성체화시킨 다음 비누화시켜 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 32

제31항에 있어서, 언급된 처리공정은 피페리단의 존재하에 무수 피리딘중에서 일반식(Ⅲ)에 대한 모노에스테르의 몰비를 1 내지 1. 5로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 33

제31항에 있어서, 언급된 처리공정은 60 내지 120℃의 온도에서 2 내지 6시간동안 수행함을 특징으로하는 방법.

청구항 34

제31항에 있어서, 언급된 이성체화 공정은 아세토니트릴, THF, 아세톤 또는 DMP 중에서 고압수은증기램프로 0. 5 내지 3시간동안 조사하여 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 35

제20항에 있어서, m이 2이고, ℓ이 0 또는 4이며, 알케닐 쇄의 이중결합이 시스 배위인 일반식(Ⅱ)의 산은 산(Ⅷ)을 상응하는 메틸 또는 에틸 에스테르로 전환시키고 이들을 이성체화시켜 알케닐 쇄의 이중결합이 시스 배위인 상용하는 에스테르를 수득한 다음 비누화시켜 제조함을 특징으로 하는 방법.

청구항 36

제35항에 있어서, 언급된 이성체화 공정은 아세토니트릴, THF, 아세톤 또는 DMF 중에서 고압수은증기램프로 0. 5 내지 4시간동안 조사하여 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 37

제20항에 있어서, 클로라이드(ⅩⅡ)와 5-아미노 테트라졸 사이의 반응은 유기용매중에서 일반식(ⅩⅡ)에 대한 5-아미노테트라졸의 몰비를 2 내지 2. 5로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 38

제37항에 있어서, 유기용매가 클로로포름, 벤젠 톨루엔, 테트라하이드로푸란, 디옥산 또는 디메틸포름아미드임을 특징으로 하는 방법.

청구항 39

제37항에 있어서, 언급된 반응은 40 내지 150℃의 온도에서 2 내지 7시간동안 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 40

제20항에 있어서, 산(Ⅱ)와 5-아미노테트라졸 사이의 직접 축합공정은 디사이클로헥실카보디이미드, 실리콘 테트라클로라이드 또는 카보닐 디이미다졸과 같은 축합제의 존재하에 유기용매중에서 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 41

제40항에 있어서, 용매가 테트라하이드로푸란, 피리딘 또는 디메틸포름아미드인 방법.

청구항 42

제40항에 있어서, 언급된 직접축합공정은 산(Ⅱ)에 대한 5-아미노테트라졸에 대한 몰비를 1 내지 1. 5로 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 43

제40항에 있어서, 언급된 직접축합공정은 40 내지 100℃의 온도에서 2 내지 10시간동안 수행함을 특징으로 하는 방법.

청구항 44

항알레르기성 활성을 갖는 약제조성물의 제조를 위한 일반식(Ⅰ)의 테트라졸 아미드 유도체의 용도.

청구항 45

약제분야에서 통상 사용되는 희석제 및 부형제와 함께 활성물질로서 일반식(Ⅰ)의 테트라졸 아미드 유도체 하나 이상을 함유함을 특징으로 하는 약제조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.