

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁵ C07D 233/60	(11) 공개번호 특 1992-0014786
	(43) 공개일자 1992년 08월 25일
(21) 출원번호	특 1992-0000124
(22) 출원일자	1992년 01월 08일
(30) 우선권주장	91-00185 1991년 01월 09일 프랑스(FR)
(71) 출원인	로우셀-우크라프 위베르 프리델 프랑스공화국 75007 파리지 볼르바르 데 쟁발리드 35
(72) 발명자	마르틴 길라르-켈리 프랑스공화국 75009 파리지 퀴 노트르 담 드 로레뜨 54 프랑스와 구베 프랑스공화국 75015 파리지 퀴 데 볼롱테르 54 다니엘 필리베르 프랑스공화국 94210 라 바렌 생 필레르 퀴 쉬발리에 16 장-조르즈 뒤펜 프랑스공화국 93500 팡땡 퀴 라브와시에르 3 레지당스 라브와시에르 바. 3
(74) 대리인	김성택, 주성민

심사청구 : 없음

(54) 페닐이미다졸리딘, 그의 제조 방법, 약제로서의 그의 용도 및 이를 함유하는 제약 조성물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

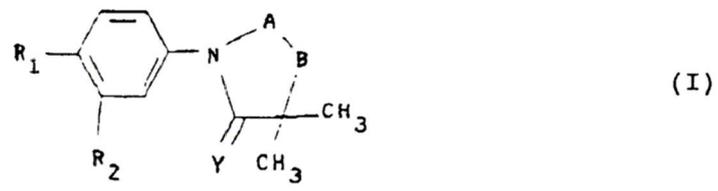
페닐이미다졸리딘, 그의 제조 방법, 약제로서의 그의 용도 및 이를 함유하는 제약 조성물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

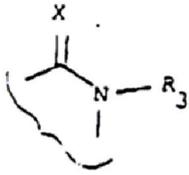
하기 일반식(I)의 화합물.



상기 식 중, R₁은 시아노 또는 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자이고, R₂는 트리플루오로메틸 라디칼 또는 할로겐 원자이고, -A-B-기는 다음 식



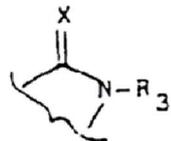
(여기서, X는 산소 또는 황 원자이고, R₃은 -수소원자, 또는 -탄소 원자수 12 이하의 알킬, 알케닐, 알키닐, 아릴 또는 아랄킬 라디칼, (이들 라디칼은 히드록시, 할로겐, 메르캅토, 시아노, 탄소 원자수 7 이하의 아실 또는 아실옥시, 분자 중 황 원자가 술폭시드 또는 술포의 형태로 산화될 수 있는 임의로 치환된 S-아릴, 유리, 에스테르화, 아미노화 또는 염화 카르복실, 아미노, 모노-또는 디알킬아미노, 또는 황, 산소 또는 질소 원자로부터 선택된 1종 이상의 헤테로 원자를 포함하는 3 내지 6원 헤테로고리 라디칼 중에서 선택된 1종 이상의 치환체로 치환될 수 있으며, 상기 알킬, 알케닐 또는 알키닐 라디칼은 1종 이상의 산소, 질소 또는 술폭시드 또는 술포의 형태로 산화될 수 있는 황 원자에 의해 추가로 차단될 수 있고, 상기 아릴 및 아랄킬 라디칼은 알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시 또는 트리플루오로메틸 라디칼에 의해 추가로 치환될 수 있다) 중에서 선택된다)의 라디칼 중에서 선택되고, Y는 산소 또는 황 원자, 또는 =NH 라디칼이며, 단, -A-B-기가 다음 식



(식 중, X는 산소 원자이고, R₃은 수소 원자이다)의 라디칼이고, Y가 산소 원자 또는 NH 라디칼이며, R₂가 할로겐 원자 또는 트리플루오로메틸 라디칼이며, R₁이 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자인 화합물은 제외한다.

청구항 2

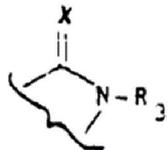
제1항에 있어서, -A-B-기가 다음 식



[식 중, X는 산소 원자이고, R₃은 수소 원자이다]의 라디칼이고, R₂가 할로겐 원자 또는 트리플루오로메틸라디칼이며, R₁이 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자인 화합물은 제외한, Y가 산소 원자인 일반식(1)의 화합물.

청구항 3

제1 또는 2항에 있어서, -A-B-기가 다음 식



[식 중, X는 황 원자이고, R₃은 제1항에서 정의한 바와 같다]의 라디칼인 일반식(1)의 화합물.

청구항 4

제3항에 있어서, R₃이 수소 원자, 또는 히드록실 라디칼에 대해 치환될 수 있는 탄소 원자수 4 이하의 알킬 라디칼인 일반식(1)의 화합물.

청구항 5

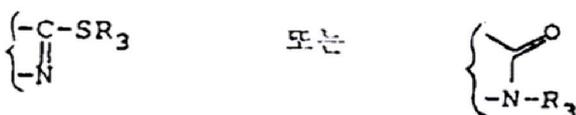
제1 내지 4항 중 어느 한 항에 있어서, R₁이 시아노 라디칼 또는 할로겐 원자인 일반식(1)의 화합물.

청구항 6

제5항에 있어서, R₁이 염소 원자인 일반식(1)의 화합물.

청구항 7

제1 또는 2항에 있어서, -A-B-기가 다음 식



[식 중, R₃은 탄소 원자수 4 이하의 알킬 또는 알케닐 라디칼, 또는 임의로 치환된 아랄킬 라디칼이다]의 기인 일반식(I)의 화합물.

청구항 8

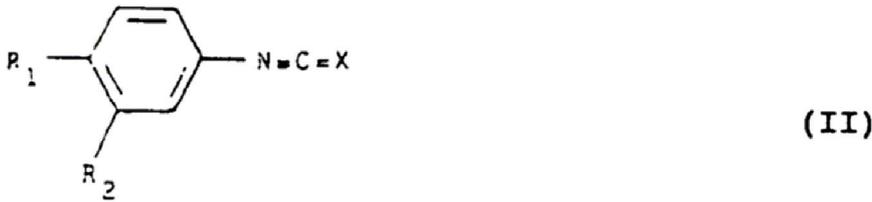
제1 내지 5항 중 어느 한 항에 있어서, -4-(5-옥소-2-티옥소-3,4,4-트리메틸-1-이미다졸리디닐)-2-(트리플루오로메틸)벤조니트릴, - 4-(4,4-디메틸-5-옥소-2-티옥소-1-이미다졸리디닐)-2-(트리플루오로메틸)벤조니트릴, - 4-[4,4-디메틸-3-(2-히드록시에틸)-5-옥소-2-티옥소-1-이미다졸리디닐]-2-(트리플루오로메틸)벤조니트릴, 또는 -3-(3,4-디클로로페닐)-2-티옥소-1,5,5-트리메틸-4-이미다졸리디논으로 명명되는 일반식(I)의 화합물.

청구항 9

제1, 2 및 7항 중 어느 한 항에 있어서, - 1-(4-니트로-3-(트리플루오로메틸)페닐)-3,4,4-트리메틸-2,5-이미다졸리딘디온, 또는 - 4-[4,5-디히드로-4,4-디메틸-5-옥소-2-(페닐메틸)티오]-1H-이미다졸-1-일]-2-(트리플루오로메틸)벤조니트릴로 명명되는 일반식(I)의 화합물.

청구항 10

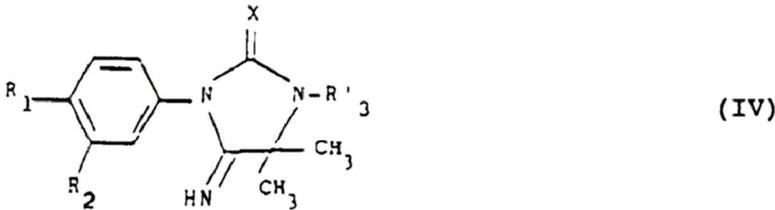
하기 일반식(II)



[상기 식 중, R₁은 시아노 또는 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자이고, R₂는 트리플루오로메틸 라디칼 또는 할로겐 원자이고, X는 산소 또는 황 원자이다]의 화합물을 3급 염기의 존재하에 하기 일반식(III)



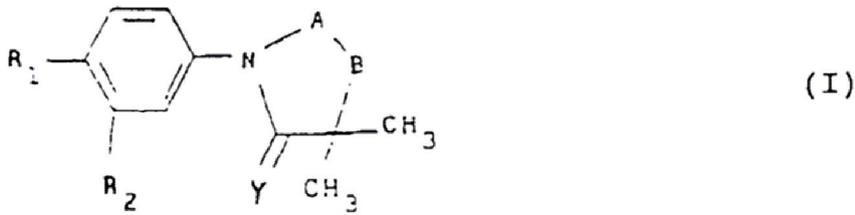
[상기 식 중, R'₃은 위에서 R₃에 관하여 정의한 바와 같고, 다만 존재 가능한 반응성 관능기는 보호될 수 있으며, R₁이 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자이고 R₂가 할로겐 원자 또는 CF₃ 라디칼이고 X가 산소 원자인 경우, R'₃은 수소 원자일 수 없다]의 화합물과 반응시켜 하기 일반식(IV)



[상기 식 중, R₁, R₂, X 및 R'₃은 상기 정의한 바와 같다]의 화합물을 얻고, 필요에 따라서, 얻어진 일반식(IV)의 화합물에 대하여 (a) R'₃에 존재할 수 있는 보호기의 제거 반응; (b) >C=NH기를 가수분해시켜 케톤기로 전환시키는 반응, 및 필요시, >C=S기의 >C=O기로의 전환 반응; (c) >C=O개(들)의 >C=S기로의 전환 반응; 및 (d) >C=NH기를 가수분해시켜 케톤 관능기로 전환시킨 후, 일반식 Hal-R''₃(여기서, R''₃는 수소가 아닌 것을 제외하고는 R'₃에 대한 정의와 동일하며, Hal은 할로겐 원자이다)의 시약을 R''₃이 수소 원자인 일반식(IV)의 화합물에 작용시키는 반응 중 한개 이상을 무순서로 수행하여, -A-B-기가 하기 식



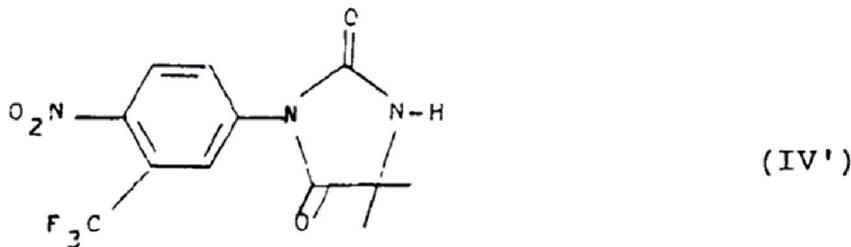
[상기 식 중, R₃은 상기 정의한 바와 같다]의 기인 하기 일반식(I)



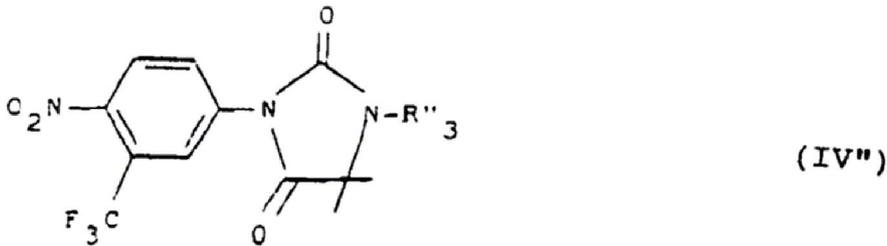
[상기 식 중, R₁ 및 R₂는 상기 정의한 바와 같고, -A-B-기는 다음 식



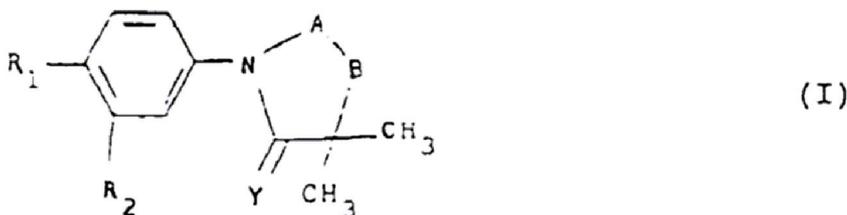
(여기서, X는 산소 또는 황 원자이고, R₃은 - 수소 원자, 또는 - 탄소 원자수 12 이하의 알킬, 알케닐, 알키닐, 아릴 또는 아랄킬 라디칼(이들 라디칼은 히드록시, 할로겐, 메르캅토, 시아노, 탄소 원자수 7 이하의 아실 또는 아실옥시, 분자 중 황 원자가 술폭시드 또는 술폰의 형태로 산화될 수 있는 임의로 치환된 S-아릴, 유리, 에스테르화, 아미노화 또는 염화 카르복실, 아미노, 모노-또는 디알킬아미노, 또는 황, 산소 또는 질소원자로부터 선택된 1종 이상의 헤테로 원자를 포함하는 3 내지 6원 헤테로 고리 라디칼 중에서 선택된 1개 이상의 치환체로 치환될 수 있으며, 상기 알킬, 알케닐 또는 알키닐 라디칼은 1종 이상의 산소, 질소, 또는 술폭시드 또는 술폰의 형태로 산화될 수 있는 황 원자에 의해 추가로 차단될 수 있고, 상기 아릴 및 아랄킬 라디칼은 알킬, 알케닐, 알키닐, 알콕시, 알케닐옥시, 알키닐옥시 또는 트리플루오로메틸 라디칼에 의해 추가로 치환될 수 있다) 중에서 선택된다)의 라디칼 중에서 선택되고, Y는 산소 또는 황 원자, 또는 =NH 라디칼이다]의 화합물을 얻고, 필요에 따라서, 얻어진 일반식(I)의 화합물에 R₃에 존재할 수 있는 보호기를 제거할 수 있는 시약 또는 에스테르화제, 아미노화제 또는 염화제를 작용시키거나, 또는 일반식 Hal-R₃[여기서, Hal 및 R₃은 상기 정의한 바와 같다]의 시약을 하기 일반식(IV')



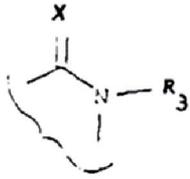
의 화합물과 반응시켜 하기 일반식(IV'')



의 화합물을 얻고, 필요시, 얻어진 일반식(IV'')의 화합물에 대하여 (a) R₃에 존재할 수 있는 보호기의 제거반응; 및 필요시, 에스테르화제, 아미노화제 또는 염화제와의 후소 반응 및 (b) >C=O기(들)의 >C=S기로의 전환 반응 중 한개 이상을 무순서로 수행함을 특징으로 하는, 하기 일반식(I)



[상기 식 중, R₁, R₂, -A-B- 및 Y는 상기 정의한 바와 같되, 다만, -A-B-기가 다음 식



(여기서, X는 산소 원자이고, R₃은 수소 원자이다)의 라디칼이고, Y가 산소 원자 또는 NH 라디칼이고 R₂가 할로겐 원자 또는 트리플루오로메틸 라디칼이며, R₁이 니트로 라디칼 또는 할로겐 원자인 화합물은 제외한다]의 화합물의 제조 방법.

청구항 11

제약상 허용되는 약제로서 유용한 제1 내지 7항 중 어느 한 항에 기재된 일반식(I)의 화합물.

청구항 12

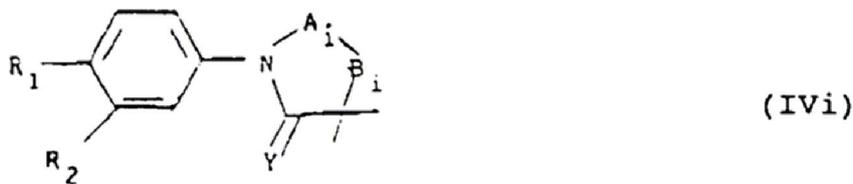
약제로서 유용한 제8 또는 9항에 기재된 일반식(I)의 화합물.

청구항 13

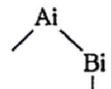
활성 성분으로서 유용한 제11 또는 12항에 기재된 약제 1종 이상을 함유하는 제약 조성물.

청구항 14

신규 공업 제품으로서의 하기 일반식(IVi)의 화합물.



(IVi)

상기 식 중, R₁, R₂ 및 Y는 제1항에서 정의한 바와 같고,  기는 하기 식



[식 중, X는 산소 또는 황 원자이고 R_{3i}는 보호된 반응성 관능기를 포함하여 R₃에 대해 정의된 기종에서 선택된다]의 라디칼 중에서 선택된다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.