(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07D 233/61

(11) 공개번호 특1993-0002323
(43) 공개일자 1993년02월22일

(21) 출원번호 특1992-0013479
(22) 출원일자 1992년07월28일
(30) 우선권주장 9116470.7 1991년07월30일 영국(GB)
(71) 출원인 팜이탈리아 카를로 에르바 에스.알.엘 비토리노 페라리오
이탈리아공화국 20159 밀란 비아 카를로 임보나티 24
(72) 발명자 파올로 코치
이탈리아공화국 20133 밀란 비아 자넬라 48/5
마리아 메니친체리
이탈리아공화국 20124 밀란 비아 레코 10
아르세니아 로씨
이탈리아공화국 24044 베르가모 달민 비아 필리포 투라티 6
코라도 페르티
이탈리아공화국 20030 밀란 바틀라씨나 비아 콰시모도 3
파트리시아 살바티
이탈리아공화국 20020 밀란 아레세 비아 발레라 16
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴-아민옥시알카노산 유도체 및 이의 제조방법

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

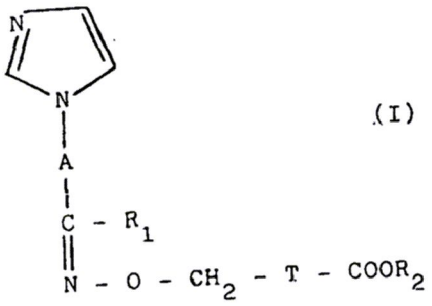
2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴-아민옥시알카노산 유도체 및 이의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

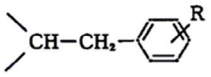
(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(I)의 화합물 및 이의 약제학적으로 허용되는 염.



(I)

상기식에서, A는 일반식  (여기서, R은 수소, 할로겐, CF_3, C_1-C_4알콕시, C_1-C_4알킬설포닐 또는 시아노이다)의 2가 그룹이고, R_1은 비치환되거나 할로겐, C_1-C_4알콕시, CF_3 또는 C_1-C_4알킬설포닐로 치환된 페닐 ; 사이클로헥실 ; 또느 직쇄 또는 측쇄 C_1-C_6알킬 그룹이며, T는 직쇄 또는 측쇄 C_3-C_5알킬렌 쇄이고, R_2는 수소 또는 C_1-C_4알킬이다.

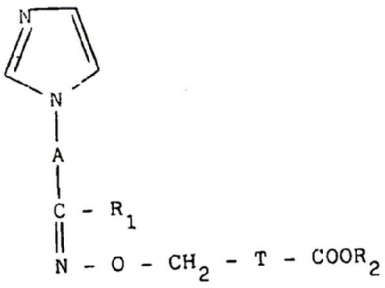
청구항 2

(±)-5-[1-페닐-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-플루오로벤질)에틸리텐]아민옥시펜타노산;(±)-5-[1-페닐-2-(이미다졸-1-)일-2-(4-클로로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-(3-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산;(±)-5-(1-시이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-메톡시벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5- [11-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-트리플루오로메틸벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-(3-클로로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(4-플루오로페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2- (3-클로로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(3-트리플루오로메틸페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(3-메틸설포닐페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2-(3-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(4-메틸설포닐페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[(1-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질-에틸리덴]-2,2-디메틸아민옥시펜타노산; (±)-5- [1-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질-에틸리덴]-3,3-디메틸아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-사이클로헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-메틸설포닐벤질)에틸리텐)아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(4-플루오로페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-메틸설포닐벤질)에틸리텐)아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-페닐-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴]-3,3-디메틸아민옥시펜타노산; (±) [1- (3-트리플루오로메틸페닐)-2-벤질에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-페닐-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴]-2,2-디메틸아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(4-메톡시페닐)-2- (이미다졸-1-일)-2-(4-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-(4-클로로페닐)-2-(이미다졸-1-일)-2- (4-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-n-헥실-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-메틸-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-메틸-2-(이미다졸-1-일)-2-(4-플루오로벤질)에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5- [1-에틸-2-(이미다졸-1-일)-2-벤질에틸리덴]아민옥시펜타노산; (±)-5-[1-프로필-2- (이미다졸-1-일)-2-벤질에틸러덴]아민옥시펜타노산으로 이루어진 그룹중에서 선택된, 2-또는 7-이성체 또는 이들 이성체들의 Z, E-혼합물 형태의 화합물 및 이의 약제학적으로 허용되는 염.

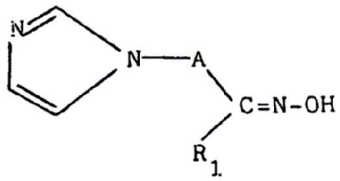
청구항 3

a)일반식 (II)의 옥심 또는 이의 염을 일반식 (III)의 화합물과 반응시키거나, b)상기 일반식 (II)의 옥심 또는 이외 염을 일반식(IV)의 락톤과 반응시켜 R_2가-OH인 일반식(I)의 화합물을 수득하거나, c)일반식(V)의 화합물을 일반식(VI)의 화합물과 반응시키거나, d)상기 일반식(V)의 화합물을 일반식(VII)의 화합물과 반응시키고; 경우에 따라 일반식 (I)의 화합물을 일반식 (I)의 또다른 화합물로 전환시키고/시키거나; 경우에 따라 일반식(I)의 화합물을 이의 염으로 전환시키고/시키거나; 경우에 따라 일반식(I)의 화합물의 염을 유리 화합물로 전환시키고/시키거나; 경우에 따라 일반식(I)의 화합물의 이성체 화합물을 단일 이성체로 분리하고/하거나; 경우에 따라 옥심 이중 결합상에서의 이성체화에 의해 일반식 (I)의 화합물의 이성체 혼합물의 E- 및 Z-이성체비를 변화시켜 상이한 비의 이성체 혼합물을 수득하고/하거나; 경우에 따라 옥신 이중 결합상에서의 이성체화에 의해 일반식 (I)의 화합물의 순수한 I-이성체를 이의 순수한 Z-이성체 또는 E- 및 Z-이성체 혼합물로 전환시키고/시키거나; 경우에 따라 옥심 이중 결합상에서의 이성체화에 의해 일반식 (I)의 화합물의 순수한 Z-이성체를 이의 순수한 E-이성체를 이의 순수한 E-이성체 또는 I-및 Z-이성체 혼합물로 전환시킴을 특징으로 하여, 제1항에 따른 일반식(I)

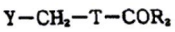
의 화합물 또는 이의 염을 제조하는 방법.



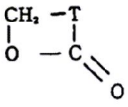
(I)



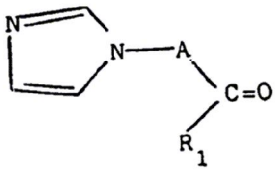
(II)



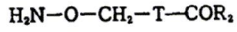
(III)



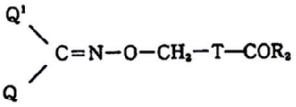
(IV)



(V)



(VI)



(VII)

상기식에서. A, R_1, R_2 및 T는 상기 제1항에서 정의한 바와 같고, Y는 이탈그룹이며, Q 및 Q' 는 각각 독립적으로 수소 저급 알킬 또는 페닐이다.

청구항 4

활성 성분으로서 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물 또는 이의 약재학적으로 허용되는 염 및 적합한 담체 및/또는 희석제를 포함함을 특징으로 하는 약제학적 조성물.

청구항 5

제1항에 있어서, 트롬복산 A_2, 합성의 향상과 관련된 질환 치료에 사용하기 위한 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 6

제1항에 있어서, 신장병 치료에 사용하기 위한 일반식(I)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 7

제1항에 있어서, 사이클로스포린 A-유도된 신장중의 예방 및/또는 치료에 사용하기 위한 일반식(I)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 8

제1항에 있어서, 신장병 증후군에 수반되는 과지혈증 치료에 사용하기 위한 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염.

※ 참고사항 ; 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.