

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07D 233/58	(11) 공개번호 특 1988-0011115
	(43) 공개일자 1988년 10월 26일
(21) 출원번호	특 1988-0002282
(22) 출원일자	1988년 03월 05일
(30) 우선권주장	P3707151.3 1987년 03월 06일 독일(DE)
(71) 출원인	핵스트 아크티엔게젤샤프트 하인리히 벡커 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라쎄 45 아크티엔게젤샤프트 베른하르트 베크 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라쎄 45
(72) 발명자	클라우스-디테르 캄페 독일연방공화국 데-6232 바트 소덴 암 타우누스 암 레흐스타이그 1 파트리시아 유싱거 독일연방공화국 데-6239 엠스타인/타우누스 하우스트스트라쎄 54 헤르베르트 쉬겔 독일연방공화국 데-6238 호프하임 암 타우누스 암 알텐 비른바움 10 아 한스 게오르그 알페르만 독일연방공화국 데-6240 퀴니그스타인/타우누스 암 아이히콤포프 10 헤르만 조셉 게르하르츠 독일연방공화국 데-6238 호프하임 암 타우누스 바콜데르베그 4
(74) 대리인	이병호

심사청구 : 없음

(54) 1-(1-아릴-2-하이드록시에틸)-이미다졸 및 그의 염, 이의 제조방법, 이 화합물을 함유한 약제 및 이의 용도

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

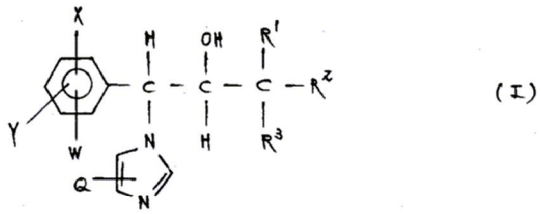
1-(1-아릴-2-하이드록시에틸)-이미다졸 및 그의 염, 이의 제조방법, 이 화합물을 함유한 약제 및 이의 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식 (I) 의 1-(1-아릴-2-하이드록시에틸)-이미다졸 및 이의 생리학적으로 허용되는 산부가염 및 입체 이성체 및 광학적으로 활성인 에난티오머.



상기식에서, X는 H, (C₁-C₄)-알킬, 페닐, F, Cl, Br, I, OH, CF₃, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-알킬티오, (C₁-C₄)-알콕시메틸, (C₃-C₅)-알케닐옥시메틸 또는 -NR₂⁴ (이때 R⁴는 동일하거나 상이하고 (C₁-C₄)-알킬을 나타

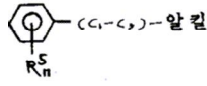
내거나, 또는 질소원자와 함께 피롤리딘, 피페리딘 또는 모르폴린 라디칼을 나타낸다)이고, Y는 H, (C₁-C₄)-알킬, F, Cl, Br 또는 (C₁-C₄)-알콕시이거나, X 및 Y는 함께 3,4-위치에서 -(CH₂)_L-쇄 (이때, L은 3 또는 4이다), -OCH₂CH₂-, -O-CH₂O- 또는 CH=CH-CH=CH- 이고, W는 H, CH₃ 또는 OCH₃이고, R¹은 H, (C₂-C₄)-알킬, (C₂-C₅)-알케닐, (C₂-C₅)-알키닐, (C₃-C₈)-사이클로알킬, (C₄-C₈)-사이클로알케닐, (C₃-C₇)-사이클로알킬-CH₂, (C₄-C₇)-1-사이클로알케닐-CH₂, (C₁-C₄)-알콕시, (C₁-C₄)-알콕시메틸, (C₃-C₅)-알케닐옥시메틸 또는



2-프로핀-1-일옥시메틸, 알킬 또는 이고 (이때, R⁵는 CH₃, C₂H₅, OCH₃, F, Cl, Br 또는 CF₃이고, n은 0, 1 또는 2이고, R₅가 CF₃인 경우, n은 1이다), R²는 (C₁-C₄)-알킬 또는 (C₃-C₅)-알케닐이고, R³는 (C₁-C₄)-알킬이거나, R¹ 및 R³ 또는 R² 및 R³는 이들과 결합된 탄소원자와 함께 (C₃-C₇)-사이클로알킬, C₇-비사이클로알킬, (C₄-C₇)-사이클로알케닐 또는 C₇-비사이클로알케닐이거나(각 경우에, 있어서 비치환되거나 1 내지 3개의 CH₃ 및/또는 OCH₃ 및/또는 Cl로 치환되며, 사이클로알케닐 및 비사이클로알케닐 라디칼에 있어서 C=C 이중결합은 1-위치에 존재하지 않는다), 또는 (옥사-C₂-C₅)-사이클로알킬이고 Q는 4- 및/또는 5-위치에서 H 또는 CH₃ 또는 C₂H₅이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 하기 정의중 적어도 하나를 충족시키는 화합물 : X는 H, (C₁-C₄)-알킬, 페닐, F, Cl, Br, I, OH, CH₃OCH₂, C₂H₅OCH₂, CH₂=CHCH₂OCH₂, (C₁-C₄)-알콕시, 3-N(CH₃)₂ 또는 3-CF₃이고, Y는 H, CH₃, Cl 또는 OCH₃이거나, X 및 Y는 함께 3,4-위치에서 -(CH₂)₄-, -O-CH₂-O- 또는 -CH=CH-CH=CH- 쇠이고, W는 H이고, R¹은 (C₂-C₄)-알킬, (C₂-C₅)-알케닐, 2-프로핀-1-일, (C₃-C₆)-사이클로알킬, (C₁-C₄)-알콕시메틸, (C₃-



C₅)-알케닐옥시메틸 또는 2-프로핀-1-일옥시메틸, (여기에서, R⁵가 OCH₃, F 또는 Cl 이고, n은 0 또는 1 이다)이고, R² 및 R³는 (C₁-C₄)-알킬이거나, R¹ 및 R³ 또는 R² 및 R³는 이들과 결합된 탄소원자와 함께 (C₃-C₇)-사이클로알킬, C₇-비사이클로알킬 또는 C₇-비사이클로알케닐(이의 C=C 이중결합은 1-위치에 존재하지 않는다) 이거나 (각 경우에 있어서 비치환되거나 1 또는 2개의 CH₃ 및/또는 OCH₃로 치환된다), (옥사-C₃-C₅)-사이클로알킬이고, Q는 4- 또는 5-위치에서 H 또는 CH₃이다.

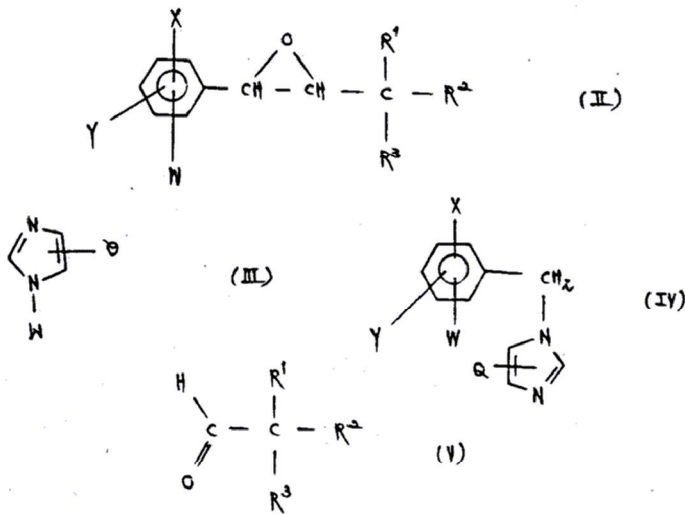
청구항 3

제1 또는 2항중 어느 한 항에 있어서, 하기 정의중 적어도 하나를 충족시키는 화합물 : X는 H, CH₃, 페닐, F, Cl, Br, 3- 또는 4-OCH₃ 또는 3-CF₃이고, Y는 H, CH₃, 3- 또는 4-Cl 또는 3- 또는 4-OCH₃ 이거나, X 및 Y는 함께 3,4-위치에서 -CH=CH-CH=CH-쇄 이고, W는 H이고, R¹은 (C₂-C₄)-알킬, (C₃-C₅)-알케닐, 2-프로핀-1-일, 벤질, (C₁-C₄)-알콕시메틸 또는 (C₃-C₄)-알케닐옥시메틸이고, R² 및 R³는 (C₁-C₄)-알킬이거나, R¹ 및 R³ 또는 R² 및 R³는 이들과 결합된 탄소원자와 함께 (C₃-C₇)-사이클로알킬, 2-노르보르닐, 노르보르넨-2-일 또는 (옥사-C₃-C₅)-사이클로알킬이고, Q는 4- 또는 5-위치에서 H 또는 CH₃이다.

청구항 4

A) 일반식 (IV)의 1-벤질이미다졸에 1 또는 2배 당량까지의 강염기를 가하고 이 혼합물을 계속해서 처음에 일반식 (V)의 알데하이드, 그 다음 양자성산과 반응시키거나, B) 일반식 (II)의 옥시란을 일반식 (III)의 화합물과 반응시켜 친핵적으로 개환시킨 후 양자성산을 가하거나, C) 방법 A) 또는 B)에서 제조된 일반식 (I)의 화합물의 경우, 치환체 X 및/또는 R¹ 및/또는 R²를 공지된 방법에 의해 다른 치환체 X 및/또는 R¹ 및/또는 R²로 전환시키고, 방법 A), B) 및/또는 C)에서 수득된 일반식 (I)의 화합물을 경우에 따라 무기 또는 유기산을 사용하여 생리학적으로 허용되는 산부가염으로 전환시키며, A), B) 또는 C)에서 수득된 화합물을 경우에 따라 이의 입체이성체 및/또는 이의 광학적으로 활성인 에난티오머로 분할

항을 특징으로 하는, 제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물의 제조방법.



상기식에서, X, Y, W, Q, R¹, R² 및 R³는 제1항에서 언급한 바와 같고, M은 수소 또는 알칼리 금속 또는 알칼리 토금속이다.

청구항 5

항진균작용을 가진 약제의 제조에 있어서, 제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물의 용도.

청구항 6

항진균제로서의 제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물의 용도.

청구항 7

제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물을 활성양을 함유하는 항진균 작용을 가진 약제.

청구항 8

항우울제로서의 제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물의 용도.

청구항 9

항우울작용을 가진 약제의 제조에 있어서, 제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물의 용도.

청구항 10

제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물 활성양을 함유하는 항우울작용을 가진 약제.

청구항 11

제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물 유효량을 약제학적으로 적당한 부형제와 함께 투여함으로써 진균증을 치료하는 방법.

청구항 12

제1항에서 청구된 일반식 (I)의 화합물 유효량을 약제학적으로 적당한 부형제와 함께 투여함으로써 우울증을 치료하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.