

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>4</sup>  
C07D 409/06

(11) 공개번호 특1988-0009013  
(43) 공개일자 1988년09월13일

|            |                                 |
|------------|---------------------------------|
| (21) 출원번호  | 특1988-0000895                   |
| (22) 출원일자  | 1988년01월30일                     |
| (30) 우선권주장 | P37 02 940.1 1987년01월31일 독일(DE) |
| (71) 출원인   | 산도즈 리미티드     진 크래머, 한스 루돌프 하우스  |
|            | 스위스연방, 체하 4002바슬, 리히트스트르세 35    |
| (72) 발명자   | 레네 옴스투프                         |
|            | 스위스연방, 4249 힘멜리트, 훔베르그스트라세 91   |
|            | 게오르크 볼리지                        |
|            | 스위스연방, 4102 비닝겐, 벤켄스트라세 43      |
|            | 기데온 샤피로                         |
|            | 스위스연방, 4057 바슬, 왜틀링거스트라세 8/2    |
| (74) 대리인   | 유영대, 나영환                        |

심사청구 : 없음

(54) 필로카르핀 유도체

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

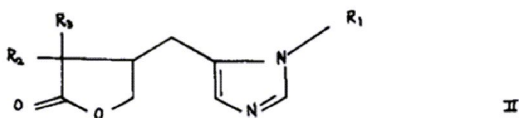
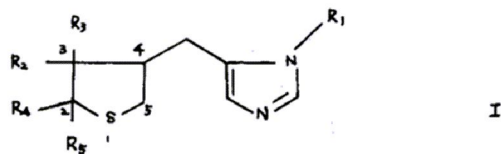
필로카르핀 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

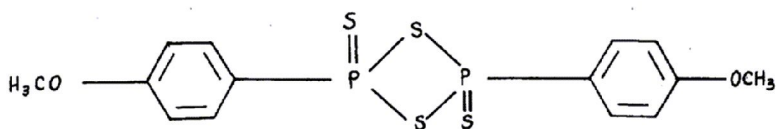
하기식 (II) 화합물과 황화인을 반응시켜 산출된 R<sub>4</sub>와 R<sub>5</sub>가 모두=0 또는 =S인 하기식 (I) 화합물을 유리 염기 또는 산첨가 염형태로 회수하는 것으로 구성된 하기식 (I) 화합물 또는 그의 산부가염의 제조방법.



상기식에서, R<sub>1</sub>은 (C<sub>1-4</sub>)알킬이고, R<sub>2</sub>와 R<sub>3</sub>는 서로 관련없이 수소 또는 (C<sub>1-4</sub>)알킬이며, R<sub>4</sub>와 R<sub>5</sub>는 모두 =0, =S 또는 =NR이고 이때 R은 모노- 또는 디(C<sub>1-4</sub>)알킬카르바모일옥시, 또는 R<sub>4</sub>는 수소이고, R<sub>5</sub>는 수소, 히드록시 또는 -OR' 이며, 이때 R' 는 (C<sub>1-4</sub>)알킬 또는 모노-또는 디(C<sub>1-4</sub>)알킬 카르바모일.

## 청구항 2

제1항에 있어서, 식 (II) 화합물과  $P_4S_{10}$  또는 하기식의 Lawesson's 시약을 반응시키는 것을 특징으로 하는 방법.



## 청구항 3

제1항에 있어서,  $R_4$ 와  $R_5$ 가 모두 =0인 식 (I) 화합물의 제조방법에 있어, 제1항의 식 (II) 화합물과 티오아세테이트 칼륨을 반응시키고 생성된 식 (I) 화합물을 유리염기 또는 산첨가 염형태로 회수하는 것으로 구성된 방법.

## 청구항 4

실제적으로 실시예 중의 어느하나에 상기한 바와 같이 참고로 기재된, 유리염기 또는 산첨가 염형태의 식 I 화합물의 생산방법.

## 청구항 5

유기 염기 또는 산첨가 염형태인, 제1항에 나타난 바의 식 I 화합물.

## 청구항 6

제5항에 있어서,  $R_1$ 은  $(C_{1-4})$ 알킬이고,  $R_2$ 는 수소이며,  $R_3$ 는 에틸이고,  $R_4$ 와  $R_5$ 는 모두 =0 또는 =S임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 7

제5항에 있어서,  $R_1$ 은 메틸이고,  $R_2$ 는 수소이며,  $R_3$ 는  $(C_{1-4})$ 알킬이고,  $R_4$ 와  $R_5$ 는 모두 =0 또는 =S임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 8

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의 (+)-(3R-트랜스)-3-에틸-디히드로-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2(3H)-티오펜은 화합물.

## 청구항 9

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의 (-)-(3R-트랜스)-3-에틸-디히드로-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2(3H)-티오펜-티오펜화합물.

## 청구항 10

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (+)-(3S-시스)-3-에틸-디히드로-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2(3H)-티오펜화합물.

## 청구항 11

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (-)-디히드로-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2(3H)-티오펜화합물.

## 청구항 12

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, ( $\pm$ )-3-에틸디히드로-3-메틸-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2(3H)-티오펜화합물.

## 청구항 13

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (+)-(3R-트랜스)-3-에틸-2-히드록시-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-테트라히드로-티오펜화합물.

## 청구항 14

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의 (+)-(3S-시스)-3-에틸-2-히드록시-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-테트라히드로-티오펜화합물.

## 청구항 15

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (+)-(3S-시스)-3-에틸-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2-메톡시 테트라히드로-티오펜화합물.

## 청구항 16

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (+)-(3R-트랜스)-3-에틸-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2-메톡시-테트라히드로-티오펜화합물.

#### 청구항 17

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의, (+)-(3R-트랜스)-3-에틸-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2-(N,N-디메틸-카르바모일옥시)-테트라히드로-티오펜화합물.

#### 청구항 18

제5항에 있어서, 유리염기 또는 산첨가 염형태의 (-)-(3R-트랜스)-3-에틸디히드로-4-[(1-메틸-1H-이미다졸-5-일)메틸]-2-(N,N-디메틸카르바모일-옥시미노)-3H-티오펜화합물.

#### 청구항 19

제5 내지 제18항 중의 어느 하나에 있어서, 약학적 사용을 위한 약학적 허용 형태의 화합물.

#### 청구항 20

제5항 내지 제18항 중의 어느 한 항에 있어서, 노인성 정신감퇴, 노인성 치매증과 Alzheimer's 병치료시의 사용을 위한 약학적 허용 형태의 화합물.

#### 청구항 21

제5항 내지 제18항 중의 어느 한 항에 있어서, 노인의 혼동상태, 중증성 근무력증, 정신분열증, 조병과 녹내장 치료시의 사용을 위한 약학적 허용 형태의 화합물.

#### 청구항 22

약학적 담체 또는 희석제와 함께, 약학적 허용 형태의 제5항 내지 제18항 중의 어느 한 항에 따른 화합물로 구성된 약학적 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.