

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵
C07D 453/02

(11) 공개번호 특1991-0020009
(43) 공개일자 1991년12월19일

(21) 출원번호	특1991-0008106
(22) 출원일자	1991년05월18일
(30) 우선권주장	P4016212.5 1990년05월19일 독일(DE)
(71) 출원인	P40188868 1991년06월13일 독일(DE) 베링거 인겔하임 케이지 디이터 라우디엔 독일연방공화국 데-6507 인겔하임 암 라인베링거 인겔하임 케이지 루돌 프 호프만 독일연방공화국 데-6507 인겔하임 암 라인 (72) 발명자 게르하르트 발터 독일연방공화국 6530 빙겐 파러-헤버러-스트라세 37 울리케 쿠프너-뮐 독일연방공화국 6500 마인쯔 암 뤼베나커 5 베르너 스트란스키 독일연방공화국 6535 가우-알게샤임 임 히펠 24 칼-하인쯔 베버 독일연방공화국 6535 가우-알게샤임 카이저-칼-스트라세 11 헬무트 엔싱거 독일연방공화국 6507 인겔하임 암 라인 마그데부르거 스트라세 54 프란쯔 요셉 쿤 독일연방공화국 6535 가우-알게샤임 베토벤스트라세 11 엔지오 뮐러 독일연방공화국 6507 인겔하임 암 라인 그룬트스트라세 22 (74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 비사이클릭 1-아자-사이클로알칸

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

비사이클릭 1-아자-사이클로알칸

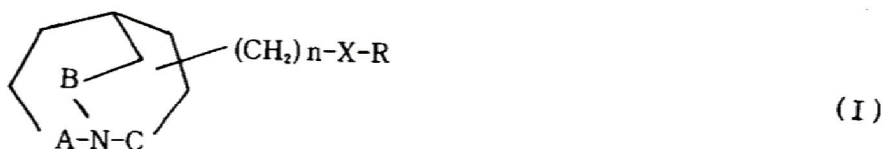
본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

임의로 라세미체, 에난티오머, 부분 입체 이성체 및 이의 혼합물 형태로 존재하는 일반식(I)의 비사이

클릭 1-아자-사이클로알칸, 및 임의로 약리학적으로 허용되는 이의 산 부가염 및 이의 4급 염.



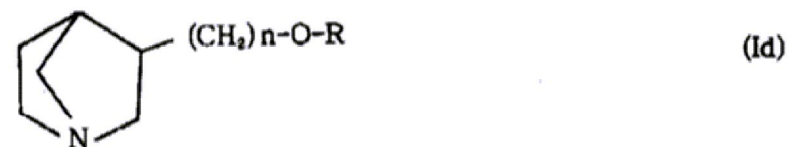
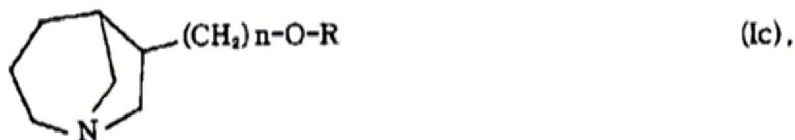
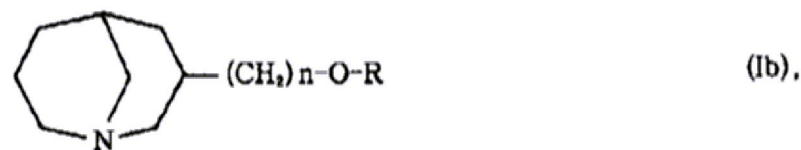
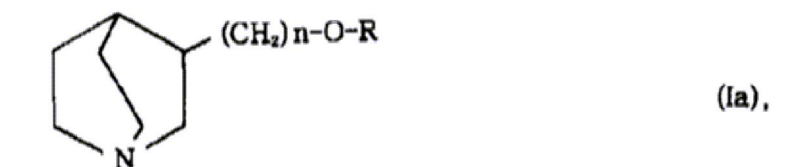
상기식에서, R은 C₁₋₆알킬 그룹, C₃₋₆알케닐 그룹 또는 C₃₋₆알키닐 그룹(이때, 알킬, 알케닐 또는 알키닐 그룹은 페닐, 치환된 페닐, 임의로 치환된 비페닐, 임의로 치환된 옥세탄 또는 임의의 치환된 5-, 6- 또는 7-원 헤테로 사이클릭 그룹에 의해 치환될 수 있다)이거나, 또는 임의로 치환된 페닐, 임의로 치환된 비페닐, 임의로 치환된 5-, 6- 또는 7-원 헤테로사이클릭 그룹이며; X는 산소 또는 황이고; A, B 및 C는 각기 독립적으로 CH₂ 또는 단일결합이며; n은 0, 1 또는 2이다.

청구항 2

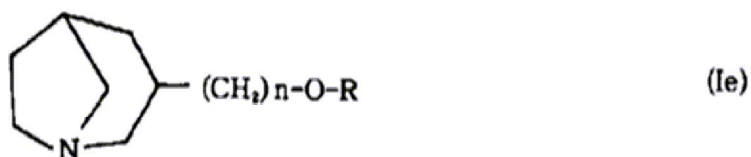
제1항에 있어서, X가 산소이고; n이 0 또는 1이며; 치환체(CH₂)_n-X-RO이 카보사이클릭 브릿지헤드(bridgehead)에 대해 α- 또는 β- 위치에 존재하고; R은 C₁₋₃알킬 그룹, C₃₋₄알케닐 그룹 C₃₋₄알키닐 그룹, 임의로 치환된 페닐 그룹 또는 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 그룹인, 임의로 라세미체, 에난티오머, 부분 입체 이성체 및 이의 혼합물로의 형태 존재하는 일반식 (I)의 비사이클릭 1-아자-사이클로알칸, 및 임의로 약리학적으로 허용되는 이의 산 부가염 및 이의 4급 염.

청구항 3

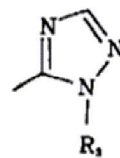
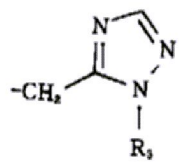
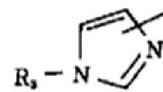
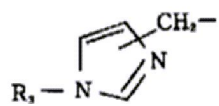
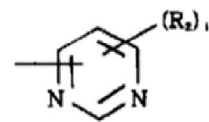
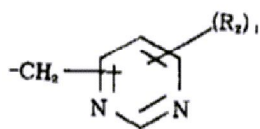
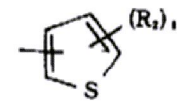
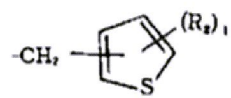
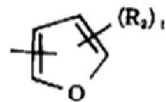
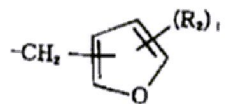
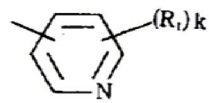
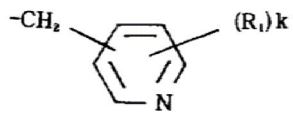
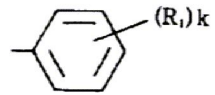
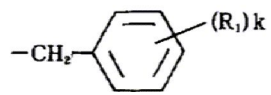
제1항에 있어서, 라세미체, 에난티오머, 부분 입체 이성체 및 이의 혼합물의 형태로 존재하는 일반식 (Ia), (Ib), (Ic), (Id) 또는 (Ie)의 비사이클릭 1-아자-사이클로알칸, 및 약리학적으로 무해한 이의 산 부가염 및 이의 4급 염.

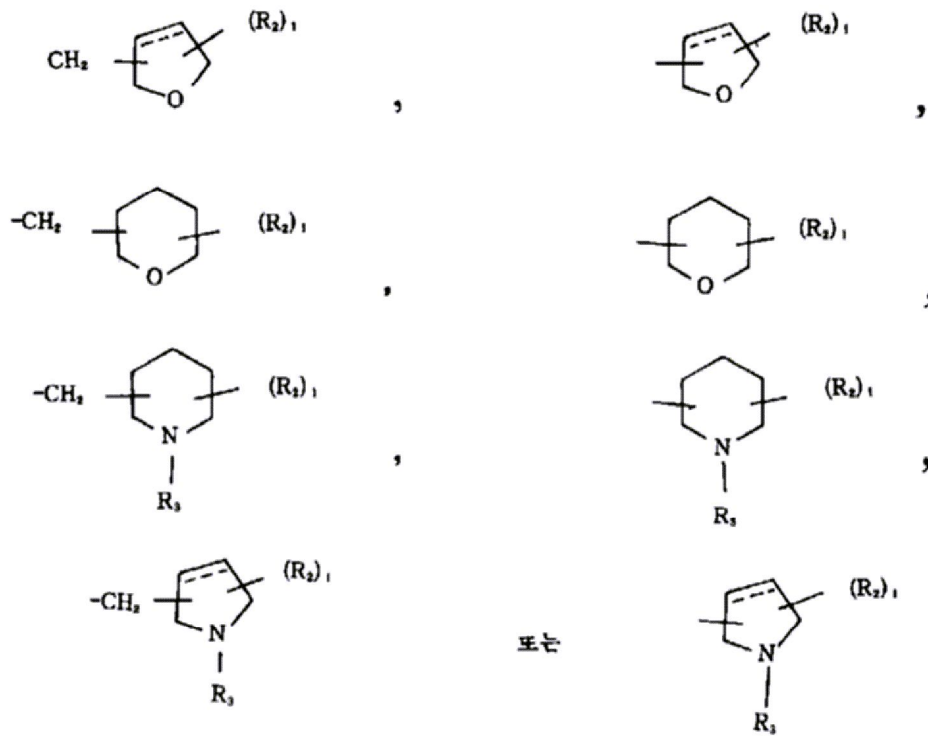


또는

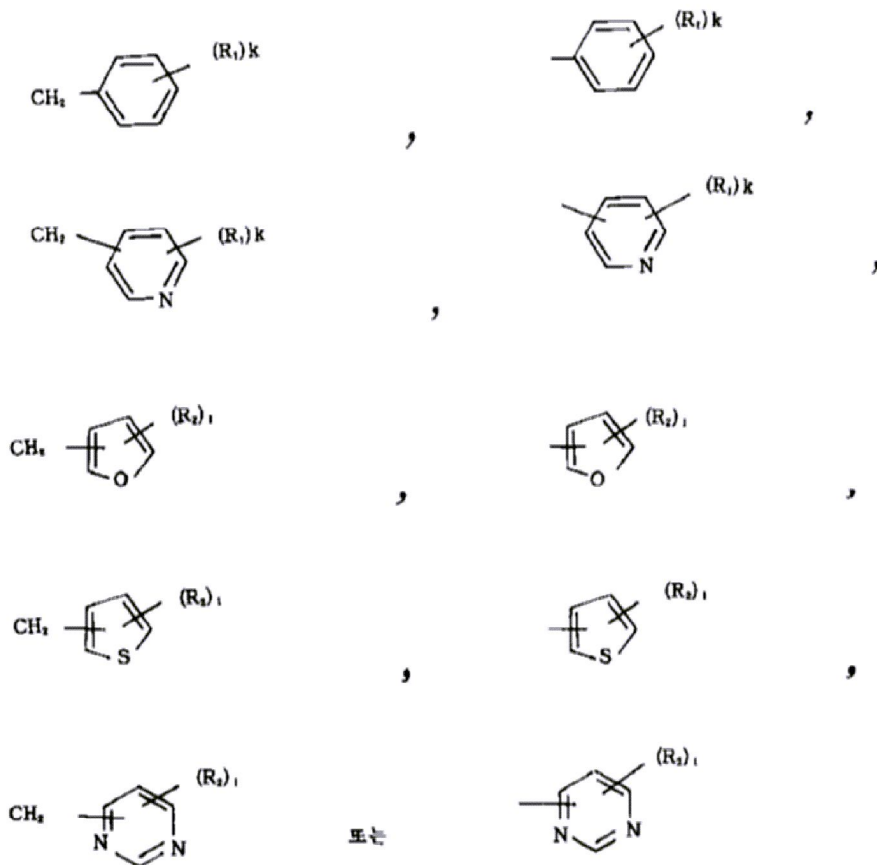


상기 일반식 (I a)에서, n은 0 또는 1이며; R은 일반식

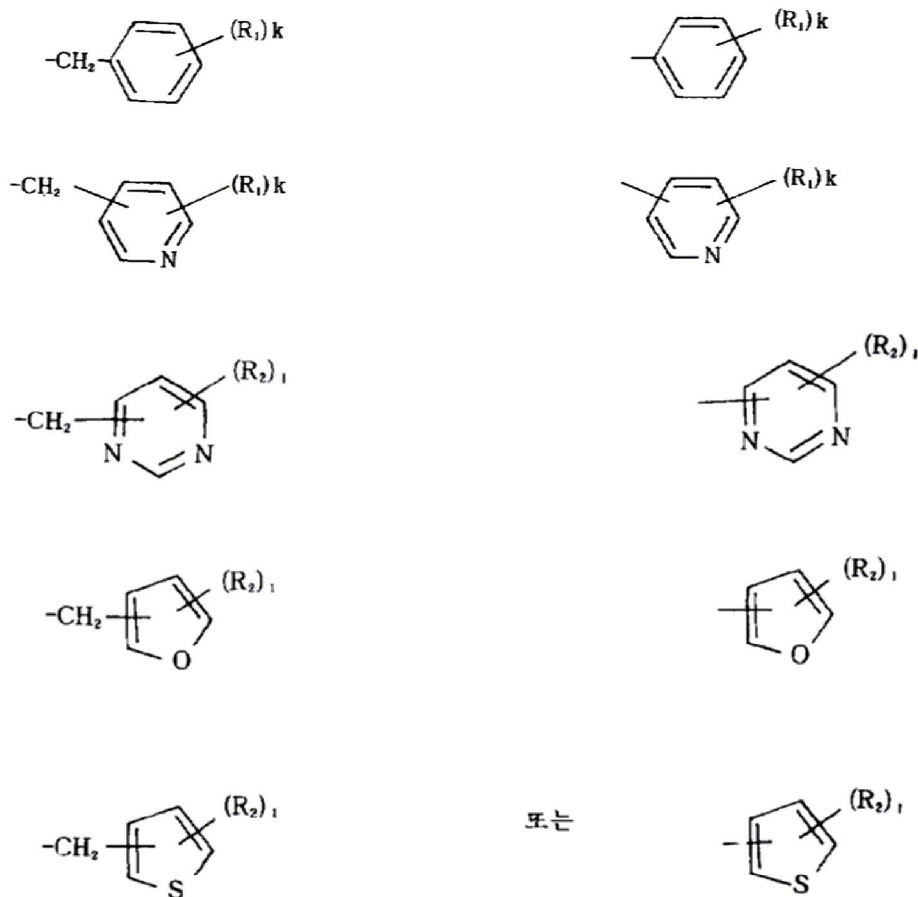




의 그룹, [여기에서, R_1 은 C_{1-4} 알킬, 바람직하게는 메틸, C_{1-4} 알콕시, 바람직하게는 메톡시, 아미노, C_{1-4} 알킬아미노, C_{1-4} 알킬아미노, C_{1-4} 디알킬아미노, 할로겐, 하이드록시, C_{3-6} 사이클로알킬, 임의로 치환된 페닐, 또는 산소이고; k 는 1, 2 또는 3이며, 이때 k 가 1보다 큰 경우, R_1 은 모두 동일하거나 상이할 수 있으며; R_2 는 수소, C_{1-4} 알킬, 바람직하게는 메틸, C_{1-4} 알콕시, 바람직하게는 메톡시, 할로겐 또는 산소이며; l 은 1 또는 2, 바람직하게는 1이며, 이때 l 이 2인 경우, R_2 는 동일하거나 상이할 수 있고; R_3 는 수소 C_{1-4} 알킬, 바람직하게는 메틸이다]이고; 상기 일반식 (1b), (1c) 또는 (1d)에서, n 은 0 또는 1, 바람직하게는 0이며, R 은 C_3 -알킬닐, C_3 -알케닐, 일반식



의 그룹(여기에서, R_1 , R_2 , k 및 l 은 상기에서 정의한 바와 동일하다)이고; 상기식(1e)에서, n 은 0 또는 1이며, R 은 C_3 -알킬닐, C_3 -알케닐, 메틸, 에틸, 프로필, 일반식



의 그룹(여기에서, R_1 , R_2 , k 및 l 은 상기에서 정의한 바와 동일하다)이다.

청구항 4

임의로 라세미체, 에난티오머, 부분 입체 이성체 및 이의 혼합물의 형태로 존재하는, 제1항 2항 또는 3항 중 어느 한항에 따른 일반식(1)의 퀴누클리딘, 및 약리학적으로 허용되는 이의 산 부가염 및 이의 4급 염의 약제학적 조성물로서의 용도.

청구항 5

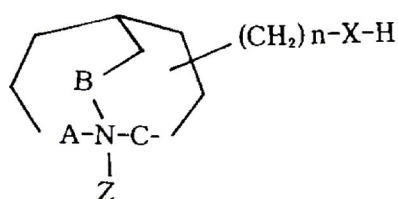
제1항, 2항 또는 3항 중 어느 한항에 따른 일반식(1)의 화합물과 함께 통상적인 갈렌식(galenic) 부형제 및/또는 담체를 포함하는 약제.

청구항 6

일반식(1)의 화합물을 통상적인 갈렌식 부형제 및/또는 담체와 혼합시킴을 특징으로 하여, 제5항의 약제를 제조하는 방법.

청구항 7

하기 일반식(1)의 화합물을 탈양성자화 시키고, 일반식 Y-R(여기에서, R 은 제1항에서 정의한 바와 동일하고, Y 는 용이하게 제거가능한 그룹이다)에서 알킬화제와 반응시킨 다음, 보호그룹을 분리시키고, 임의로 이 화합물을 이의 산 부가염 또는 이의 4급 염으로 전환시키고/시키거나 임의로 이의 광학적 활성 화합물로 분리시킴을 특징으로 하여, 제1항, 2항 또는 3항 중 어느 한항에 따른 일반식(1)의 화합물을 제조하는 방법.

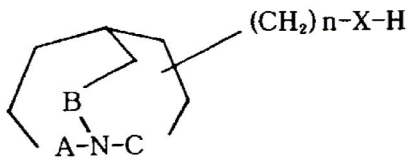


상기식에서, n , A , B , C 및 x 는 제1항에서 정의한 바와 동일하고, Z 은 보호그룹이며 이때 X 가 황인 경

우, 보호그룹 Z은 존재하지 않을 수 있다.

청구항 8

하기 일반식의 화합물을 트리페닐포스핀 및 알킬아조 디카보기실레이트의 존재하에 일반식 HOR(여기에서, R은 페닐 또는 헤테로사이클릭 그룹이다)의 화합물과 반응시킴을 특징으로 하여, 제1항, 2항 또는 3항중 어느 한항에 따른, R이 페닐 또는 헤테로사이클릭 그룹인 일반식(1)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, n, A, B, C 및 x는 제1항에서 정의한 바와 동일하다.

청구항 9

(+)-(프로파길옥시메틸)-1-아자비사이클로[2,2,2]옥탄.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개되는 것임.