(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07D 249/08

(11) 공개번호 특1994-0021536
(43) 공개일자 1994년10월19일

(21) 출원번호 특1994-0006165
(22) 출원일자 1994년03월28일

(30) 우선권주장 105,200 1993년03월29일 이스라엘(IL)
(71) 출원인 테바 파마슈티칼 인더스트리즈 리미티드 비. 제트. 와이너, 예후다흐 리브네흐
이스라엘 예루살렘 91010 하르 핫쯔빔 피.오. 박스 1142 하마르페흐 스트리트 4

(72) 발명자 알렉산더 베인버그
이스라엘 레호보트 76281 아하로니 스트리트 5/16
알렉산더 센더리친
이스라엘 예루살렘 카쉬아니 스트리트 23/13

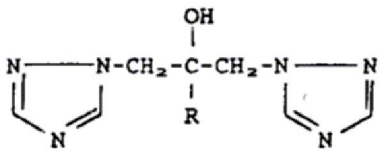
(74) 대리인 김창세, 김영, 장성구

심사청구 : 없음

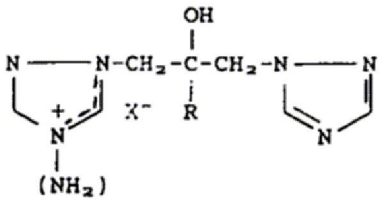
(54) 1, 3-비스(1, 2, 4-트리아졸- 1- 일)-프로판-2-올 유도체의 제조방법

요약

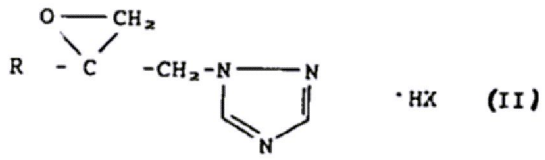
본 발명은 하기 일반식(II)의 옥시란산 염 또는 하기 일반식(II´)의 옥시란을 산성 조성하에서 하기 일반식(III)의 4H-4-아미노-1, 2, 4-트리아졸과 반응시키고, 임의로 하기 일반식(Ia)의 화합물을 탈아미노화시켜 일반식(I)의 화합물을 제조함을 포함하는 하기 일반식(I) 및 (Ia)의 1, 3-비스(1, 2, 4-트리아졸-1-일)-프로판-2-올 유도체의 위치 특이적 제조방법을 제공한다 :



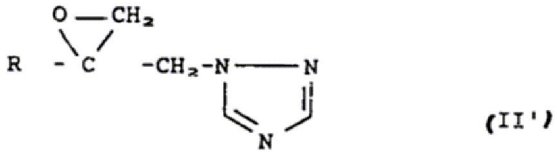
(I)



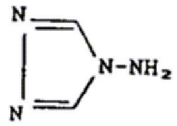
(Ia)



·HX (II)



(II')



(III)

상기 식에서, R은 하나 이상의 같거나 다른 할로겐 그룹으로 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 아릴 또는 아르알킬이고, X는 강산의 음이온이다.

명세서

[발명의 명칭]

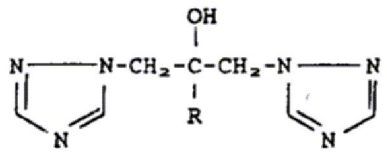
1, 3-비스(1, 2, 4-트리아졸-1-일)-프로판-2-올 유도체의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

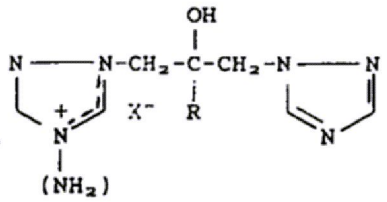
(57) 청구의 범위

청구항 1

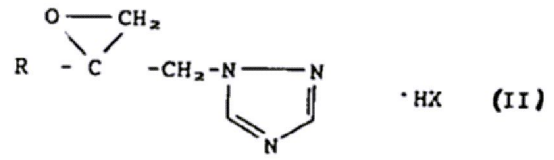
하기 일반식(II)의 옥시린산 염 또는 하기 일반식(II′)의 옥시란을 산성 조건하에서 하기 일반식(III)의 4H-4-아미노-1, 2, 4-트리아졸과 반응시키고, 임의로 하기 일반식(Ia)의 화합물을 탈아미노화시켜 하기 일반식(I)의 화합물을 제조함을 포함하는 하기 일반식(I) 및 (Ia)의 1, 3-비스(1, 2, 4-트리아졸-1-일)-프로판-2-올 유도체의 위치 특이적 제조방법 :



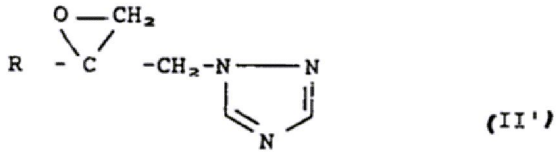
(I)



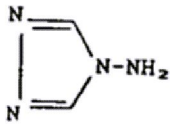
(Ia)



·HX (II)



(II')

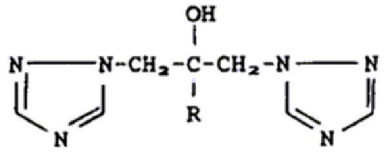


(III)

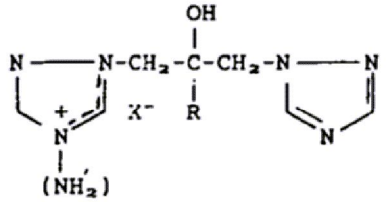
상기 식에서, R은 하나 이상의 같거나 다른 할로겐 그룹으로 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 아릴 또는 아르알킬이고, X는 강산의 음이온이다.

청구항 2

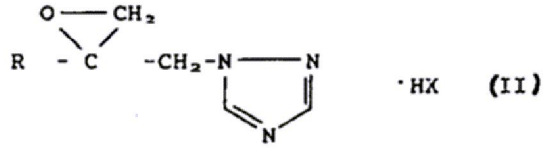
제1항에 있어서, 하기 일반식(Ⅱ)의 옥시란산 염을 산성 조건하에서 하기 일반식(Ⅲ)의 4H-4-아미노-1, 2, 4-트리아졸과 반응시킴을 포함하는 하기 일반식(Ⅰ) 및 (Ⅰa)의 1, 3-비스(1, 2, 4-트리아졸-1-일)프로판-2-올 유도체의 위치 특이적 제조방법 :



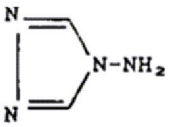
(I)



(Ia)



·HX (II)



(III)

상기 식에서, R은 하나 이상의 같거나 다른 할로겐 그룹으로 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 아릴 또는 아르알킬이고, X는 강산의 음이온이다.

청구항 3

제1항에 있어서, R이 할로겐 치환된 아릴 그룹인 방법.

청구항 4

제3항에 있어서, R이 2, 4-디플루오로페닐인 방법.

청구항 5

제1항에 있어서, X가 클로라이드, 설페이트, p-톨루엔설포네이트 및 메탄설포네이트로 이루어진 그룹중에서 선택된 강산의 음이온인 방법.

청구항 6

제5항에 있어서, 강산의 음이온이 메탄설포네이트인 방법.

청구항 7

제5항에 있어서, 강산의 음이온이 p-톨루엔설포네이트인 방법.

청구항 8

제1항에 있어서, 일반식(Ⅰa)의 화합물을 탈아미노화시켜 일반식(Ⅰ)의 화합물을 제조함을 포함하는 방법.

청구항 9

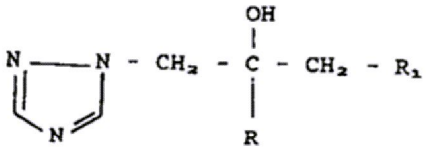
제1항에 있어서, 정의된 바와 같은 일반식(Ⅱ)의 옥시란을 옥시란 몰당 적어도 1당량의 산 존재하에 4H-4-아미노-1, 2, 4-트리아졸과 반응시킴을 포함하는 방법.

청구항 10

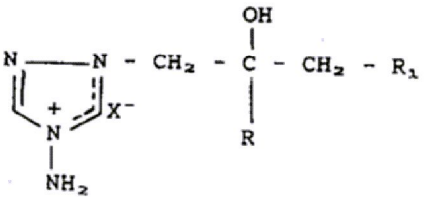
인간의 진균 감염을 치료하는데 사용하기 위한, 제1항의 방법에 의해 제조된 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용되는 염.

청구항 11

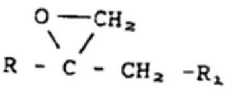
하기 일빈식(XIa)의 옥시란산 염 또는 하기 일반식(XI)의 옥시란을 산성 조건하에서 하기 일반식(III)의 4H-4-아미노-1, 2, 4-트리아졸과 반응시키고, 임의로 하기 일반식(XIIa)의 화합물을 탈아미노화시켜 하기 일반식(XII)의 화합물을 제조함을 포함하는 하기 일반식(XII) 및 (XIIa)의 1-(1, 2, 4-트리아졸-1-일)-프로판-2-올 유도체의 위치특이적 제조방법 :



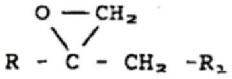
(XII)



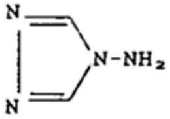
(XIIa)



(XIa)



(XI)



(III)

상기 식에서, R은 하나 이상의 같거나 다른 할로겐 그룹으로 임의로 치환된 알킬, 사이클로알킬, 아릴 또는 아르알킬이고, R_1은 각각 임의로 치환되거나 비치환된, 하이드록시, 할로겐, 알킬, 사이클로알킬, 아릴, 아르알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이고, X는 강산의 음이온이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.