

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07D 401/04	(11) 공개번호 특 1989-0003730
(21) 출원번호 특 1988-0010045	(43) 공개일자 1989년 04월 17일
(22) 출원일자 1988년 08월 06일	
(30) 우선권주장 82760 1987년 08월 07일 미국(US)	
(71) 출원인 미합중국 뉴저지 08876 서머빌 루트 202-206 노스 조셉 토마스 스트럽크 제프스키	도날드 알. 토르센
(72) 발명자 미합중국 뉴저지 08822 플레밍톤 스테워드 레인 4 이병호	
(74) 대리인 이병호	

심사청구 : 없음

(54) 1-페닐-3-(1-피페라지닐)-1H-인다졸, 그의 제조방법 및 중간생성물, 및 약제로서의 용도

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

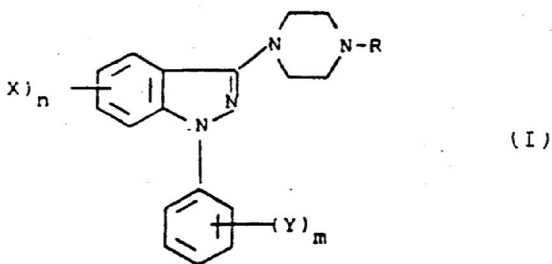
1-페닐-3-(1-피페라지닐)-1H-인다졸, 그의 제조방법 및 중간생성물, 및 약제로서의 용도

본 건은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

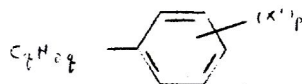
(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(I)의 화합물, 그의 기하 이성체, 광학적 대장체 또는 약제학적으로 허용되는 산부가염.



상기식에서, n은 0 또는 1의 정수이고; m은 0 내지 2의 정수이며; X 및 Y는 독립적으로, 할로겐, 저급알킬, 저급알콕시, 저급알킬티오, 디저급알킬아미노, 저급알킬아미노, 아미노, 니트로, 시아노, 머캅토, 하이드록시 또는 트리플루오로 메틸이고, 각각의 m에 대해 Y는 같거나 다를 수 있으며; R은 수소, 저급알킬, 사이클로알킬 저급알킬, 저급알케닐, 하이드록시 저급알킬, 디저급알킬아미노 저급알킬, 디저급알킬포스피닐 저급알킬, 시아노, 저급알킬카보닐, 저급알카노일, 아미노카보닐, 저급알킬아미노카보닐, 또



는 일반식 $C_6H_4(X')_p$ 의 그룹(여기서, q는 0 내지 5의 정수이고; X'은 할로겐, 저급알킬, 저급알콕시, 저급알킬티오, 디저급알킬아미노, 저급알킬아미노, 아미노, 니트로, 시아노, 머캅토, 하이드록시, 또는 트리플루오로 메틸이며; P는 0 내지 2의 정수이고; 각각의 P에 대해 X'은 같거나 다를 수 있다)이다.

청구항 2

제1항에 있어서, n은 0이고, m이 0 또는 1이며, Y가 할로겐 또는 트리플루오로 메틸이며, R이 수소, 저급알킬, 사이클로알킬 저급알킬, 저급알케닐, 저급알카노일, 아미노카보닐, 저급알킬아미노 저급알킬, 디

저급알킬아미노 저급알킬 또는 디저급알킬포스피닐 저급알킬인 화합물.

청구항 3

제2항에 있어서, R¹ 수소, 저급알킬, 또는 사이클로알킬 저급알킬인 화합물.

청구항 4

제3항에 있어서, 1-페닐-3-(1-피페라지닐)-1H-인다졸, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염.

청구항 5

제3항에 있어서, 1-페닐-3-(4-메틸-1-피페라지닐)-1H-인다졸 또는 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염.

청구항 6

제3항에 있어서, 1-(4-플루오로페닐)-3-(4-메틸-1-피페라지닐)-1H-인다졸 또는 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염.

청구항 7

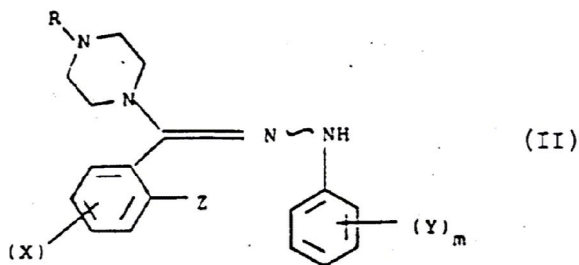
제2항에 있어서, 3-[4-(디메틸포스피닐 메틸)-1-피페라지닐]-1-페닐-1H-인다졸 또는 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염.

청구항 8

제3항에 있어서, 3-(4-에틸-1-피페라지닐)-1-[4-(트리플루오로 메틸)페닐]-1H-인다졸 또는 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염.

청구항 9

일반식(II)의 화합물, 그의 기하 이성체, 광학적 대장체, 또는 약제학적으로 허용되는 산부가염.



상기식에서, R은 저급알킬, 저급알콕시카보닐 또는 일반식 의 그룹(여기에서, X¹은 할로겐, 저급알킬, 저급알콕시, 저급알킬티오, 디저급알킬아미노, 니트로, 시아노, 또는 트리플루오로 메틸이며; P는 0 내지 2의 정수이고, 각각의 P에 대해 X¹은 같거나 다를 수 있다)이며; X 및 Y는 독립적으로, 할로겐, 저급알킬, 저급알콕시, 저급알킬티오, 디저급알킬아미노, 니트로, 시아노 또는 트리플루오로 메틸이며; n은 0 또는 1의 정수이며; m은 0 내지 2의 정수이고; 각각의 m에 대해, Y는 같거나 다를 수 있으며; Z는 불소 또는 염소이다.

청구항 10

약제학적으로 적절한 담체와 함께 활성성분으로서 제1항에 정의된 화합물을 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 11

진통, 진경 및/또는 항우울 활성을 가지는 약제를 제조하기 위한, 제1항에 정의된 화합물의 용도.

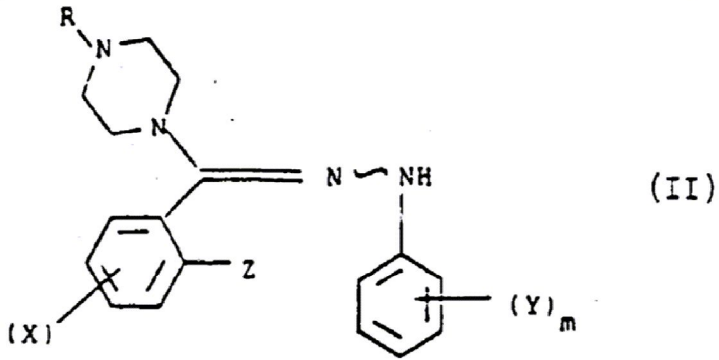
청구항 12

a) 일반식(II)의 화합물을 불활성 유기용매의 존재하에 무기염기로 처리하고; b) 임의로 R¹이 저급알콕시 카보닐인 일반식(1)의 화합물을 가수분해시켜 R¹이 수소인 일반식(1)의 화합물을 제공하고; c) 임의로 R¹이 수소인 일반식(1)의 화합물을 일반식 R¹X²의 할라이드(여기에서, R¹은 저급알킬, 사이클로알킬저급알킬, 하이드록저급알킬, 저급알케닐, 디저급알킬포스피닐 저급알킬, 디저급알킬아미노, 저급알카노일,



시아노 또는 일반식 (여기에서, q, p, 및 X¹은 상기 정의된 바와 같다)의 라디칼이며, X²는 할로겐이다)로 처리하여 R¹이 상기 정의된 R¹의 의미를 갖는 일반식(1)의 화합물을 제공하고, d) 임의로 R¹이 수소인 일반식(1)의 화합물을 무수 아세트산의 존재하에 포름산으로 처리하여 R¹이 포름일 그룹인 일반식(1)의 화합물을 제공하고, e) 임의로 R¹이 수소인 일반식(1)의 화합물을

일반식 $\text{NO}_2\text{NH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NHR}^2$ (여기에서, R^2 는 수소 또는 저급알킬이다)의 니트로-치환된 우레아로 처리하여 R 이 아미노카보닐 또는 저급알킬아미노 카보닐인 일반식(I)의 화합물을 제공하고, f) 임의로 당분야에 공지된 통상의 방법으로 그의 약제학적으로 허용되는 산부가염을 제조함을 특징으로 하여 제1항에 정의된 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, X, Y, m 및 n은 제9항에 정의된 바와같으며, R은 저급알킬, 저급알콕시카보닐 또는 페닐이며, Z는 불소 또는 염소이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.