

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

| | |
|--|--|
| (51) Int. Cl. ⁴ C07D 405/14 | (11) 공개번호 특 1991-0000714 |
| | (43) 공개일자 1991년 01월 30일 |
| (21) 출원번호 특 1990-0007765 | |
| (22) 출원일자 1990년 05월 29일 | |
| (30) 우선권주장 7363795 1989년 06월 09일 미국(US) | |
| (71) 출원인 자얀센 파아마슈우티카 엔.브이 구스타프 반 리이트 | |
| (72) 발명자 벨기에왕국 비-2340-바아제 턴하우쓰웨그 30 잔 하이레스 | |
| | 벨기에왕국 비-2350- 보셀라아 램스쿠일렌 18 레오 자코부스 조세프 박크스 |
| (74) 대리인 최재철, 김기중 | 벨기에왕국 비-2370-아렌돈크 브뤼크스트라아트 92 |

심사청구 : 없음

(54) 항진균성 4-[4-[4-[4[[2-(2,4-디플루오로 페닐)-2-(1H-아졸릴 메틸)-1,3-디옥솔란-4-일]메톡시]페닐]-1-피페라지닐]페닐]트리아졸론 및 이미다졸론

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

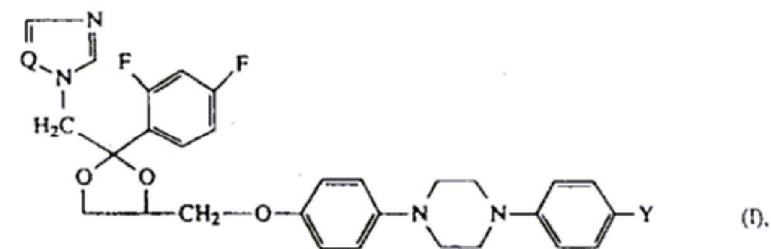
항진균성 4-[4-[4-[4[[2-(2,4-디플루오로페닐)-2-(1H-아졸릴 메틸)-1,3-디옥솔란-4-일]메톡시]페닐]-1-피페라지닐]페닐]트리아졸론 및 이미다졸론

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

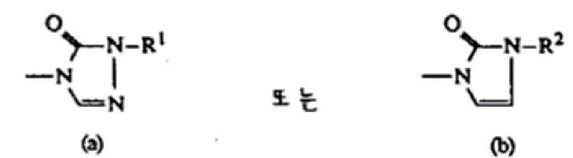
(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 구조식 (1)의 화합물과 약제학적으로 허용되는 이들의 산부가염 또는 입체화학적 이성체



위의 식에서 Q는 C 또는 N이고, Y는 하기구조식의 라디칼이다.



(위의 식에서 R¹은 C₅₋₇-시클로알킬 또는 모노-, 디-, 트리-, 테트라- 또는 펜타할로 C₁₋₄-알킬이고, R²는 C₁₋₄-알킬, C₅₋₇-시클로알킬 또는 모노-, 디-, 트리-, 테트라- 또는 펜타할로 C₁₋₄-알킬이다)

청구항 2

제1항에 있어서, Q는 N이고, 디옥솔란 핵에 있는 치환기들이 시스배열을 가진 화합물.

청구항 3

제2항에 있어서, R¹과 R²는 모노-, 디-, 트리-, 테트라- 또는 펜타할로 C₁₋₄알킬, 시클로헥실 또는 시클로펜틸이거나 R²는 C₁₋₄알킬인 화합물.

청구항 4

제3항에 있어서, R¹과 R²는 2,2,2-트리플루오로에틸, 2,2,3,3-테트라플루오로프로필, 시클로펜틸이거나 R²가 프로필, 1-메틸프로필, 2-메틸프로필 또는 부틸인 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서 화합물이 시스-2-시클로펜틸-4-[4-[4-[4-[[2-(2,4-디플루오로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일메틸)-1,3-디옥솔린-4-일]메톡시]페닐]-1-피페라지닐]페닐]-2,4-디히드로-3H-1,2,4-트리아졸-3-온, 시스-4-[4-[4-[4-[[2-(2,4-디플루오로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일메틸)-1,3-디옥솔린-4-일]메톡시]페닐]-1-피페라지닐]페닐]-2,4-디히드로-2-(2,2,2-트리플루오로에틸)-3H-1,2,4-트리아졸-3-온, 또는 시스-1-[4-[4-[4-[[2-(2,4-디플루오로페닐)-2-(1H-1,2,4-트리아졸-1-일메틸)-1,3-디옥솔린-4-일]메톡시]페닐]-1-피페라지닐]페닐]-1,3-디히드로-3-(1-메틸프로필)-2H-이미다졸-2-온인 화합물.

청구항 6

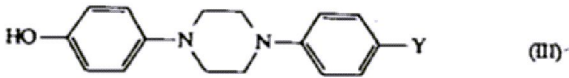
비활성 담체와 활성성분으로서 제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 의한 화합물을 항진균 유효량으로 하여 함유한 항진균성 조성물.

청구항 7

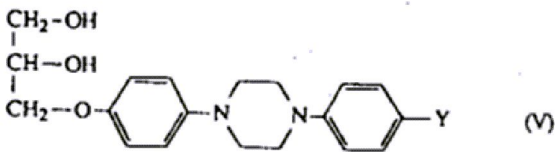
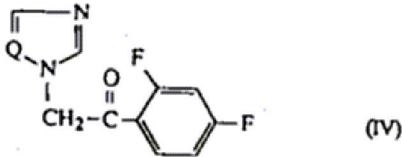
제1항 내지 제5항 중 어느 한 항에 의한 화합물을 항진균유효량으로 하여 온혈동물에 전신투여 또는 국소투여함으로써 균류에 의한 각종 질환을 앓고 있는 온혈동물에 있어서 균류의 생장이나 발육을 억제 또는 예방하거나 균류를 박멸하는 방법.

청구항 8

(a) 반응비활성 용매중에서 염기존재하에 하기 구조식(III)의 페놀을 구조식 D-CH₂-W(II)(여기서 W는 반응성 이탈기)의 알킬화 제로 0-알킬화하거나,

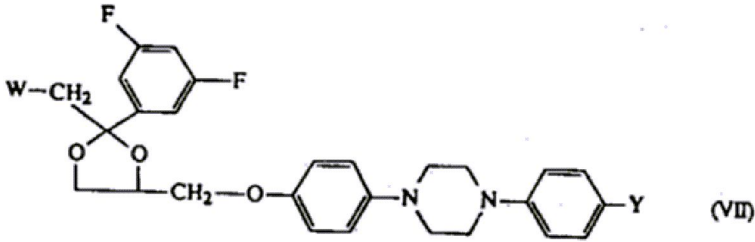
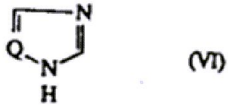


(b) 반응비활성용매중에서 산 존재하에 하기 구조식(IV)의 케톤을 구조식(V)의 2,3-디히드록시프로필에 테르 유도체로 아세탈화 반응시키거나,



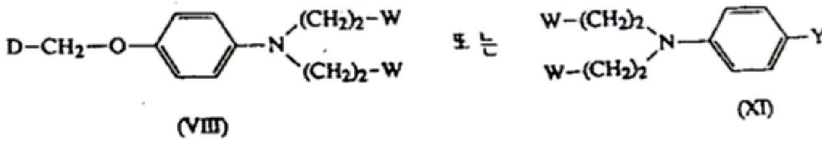
(c) 반응비활성용매중에서 염기존재하에 하기 구조식(VI)의 아졸 또는 그 금속염을 하기 구조식(VII)의

중간체로 N-알킬화하거나,

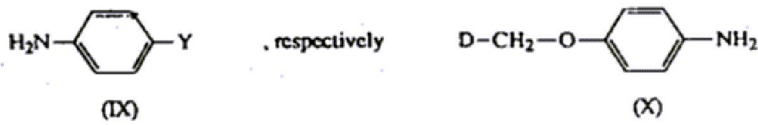


(위의 식에서 w는 반응성 이탈기이다)

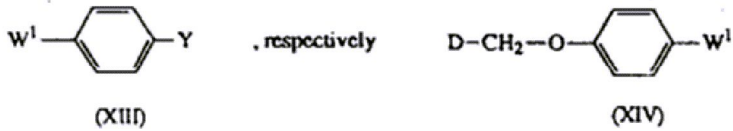
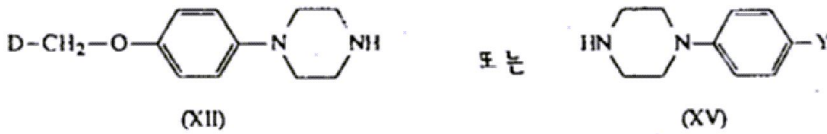
(d)극성의 반응비활성 용매중에서 하기 구조식(VIII)또는 (IX)의 중간체를 하기구조식(X)또는 (X)의 벤젠아민으로 폐환시키거나,



(위의 식에서 w는 각각 반응성 이탈기이다)

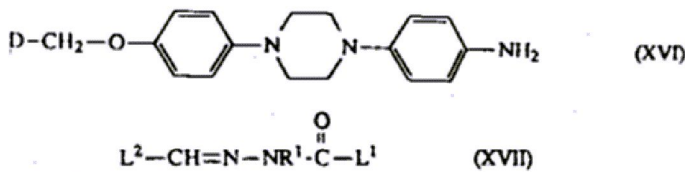


(e) 반응비활성 용매중에서 염기존재하에 하기 구조식(XII) 또는 (XV)의 피페라진을 하기 구조식(XIII)또는 (XIV)의 벤젠유도체로 N-알킬화하거나

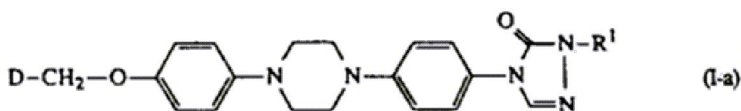


(위의 식에서 w' 는 반응성 이탈기이다)

(f) 반응비활성용매중에서 하기 구조식(XVI)의 벤젠아민을 하기 구조식(XVII)의 시약으로 폐환시켜 하기 구조식(I-a)의 화합물을 얻거나,

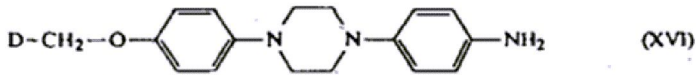


(위의 식에서 L¹과 L²는 모두 반응성 이탈기이다)

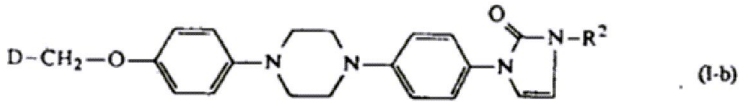


(g) 반응비활성 용매중에서 하기 구조식(XVI)의 벤젠아민을 하기 구조식(XVIII)의 시약으로 폐환시켜 하

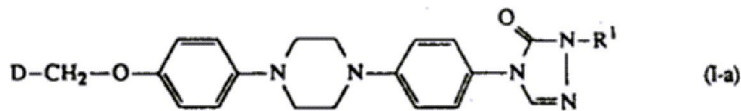
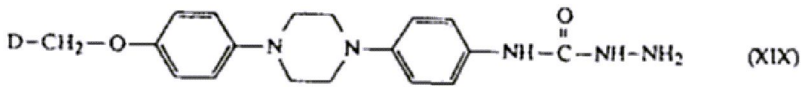
기 구조식(1-b)의 화합물을 얻거나,



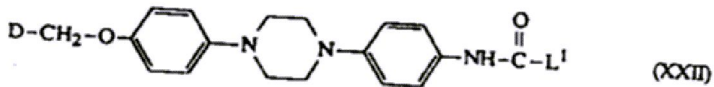
(위의 식에서 L¹과 L²는 모두 반응성 이탈기이다)



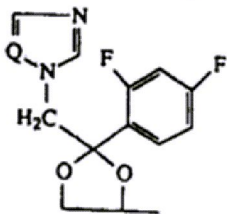
(h) 하기 구조식(XIX)의 중간체를 구조식 HC(=NH)NH₂(XX)의 아미단으로 폐환시키고 여기서 수득한 중간체를 구조식 R₁-W(XXI)(여기서 w는 반응성이탈기)의 시약으로 반응비활성용매중에서 N-알킬화하여 하기 구조식(1-a)의 화합물을 얻거나



(i) 반응비활성 용매중에서 산 존재하에 하기 구조식(XXII)의 중간체를 구조식 (L²)₂-CH-CH₂-NHR²(XXIII)의 시약으로 폐환시키고.



(위의 식들에 있어서 L¹과 L²는 반응성 이탈기이고, D는



필요에 따라서는 구조식(1)의 화합물을 약제학적으로 허용되는 산으로 처리하여 산으로 처리하여 염형태로 전환시키거나, 역으로는 염을 알칼리로 처리하여 유리염기로 전환시키며/또는 그 입체화학적 이성체를 제조함을 특징으로 하는 제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 의한 구조식(1)의 화합물의 제조방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.