

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
C07D 403/10

(11) 공개번호 특 1993-0007938
(43) 공개일자 1993년05월20일

(21) 출원번호	10-1992-0017893
(22) 출원일자	1992년09월30일
(30) 우선권주장	P4132633.4 1991년10월01일 독일(DE)
(71) 출원인	바이엘 악티엔게젤샤프트 만프레트 조벨 독일연방공화국 디 5090 레버쿠션 바이엘베르크바이엘 악티엔게젤샤프트 요아히 그렘
(72) 발명자	독일연방공화국 디 5090 레버쿠션 바이엘베르크 토마스 크래머 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 인 덴 비르켄 92에이 위르겐 드레셀 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 인 덴 비르켄 92에이 루돌프 항코 독일연방공화국 디 4300 애센 발트자움 25 발테르 휘브쉬 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 빌트스타이크 22 울리히 월러 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 클라우디우스베크 5 마티아스 월러-글리만 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 클라우디우스베크 5 마르틴 보익 독일연방공화국 디 4006 에르크라트 2 트릴스 7 스타니슬라프 카즈다 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 켈레르트베크 18 요하네스-페터 스타쉬 독일연방공화국 디 5600 부페르탈 1 쉐네비트핸베크 37 안드레아스 크노르 독일연방공화국 디 4006 에르크라트 2 트릴저그라벤 10 스테판 볼파일 독일연방공화국 디 4010 힐덴 투헤르베크 25 주성민, 김성택
(74) 대리인	

심사청구 : 없음

(54) 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체

요약

시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체는 알데하이드를 반응시키고 이어서 물을 제거하여 제조할 수 있다. 시클필 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체는 의약, 특히 교혈압 및 아테롬성 동맥경화증 치료용 의약에서 활성물질로서 적합하다.

명세서

[발명의 명칭]

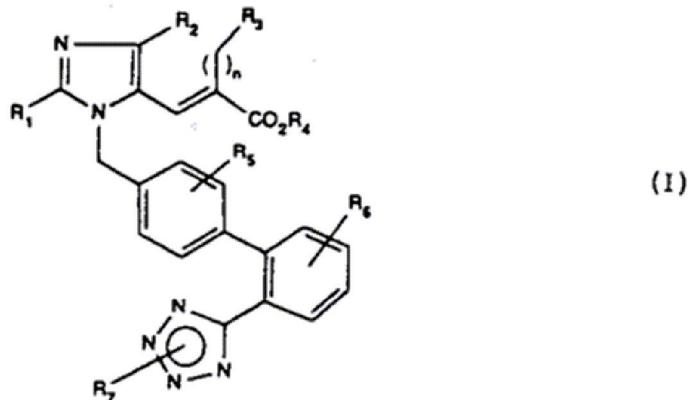
시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(I)의 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 및 그의 염.



상기 식 중, R^1 은 탄소 원자수 3 내지 6의 시클로알킬에 의해 각각 치환되는 각각 탄소 원자수 8 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬 또는 알케닐을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 3 내지 8의 시클로알킬을 나타내고, R^2 는 수소, 할로겐, 히드록실, 니트로, 시아노, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 펜타플루오로에틸을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 6 내지 10의 아릴을 나타내고, n 은 0, 1, 2, 3, 4 또는 5를 나타내고, R^3 은 탄소 원자수 3 내지 8의 시클로알킬을 나타내고, R^4 는 수소, 탄소 원자수 8 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬, 또는 페닐을 나타내고, R^5 및 R^6 은 동일하거나 또는 상이한 것으로서, 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, 트리플루오로메틸, 히드록실, 트리플루오로메톡시 또는 각각 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬 또는 알콕시를 나타내고, R^7 은 수소 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타낸다.

청구항 2

제 1 항에 있어서, R^1 이 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸 또는 시클로헥실에 의해 각각 임의 치환되는 각각 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬 또는 알케닐을 나타내거나, 또는 시클로프로필, 시클로펜틸 또는 시클로헥실을 나타내고, R^2 가 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시, 펜타플루오로에틸, 페닐 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내고, n 이 0, 1, 2, 3 또는 4를 나타내고, R^3 이 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실 또는 시클로헵틸을 나타내고, R^4 가 수소 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내고, R^5 및 R^6 이 동일하거나 또는 상이한 것으로서, 수소, 불소, 염소, 브롬, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내고, R^7 이 수소 또는 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내는 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 및 그의 염.

청구항 3

제 1 항에 있어서, R^1 이 각각 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬 또는 알케닐을 나타내거나, 또는 시클로프로필을 나타내고, R^2 가 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 트리플루오로메틸 또는 펜타플루오로에틸, 페닐 또는 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내고, n 이 1, 2 또는 3을 나타내고, R^3 이 시클로프로필, 시클로펜틸, 시클로헥실 또는 시클로헵틸을 나타내고, R^4 가 수소 또는 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬을 나타내고, R^5 및 R^6 이 동일하거나 또는 상이한 것으로서, 수소, 불소, 염소 또는 브롬을 나타내고, R^7 이 수소, 메틸, 에틸, 프로필 또는 이소프로필을 나타내는 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 및 그의 염.

청구항 4

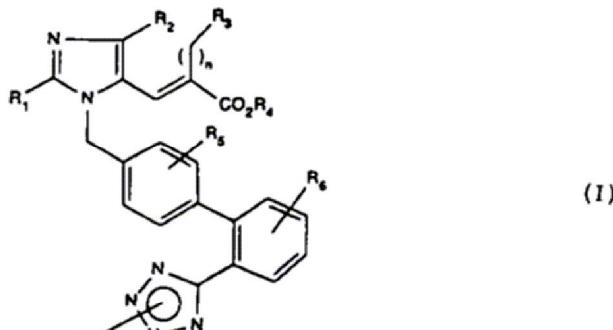
제 1 항에 있어서, R^1 이 각각 탄소 원자수 4 이하의 직쇄 또는 분지쇄 알킬 또는 알케닐을 나타내고, R^2 가 수소, 불소, 염소, 브롬, 요오드, 트리플루오로메틸 또는 펜타플루오로에틸을 나타내고, n 이 1 또는 2를 나타내고, R^3 이 시클로프로필, 시클로펜틸 또는 시클로헥실을 나타내고, R^4 가 수소, 메틸 또는 에틸을 나타내고, R^5 , R^6 및 R^7 이 수소를 나타내는 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 및 그의 염.

청구항 5

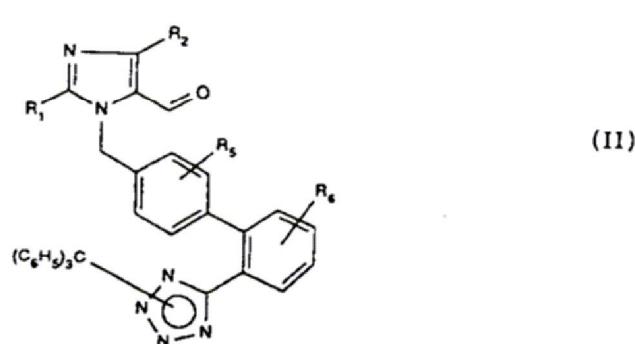
질병 억제용의 제 1 항 기재의 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체.

청구항 6

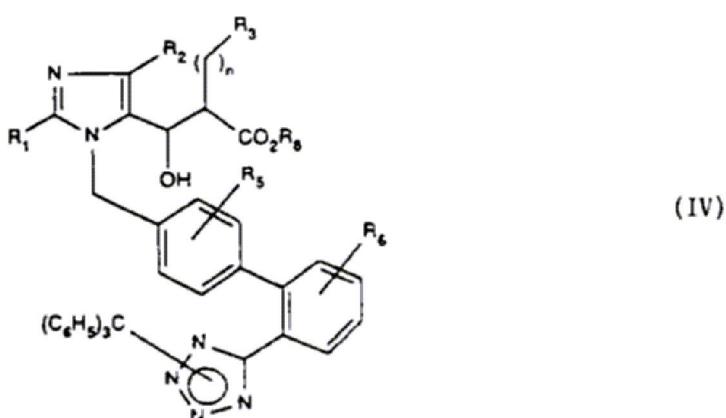
먼저 하기 일반식(II)의 알데하이드를 불활성 용매 중에서 염기 존재하에 하기 일반식(III)의 화합물과 반응시켜 하기 일반식(IV)의 화합물로 전환시킨 후, 유리하이드록실 관능기를 보호기를 도입하여 보호시키고, 마지막 단계에서 불활성 용매중에서 염기 존재하에 보호기를 제거시키고, R^4 가 H인 산의 경우에는 에스테르를 가수분해시키고, R^7 이 수소가 아닌 경우에는 -NH관능기를 알킬화시키는 것을 특징으로 하는, 하기 일반식(I)으로 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 및 그의 염의 제조 방법.



(I)



(II)



(IV)

상기 식 중, R^1 은 탄소 원자수 3 내지 6의 시클로알킬에 의해 각각 치환되는 각각 탄소 원자수 8 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬 또는 알케닐을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 3 내지 8의 시클로알킬을 나타내고, R^2 는 수소, 할로겐, 히드록실, 니트로, 시아노, 트리플루오로메틸, 트리플루오로메톡시 또는 펜타플루오로에틸을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬을 나타내거나, 또는 탄소 원자수 6 내지 10의 아릴을 나타내고, n 은 0, 1, 2, 3, 4 또는 5를 나타내고, R^3 은 탄소 원자수 3 내지 8의 시클로알킬을 나타내고, R^4 는 수소, 탄소 원자수 8 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬, 또는 페닐을 나타내고, R^5 및 R^6 은 동일하거나 또는 상이한 것으로서, 수소, 할로겐, 시아노, 니트로, 트리플루오로메틸, 히드록실, 트리플루오로메톡시 또는 각각 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬 또는 알콕시를 나타내고, R^7 은 수소 또는 탄소 원자수 6 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬을 나타내고, R^8 은 탄소 원자수 8 이하의 직쇄 또는 분자쇄 알킬, 또는 페닐을 나타낸다.

청구항 7

제 6 항에 있어서, 반응이 -100°C 내지 $+100^{\circ}\text{C}$ 의 온도 범위에서 수행되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 8

제 1 항 기재의 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체 1 종 이상을 함유하는 의약.

청구항 9

제 8 항에 있어서, 고혈압 및 아테롬성 동맥경화증 치료용인 의약.

청구항 10

제 1 항 기재의 시클릭 치환 이미다졸릴-프로펜산 유도체의 의약 제조용 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.