

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁵ C07D 403/12	(11) 공개번호 특 1993-0002344
	(43) 공개일자 1993년 02월 23일
(21) 출원번호	특 1992-0013494
(22) 출원일자	1992년 07월 27일
(30) 우선권주장	P4124942.9 1991년 07월 27일 독일(DE)
(71) 출원인	닥터 칼 토메 게엠베하 디터 라우딘, 게르하르트 후버 독일연방공화국 베-7950 비베라흐 1 포스 파흐 1755
(72) 발명자	프랑크 힘멜스바흐 독일연방공화국 베-7951 밀텔비베라흐 아오른베크 16 귄터 린쯔 독일연방공화국 베-7951 밀텔비베라흐 드로셀베크 14 폴크하르트 아우스텔 독일연방공화국 데-7950 비베라흐 1 카펠렌베크 7 헬무트 피퍼 독일연방공화국 데-7950 비베라흐 1 카펠렌베크 5 토마스 뮐러 독일연방공화국 데-7950 비베라흐 김나지움슈트라세 16 요한네스 바이젠베르거 독일연방공화국 데-7950 비베라흐 1 하이든베크 5 엘케 제발트-벡커 독일연방공화국 데-7950 비베라흐 휘너펠트슈트라세 26
(74) 대리인	이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 5-원 헤테로사이클릭 화합물, 이의 제조방법 및 이를 함유하는 약제학적 조성물

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

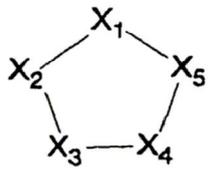
5-원 헤테로사이클릭 화합물, 이의 제조방법 및 이를 함유하는 약제학적 조성물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(I)의 5-원 헤테로사이클릭 화합물, 이의 토오토머, 혼합물을 포함하는 이의 입체이성체 및 이의 염.

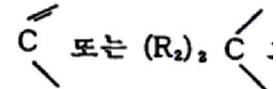


상기 식에서, 5-원 헤테로사이클릭 환은 피롤리딘, 피롤린, 리롤리논 또는 피롤리디논 환이 아니며 탄소

원자를 하나 이상 함유 하고, 그룹 X_1 내지 X_5 중의 하나는 일반식 A-B-C-N<, A-B-C-CH< 또는 A-B-C-의 그룹[여기서, A는 시아노 그룹, 직쇄 또는 측쇄 C_{2-4} -시아노알킬 그룹, B 또는 C의 페닐 환에 직접 결합되지 않는 아미노 그룹, 직쇄 또는 측쇄 C_{1-4} -아미노알킬 그룹, 아미디노 또는 구아니디노 그룹이며, 상기 언급된 각각의 아미노, 아미노알킬, 아미디노 또는 구아니디노 그룹에 있어서 질소원자들중 하나에서 1개 또는 2개의 수소원자는 1개 또는 2개의 C_{1-4} 알킬 그룹으로 대체될 수 있거나 1개의 수소원자는 C_{2-5} (알콕시카보닐)그룹, C_{4-6} -(알케닐옥시카보닐)그룹, 아르알콕시카보닐, 아릴카보닐, 아릴옥시카보닐, 알카노일옥시 메톡시카보닐, 사이클로알카노일옥시메톡시카보닐, 아르알카노일옥시메톡시카보닐, 아로일옥시메톡시카보닐, 포스포노, 디알킬 포스포릴 또는 0-알킬포스포노 그룹으로 대체될 수 있고, 여기서, 알카노일 잔기는 각각 총 2 내지 7개의 탄소원자를 함유할 수 있으며 사이클로 알카노일 잔기는 총 4 내지 8개의 탄소원자를 함유할 수 있고, 각각의 메톡시 잔기는 1개의 C_{3-6} -사이클로알킬그룹, 아르알킬, 아릴 또는 알킬 그룹 또는 메틸렌 탄소원자와 함께 5- 또는 6-원 환을 형성할 수 있는 알킬 그룹 2개에 의해 대체될 수 있거나, B 또는 B 및 C가 함께 4- 내지 7-원 사이클릭이민일 경우, A는 이미노 질소에 결합된 수소원자이거나 이미노질소에 결합된 알킬 그룹일 수 있고, B는 결합, 알킬렌 또는 알케닐렌 그룹, 불소, 염소 또는 브롬원자, C_{1-4} -알킬 그룹, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, $(R_1)_2N-$, $(R_1)_2NCO-$ 또는 $(R_1)_2NSO_2-$ 그룹에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹에 의해 치환된 R_1NH- 그룹에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있는 페닐렌 그룹(여기서, 치환체는 동일하거나 상이할 수 있으며 R_1 은 각 경우에 수소원자, C_{1-5} -알킬 그룹, 아르알킬, 아릴 또는 헤테로아릴 그룹일 수 있다). 염소원자 또는 알킬 알콕시 그룹에 의해 탄소 골격에서 각각 치환될 수 있는 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌, 피리다지닐렌 또는 트리아지닐렌 그룹(한편, 추가로 -CH=N-그룹 1개 또는 2개는 각각 -CO-NR₁-그룹으로 대체될 수 있고, 질소원자들 중의 하나는 그룹 R_1 대신에 그룹 C에 결합될 수 있다), 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의 치환된 사이클로프로필렌 그룹, 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의 치환된 C_{4-5} -사이클로알킬렌 그룹(여기서, CH단위는 질소원자에 의해 대체될 수 있으며 추가로 질소원자에 인접한 메틸렌 그룹은 카보닐 그룹에 의해 대체될 수 있다), 임의로 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의로 치환된 C_{6-7} -사이클로알킬렌 그룹(여기서, 1개 또는 2개의 CH단위는 질소원자에 의해 대체될 수 있으며, 추가로 질소원자에 인접한 1개 또는 2개의 메틸렌 그룹은 카보닐 그룹에 의해 대체될 수 있다)이고, C는 불소, 염소 또는 브롬원자 C_{1-4} -알킬그룹, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, $(R_1)_2N$, $(R_1)_2NCO-$ 또는 $(R_1)_2NSO_2-$ 그룹에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹에 의해 일- 또는 이치환될 수 있는 페닐렌 그룹(여기서, 각각의 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다), 인다닐렌 또는 1,2,3,4-테트라하이드로나프틸렌 그룹(여기서, 포화된 환은 그룹 A 또는 B에 결합되며 방향족 환은 환내에 위치한 그룹 X_1 내지 X_5 의 원자에 결합된다), 염소원자 또는 알킬 또는 알콕시 그룹에 의해 탄소 골격에서 각각 치환될 수 있는 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌, 피리다지닐렌 또는 트리아지닐렌(한편, 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 각각 -CO-NR₁-그룹에 의해 치환될 수 있으며 질소원자들중의 하나는, 그룹 R_1 에 결합되며 대신에 그룹 B 또는 환 내에 위치한 그룹 X_1 내지 X_5 의 원자에 결합될 수 있지만, C는 헤테로사이클릭 환 시스템이 디티올란 환이고 동시에 그룹 A가 아미노 그룹일 경우 피리미디닐렌 그룹이 아니다), 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의 치환된 C_{4-5} -사이클로알킬렌 그룹(여기서, CH단위는 각각 질소원자에 의해 대체될 수 있다), 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의 치환된 C_{6-7} -사이클로알킬렌 그룹(여기서, 1개 또는 2개의 CH단위는 각각 질소원자에 의해 대체될 수 있고, 추가로 1개 또는 질소원자에 인접한 1개 또는 2개의 메틸렌 그룹은 각각 카보닐 그룹에 의해 대체될 수 있다)이다]이며, 그룹 X_1

내지 X_5 중 다른 하나는 일반식 F-F-D-N<, F-E-D-CH< 또는 F-E-D- [여기서, D는 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, $(R_1)_2N-$, (알킬카보닐)NR₁-, (아르알킬카보닐)NR₁-, (아릴카보닐)NR₁-, (헤테로아릴카보닐)NR₁-, (알콕시카보닐)NR₁-, (아르알콕시카보닐)NR₁-, (아릴옥시카보닐)NR₁-, $((R_1)_2NCO)NR_1-$, (알킬설포닐)NR₁-, (아르알킬설피닐)NR₁-, (아릴설포닐)NR₁-, 또는 R_1OCO- 그룹에 의해 임의로 치환된 직쇄 또는 측쇄 알킬렌 또는 알케닐렌 그룹(여기서, 알킬렌 잔기는 각각 1 내지 5개의 탄소원자를 함유하며 알케닐렌 잔기는 각각 2 내지 5개의 탄소원자를 함유할 수 있다), 불소, 염소 또는 브롬원자, C_{1-4} -알킬 그룹, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, $(R_1)_2N-$, $(R_1)_2NCO-$ 또는 $(R_1)_2NSO_2-$ 또는 R_1OCO- 알콕시 그룹에 의해 일치환 또는 이치환되거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹(여기서, 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다)에 의해 치환된 R_1NH 그룹에 의해 일치환 또는 이치환된 페닐렌 그룹, 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌, 피리다지닐렌 또는 트리아지닐렌 그룹(이들 각각은 염소원자 또는 알킬 또는 알콕시 그룹에 의해 탄소 골격에서 치환될 수 있고, 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 각각 -CO-NR₁-그룹에 의해 대체될 수 있으며, 질소원자들 중 하나는 그룹 R_1 에 결합되는 대신 그룹 E에 결합될 수 있으며, 단, 이는 결합은 아니며 산소 또는 황원자를 통해 그룹 D에 결합되지 않거나, 환 내에 위치한 그룹 X_1 내지 X_5 의 원자에 결합될 수 있다), 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 치환된 C_{4-5} -사이클로알킬렌 그룹(여기서, CH 단위는 질소원자에 의해 대체될 수 있으며 추

가로 질소원자에 인접한 메틸렌 그룹은 카보닐 그룹에 의해 대체될 수 있다), 알킬 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 임의로 치환된 C₆₋₇-사이클로알킬렌 그룹(여기서, 1개 또는 2개의 CH단위는 질소원자에 의해 대체될 수 있으며, 추가로 질소원자에 인접한 1개 또는 2개의 메틸렌 그룹은 각각 카보닐 그룹에 의해 대체될 수 있다) 또는 그룹 W₁을 통해서 한 내에 위치한 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합된 C₁₋₆-알킬렌 그룹(여기서, W₁은 NR₁-그룹 또는 산소 또는 황원자이다)이고, E는 결합; R₁OCO-알킬 그룹에 의해 각각 치환될 수 있는 직쇄 또는 측쇄 C₁₋₅-알킬렌 그룹 또는 C₂₋₅-알케닐렌 그룹 또는 그룹 W₂를 통해 그룹 D에 결합된 알킬렌 그룹(여기서, W₂는 산소 또는 황원자, 설피닐, 설포닐, -NR₁-, -(알킬카보닐)N-, -(아르알킬 카보닐)N-, -(아릴카보닐)N-, -(헤테로아릴카보닐)N-, -(알킬설피닐)N-, -(아릴설포닐)N-, -CONR₁- 또는 -NR₁CO- 그룹이다)이며, F는 하이드록시 그룹, 아미노 그룹, C₁₋₆-알콕시 그룹(여기서, C₁₋₃-알콕시 그룹은, C₄₋₈-사이클로알킬 그룹, 아릴 또는 헤테로아릴 그룹에 의해 1-, 2- 또는 3-위치에서 치환될 수 있거나 피롤리딘-2-온-1-일, 모르폴리노, 티오모르폴리노 또는 1-옥시도-티오모르폴리노 그룹에 의해 2- 또는 3-위치에서 치환될 수 있다), C₄₋₆-사이클로알콕시 그룹, 알킬 잔기 내에 총 2 내지 7개의 탄소원자를 갖는 알카노일옥시메톡시 그룹, 사이클로알카노일 잔기 내에 총 4 내지 8개의 탄소원자를 갖는 사이클로알카노일옥시메톡시 그룹, 알킬 잔기 내에 1 내지 6개의 탄소원자를 갖는 알콕시카보닐옥시카보닐메톡시 그룹, 사이클로알킬 잔기 내에 3 내지 7개의 탄소원자를 갖는 사이클로알카노일옥시메톡시 그룹 또는 아로일옥시메톡시, 아르알카노일옥시메톡시, 아릴옥시카보닐옥시메톡시 또는 아르알콕시카보닐옥시메톡시 그룹(여기서, 메톡시 잔기는 C₁₋₆-알킬 그룹, C₃₋₇-사이클로알킬 그룹 또는 아르알킬 또는 아릴 그룹에 의해 치환될 수 있다)에 의해 치환될 수 있고 그룹 D 또는 E의 헤테로원자에 결합하지 않는 카보닐 그룹, 설포-, 포스포노-, -알킬포스포노- 또는 테트라졸-5-일 그룹이며, A가 아미노 그룹 또는 시아노 그룹일 경우, 이 그룹과 그룹 F간의 최단 거리는 10개 이상의 결합이며 헤테로사이클릭 환 시스템이 피라졸린 환이고 이와 동시에 그룹 C 및 D가 비치환된 페닐렌 그룹인 동시에 B 및 E가 결합되거나 헤테로사이클릭 환 시스템이 옥사졸 또는 옥사졸린환인 동시에 그룹 C가 비치환된 페닐렌 그룹이고 B가 결합인 경우 A는 통상 시아노 그룹이 아니다]이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 또 다른 하나는 황원자, 설피닐, 설포닐, R₁N<



그룹 또는 N-원자(여기서, R₂는 상기 정의한 바와 동일하고, R₂는 수소, 염소 또는 브롬원자, C₁₋₇-알킬 그룹, 아르알킬, 아릴, 헤테로아릴, 알콕시, (R₁)₂-, R₁OCO- 또는 (R₁)₂NCO-그룹이다)이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 또다른 하나는 후자가 2개의 질소원자 사이에 위치하지 않을 경우, 황



또는 질소원자, 설포닐 또는 그룹 또는 카보닐 그룹이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 마지막 하나는



질소원자, R₂ 또는 (R₂)₂C<그룹이거나 X₁ 내지 X₅의 2개의 인접한 그룹은 함께 o-페닐렌 그룹이고, 달리 명시하지 않는 한, 상기 언급한 알킬, 알킬렌, 알케닐렌 또는 알콕시 잔기는 각각 1 내지 3개의 탄소원자를 함유하며, 상기 언급한 용어 “아릴 그룹” 또는 “아로일 그룹”은 트리플루오로메틸, 카복시, (R₁)₂NCO-, 알콕시카보닐-, 알킬카보닐-, 알킬설피닐-, 알킬설피닐-, 알킬설포닐-, 니트로-, (R₁)₂N-, 알킬카보닐-NR₁-, 아르알킬카보닐-NR₁-, 아릴카보닐-NR₁-, 헤테로아릴카보닐-NR₁-, 알킬설포닐-NR₁- 아르알킬설포닐-NR₁-, 아릴설포닐-NR₁- 또는 (R₁)₂N-설포닐-그룹에 의해 일치환 되거나 불소, 염소 또는 브롬 원자 또는 하이드록시, 알콕시 또는 C₁₋₄-알킬 그룹에 의해 일-, 이- 또는 삼치환될 수 있는 페닐, 나프틸 또는 벤조일 그룹이며, 상기 언급된 용어 “헤테로아릴 그룹”은 산소, 황 및 질소원자 중의 하나; 질소원자 하나와 산소, 황 및 질소원자 중의 1개 또는 질소원자 2개와 산소, 황 또는 질소원자 중의 하나를 함유하는 5-원 헤테로방향족 환 또는 질소원자 1,2또는 3개를 함유하며 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 -CO-NR₁- 그룹에 의해 대체될 수 있는 6-원 헤테로사이클릭 환이며, 알킬 그룹 또는 불소, 염소 또는 브롬원자 또는 하이드록시 또는 알콕시 그룹에 의해 치환될 수 있다.

청구항 2

제1항에 있어서, 푸란, 테트라하이드로푸란, 2,3-디하이드로-푸란, 2,5-디하이드로-푸란, 티오펜, 2,3-디하이드로-티오펜, 2,5-디하이드로-티오펜, 테트라하이드로 티오펜, S-옥시도-테트라하이드로티오펜, S,S-디옥시도-테트라하이드로,티오펜, 1,2-디티올란, 1,3-디티올란, 1,3-디티올란-S,S,S', S'-테트라옥사이드, 피롤, 인돌, 이소인돌, 2,3-디하이로-인돌, 2,3-디하이드로-이소인돌, 2-인돌론, 이미다졸 4,5-디하이로-이미다졸, 테트라하이드로이미다졸, 벤즈이미다졸린, 피라졸, 2H-피라졸-5온, 4,5-디하이로-피라졸, 1,5-디하이드로-피라졸, 인다졸, 2,3-디하이로-인다졸, 옥사졸, 이소옥사졸, 옥사졸린, 옥사졸리딘, 티아졸, 이스티아졸, 티아졸린, 티아졸리딘, 1,3,4-옥사디아졸, 1,3,4-티아디아졸, 1,2,3-트리아졸, 1,2,4-트리아졸 및 테트라졸 유도체, 이의 토오토머, 혼합물을 포함하는 이의 입체이성체 및 이의 염.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 5원 헤테로사이클릭 환은 피롤리딘, 피롤린, 피롤리논 또는 피롤리디논 환이 아니며 탄소원자를 하나 이상 함유하고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 하나는 일반식 A-B-C<, A-B-C-CH< 또는

A-B-D-의 그룹[여기서, A는 시아노 그룹, 직쇄 또는 측쇄 C₂₋₄-시아노알킬 그룹, B 또는 C의 페닐 환에 직접 결합되지 않는 아미노 그룹, 직쇄 또는 측쇄 C₁₋₄-아미노알킬 그룹, 아미디노 또는 구아니디노 그룹이며, 상기 언급된 각각의 아미노, 아미노알킬, 아미디노 또는 구아니디노 그룹에 있어서 질소원자들중 하나에서 1개 또는 2개의 수소원자는 1개 또는 2개의 C₁₋₄알킬 그룹으로 대체될 수 있거나, 1개의 수소원자는 C₂₋₅-알콕시카보닐 그룹, 알케닐옥시카보닐 그룹, 아르알콕시카보닐, 아릴옥시카보닐옥시 또는 아릴카보닐 그룹, 알카노일옥시메톡시카보닐 그룹(여기서, 알카노일 잔기는 총 2 내지 7개의 탄소원자를 함유할 수 있고 메톡시 잔기는 알킬 그룹에 의해 치환될 수 있다), 포스포노, 디알킬포스포릴 또는 0-알킬-포스포노 그룹으로 대체될 수 있고, B 또는 B 및 C가 함께 6원 환인 사이클릭 이민을 나타내는 경우, A는 또한 이미노 질소에 결합된 수소원자 또는 이미노 질소에 결합된 알킬 그룹일 수 있고, B는 결합; 불소, 염소, 또는 브롬원자에 의해, C₁₋₄알킬 그룹에 의해, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, (R₁)₂N-, (R₁)₂NCO- 또는 (R₁)₂NSO₂- 그룹에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹에 의해 치환된 R₁NH- 그룹에 의해 일- 또는 이치환될 수 있는 페닐렌 그룹(여기서, 치환체는 동일하거나 상이할 수 있으며, R₁은 수소원자, C₁₋₅-알킬 그룹, 아르알킬, 아릴 그룹이다); 각각 탄소 골격에서 알킬 그룹에 의해 치환될 수 있는 피리디닐렌 피리미디닐렌, 피라지닐렌 또는 피리다지닐렌 그룹(한편, 추가로 -CH=N-그룹 1개 또는 2개는 각각 -CO-NR₁-그룹으로 대체될 수 있고, 질소원자들 중의 하나는 그룹 R₁에 결합되는 대신, 그룹 C에 결합될 수도 있다); C₃₋₅ 사이클로알킬렌 그룹, 사이클로헥실렌 그룹(여기서, 1개 또는 2개의 CH단위는 각각 질소원자에 의해 치환될 수 있는 한편, 질소원자에 인접한 1 또는 2개의 메틸렌 그룹은 또한 카보닐 그룹에 의해 치환될 수 있다)이며; C는 불소, 염소 또는 브롬원자 C₁₋₄-알킬 그룹, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, (R₁)₂N-, (R₁)₂NCO- 또는 (R₁)₂NSO₂- 그룹에 의해 일치환 또는 이치환될 수 있거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹에 의해 치환된 R₁NH-(여기서, 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다); 인다닐렌 또는 1,2,3,4-테트라하이드로나프틸렌 그룹(여기서, 포화된 환은 그룹 A에 결합되며 방향족 환은 환내에 위치한 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합된다); 알킬 그룹에 의해 탄소 골격에서 각각 치환될 수 있는 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌 또는 피리다지닐렌(한편, 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 각각 -CO-NR₁-그룹에 의해 대체될 수 있으며, 질소원자 중의 하나는, 그룹 R₁에 결합되는 대신에 그룹 B 또는 환내에 위치한 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합될 수 있으며, 단 이때 이것은 탄소원자이다); 사이클로헥실렌 그룹(여기서, 1개 또는 2개의 CH단위는 각각 질소원자에 의해 치환될 수 있고, 질소원자에 인접한 1 또는 2개의 메틸렌 그룹은 또한 카보닐 그룹에 의해 치환될 수 있다)이다]며, 그룹 X₁ 내지 X₅중 다른 하

나는 일반식 F-F-D-N<, F-E-D-CH< 또는 F-E-D- [여기서, D는 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, (R₁)₂N-, (알킬카보닐)NR₁-, (아르알킬카보닐)NR₁-, (아릴카보닐)NR₁-, (헤테로아릴카보닐)NR₁-, (알콕시카보닐)NR₁-, (아르알콕시카보닐)NR₁-, ((R₁)₂NCO)NR₁-, (알킬설포닐)NR₁-, (아르알킬설피닐)NR₁-, (아릴설포닐)RR₁-, 또는 R₁OCO- 그룹에 의해 임의로 치환된 직쇄 또는 측쇄 알킬렌 또는 알케닐렌 그룹(여기서, 알킬렌 잔기는 각각 1 내지 5개의 탄소원자를 함유할 수 있고, 알케닐렌 잔기는 탄소원자를 2 내지 5개 함유할 수 있다); 불소, 염소 또는 브롬원자에 의해, C₁₋₄-알킬 그룹, 트리플루오로메틸, 하이드록시, 알콕시, 알킬설페닐, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 니트로, (R₁)₂N-, (R₁)₂NCO- 또는 (R₁)₂NSO₂- 또는 R₁OCO- 알콕시 그룹에 의해 일치환 또는 이치환되거나 알킬카보닐, 아르알킬카보닐, 아릴카보닐, 헤테로아릴카보닐, 알킬설포닐, 아르알킬설포닐 또는 아릴설포닐 그룹(여기서, 치환체는 동일하거나 상이할 수 있다)에 의해 치환된 R₁NH 그룹에 의해 일- 또는 이치환된 페닐렌 그룹; 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌, 피리다지닐렌 그룹(이들 각각 탄소 골격에서 알킬 그룹에 의해 치환될 수 있는 한편, 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 각각 -CO-NR₁-그룹에 의해 대체될 수 있고, 질소원자들 중 하나는 그룹 R₁에 결합되는 대신, 그룹 E에 결합될 수 있으며, 단, 이는 결합이 아니며 헤테로원자를 통해 그룹 D에 결합되지 않거나, 이것이 탄소원자인 경우, 환에 위치한 특정 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합될 수 있다); 사이클로헥실렌 그룹(여기에서, 1 또는 2개의 CH단위는 각각 질소원자에 의해 치환될 수 있고 질소원자에 인접한 1 또는 2개의 메틸렌 그룹은 또한 각각 카보닐 그룹에 의해 치환될 수 있다); 또는 그룹 W₁을 통해 환에 위치한 특정 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합된 C₁₋₃-알킬렌 그룹(단, 이때 후자는 탄소원자이며, W₁은 NR₁-그룹 또는 산소 또는 황원자이다)이고; E는 결합; 직쇄 또는 측쇄 C₁₋₅-알킬렌 그룹 또는 C₂₋₅-알케닐렌 그룹(이들은 각각 1 또는 2개의 R₁OCO-알킬 그룹에 의해 각각 치환될 수 있다); 또는 그룹 W₂를 통해 그룹 D에 결합된 알킬렌 그룹(여기서, W₂는 산소 또는 황원자, 설피닐, 설포닐, -NR₁-, -(알킬카보닐)N-, -(아르알킬카보닐)N-, -(아릴카보닐)N-, -(헤테로아릴카보닐)N-, -(알킬설포닐)N-, -(아릴설포닐)N-, -CONR₁- 또는 -NR₁CO- 그룹이며, 그룹 D의 헤테로원자에 결합되지 않는다)이며, F는 그룹 D 또는 E의 헤테로원자에 결합되지 않지만 하이드록시 그룹에 의해, 아미노 그룹에 의해, C₁₋₅-알콕시 그룹(여기에서, C₁₋₃-알콕시 잔기는 1-, 2- 또는 3- 위치에서 C₅₋₇-사이클로알킬 그룹에 의해, 아릴 또는 헤테로아릴 그룹에 의해 또는 2- 또는 3- 위치에서 피롤리딘-2-온-1-일, 모르폴리노, 티오모르폴리노 또는 1-옥시도-티오모르폴리노 그룹에 의해 치환될 수 있다)에 의해, C₄₋₆-사이클로알콕시 그룹에 의해, 알카노일 전기의 총 탄소수

가 2 내지 7인 알카노일옥시메톡시 그룹에 의해, 아로일옥시메톡시 그룹에 의해, 알킬 잔기의 총 탄소수가 1 내지 4인 알콕시카보닐옥시메톡시 그룹에 의해 또는 사이클로알킬 잔기의 탄소수가 5 내지 6인 사이클로알콕시-카보닐옥시메톡시 그룹(여기에서, 메톡시 잔기는 알킬 그룹에 의해 치환될 수 있다)에 의해 치환된 카보닐 그룹, 또는 설폰, 포스포노, 0-알킬포스포노- 또는 테트라졸-5-일 그룹(이때, A가 아미노 그룹 또는 시아노 그룹일 경우, 이러한 그룹과 그룹 F사이의 최단 거리는 10개 이상의 결합이고, 헤테로사이클릭 환 시스템이 피라졸린 환인 경우, 일반적으로 A는 시아노 그룹을 나타낼 수 없으며, 동시에 그룹 C 및 D는 비치환된 페닐렌 그룹을 나타내고 동시에 B 및 E가 결합을 나타내거나, 헤테로사이클릭 환 시스템이 옥사졸 또는 옥사졸린 환이고 동시에 그룹 C가 비치환된 페닐렌 그룹인 경우, B는 결합이다)이다]이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 또 다른 하나는 R₁N<, R₂  또는 (R₂)₂C<그룹 또는 N-원자(여기서, R₁은 상기 정의한 바와 동일하고, R₂는 수소, 염소 또는 브롬원자, C₁₋₇-알킬 그룹, 아릴알킬, 아릴, 헤테로아릴, 알콕시, (R₁)₂N-, R₁OO< 또는 (R₁)₂NCO- 그룹이다)이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 또다른

나오는 산소, 황, 또는 질소원자 또는 R₂  그룹 또는 카보닐 그룹이고, 단 후자가 2개의 질소원자 사이

에 위치하지 않으며, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 마지막 하나는 질소원자, R₂  또는 (R₂)₂C<그룹이거나 그룹 X₁ 내지 X₅의 2개의 인접한 그룹은 함께 0-페닐렌 그룹이고, 달리 언급하지 않는 한, 상기 알킬, 알킬렌, 알케닐렌 또는 알콕시 잔기는 각각 탄소원자를 1 내지 3개 함유할 수 있고, 상기 언급한 용어 “아릴 그룹” 또는 “아로일 그룹”은 트리플루오로메틸, 카복시, (R₁)₂NCO-, 알콕시카보닐-, 알키카보닐-, 알킬설페닐-, 알킬설피닐-, 알킬설폰닐-, 니트로-, (R₁)₂N-, 알킬카보닐-NR₁-, 아르알킬카보닐-NR₁-, 아릴카보닐-NR₁-, 헤테로아릴카보닐-NR₁-, 알킬설폰닐-NR₁- 아르알킬설폰닐-NR₁-, 아릴설폰닐-NR₁- 또는 (R₁)₂N-설폰닐-그룹에 의해 일치한 되거나 불소, 염소 또는 브롬원자 또는 하이드록시, 알콕시 또는 C₁₋₄-알킬 그룹에 의해 일-, 또는 이치환 될수 있는 페닐, 나프틸 또는 벤조일 그룹이며, 상기 언급된 용어 “헤테로아릴 그룹”은 산소, 황 및 질소원자 중의 하나; 질소원자 하나와 산소, 황 및 질소원자 중의 1개 또는 질소원자 2개와 산소, 황 또는 질소원자 중의 하나를 함유하는 5-원 헤테로방향족 환 또는 질소원자 1,2 또는 3개를 함유하며 추가로 1개 또는 2개의 -CH=N-그룹은 -CO-NR₁- 그룹에 의해 대체될 수 있는 6-원 헤테로사이클릭 환이며, 상기-언급한 헤테로방향족 환은 추가로 1개 또는 2개의 알킬 그룹 또는 불소, 염소 또는 브롬원자 또는 하이드록시 또는 알콕시 그룹에 의해 치환될 수 있는 일반식(1)의 5-헤테로사이클릭 화합물, 이의 토오도머, 혼합물을 포함하는 이의 입체이성체 및 이의 염.

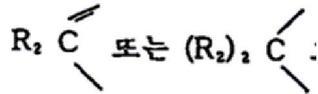
청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, 5원 헤테로사이클릭 환은 피롤리딘, 피롤린, 피롤리논 또는 피롤리디논 환이 아니며 탄소원자를 하나 이상 함유하고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 하나는 일반식 A-B-C<, A-B-C-CH< 또는

A-B-C-  의 그룹[여기서, A는 그룹 B 또는 C의 페닐 환에 직접 결합되지 않는 아미노 그룹, 직쇄 또는 측쇄 C₁₋₃-아미노알킬 그룹, 아미디노 또는 구아니디노 그룹이며, 상기 언급된 각각의 아미노, 아미노알킬, 아미디노 또는 구아니디노 그룹에 있어서, 질소원자들중 하나에서 1개 또는 2개의 수소원자는 1개 또는 2개의 C₁₋₄알킬 그룹으로 대체될 수 있거나, 1개의 수소원자는 C₂₋₅-알콕시카보닐 그룹, 아릴옥시카보닐 그룹, 벤질옥시카보닐 그룹, 알카노일옥시메톡시카보닐 그룹시카보닐 그룹(여기서, 알카노일 잔기는 탄소원자를 총 2 내지 4개를 함유하고, 메톡시 잔기는 메틸 그룹에 의해 치환될 수 있다), 포스포노, 디메틸포스포닐 또는 디에틸포스포닐 그룹으로 대체될 수 있고, B 또는 B 및 C가 함께 6원 환인 사이클릭 이민을 나타내는 경우, A는 또한 이미노 질소에 결합된 수소원자 또는 이미노 질소에 결합된 메틸 그룹일 수 있고, B는 결합; 불소, 염소, 또는 브롬원자에 의해, 메틸 또는 메톡시 그룹에 의해 치환될 수 있는 페닐렌 그룹; 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌 또는 피리다지닐렌 그룹; 피리디닐렌, C₃₋₅사이클로알킬렌 그룹; 피페리디닐렌 또는 2-옥소-피페리디닐렌 그룹이며, C는 불소, 염소 또는 브롬원자, 메틸, 메톡시, 메틸설페닐, 메틸설피닐 또는 메틸설폰닐 그룹에 의해 치환될 수 있는 페닐렌 그룹; 인다닐렌 또는 1,2,3,4-테트라하이드로나프탈렌 그룹(여기서, 각 경우의 포화환은 그룹 A에 결합되며 방향족 환은 환에 위치하는 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합된다); 임의로 메틸-치환된 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라지닐렌 또는 피리다지닐렌 그룹; 또는 사이클로헥실렌 그룹(이때, 1개 또는 2개의 CH단위가 각각 질소원자에 의해 대체될 수 있다)이다]이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중 하나는 일반식 F-F-D-N<, F-E-D-CH<

또는 F-E-D-  [여기서, D는 하이드록시, 메톡시 아미노, 디메틸아미노, 디벤질아미노 또는 카복시 그룹에 의해, 또는 C₂₋₄-알콕시카보닐 그룹에 의해 C₂₋₅-알콕시카보닐아미노 그룹에 의해 임의로 치환된 알킬렌 또는 알케닐렌 그룹(이때, 알킬렌 그룹은 탄소원자를 1 내지 3개 함유하고, 알케닐렌 그룹은 탄소원자를 2 내지 3개 함유한다); 불소, 염소, 브롬원자에 의해, 메틸, 하이드록시, 메톡시, 메틸설페닐, 메틸설피닐, 메틸설폰닐, 니트로, 이미노, 아세트아미노, 벤조일아미노, 메탄설폰닐아미노, 카복시메톡시 또는 메톡시카보닐메톡시 그룹에 의해 치환될 수 있는 페닐렌 그룹, 피리디닐렌, 피리미디닐렌, 피라

지닐렌 또는 피리다지닐렌 그룹(여기서, -CH=N-그룹은 각각 -CO-NH- 그룹에 의해 대체될 수 있으며, 여기서, 질소는 수소원자에 결합하는 대신 그룹 E에 결합될 수 있고, 단 이것은 결합이 아니고 헤테로원자를 통해 그룹 D에 결합하지 않거나 환상에 위치하는 그룹 X₁ 내지 X₅의 특정원자가 탄소원자인 경우, 질소는 이 탄소원자에 결합할 수 있다) 사이클로헥실렌 그룹(여기서, CH단위는 질소원자에 의해 대체될 수 있다); 또는 그룹 W₁을 통해 환상에 위치하는 그룹 X₁ 내지 X₅의 원자에 결합된 C₁₋₂-알킬렌 그룹(단, 이때 후자는 탄소원자이며, W₁은 이미노 그룹 또는 황원자이다)이고, E는 결합; 직쇄 또는 측쇄 C₁₋₄-알킬렌 그룹 또는 C₂₋₄-알케닐렌 그룹(이들은 각각 카복시메틸 또는 메톡시카보닐메틴 그룹에 의해 치환될 수 있다); W₂를 통해 그룹 D에 결합된 C₁₋₂-알킬렌 그룹(여기서, W₂는 산소 또는 황원자, 설피닐, 설포닐, 이미노, 메틸이미노 또는 아세틸이미노 그룹 또는 카보닐 그룹을 통해 D에 결합된 아미노카보닐 그룹이고, (여기서 E는 그룹 D의 헤테로원자에 결합될 수 없다)이며, F는 그룹 D의 헤테로원자에 결합하지 않지만 하이드록시 그룹, 1-, 2- 또는 3-위치에서 사이클로헥실 또는 페닐 그룹에 의해 임의로 치환된 C₁₋₄-알콕시 그룹, C₅₋₈-사이클로알콕시 그룹, 알카노일 잔기의 총 탄소수가 2 내지 6인 알카노일옥시메톡시 그룹, 벤조일옥시메톡시 그룹, 알콕시 잔기의 탄소수가 1 내지 3인 알콕시카보닐옥시메톡시 그룹, 또는 사이클로헥실옥시카보닐옥시메톡시 그룹(이때, 메톡시 잔기는 메틸 그룹에 의해 치환될 수 있다)에 의해 치환될 수 있는 카보닐 그룹, 또는 설포, 포스포노, 0-메틸-포스포노, 0-에틸-포스포노 또는 테트라졸-5-일 그룹이고, 한편, A가 아미노 그룹인 경우, 그룹 A와 그룹 F 사이의 최단 거리가 적어도 10개의 결합이다)이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 또 다른 하나는 N-원자, 이미노, 메틸이미노, 에틸이미노, 페닐이미노, 벤



질이미노 또는 2-페닐에틸이미노, 그룹(이때, R₂는 수소원자, C₁₋₇-알킬 그룹, 벤질, 페닐에틸, 페닐, 피리딜, 카복시, 아미노카보닐 또는 C₂₋₄-알콕시카보닐이다)를 나타내며, 그룹 X₁ 내지 X₅중 또 다른 하나는 2개의 질소원자 사이에 위치하지 않는 경우, 산소, 황 또는 질소원자, R₂

그룹 또는 카보닐 그룹이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중의 마지막 하나는 질소원자, R₂ 또는 (R₂)₂C< 그룹(이때, R₂는 상기에서 정의한 바와 같다)이거나, 그룹 X₁ 내지 X₅의 인접한 2개의 그룹이 함께 o-페닐렌 그룹인 일반식(1)의 5-원 헤테로사이클릭 화합물, 이의 토오토머, 혼합물을 포함하는 이의 입체이성체 및 이의 염.

청구항 5

제1항 또는 제2항에 있어서 5-원 헤테로사이클릭 환은 피롤리딘, 피롤린, 피롤리논 또는 피롤리디논 환

이 아니며 탄소원자를 하나 이상 함유하며, 그룹 X₁ 내지 X₅중 하나는 일반식 A-B-C-N 또는 A-B-C- [여기서, A는 하나의 질소원자에서 총 탄소수 2 내지 3의 알콕시카보닐 그룹에 의해 임의로 치환된 아미디노 그룹이고, B는 결합 또는 페닐렌 그룹이고, C는 페닐렌 또는 피리다지닐렌 그룹이다]이고, 그룹 X₁



내지 X₅중 다른 하나는 F-E-D- 또는 F-E-D- [여기서, D는 하이드록시, 아미노, 디메틸아미노 또는 3급-부톡시카보닐아미노 그룹에 의해 임의로 치환된 에틸렌 그룹이거나 페닐렌 그룹 또는 메틸렌티오 그룹(이때, 황원자는 환의 탄소원자에 결합된다)이고, E는 결합 또는 에틸렌 그룹이고, F는 하이드록시 또는 C₁₋₂-알콕시 그룹에 의해 치환된 카보닐 그룹이다]이며, 그룹 그룹 X₁ 내지 X₅중 또 다른 하나는 N원자, 이미노, 메틸이미노 또는 메틴 그룹이고, 그룹 X₁ 내지 X₅중 또 다른 하나는 산소, 황 또는 질소원자를 나타내고, 그룹 X₁ 내지 X₅의 마지막 하나는 질소원자, 메틴, 카복시메틴, 메톡시카보닐메틴 또는 에톡시카보닐메틴 그룹이거나, 그룹 X₁ 내지 X₅중 2개의 인접한 그룹은 함께 o-페닐렌 그룹인 일반식(1)의 5-원 헤테로사이클릭 화합물, 이의 토오토머, 혼합물을 포함하는 이의 입체이성체 및 이의 염.

청구항 6

제1항 또는 2항에 있어서, 하기 일반식(1)의 화합물, 이의 토오토머 및 이의 염 : (a) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-카복시메틸)-이미다졸, (b) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-카복시-2-하이드록시-에틸)-이미다졸, (c) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-아미노-2-카복시-에틸)-이미다졸, (d) 5-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-카복시-에틸)-페닐]-테트라졸, (e) 5-(4-아미디노-4'-비페닐일)-2-(2-카복시-에틸)-테트라졸, (f) 4-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-카복시-에틸)-페닐]-티아졸, (g) 4-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-카복시-에틸)-페닐]-1-메틸-이미다졸, (h) 4-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-카복시-에틸)-페닐]-이마다졸, (i) 3-(4-아미디노-페닐)-5-[4-(2-카복시-에틸)-페닐]-1,2,4-트리아졸, (j) 2-(4-아미디노-4'-비페닐일)-5-(2-카복시-에틸)-1,3,4-티아디아졸, (k) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-카복시-2-디벤질아미노-에틸)-이미다졸, (l) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-3-(2-카복시-에틸)-인돌, (m) 3-(4-아미디노-4'-비페닐일)-5-카복시메틸티오-1,2,4-트리아졸, (n) 4-(2-아미노-2-카복시-에틸)-1-[6-(4-아미노메틸-페닐)-3-피리다진일]-이마다졸, (o) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-메톡시카보닐-에틸)-이미다졸, (p) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-피리다진일]-4-(2-하이드록시-2-메톡시카보닐-에틸)-이미다졸, (q) 1-[6-(4-아미디노-페닐)-3-

피리다진일]-4-(2-아미노-2-메톡시카보닐-에틸)-이미다졸, (r) 5-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-트트라졸, (s) 5-(4-아미디노-4'-비페닐일)-2-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-트트라졸, (t) 4-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-1-에틸-이미다졸, (u) 4-(4-아미디노-페닐)-2-[4-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-이미다졸, (v) 2-(4-아미디노-페닐)-5-[4-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-1,3,4-티아디아졸, (w) 2-(4-아미디노-4'-비페닐일)-5-(2-메톡시카보닐-에틸)-1,3,4-티아디아졸, (x) 3-(4-아미디노-4'-비페닐일)-5-메톡시카보닐메틸-티오-1,2,4-트리아졸, (y) 4-(4-메톡시카보닐아미디노-페닐)-2-[4-(2-메톡시카보닐-에틸)-페닐]-1-메틸-이미다졸 및 (z) 4-(4-메톡시카보닐아미디노-페닐)-2-[4-(2-메톡시카복시-에틸)-페닐]-이미다졸.

청구항 7

제1항 내지 제6항중 어느 한 항에 따른 화합물의 무기 또는 유기 산 또는 염기와의 생리학적으로 허용되는 부가염.

청구항 8

제1항 내지 제6항중 어느 한 항에 따른 화합물 또는 제7항에 따른 생리학적으로 허용되는 부가염 및 임의로 하나 이상의 불활성 담체 및/또는 희석제를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 9

세포의 웅집이 보다 작거나 보다 크게 일어나거나 세포 대 매트릭스의 상호작용이 역할을 하는 질병을 치료하거나 예방하기에 적합한 약제학적 조성물을 제조하기 위한, 제1항 내지 7항 중 어느 한 항에 따른 화합물의 용도.

청구항 10

제1항 내지 제7항 중 어느 한 항에 따른 화합물을 비화학적 방법에 의해 하나 이상의 불활성 담체 및/또는 희석제에 혼합시키는 것을 특징으로 하여 제8항에 따른 약제학적 조성물을 제조하는 방법.

청구항 11

a) 일반식(III)의 화합물을 F가 카복실 그룹인 일반식(I)의 화합물로 전화시켜 F가 카복실 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, b) 반응 혼합물중에 임의로 형성된 일반식(III)의 화합물을 일반식(IV)의 아민 또는 이의 산 부가염과 반응시켜 A가 임의로 알킬-치환된 H₂N-C(=NH)-그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, c) 일반식(V)의 화합물을 산화시켜, B, C, D 또는 E 그룹중 하나 이상시 설포 또는 설포닐 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, d) 일반식(VI)의 화합물을 일반식(VII)의 화합물과 반응시켜 A가 총 탄소수 2 내지 5인 알콕시카보닐 그룹 또는 아르알콕시카보닐 그룹에 의해 치환된 아미노, 아미노알킬, 아미디노 또는 구아니디노 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, e) 일반식(VIII)의 화합물을 일반식(IX)의 알코올과 반응시켜 F가 C₁₋₆알콕시 그룹에 의해 치환된 카보닐 그룹(여기서, C₁₋₃-알콕시 그룹이 1-, 2- 또는 3-위치에서 아릴 또는 헤테로아릴 그룹에 의해 치환되거나 2- 또는 3-위치에서 피릴리딘-2-온-1-일, 모르폴리노, 티오모르폴리노 또는 1-옥시도-티오모르폴리노 그룹에 의해 치환될 수 있다)인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, f) 일반식(X)의 화합물을 환원시켜 A가 아미노알킬 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, g) 일반식(XI)의 화합물을 일반식(XII)의 화합물과 반응시켜, X₁ 내지 X₅그룹 중 하나가 A-B-C-N < 또는 F-E-D-N < 그룹(여기서, A 내지 F는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, h) 반응 혼합물중에서 임의로 제조된 일반식(XIII)의 화합물을 일반식(XIV)의 화합물과 반응시켜, X₁ 내지 X₅그룹 중 하나는 A-B-C-N < 또는 F-E-D-N < 그룹이고, 다른 하

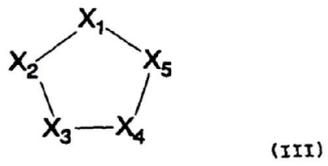
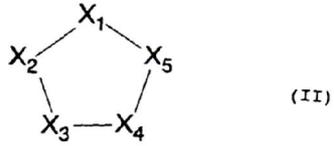
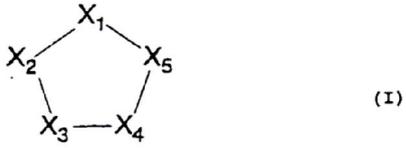


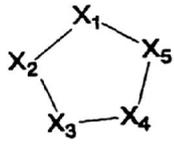
나거나 A-B-C- < 또는 F-E-D- < 그룹이며 나머지 그룹들은 질소원자인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, i) 일반식(XV)의 화합물을 일반식(XVI)의 화합물과 반응시켜 일반식(I)의 티아졸을 제조하거나, j) 반응 혼합물중에서 임의로 형성된 일반식(XVII)의 화합물을 폐환시켜 일반식(I)의 디아졸 유도체를 제조하거나, k) 일반식(XVIII)의 화합물을 S-알킬-이소티오우레이아와 반응시켜 A 및 B 또는 A, B 및 C가 함께는 4 내지 7원의 N-아미디노 사이클릭 이미노 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, l) 일반식(XIX)의 화합물을 탈수시켜 X₁ 내지 X₅가 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같고, X₁ 내지 X₅그룹



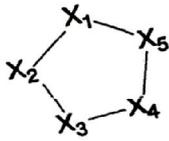
중 하나가 그룹 A-B-C- < 이고 다른 하나가 F-E-D- < 이며, X₁ 내지 X₅그룹 중 다른 하나가 산소원자이고, X₁ 내지 X₅그룹 중 또다른 하나 및 마지막 하나가 R₂C(여기서, A 내지 F 및 R₂는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, m) 일반식(XX)의 화합물을 시안아미드 또는 산부가염과 반응시켜 A가 구아니디노 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, n) 일반식(XXI)의 화합물을 일반식(XXII)의 페닐요도(III)화합물과 반응시켜 A가 아미노 또는 아미노알킬 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, o) 일반식(XXIII)의 화합물을 환원시켜 A가 아미노알킬 그룹(여기서, 아미노 그룹은 4급 탄소원자에 결합되지 않는다) 또는 그룹 B 또는 C의 CH 또는 CH₂그룹에 결합된 아미노 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, p) 일반식(XXIII)의 화합물을 일반식(XXVII)의 화합물과 반응시켜 X₁ 내지 X₅그룹중 하나 이상이 1개 또는 두개의 알킬 또는 아르알킬 그룹으로 치환된 아미노 그룹 또는 알킬 그룹으로 치환된 이미노 그룹을 함유하는 일반식(I)의 화합물을 제조하거나, q) 일반식(XXVI)의 화합물을 일반식(XXVII)의 화합물과 반응시켜 A가 알킬 잔기에서 탄소수 1 내지 3의 디알킬포스포릴 그룹에 의해 치환된 아미노 또는 아미노알킬, 아미디노 또는 구아니디노 그룹인 일반식(I)의 화합물을 제조하고, 연속해서, 필요한 경우, 카복시 그룹을 함유하는 수득된 일반식(I)의 화합물을 이의 에스테르

로 전환시키고/거나, 필요한 경우, 반응성 그룹을 보호하기 위해 반응 중에 사용된 보호 그룹을 분리시키고/거나, 필요한 경우, 수득된 일반식(I)의 화합물을 이의 입체이성체로 분해시키고/거나, 수득된 일반식(I)의 화합물 이의 염으로, 보다 특히 약제학적으로 사용하기 위해 무기 또는 유기 산 또는 염기와 생리학적으로 허용되는 이의 염으로 전환시킴을 특징으로 하여 제1항 내지 제7항 중 어느 한 항에 따른 5-원 헤테로사이클릭 화합물을 제조하는 방법.





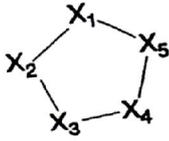
(v)



(vi)

Z-COOR₄

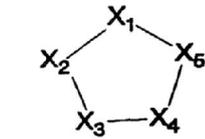
(vii)



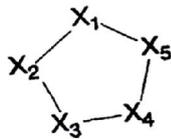
(viii)

HO-R₄

(ix)



(x)



(xi)

Z₃-R₆

(xii)

R'-N₂(+)X

(xiii)

R'-CH=N-NH-Z₄

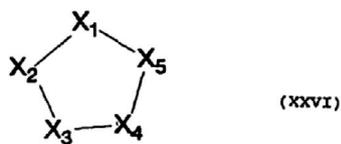
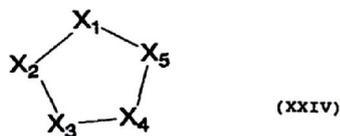
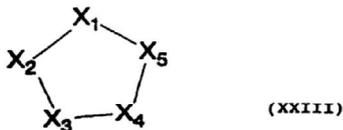
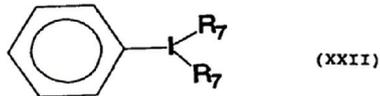
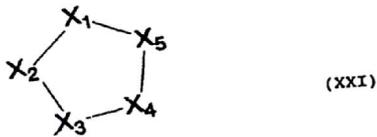
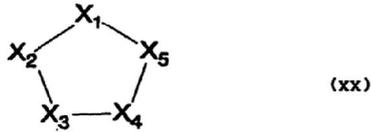
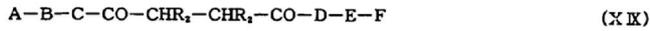
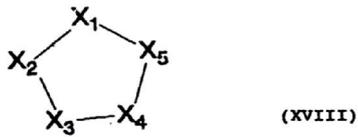
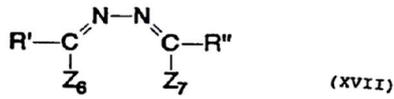
(xiv)

R'-CO-CH₂-Z₄

(xv)

R'-CS-NH₂

(xvi)



여기서, 그룹 X_1 내지 X_5 는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같고, 단, 일반식(II)에 있어서, X_1 내지

X_5 그룹중의 하나는 일반식 $\text{F}'-\text{E}-\text{D}-\text{N}<$, $\text{F}'-\text{E}-\text{D}-\text{CH}<$ 또는 $\text{F}'-\text{E}-\text{D}-\text{C}<$ (여기서, E 및 D는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같고 F' 는 가수분해, 산 처리, 열분해 또는 가수소분해에 의해 카복실 그룹으로 전환될 수 있는 그룹이다)이고, 일반식(III)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹 중의 하나는 일반식 $\text{Z}_1-\text{C}(=\text{NH})-\text{B}-$

$\text{C}-\text{N}<$, $\text{Z}_1-\text{C}(=\text{NH})-\text{B}-\text{C}-\text{CH}<$ 또는 $\text{Z}_1-\text{C}(=\text{NH})-\text{B}-\text{C}-$ (여기서, B 및 C는 제1항 내지 6항에서 정의한 바와 같고 Z_1 는 알콕시, 아르알콕시, 알킬티오, 아르알킬티오 또는 아미노 그룹이다)이고, 일반식(V)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹중의 하나는 설페닐 또는 설페닐 그룹을 함유하고, 일반식(VI)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹중

의 하나는 일반식 $A'-B-C-N<$, $A'-B-C-CH<$ 또는 $A'-B-C-$ (여기서, A' 는 아미노, 아미노알킬, $H_2N-C(=NH)-$ 또는 $H_2N-C(=NH)-NH-$ 그룹이고, B 및 C는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)이고,

일반식(VIII)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹중의 하나는 일반식 $F''-E-D-N<$, $F''-E-D-CH<$ 또는 $F''-E-D-$ (여기서, F'' 카복시 또는 알콕시카보닐 그룹이다)이며, 일반식(X)에 있어서, $A''-B-C-N<$, $A''-B-C-CH<$

또는 $A''-B-C-$ (여기서, A'' 는 시아노 그룹 또는 시아노알킬 그룹이고, B 및 C는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)이고, 일반식(XI)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹중의 하나는 이미노 그룹이고, 일반식(XVII)에 있어서, B 또는 B 및 C가 함께 4 내지 7원 사이클릭 이미노이고, 일반식(XX)에 있어서, A가 아미노 그룹이고, 일반식(XXI)에 있어서, X_1 내지 X_5 그룹중의 하나는 $H_2N-CO-T-B-C-$ 그룹(여기서, T는 결합 또는 C_{1-5} -알킬렌 그룹이고, B 및 C는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)이고, 일반식(XXIII)에 있어서, X_1 내지 X_5 중의 하나는 일반식 $A'''-B-C-$ 그룹(여기서, A''' 는 N-하이드록시-이미노그룹을 함유하고, B 및 C는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같다)을 함유하고, 일반식(XXIV)에 있어서, X_1 내지 X_5 중의 하나는 아미노, 알킬아미노 또는 이미노 그룹을 함유하고, R^3 은 동일하거나 상이할 수 있으며 수소원자 또는 C_{1-3} -알킬 그룹이며, R_4 는 C_{1-4} -알킬 그룹 또는 아르알킬 그룹이고, Z_2 는 친핵성 이탈그룹이며, R_5 는 1-, 2- 또는 3-위치에서 아릴 또는 헤테로아릴 그룹에 의해 치환되거나, 2- 또는 3-위치에서 피롤리딘-2-온-1-일, 모르폴리노, 티오모르폴리노 또는 1-옥시도-티오 모르폴리노 그룹에 치환될 수 있는 C_{1-6} -알킬 그룹이고, R_6 , R' 및 R'' 은 일반식 $A-B-C-$ 또는 $F-E-D-$ 의 그룹이며, 단, R_6 의 경우 A 내지 F는 제1항 내지 제6항에서 정의한 바와 같고, R' 의 경우 C 또는 D는 탄소원자를 통해 5원환에 결합하는 아릴 또는 헤테로아릴을 나타내고, R'' 은 공정 h)의 경우 R' 이 아닌 $A-B-C-$ 및 $F-E-D-$ 그룹이고, 공정 i) 및 j)의 경우, R' 또는 R'' 중 하나가 $A-B-C-$ 그룹이면, 다른 하나는 $F-E-D-$ 그룹이며, Z_3 는 친핵성 이탈그룹이고, X는 무기산의 음이온이며, Z_5 는 친핵성 이탈 그룹이고, Z_6 및 Z_7 은 동일하거나 상이할 수 있으며 하이드록시, 알콕시, 머캄토, 알킬머캄토 또는 아미노 그룹이며, R_7 은 아세톡시 또는 트리플루오로 아세톡시 그룹과 같은 유기 카복실산의 아실 그룹이고, R_8 및 R_9 는 동일하거나 상이할 수 있으며 수소원자, 알킬, 아르알킬 또는 아릴 그룹이며, Z_8 또는 Z_9 그룹중의 하나는 친핵성 이탈그룹이고 다른 하나는 수소 원자 또는 알킬 그룹이거나 함께 산소원자를 나타내고, R_{10} 은 C_{1-3} -알킬 그룹이며, Z_{10} 은 친핵성 이탈 그룹이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.