

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁴
C07D 307/79

(11) 공개번호 특1985-0008672
(43) 공개일자 1985년 12월 21일

(21) 출원번호	특1985-0003017
(22) 출원일자	1985년 05월 03일
(30) 우선권주장	P3416695.5 1984년 05월 05일 독일(DE)
(71) 출원인	바이엘 약티엔 게젤샤프트 에리히 데브리쯔, 요아힘 그렘 독일연방공화국 바이어베르크 레버쿠센 1
(72) 발명자	할트무트 스테겔마이에트 독일연방공화국 힐덴, 마이데 1드
(74) 대리인	장수길, 이세진

심사청구 : 없음

(54) 테트라린, 크론, 티오크론 및 테트라히드로퀴놀린 유도체의 아미디노히드라존류의 제조방법

요약

내용없음

명세서

[발명의 명칭]

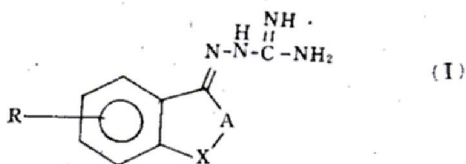
테트라린, 크론, 티오크론 및 테트라히드로퀴놀린 유도체의 아미디노히드라 존류의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

이성체, 이성체 혼합물, 라세미체 및 광학대장체의 형태로 존재하는 하기 일반식(I)의 아미디노히드라 존류 및 약리학적으로 허용가능한 그 염류.



위 식에서, R는 수소이거나, 또는 할로겐, C₁-C₆-알킬아민으로 임의 치환된 알킬(탄소원자 수 1 내지 10개), 알콕시(탄소원자 수 1 내지 10개), 알킬티오(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬술피닐(탄소원자 수 1 내지 10개), 시아노, 히드록실, 니트로, 모노플루오로알킬 또는 폴리플루오로알킬(탄소원자 수 1 내지 5개), 모노플루오로알킬티오(탄소원자수 1 내지 5개), 아미노, 모노알킬아미노(탄소원자수 1 내지 5개) 디알킬아미노(각 알킬의 탄소원자 수 1 내지 5개), -O-C₁-C₆-알킬렌, C₁-C₆-알콕시카트보닐, N-C₁-C₆-알킬카르바메이트이다)로 구성된 군중에서 선택된 동일 또는 상이한 1개 4개의 치환제를 나타내거나, 또는 NR₁₉R₂₀(여기서, R₁₉와 R₂₀은 동일 또는 상이한 것으로서, H, CO-C₁-C₆-알킬아민, CONH-헤테로아릴 또는 ,CO-C₁-C₆-알킬이다)를 나타내며, X는 CR^{1,2}R², O, S(O)_n(n=0, 1, 2), NR³ 또는 Se를 나타내고, A는 단일한 결합인 CR₄R₅, CR^{6,7}R^{8,9}, CR^{10,11}-CR^{12,13}-CR^{14,15}, CR¹⁶=CR¹⁷CO 또는 C=NOH를 나타내는데, 여기서, R¹, R² 및 R⁴⁻¹⁷은 동일 또는 상이한 것으로서, 수소이거나, 또는 할로겐, 알킬(탄소원자 수 1 내지 10개), 알콕시(탄소원자 수 1 내지 10개), 알킬티오(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬술피닐(탄소원자 수 1 내지 10개)시아노, 히드록실, 니트로, 모노플루오로알킬 또는 폴리플루오로알킬(탄소원자 수 1 내지 5개), 모노플루오로알콕시 또는 폴리플루오로알콕시(탄소원자수 1 내지 5개), 모노플루오로알킬티오 또는 폴리플루오로알킬티오(탄소원자수 1 내지 5개), 아미노, 모노알킬아미노(탄소원자수 1 내지 5개), 디알킬아미노(각 알킬의 탄소원자수 1 내지 10개, 알콕시(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬티오(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬술피닐(탄소원자수 1 내지 5개), 모노플루오로알킬티오(탄소원자수 1 내지 5개),로 구성된 군중에서 선택된 1개 또는 5개의 동일 또는 상이한 치환제로 임의 치환된 방향족 또는 헤테로방향족을 나타내고, R³은 수소, 알킬(탄소원자수 1 내지 10개), 아릴, 아실(탄소원자수 1 내지 10개)를 나타내거나, 또는 수소, 할로겐,

알킬(탄소원자수 1 내지 10개), 알콕시(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬티오(탄소원자수 1 내지 10개), 알킬술피닐(탄소원자수 1 내지 10개), 시아노, 히드록실, 니트로, 모노플루오로알킬 또는 폴리플루오로알킬(탄소원자수 1 내지 5개), 모노플루오로알킬티오(탄소원자수 1 내지 5개)로 구성된 군 중에서 선택된 1개 또는 5개의 동일 또는 상이한 치환체로 임의 치환된 알킬술폰(탄소원자수 1 내지 10개)를 나타낸다.

청구항 2

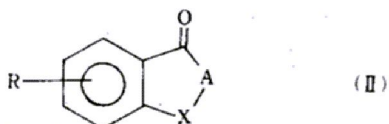
제1항에 있어서, A가 단일 결합인 C_1-C_8 -알킬렌, C_2-C_6 -알케닐렌, CO, $C=NOH$ 이거나, 페닐, 클로로페닐, 니트로페닐, 아미노페닐, 모노- C_1-C_3 -알킬아민, 디- C_1-C_3 -알킬아민, 아릴- C_1-C_4 -알킬렌 또는 페녹시- C_1-C_4 -알킬렌(여기서, 페녹시기는 할로겐, 니트로, C_1-C_4 -알킬, C_1-C_4 -알콕시, 시아노, 히드록실, 아미노, 모노- C_1-C_3 -알킬아민, 디- C_1-C_3 -알킬아민 또는 디- C_1-C_3 -알킬아미노 C_2-C_6 -알킬렌으로 임의 치환된다)으로 치환된 C_2-C_6 -알케닐렌)이고, R가 H, 할로겐, OH, 니트로, 아미노, C_1-C_3 -모노알킬아미노, C_1-C_3 -디알킬아미노이거나, 또는 모르폴린, 피페리딘, 피롤리딘으로 임의 치환된 C_1-C_6 알킬이거나, C_1-C_6 알콕시, 시아노, $-OCH_2-CO_2R_{18}$ (여기서, R_{18} C_1-C_4 -알킬 또는 C_1-C_4 -알킬카르바메이트이다), 또는 $NR_{19}R_{20}$ (여기서, R_{19} 및 R_{20} 은 동일 또는 상이한 것으로서, H, CO-모르폴린, CO-피페리딘, CO-피롤리딘, CONH-피리딜 또는 CO- C_1-C_4 알킬)이며, X가 S, Se, O, SO_2 , CR_1R_2 또는 NR^3 인데, 단 R_1 및 R_2 는 동일 또는 상이한 것으로서, 수소, C_1-C_6 알킬 또는 페닐(여기서, 페닐기는 할로겐, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알콕시, 히드록실, 니트로, 시아노, 아미노, 모노- C_1-C_4 -알킬 또는 디- C_1-C_4 -알킬로 임의 치환된다)이고, R^3 은 수소, 아실, 페닐, 나프틸 또는 피리딜(여기서, 페닐, 나프틸 또는 피리딜은 할로겐, C_1-C_6 -알킬, C_1-C_6 -알콕시, 히드록실, 니트로, 시아노, 아미노, 모노- C_1-C_4 -알킬아미노 및 (또는) 디- C_1-C_4 -알킬아미노로 임의 치환된다)인 화합물.

청구항 3

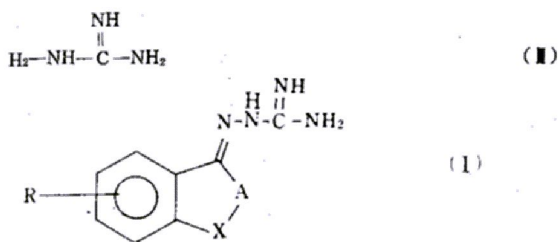
제1항에 있어서, A가 C_1-C_5 -알킬렌, 프러페닐렌, CO, $C=NOH$, $CH=C$ -페닐, $CH=C$ -클로로페닐, 페닐- C_1-C_3 -알킬렌, 디클로로페녹시- C_1-C_3 -알킬렌 또는 $(CH_3)_2N-C_3$ -알킬렌이고, X는 S, Se, O, SO_2 , CR_1R_2 또는 NR_3 (여기서, R은 수소, 페닐, 니트로페닐 또는 에톡시카르보닐이고, R_1 및 R_2 는 동일 또는 상이한 것으로서, 수소 또는 페닐이다)이며, R가 수소, 염소, 히드록실, 니트로, 아미노, C_1-C_3 -알킬(모르폴리노로 임의 치환된다), C_1-C_3 -알콕시, $-O-CH_2CO_2R_{18}$ (여기서, R_{18} 은 $-C_1-C_4$ -알킬, $-C_1-C_3$ -알콕시 $-C_1-C_4$ -알킬렌, $-C_1-C_3$ -알콕시 카르보닐 또는 N- C_1-C_3 -알킬카르바메이트이다), 또는 $NR_{19}R_{20}$ (여기서, R_{19} 및 R_{20} 은 동일 또는 상이한 것으로서, 수소, CO-모르폴리노, CO-NH-피리딜 또는 아실이다)인 화합물.

청구항 4

하기 일반식(II)의 케톤을 희석제 존재하에, $0^\circ -150^\circ C$ 의 온도에서, 하기 일반식(III)의 아미노구아니딘과 반응시키는 것을 특징으로 하는 하기 일반식(I)로 나타내는 화합물의 제조방법.



(식중, R, X 및 A는 제1항 내지 제3항에서 정의한 바와 같음)



(식중, R, X 및 A는 제1항 내지 제3항에서 정의한 바와 같음)

청구항 5

제4항에 있어서, 상기 반응이 촉매량의 산존재하에서 진행되는 것이 특징인 방법.

청구항 6

제4항에 있어서, 상기 반응이 $40^\circ -120^\circ C$ 의 온도에서 진행되는 것이 특징인 방법.

청구항 7

제1항 내지 제3항에 의한 화합물을 유효성분으로 함유하는 의약.

청구항 8

제1항 내지 제3항에 의한 질병치료용 아미디노히드라존류.

청구항 9

제1항 내지 제3항에 의한 화합물의 질병치료용 용도.

청구항 10

제1항 내지 제3항에 의한 화합물의 고혈압, 디기탈리스 중독 및 저혈압 질병치료, 심장 수축작용증진 또는 염화나트륨 배출촉진 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.