

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07D 249/04	(11) 공개번호 특 1986-0008152
	(43) 공개일자 1986년 11월 12일
(21) 출원번호 특 1986-0002954	
(22) 출원일자 1986년 04월 17일	
(30) 우선권주장 1663/85-5 1985년 04월 18일 스위스(CH)	
(71) 출원인 시바-가이키 에이지 아놀드 자일러, 에른스트 알테르	
(72) 발명자 스위스연방 4002 바슬 클라이벡 스트라세 141 레네 마이어	
(74) 대리인 스위스연방 4463 부즈 리켄바허 스트라세 76 이병호	

심사청구 : 없음

(54) 불소화 벤질트리아졸의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

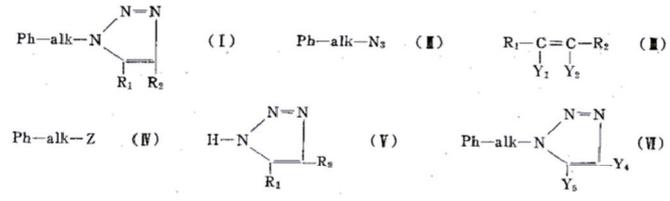
불소화 벤질트리아졸의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(II)의 화합물을 하기 일반식(III)의 화합물 또는 이의 염 및/또는 토도머와 반응시키거나 ; 하기 일반식(IV)의 화합물을 하기 일반식(V)의 1H-1,2,3-트리아졸 유도체 또는 이의 염과 반응시키거나 ; 하기 일반식(VI)의 화합물에서, X<sub>A</sub> 및/또는 Y<sub>B</sub>를 카바모일 또는 저급알킬카바모일로 전환시키고 필요한 경우, 이성체의 혼합물을 각각의 이성체로 분리시켜 일반식(I)의 이성체를 단리시키고, 필요한 경우, 이렇게 수득한 반응생성물을 일반식(I)의 다른 화합물로 전환시키고/시키거나, 상기 방법에 의해 수득한 에난티오머 또는 부분입체 이성체의 혼합물을 개개성분으로 분할시킴을 특징으로 하여, 하기 일반식(I)의 1-(α-페닐-저급알킬)-1H-1,2,3-트리아졸을 제조하는 방법.



상기식에서, Ph는 1개 이상의 추가의 할로겐원자에 의해 추가로 치환될 수 있는 o-불소화 페닐라디칼이고 ; alk는 저급알킬리덴이며 ; R<sub>1</sub>은 수소, 저급알킬, 또는 비치환되거나 저급알칸오일 또는 저급알킬에 의해 치환된 카바모일그룹이고 ; R<sub>2</sub>는 비치환되거나 저급알칸오일 또는 저급알킬에 의해 치환된 카바모일그룹이며 ; Y<sub>1</sub>은 하이드록시이고, Y<sub>2</sub>는 수소가거나, Y<sub>1</sub>과 Y<sub>2</sub>가 함게는 추가의 결합을 형성하고 ; Z는 반응성 에스테르화 하이드록시이며 ; Y<sub>3</sub>는 카바모일 또는 저급알킬카바모일로 전화가능한 라디칼 Y<sub>A</sub>이고 ; Y<sub>4</sub>는 그룹 R<sub>1</sub>, 또는 카바모일 또는 저급알킬카바모일로 전화가능한 라디칼 Y<sub>B</sub>이거나, Y<sub>4</sub>는 그룹 R<sub>2</sub>이고 ; Y<sub>5</sub>는 카바모일 또는 저급알킬카바모일로 전화가능한 라디칼 Y<sub>B</sub>이다.

청구항 2

제1항에 있어서, Y<sub>4</sub>가 에스테르화 카복시이고 Y<sub>5</sub>가 수소, 저급알킬 또는 에스테르화 카복시인 일반식(VI) 화합물을 과량의 암모니아 또는 디-저급알킬아민과 반응시키고, 필요한 경우, 이렇게 하여 수득된 R<sub>2</sub> 및/또는 R<sub>1</sub>이 비치환된 카바모일인 화합물에서 R<sub>2</sub> 및/또는 R<sub>1</sub>을 저급 알칸오일화시킴을 특징으로 하는 방

법.

**청구항 3**

제1항에 있어서, 본 명세서의 실시예 1 내지 18중 어느 하나에 기술된 방법.

**청구항 4**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, ph가 원자번호 35까지의 할로겐원자 3개이하에 의해 추가로 치환될 수 있는 o-불소화 페닐라디칼이고, alk는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬리덴이며, R<sub>1</sub>은 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬, 카바모일, N-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>7</sub>)알칸오일카바모일 또는 N,N-디(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬카바모일이고, R<sub>2</sub>는 카바모일, N-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>7</sub>)알칸오일카바모일 또는 N,N-디(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 5**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, ph가 2개이하의 염소원자에 의해, 1개의 불소원자 및 1개의 염소원자에 의해 또는 2개이하의 불소원자에 의해 추가로 치환될 수 있는 o-불소화 페닐라디칼이고, alk는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬리덴이며, R<sub>1</sub>은 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬, 카바모일, N-(C<sub>2</sub> 내지 C<sub>5</sub>)알칸오일카바모일 또는 N,N-디(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬카바모일이고, R<sub>2</sub>는 카바모일, N-(C<sub>2</sub> 내지 C<sub>5</sub>)알칸오일카바모일 또는 N,N-디(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 6**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, ph가 염소원자 1개, 불소원자 1개 및 염소원자 1개에 의해, 또는 불소원자 2개이하에 의해 추가로 치환될 수 있는 o-불소화 페닐라디칼이고, alk는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬리덴이며, R<sub>1</sub>은 수소 또는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬이거나, 라디칼 R<sub>2</sub>이고, R<sub>2</sub>는 카바모일 또는 N,N-디(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)알킬카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 7**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, pH가 0-플루오로페닐, 2,3-, 2,4-, 2,5- 또는 2,6-디플루오로페닐 또는 6-클로로-2-플루오로페닐이고, alk는 메틸렌이며, R<sub>1</sub>은 수소 또는 카바모일이고, R<sub>2</sub>는 카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 8**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, pH가 0-플루오로페닐 또는 2,6-디플루오로페닐, 2,6-디플루오로페닐 또는 2-클로로-6-플루오로-페닐이고, alk는 메틸렌이며, R<sub>1</sub>은 수소 또는 카바모일이고 R<sub>2</sub>가 카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 9**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, pH가 0-플루오로페닐, 2,5-디플루오로페닐, 2,6-디플루오로페닐 또는 2-클로로-6-플루오로-페닐이고, alk는 메틸렌이며, R<sub>1</sub> 및 R<sub>2</sub> 둘다가 카바모일인 일반식 ( I ) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 10**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 제1항에 따르는 1-(0-플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카복사미드를 제조하는 방법.

**청구항 11**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 제1항에 따르는 1-(2,6-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카복사미드를 제조하는 방법.

**청구항 12**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 제1항에 따르는 1-(플루오오벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복사미드를 제조하는 방법.

**청구항 13**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 제1항에 따르는 1-(2,6-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복사미드를 제조하는 방법.

**청구항 14**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(6-클로로-2-플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카복사미드를 제조하는 방법.

**청구항 15**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(6-클로로-2플루오로벤질)-1H-1,2,3,-트리아졸-4,5-디카복사

미드를 제조하는 방법.

**청구항 16**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,5-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 17**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,4-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 18**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,6-디플루오로벤질)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 19**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,6-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-(N,N-디메틸)디카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 20**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-[1-(2,6-디플루오로페닐)에틸]-1H-1,2,3-트리아졸-4-카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 21**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-{2-[2-(2,6-디플루오로페닐)프로필]}-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 22**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-{2-[2-(2,6-디플루오로페닐)프로필]}-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 23**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,6-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4-(N-아세틸)카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 24**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,6-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-(N-아세틸)디카복스아미드를 제조하는 방법.

**청구항 25**

제1항 내지 3항중 어느 하나에 있어서, 1-(2,3-디플루오로벤질)-1H-1,2,3-트리아졸-4,5-디카복스아미드를 제조하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.