

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>  
C07F 5/02

(11) 공개번호 특1990-0009663  
(43) 공개일자 1990년07월05일

|            |   |
|------------|---|
| (21) 출원번호  | 특1989-0017374   |
| (22) 출원일자  | 1989년11월29일   |
| (30) 우선권주장 | P3840452.4 1988년12월01일 독일(DE)   |
| (71) 출원인   | 헥스트 아크티엔 게젤샤프트 벡커, 벡크<br>독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 50   |
| (72) 발명자   | 하인즈 베르너 클리만<br>독일연방공화국 데-6092 켈스테르바크 안스트라세 6<br>한스외르그 우르바크<br>독일연방공화국 데-6242 크론베르크/타우누스 레 라반도우스트라세 41<br>디터 루페르트<br>독일연방공화국 데-6242 크론베르크/타우누스 쉬레이어스트라세 30<br>베른바르트 쉬월켄스<br>독일연방공화국 데-6233 켈크하임(타우누스) 휠더린스트라세 62 |
| (74) 대리인   | 이병호, 최달용  |

심사청구 : 없음

(54) β-아미노-브론산 유도체

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

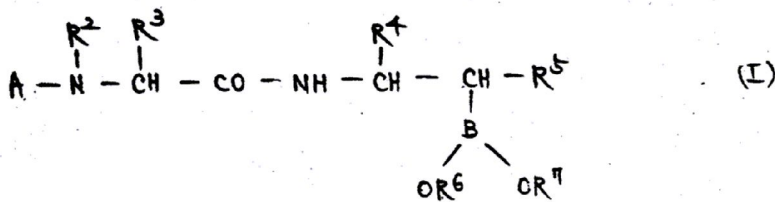
β-아미노-브론산 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

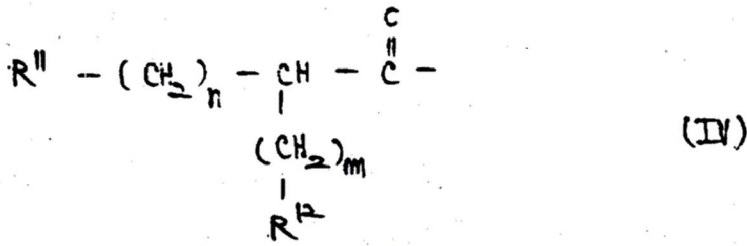
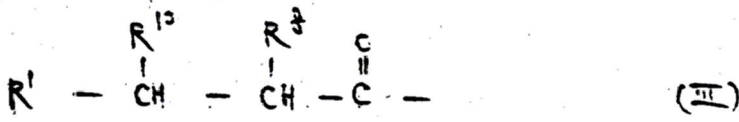
청구항 1

일반식(I)의 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용되는 염.



상기식에서, A는 일반식(II), (III) 또는 (IV)의 라디칼을 나타내고,





[여기에서 R<sup>1</sup>은 a<sub>1</sub>) 수소;임의로 일-또는 이불포화되고, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, 카바모일, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일옥시, 카복실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, F, Cl, Br, I, 아미노, 아미디노(이는 1내지 3개의 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 라디칼로 임의로 치환될 수 있다), 구아니디노(이는 1내지 4개의 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 라디칼로 임의로 치환될 수 있다), (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-알콕시카보닐아미노, (C<sub>7</sub>-C<sub>15</sub>)-아르알콕시카보닐 아미노 및 9-플루오레닐메톡시카보닐아미노로 이루어지는 그룹으로부터의 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬;모노-, 비-또는 트리사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴 (여기에서, 사이클로알킬 부분은 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬로 임의로 치환되고, 아릴은 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 아미노 및 트리플루오로메틸로 이루어지는 그룹으로부터의 1또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된다); 아릴 부분이 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬 (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 카복실, 카복시메톡시, 아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>) 알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)알킬, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐메톡시, 카바모일, 설페오일, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시설페오일 및 설페오-및 구아니디노-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬로 이루어지는 그룹으로부터의 1또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬; 또는 환 원으로서 탄소 원자 1개 이상, 질소 원자 1내지 4개 및/또는 황 원자 1또는 2개 및/또는 산소 원자 1또는 2개를 가지며, a<sub>1</sub>)하에 정의한 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴과 유사하게 임의로 일-, 이- 또는 삼치환된, 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭, 부분적으로 또는 완전히 수소화된 헤테로방향족의 라디칼을 나타내거나, a<sub>2</sub>) 일반식(V)의 라디칼을 나타낸다.



(여기에서, R<sup>1</sup>는 a<sub>1</sub>) 하에 R<sup>1</sup>으로 정의된 바와 같고, W는 -CO-, -O-CO-, -SO<sub>2</sub>-, -SO-, -NH-SO<sub>2</sub>-, -NH-CO-, -CH(OH)- 또는 -N(OH)-를 나타낸다); R<sup>2</sup>는 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬을 나타내거나, 또는 R<sup>3</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께 5내지 12개의 환 원을 가지며, 모노-또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하며; R<sup>3</sup> 및 R<sup>8</sup>은 서로 독립적으로 a<sub>1</sub>)하에 R<sup>1</sup>으로서 정의된 바와 같거나, 또는 R<sup>2</sup> 또는 R<sup>9</sup> 및 이들을 갖는 원자와 함께, 상기 정의한 바와 같이, 5내지 12개의 환원을 갖는 환 시스템을 형성하고; R<sup>4</sup>는 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, 모노-, 비-또는 트리사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬 메틸 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬에틸 (여기에서, 사이클로알킬 부분은 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬로 임의로 치환된다), 디티올라닐, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴메틸, 디티올라닐메틸, 디티올라닐에틸, 디티아닐, 디티아닐메틸 또는 디티아닐에틸을 나타내며; R<sup>5</sup>는 수소, 아지도, 아지도-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬 (이는 하이드록실, 아지도, 또는 하이드록실 및 아지도로 임의로 치환될 수 있다). (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬설페오일-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬설페오일-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 (여기에서, 아릴은 환 원으로서 탄소 원자 1개 이상, 질소 원자 1내지 4개 및/또는 황 원자 1또는 2개 및/또는 산소 원자 1또는 2개를 가지며, 또한 부분적으로 또는 완전히 수소화될 수 있는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9-또는 10원 비사이클릭 헤테로방향족의 라디칼을 나타낼 수 있으며, 아릴 및 헤테로아릴은 a<sub>1</sub>) 하에 정의된 바와 같이 유사하게 치환될 수 있다)을 나타내고; R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 서로 독립적으로 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬을 나타내거나, 또는 붕소 원자 및 산소 원자들과 함께, 붕소 원자, 산소 원자 및 탄소 원자(들)에 더하여 -O-원, -NR<sup>13</sup>-원 또는 -CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>-원을 또한 함유할 수 있는 5내지 18개의 환 원을 갖는 모노-, 비- 또는 트리사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 모노-, 디-, 트리-또는 테트라-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬화되거나 페닐화된 환 시스템을 형성하며, R<sup>9</sup>는 수소 또는 (C<sub>1</sub>-

C<sub>8</sub>)-알킬을 나타내거나, 또는 R<sup>8</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 5내지 12개의 환 원을 갖는 모노-또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하고; R<sup>18</sup>은 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬이거나, 또는 R<sup>1</sup> 또는 R<sup>8</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께 탄소 원자에 더하여 황 원자 1개를 또한 함유할 수 있고, 설픽사이드 또는 설피온으로 임의로 산화될 수 있으며, 5내지 12개의 환 원을 갖는 모노-또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하며; R<sup>11</sup> 및 R<sup>12</sup>는 서로 독립적으로 수소; 하이드록실; 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴 (여기에서, 아릴은 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 카복실, 카복시메톡시, 아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐메톡시, 카바모일, 설파모일, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시설피닐 및 설피-및 구아니디노-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬로 이루어지는 그룹으로부터의 1또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된다)이거나; 또는 환 원으로서 탄소 원자 1개 이상, 질소 원자 1내지 4개 및/또는 황 원자 1 또는 2개 및/또는 산소원자 1 또는 2개를 가지며, 상기 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴과 유사하게 임의로 일-또는 이치환된 5-또는 6-원 모노사이클릭 또는 9-또는 10-원 비사이클릭, 임의로는 부분적으로 또는 완전히 수소화된 헤테로방향족의 라디칼을 나타내며; n 및 m은 서로 독립적으로 0, 1, 2, 3 또는 4일 수 있고, R<sup>13</sup>은 수소; 또는 임의로 일-또는 이불포화되고, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, 아미노 및 모노-또는 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노로 이루어지는 그룹으로부터의 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬을 나타내며; R<sup>14</sup> 및 R<sup>15</sup>는 서로 독립적으로 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬, 하이드록시메틸, 2-하이드록시메틸, (3-하이드록시설피닐, 2-하이드록시프로필)아미노, (2-하이드록시설피닐에틸)아미노, (2-하이드록시설피닐프로필)아미노, (카복시메틸)아미노 또는 비스(2-하이드록시에틸)아미노를 나타낸다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sup>1</sup>은 수소; (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; 사이클로펜틸; 사이클로헥실; 사이클로펜틸-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; 사이클로헥실-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; 임의로 치환된 페닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬; 2-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬; 3-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬; 4-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬; H<sub>2</sub>N-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; HO-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시카보닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬설피닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬설피닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-하이드록시알킬설피닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-하이드록시알킬설피닐; 하이드록시-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알카노일; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일옥시-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; (C<sub>1</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 임의로 보호된 아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 피페리디노-4-카보닐; 모르폴리노-4-카보닐; (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-사이클로알킬카보닐; (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-아릴-(C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 2-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일; 3-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일; 4-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일; 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐로 임의로 치환된 벤조일; 피롤릴-2-카보닐, 피리딜-3-카보닐; 벤젠설피닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알콕시카보닐; 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알콕시카보닐; 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알콕시카보닐을 나타내거나, 또는 R<sup>10</sup>과 함께, 탄소에 더하여 또한 황 원자 1개를 함유할 수 있으며, 임의로 설픽사이드 또는 설피온으로 산화될 수 있고, 5내지 12개의 환 원을 갖는 모노-또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하며; R<sup>2</sup>는 수소, 메틸 또는 에틸이거나, 또는 R<sup>3</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 각각 사이클로펜틸, 사이클로헥실 또는 페닐과 또한 융합될 수 있는 피롤리딘 또는 피페리딘을 형성하고; R<sup>3</sup> 및 R<sup>8</sup>은 서로 독립적으로 수소; 임의로 일-또는 이불포화되고, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알카노일옥시, 카복실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시 카보닐, Cl, Br, 아미노, 아미디노, 구아니디노, 카바모일, (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-알콕시카보닐아미노, (C<sub>6</sub>-C<sub>15</sub>)-아르알콕시카보닐 아미노 및 9-플루오레닐메톡시카보닐아미노로 이루어지는 그룹으로부터의 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 아미노 및 트리플루오로메틸로 이루어지는 그룹으로부터의 1또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬 또는 모노-또는 비사이클릭 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬; 또는 환 원으로서 탄소 원자 1개 이상, 질소 원자 1내지 4개 및/또는 황 원자 1또는 2개 및/또는 산소 원자 1또는 2개를 가지며, 제1항에서 아릴 부분에 대해 기술한 바와 같이 임의로 일-또는 이치환된 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭, 임의로는 부분적으로 또는 완전히 수소화된 헤테로 원자의 라디칼로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬을 나타내거나, 또는 R<sup>2</sup>또는 R<sup>9</sup>와 함께 R<sup>2</sup>하에 상기 기술한 바와 같이 환 시스템을 형성하며; R<sup>4</sup>는 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬; 사이클로알킬 부분이 임의로 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬로 치환된 모노-, 비- 또는 트리사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로 알킬메틸; (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴메틸; 디티올라닐; 디티올라닐메틸; 디티아닐 또는 디티아닐메틸이고; R<sup>5</sup>는 수소, 아지도, 아지도-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (2-피리딜)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (3-피리딜)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (4-피리딜)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, 이미다졸-2-일, 이미다졸-1-일, 이미다졸-4-일, (이미다졸-2-일)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (이미다졸-1-일)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (이미다졸-4-일)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, [1-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이미다졸-2-일]-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (이미다졸린-2-일)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬 또는 [1-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이미다졸린-2-일]-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬을 나타내며; R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 서로 독립적으로 수소이거나, 또는 붕소 원자 및

산소 원자와 함께, 붕소 원자, 산소 원자 및 탄소 원자(들)에 더하여 -O-원, -NR<sup>13</sup>-원 또는 -CR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>-원을 또한 함유할 수 있고, 5내지 18개의 환 원을 갖는 모노-, 비- 또는 트리사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 모노-, 디-, 트리-또는 테트라알킬화되거나 -페닐화된 환 시스템을 형성하고; R<sup>9</sup>는 수소, 메틸 또는 에틸이거나, 또는 R<sup>8</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 각각 사이클로펜틸, 사이클로헥실 또는 페닐과 또한 융합될 수 있는 피롤리딘 또는 피페리딘을 형성하며; R<sup>10</sup>은 수소 또는 메틸이거나, 또는 R<sup>1</sup> 또는 R<sup>8</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 탄소 원자에 더하여 환 원자 1개를 또한 함유할 수 있고, 임의로 설포사이드 또는 설폰으로 산화될 수 있으며, 5내지 12개의 환 원을 갖는 모노-또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하고; R<sup>11</sup> 및 R<sup>12</sup>는 서로 독립적으로 수소, 하이드록실, 페닐, 2- 또는 3-티에닐, 2-, 3- 또는 4-피리딜, 1-, 2- 또는 4-이미다졸릴, 1- 또는 2-나프틸 또는 2- 또는 3-벤조[b]티에닐이며; n 및 m은 서로 독립적으로 0, 1, 2, 3 또는 4를 나타내고; R<sup>13</sup>은 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬이며; R<sup>14</sup> 및 R<sup>15</sup>는 독립적으로 수소, 하이드록실, 하이드록시메틸, 2-하이드록시메틸, (3-하이드록시설포닐, 2-하이드록시프로필)아미노, (2-하이드록시설포닐에틸)아미노, (2-하이드록시설포닐프로필)아미노, (카복시메틸)아미노 또는 비스(2-하이드록시메틸)아미노를 나타내는 일반식(1)의 화합물 또는 이의 허용되는 염.

**청구항 3**

제1항 또는 2항에 있어서, R<sup>1</sup>은 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬설포닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알킬설피닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-하이드록시알킬설포닐; 하이드록시-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알카노일; (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일옥시-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬; (C<sub>1</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 피페리디노-4-카보닐; 모르폴리노-4-카보닐; (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-사이클로알킬카보닐; (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-아릴-(C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>)-알카노일; 2-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일; 4-피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-알카노일; 할로겐, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐로 임의로 치환된 벤조일; 피롤릴-2-카보닐; 피리딜-3-카보닐; 벤젠설포닐; (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알콕시카보닐; 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알콕시카보닐; -알콕시카보닐; 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알콕시 카보닐을 나타내고; R<sup>2</sup>는 수소 또는 메틸을 나타내거나, 또는 R<sup>3</sup> 및 이들 라디칼을 갖는 -N-CH-그룹과 함께 테트라하이드로이소퀴놀린 또는 아조비사이클로옥탄 골격을 형성하며; R<sup>3</sup> 및 R<sup>8</sup>은 서로 독립적으로 수소, 메틸, 에틸, 이소프로필, n-프로필, n-부틸, 이소부틸, 2급-부틸, 3-구아니디노프로필, 카바모일메틸, 2-카바모일메틸, 카복시메틸, 2-카복시메틸, 머캅토메틸, 2-(메틸티오)에틸, (1-머캅토, 1-메틸)에틸, 하이드록시메틸, 1-하이드록시메틸, 아미노, 아미노메틸, 2-아미노에틸, 3-아미노프로필, 4-아미노부틸, N,N-디메틸아미노, 사이클로헥실프로필, 4-아미노부틸, N,N-디메틸아미노, 사이클로헥실메틸, 이미다졸-4-일-메틸, 벤질, 2-메틸벤질, 3-메틸벤질, 인돌-3-일-메틸, 4-하이드록시 벤질, 4-메톡시벤질, 3,4-디하이드록시벤질, 3,4-디메톡시벤질, (벤조디옥솔란-5-일)메틸, 2-티에닐, 2-티에닐메틸, 2-(2-티에닐)에틸, 3-티에닐, 3-티에닐메틸, 2-(3-티에닐)에틸, 4-클로로벤질, 2-(메틸설파닐)에틸, 2-(메틸설포닐)에틸, 2-피리딜메틸, 3-피리딜메틸, 4-피리딜메틸, 사이클로헥실, (1-메틸이미다졸-4-일)메틸, (3-메틸-이미다졸-4-일)메틸, 페닐, 1-나프틸메틸, 2-나프틸메틸, 2-페닐에틸, 2-티아졸릴메틸, 4-티아졸릴메틸, 3-피라졸릴메틸, 4-피리미디닐메틸, 인돌-2-일-메틸, 2-벤조[b]티에닐메틸, 3-벤조[b] 티에닐메틸 또는 2-푸릴메틸이거나, 또는 R<sup>2</sup>또는 R<sup>9</sup>와 함께, R<sup>2</sup>하에 상기 정의한 바와 같이 환 시스템을 형성하고; R<sup>1</sup>은 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬; 사이클로알킬 부분이 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬로 임의로 치환된 모노-또는 비사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬메틸; (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-아릴 메틸; 디티올라닐; 디티올라닐메틸; 디티아닐 또는 디티아닐메틸이며; R<sup>5</sup>는 수소, 이지도, 아지도메틸, 2-아지도메틸, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬, 3-(2-피리딜)-프로필, 3-(3-피리딜)-프로필, 이미다졸-2-일, 이미다졸-1-일, 이미다졸-4-일, 3-(4-피리딜)-프로필, (이미다졸-2-일)-프로필, (이미다졸-1-일)-프로필, (이미다졸-4-일)프로필, [1-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이미다졸-2-일]-프로필 또는 (이미다졸린-2-일)-프로필이고; R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 제2항에서 정의한 바와 같으며; R<sup>9</sup>는 수소 또는 메틸을 나타내거나, 또는 R<sup>8</sup> 및 이들 라디칼을 갖는 -N-CH-그룹과 함께, 테트라하이드로이소퀴놀린 또는 아조비사이클로옥탄골격을 형성하고; R<sup>10</sup>은 수소를 나타내거나, 또는 R<sup>1</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 탄소에 더하여 환 원자 1개를 또한 함유하고, 특히 바람직하게는 설폰으로 산화된 5내지 12개의 환 원을 갖는 모노-또는 비사이클릭 포화되거나 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하거나, 또는 R<sup>8</sup> 및 이를 갖는 원자와 함께, 환 원자가 특히 바람직하게는 설폰으로 산화된 티오크르만 시스템을 형성하며; R<sup>11</sup> 및 R<sup>12</sup>는 서로 독립적으로 수소, 하이드록실, 페닐, 2-티에닐, 2-, 3- 또는 4-피리딜, 1- 또는 2-이미다졸릴, 1-나프틸 또는 2-또는 3-벤조[b] 티에닐이고; n 및 m은 서로 독립적으로 0, 1 또는 2이며 R<sup>13</sup>은 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이고, R<sup>14</sup> 및 R<sup>15</sup>는 제2항에서 정의한 바와 같은 일반식(1)의 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용되는 염.

**청구항 4**

말단 카복실 그룹 또는 이의 반응성 유도체를 갖는 단편을 유리 아미노 그룹을 갖는 상응하는 단편과 커플링시키고, 경우에 따라, 일시적으로 도입된 보호그룹(들)을 분리 제거하여 다른 작용성 그룹을 보호하며, 경우에 따라, 수득된 화합물을 이의 생리학적으로 허용되는 염으로 전환시킴을 특징으로 하여, 제1항 내지 3항중 어느 한 항에서 청구한 일반식(1)의 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 5**

약제로서 사용하기 위한, 제1항 내지 3항중 어느 한 항에서 청구한 일반식(1)의 화합물.

**청구항 6**

고혈압의 치료시 약제로서 사용하기 위한, 제1항 내지 3항중 어느 한 항에서 청구한 일반식(1)의 화합물.

**청구항 7**

제1항 내지 3항 중 어느 한 항에서 청구한 일반식(1)의 화합물을 함유하는 약제학적 제제.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.