

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 특허공보(B1)

(51) Int. Cl.⁶

C07C 317/28

C07C 317/46

C07C 381/00

A61K 31/00

(45) 공고일자 1997년07월05일

(11) 공고번호 97-011008

(21) 출원번호

특 1989-0000293

(65) 공개번호

특 1989-0011836

(22) 출원일자

1989년01월13일

(43) 공개일자

1989년08월22일

(30) 우선권주장

6303/1988 1988년01월14일 일본(JP)

니혼 노야꾸 카부시끼카이샤 코다이라 타스꾸
일본국 토오쿄도 츄오꾸 니훈바시 1쵸메 2반 5고

(72) 발명자

나가미네 마사시

일본국 효고KEN 니시노미야시 카와하라마찌 5-31-208
히라가 쿠니카즈일본국 오오사까후 오오사까시 조또꾸 시기노니시 3쵸메 4반 2-305
사까이 아쓰시일본국 오오사까후 카와찌나가노시 혼다쵸5-6-302
우찌다 마타자에몬일본국 오오사까후 카와찌나가노시 다이시쵸 14-22
이병호, 최달용

(74) 대리인

심사관 : 이재웅 (책자공보 제5101호)**(54) 케텐디티오아세탈 유도체, 이의 제조방법 및 이의 용도****요약**

내용없음.

영세서

[발명의 명칭]

케텐디티오아세탈 유도체, 이의 제조방법 및 이의 용도

[발명의 상세한 설명]

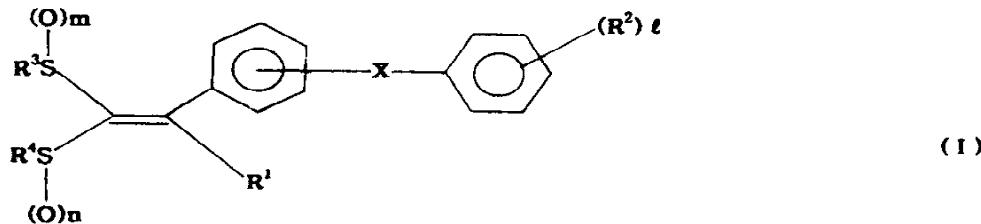
본 발명은 다음 일반식(I)의 케텐디티오아세탈 유도체, 이의 염, 이의 제조방법 및 당해 화합물을 함유하는 의약 조성물, 특히 항고지방혈증 및 항동맥경화용 약제에 관한 것이다.

2	3 4	3 4	123 412 1234 16 16	16.5 19.5 11.5
1 1 1 6 2 7 1 6 1 6	2 7 1 4 1 6 2 7 1 4	1 4 1 6 2 7 2 7 1 4 1 4	1 6	24
			D	D D

(57) 청구의 범위

청구항 1

다음 일반식(I)의 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염



상기 식에서, R¹은 C₁ 내지 C₆ 알킬기, C₁-C₁ 내지 C₄알킬-아미노 C₁ 내지 C₆ 알킬기, C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐 C₁ 내지 C₆ 알킬기 또는 카복시 C₁ 내지 C₆ 알킬기이고, R²는 동일하거나 상이하며, 수소원자; 할로겐 원자; C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐기, 카복실기 또는 C₁ 내지 C₄ 알킬설피닐기에 의해 치환될

수 있는 C₁ 내지 C₆ 알킬기; 하이드록시기; 알킬 부분이 C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐기, 카복실기, 디- C₁ 내지 C₄ 알킬아미노기, N-C₁ 내지 C₄ 알킬 치환 피페라지노기, 하이드록시기 또는 니트로옥시기에 의해 치환될 수 있는 C₁ 내지 C₁₆ 알콕시기; C₂ 내지 C₇ 알킬카보닐옥시기; 메틸렌디옥시기; C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐기; 카복실기; 시아노기; C₁ 내지 C₄ 알킬티오기 또는 C₁ 내지 C₄ 알킬설피닐기이며, R³ 및 R⁴는 동일하거나, 상이하며, C₁ 내지 C₆ 알킬기이거나, R³ 및 R⁴는 서로 함께 질소원자에 의해 차단될 수 있는 C₂ 내지 C₄ 알킬렌기이고, X는 산소원자, 황원자 또는 메틸렌기이며, ℓ은 1 내지 3의 정수이고, m 및 n은 0 또는 1의 정수이다.

청구항 2

제 1 항에 있어서, R¹이 저급 알킬기, 저급 알콕시 카보닐알킬기 또는 카복시알킬기이고; R²가 동일하거나 상이하며, 수소원자, 할로겐 원자, 저급 알킬기, 하이드록시기 또는 저급 알콕시기이며; R³ 및 R⁴가 동일하거나 상이하며, 저급 알킬기이거나, 또는 R³ 및 R⁴가 서로 함께 질소원자에 의해 차단될 수 있는 저급 알킬렌기이고; X가 산소원자 또는 메틸렌기이며; ℓ이 1 내지 3의 정수이고; m 및 n이 0 또는 1의 정수인 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염.

청구항 3

제 1 항에 있어서, R¹이 C₁ 내지 C₆ 알킬기, 디-C₁ 내지 C₄ 알킬아미노 C₁ 내지 C₆ 알킬기, C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐 C₁ 내지 C₆ 알킬기 또는 카복시 C₁ 내지 C₆ 알킬기이고; R²가 동일하거나 상이하며, 수소원자; 할로겐 원자; C₂ 내지 C₇ 알콕시 카보닐기, 카복실기 또는 C₁ 내지 C₄ 알킬설피닐기에 의해 치환될 수 있는 C₁ 내지 C₆ 알킬기, 하이드록시기, 알킬 부분이 C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐기, 카복실기, 디-C₁ 내지 C₄ 알킬 아미노기, N-C₁ 내지 C₇ 알킬 치환 피페라지노기, 하이드록시기 또는 니트로옥시기에 의해 치환될 수 있는 C₁ 내지 C₁₆ 알콕시기; C₂ 내지 C₇ 알킬카보닐옥시기; 메틸렌디옥시기; C₂ 내지 C₇ 알콕시카보닐기; 카복실기; 시아노기; C₁ 내지 C₄ 알킬티오기 또는 C₁ 내지 C₄ 알킬설피닐기이며; R³ 및 R⁴가 동일하거나 상이하며, C₁ 내지 C₆ 알킬기이거나, 또는 R³ 및 R⁴가 서로 함께 C₁ 내지 C₄ 알킬기에 의해 치환된 질소원자에 의해 차단될 수 있는 C₂ 내지 C₄ 알킬렌기이고; X가 산소원자, 황원자 또는 메틸렌기이며; e이 1 내지 3의 정수이고; m 및 n이 0 또는 1의 정수인 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염.

청구항 4

제 1 항, 제 2 항 또는 제 3 항에 있어서, R³ 및 R⁴가 서로 함께 C₂ 내지 C₄ 알킬렌기인 케텐디티오아세탈유도체 및 이의 염.

청구항 5

제 1 항, 제 2 항 또는 제 3 항에 있어서, R³ 및 R⁴가 서로 함께 C₁ 내지 C₄ 알킬기에 의해 치환된 질소원자에 의해 차단된 C₂내지 C₃ 알킬렌기인 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염.

청구항 6

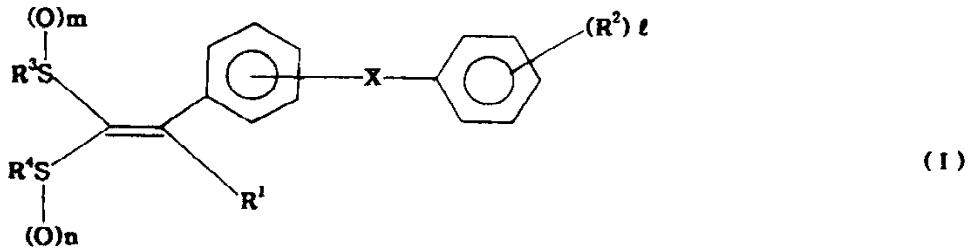
제 1 항, 제 2 항 또는 제 3 항에 있어서, R³ 및 R⁴가 서로 독립적으로 동일하거나 상이하며, C₁ 내지 C₆알킬기인 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염.

청구항 7

제 1항, 제 2 항 또는 제 3 항에 있어서, 케텐디티오아세탈 유도체가
 2-[1-{4-(4-메톡시펜옥시)페닐}-에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-n-프로록시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-i-프로록시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-(3-디메틸아미노프로록시)펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-(4-페녹시페닐)프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-(4-아세토시펜옥시)페닐)}프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-n-프로록시펜옥시)페닐}프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-메톡시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-하이드록시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-하이드록시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3,5-디메틸-4-하이드록시펜옥시)페닐}]에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-에틸-4-하이드록시펜옥시)페반}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)}에탄-1-일]펜옥시아세트산; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)}에탄-1-일]펜옥시]벤조에이트; 에틸 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)}에탄-1-일]펜옥시]페닐아세테이트; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)}에탄-1-일]펜옥시부티르산인 케텐디티오아세탈유도체 및 이의 염.

청구항 8

다음 일반식(I)의 케텐디티오아세탈 유도체 및 이의 염을 유효성분으로서 함유함을 특징으로 하는 의약 조성물.



상기 식에서, R^1 은 C_1 내지 C_6 알킬기, 디- C_1 내지 C_4 알킬-아미노 C_1 내지 C_6 알킬기, C_2 내지 C_7 알콕시카보닐 C_1 내지 C_6 알킬기 또는 카복시 C_1 내지 C_6 알킬기이고, R^2 는 동일하거나 상이하며, 수소원자; 할로겐 원자; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_6 알킬기; 하이드록시기; 알킬 부분이 C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기, 디- C_1 내지 C_4 알킬아미노기, N- C_1 내지 C_4 알킬 치환 피페라지노기, 하이드록시기 또는 니트로옥시기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_{16} 알콕시기; C_2 내지 C_7 알킬카보닐옥시기; 메틸렌디옥시기; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기; 카복실기; 시아노기; C_1 내지 C_4 알킬티오기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기이며, R^3 및 R^4 는 동일하거나 상이하며, C_1 내지 C_6 알킬기이거나, R^3 및 R^4 가 서로 함께 질소원자에 의해 차단될 수 있는 C_2 내지 C_4 알킬렌기이고, X 는 산소원자, 황원자 또는 메틸렌기이며, l 은 1 내지 3의 정수이고, m 및 n 은 0 또는 1의 정수이다.

청구항 9

제 8 항에 있어서, R^1 이 저급 알킬기, 저급 알콕시카보닐알킬기 또는 카복시알킬기이고; R^2 가 동일하거나 상이하며, 수소원자, 할로겐 원자, 지금 알킬기, 하이드록시기 또는 저급 알콕시기이며; R^3 및 R^4 가 동일하거나 상이하며 저급 알킬기이거나, 또는 R^3 및 R^4 가 서로 함께 질소원자에 의해 차단될 수 있는 저급알킬렌기이고; X 가 산소원자 또는 메틸렌기이며; l 이 1 내지 3의 정수이고; m 및 n 이 0 또는 1의 정수인 의약 조성물.

청구항 10

제 8 항에 있어서, R^1 이 C_1 내지 C_6 알킬기, 디- C_1 내지 C_4 알킬아미노 C_1 내지 C_6 알킬기, C_2 내지 C_7 알콕시카보닐 C_1 내지 C_6 알킬기 또는 카복시 C_1 내지 C_6 알킬기이고; R^2 가 동일하거나 상이하며, 수소원자; 할로겐 원자; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_6 알킬기, 하이드록시기, 알킬 부분이 C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기, 디- C_1 내지 C_4 알킬아미노기, N- C_1 내지 C_4 알킬 치환 피페라지노기, 하이드록시기 또는 니트로옥시기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_{16} 알콕시기; C_2 내지 C_7 알킬카보닐옥시기; 메틸렌디옥시기; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기; 카복실기; 시아노기; C_1 내지 C_4 알킬티오기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기이며; R^3 및 R^4 가 동일하거나 상이하며, C_1 내지 C_6 알킬기이거나, 또는 R^3 및 R^4 가 서로 함께 C_1 내지 C_4 알킬기에 의해 치환된 질소원자에 의해 차단될 수 있는 C_2 내지 C_4 알킬렌기이고; X 가 산소원자, 황원자 또는 메틸렌기이며; l 은 1 내지 3의 정수이고; m 및 n 이 0 또는 1의 정수인 의약 조성물.

청구항 11

제 8 항, 제 9 항 또는 제 10 항에 있어서, R^3 및 R^4 가 서로 함께 C_2 내지 C_4 알킬렌기인 의약 조성물.

청구항 12

제 8 항, 제 9 항 또는 제 10 항에 있어서, R^3 및 R^4 가 서로 함께 C_1 내지 C_4 알킬기에 의해 치환된 질소원자에 의해 차단된 C_2 내지 C_3 알킬렌기인 의약 조성물.

청구항 13

제 8 항, 제 9 항 또는 제 10 항에 있어서, R^3 및 R^4 가 서로 독립적으로 동일하거나 상이하며, C_1 내지 C_6 알킬기인 의약 조성물.

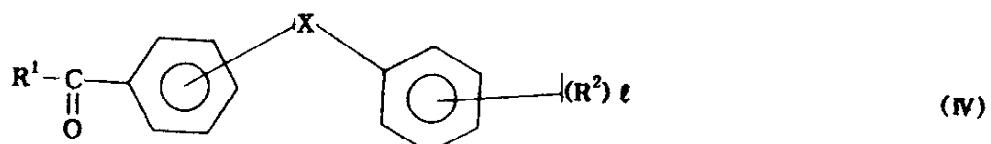
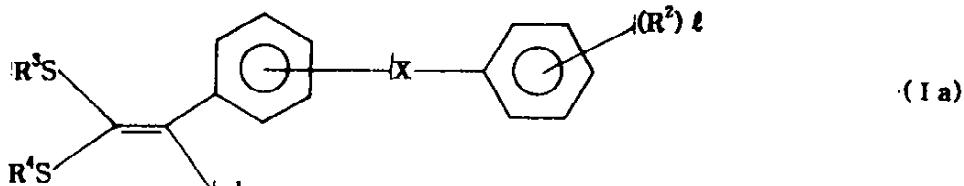
청구항 14

제 8 항, 제 9 항 또는 제 10 항에 있어서, 케텐디티오아세탈 유도체가 2-[1-{4-(메톡시펜옥시)페닐}-에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-n-프로폭시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-i-프로폭시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-디메틸아미노프로폭시)펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-(4-펜옥시페닐)프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-아세톡시펜옥시)페닐}프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-

n-프로폭시펜옥시)페닐]프로판-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-메톡시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3-하이드록시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(4-하이드록시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 2-[1-{4-(3,5-디메틸-4-하이드록시펜옥시)페닐}에탄-1-일리덴]-1,3-디티안; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)에탄-1-일}펜옥시]펜옥시 아세트산; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)에탄-1-일}펜옥시]페닐아세트산; 에틸 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)에탄-1-일}펜옥시]벤조에이트; 에틸 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)에탄-1-반펜옥시]페닐아세테이트; 4-[4-{1-(1,3-디티안-2-일리덴)에탄-1-일}펜옥시부티르산인의 약 조성물.

청구항 15

다음 일반식(II)의 화합물을 염기와 반응시켜 다음 일반식(III)의 화합물을 수득하고, 이어서 다음 일반식(IV)의 화합물과 반응시킴을 특징으로 하여, 다음 일반식(Ia)의 케텐디티오아세탈 유도체를 제조하는 방법.



상기 식에서, R^1 은 C_1 내지 C_6 알킬기, 디- C_1 내지 C_4 알킬-아미노 C_1 내지 C_6 알킬기, C_2 내지 C_7 알콕시카보닐 C_1 내지 C_6 알킬기 또는 카복시 C_1 내지 C_6 알킬기이고, R_2 는 동일하거나 상이하며, 수소원자; 할로겐 원자; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_6 알킬기; 하이드록시기; 알킬 부분이 C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기, 카복실기, 디- C_1 내지 C_4 알킬아미노기, N- C_1 내지 C_4 알킬 치환 피페라지노기, 하이드록시기, 또는 니트로옥시기에 의해 치환될 수 있는 C_1 내지 C_{16} 알콕시기; C_2 내지 C_7 알킬카보닐옥시기; 메틸렌디옥시기; C_2 내지 C_7 알콕시카보닐기; 카복실기; 시아노기; C_1 내지 C_4 알킬티오기 또는 C_1 내지 C_4 알킬설피닐기이며, R^2 및 R^4 는 동일하거나 상이하며, C_1 내지 C_6 알킬기이거나, R_3 및 R_4 가 서로 함께 질소원자에 의해 차단될 수 있는 C_2 내지 C_4 알킬렌기이고, X는 산소원자, 황원자 또는 메틸렌기이며, l은 1 내지 3의 정수이고, m 및 n은 0 또는 1의 정수이며, M은 알칼리 금속원자이며, Z는 트리메틸실릴기, 트리페닐실릴기, 디- C_1 내지 C_6 알콕시포스포릴기, 트리부틸스타닐기 또는 클로로트리페닐 포늄기이다.