(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07D 403/06

(11) 공개번호 특1991-0007918
(43) 공개일자 1991년05월30일

(21) 출원번호 특1990-0017301
(22) 출원일자 1990년10월25일

(30) 우선권주장 7/427158 1989년10월25일 미국(US)
(71) 출원인 스미스클라인 비참 코포레이션 스튜아트 알. 슈터
미합중국 펜실바니아 19101 필라델피아 원플랭클린 플라자
(72) 발명자 리챠드 맥쿨로우치 키이난
미합중국 펜실바니아 19355 멜버른 캐롤 레인 60
조셉 와인스톡
미합중국 펜실바니아 19460 페닉스 빌 포트하이스로우드 1234
(74) 대리인 황주명

심사청구 : 없음

(54) 치환된5-[(테트라졸릴)알케닐]이미다졸

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

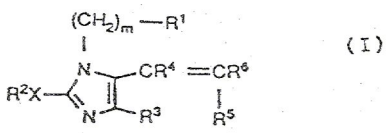
치환된 5-[(테트라졸릴)알케닐]이미다졸

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식 (Ⅰ)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.



(Ⅰ)

상기식에서 R^1은 아다만틸메틸, 또는 페닐, 비페닐 또는 나프틸이며, 여기서 각각의 아릴그룹은 비치환되거나, Cl, Br, F, I, C_{1-6}알킬, 니트로, CO_2R_7, C_{1-6}알콕시, 하이드록시, SC_{1-6}-C_6알킬, SC_{1-6}알킬, 테트라졸-5-일, SO_2NHR^7, SO_3H, $PO(OR^7)_2$, $CONR^7R^7$, CN, NR^7R^7, NR^7COH, NR^7COC_{1-6}알킬, $NR^7CON(R^7)_2$, NR^7COW, SO_2W, 및 W중에서 선택된 1내지 3개의 치환체에 의해 치환되고:R^2는 비치환되거나, C_{1-6}알킬, 니트로,Cl, Br, F, I, 하이드록시, C_{1-6}알콕시, NR^7R^7, CO_2R_7, CN, $CONR^7R^7$, W, NR^7COH, NR^7COC_{1-6}알킬, N^7COW, SO_2W, SO_2C_{1-6}알킬 및 SC_{1-6}알킬중에서 선택된 1내지 3개의 치환체에 의해 치환된 C_{2-10}알킬, C_{3-10}알케닐, $(CH_2)_{0-8}$-C_{3-6}사이클로알킬 또는 $(CH_2)_{0-8}$페닐이며: X는 단일결합, S 또는 O이고: m은 0내지 4이며: R^4는 수소, Cl, Br, F, I, CHO, 하이드록시메틸, C_{1-6}알킬, NR^7R^7, $CONR^7R^7$, NO_2, CN, 페닐 또는 W이고:R^3는 및 R^5는 각각 독립적으로 수소, C_{1-8}알킬, C_{3-6}사이클로알킬, 테에닐-Y-, 퓨릴-Y-, 피라졸릴-Y-, 이미다졸릴-Y-, 티아졸릴-Y-, 피리딜-Y-, 테트라졸릴-Y-, 피롤릴-Y-, 트리아졸릴-Y-, 옥사졸리-Y-, 이속사졸릴-Y-, 또는 페닐-Y- 이며, 여기에서 아릴 또는 헤테로아릴 그룹은 비치환되거나 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, Cl, Br, F, I: NR^7R^7, CO_2R_7, $CONR^7R^7$, SO_2NHR^7, SO_3H, OH, NO_2, W, SO_2C_1-C_6알킬, SO_2W, SC_1-C_6알킬, NR^7COW, NR^7COH, 또는 N R^7COC_1-C_6알킬이고: Y는 직쇄 또는 측쇄의 C_1-C_6알킬 또는 단일결합이며: R^6는 Z-테트라졸-5-일 이고:Z는 단일결합: 비날: 또는 비치환되거나, C_1-C_4알킬, 1또는 2개의 벤질그룹, 티에닐메틸 또는 퓨밀메

틸에 의해 치환된 메틸렌이며:W는 C_2R_{20-1}(여기에서 n은 1내지 4이다)이고: R^7은 각각 독립적으로 수소 또는 C_{1-6}알킬이다.

청구항 2

제1항에 있어서 R^1이 비치환되거나 클로로 플루오로, 니트로, 메틸, 트리플루오로메틸, 메톡시, 하이드록시, 설폰아미도, 설파민, 시아노, 카복시, 카보 C_{1-6}알콕시, 카바모일 및 테트라졸-5-일중에서 선택된 1내지 3개의 치환체에 의해 치환된 페닐이고: R^2가 C_{2-8}알킬이며: X가 단일결합 또는 S이고: m이 1 또는 2이며: R^3가 수소, 클로로, 플루오로 또는 트리플루오로메틸이고:R^4가 수소 또는 C_{1-6}알킬이며: R^5가 비치환되거나 메틸에 의해 치환된 티에닐메틸, 또는 비치환되거나 메톡시 또는 하이드록시에 의해 치환된 벤질이고: R^6가 테트라졸-5-일인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, E이성체이고, 테트라졸 및 이미다졸그룹이 서로에 대하여 트랜스인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서 (E)-1-[2-n-부틸-1-{(4-카르복시페닐)메틸}-1H-이미다졸-5-일]-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 5

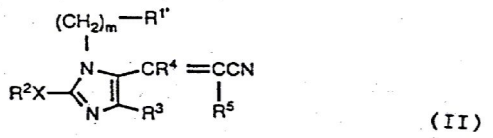
제1항에 있어서 (E)-1-[2-n-부틸-1-{(2-클로로페닐)메틸}-1H-이미다졸-5-일]-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜:(E)-1-[2-n-부틸-1-{(2-니트로페닐)메틸}-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜:(E)-1-[2-n-부틸-1-{(4-트리플루오로메틸페닐)메틸}-1H-이미다졸-5-일]-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜: 염.(E)-1-((2-n-부틸-1-((2-클로로페닐)메틸)-H-이미다졸-5-일]-2-2(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닌)-1H-프로펜; (E)-1-[2-n-부틸-1-{(2-클로로페닐)메틸}-4-플루오로-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜:(E)-1-((2-n-부틸-1-((2-클로로페닐)메틸)-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(3-티에닐)-1H-프로펜: (E)-1-((2-n-부틸-1-((2-클로로페닐)메틸)-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(4-하이드록시페닐)-1H-프로펜:(E)-1-[2-(1-부테닐)-1-{(2-클로페닐)메틸}-1H-이미다졸-5-일]-2-(1-테트라졸-5-일)-3-(2-디에닐-H-프로펜; (E)-1-((2-n-부테닐-1-((2-클로로페닐)메틸)-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜: (E)-1-((2-n-부틸-1-((2-클로로페닐)메틸)-1H-이미다졸-5-일)-2-(1H-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1H-프로펜:또는 (E)-1-((2-n-부틸-1-((4-테트라졸-5-일)-3-(2-티에닐)-1-프로펜인 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한항에 따르는 화합물과 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 7

하기의 일반식(II)의 화합물을 아자이드와 반응시키고, 그후 필요한 경우 R^1그룹이 C_{1-6}알콕시에 의하여 치환된 일반식(I)화합물을 탈보호시켜 R^1그룹이 하이드록시에 의하여 치환된 일반식(I)의 화합물로 전환시키거나, R^1그룹이 CO_2C_{1-6}알킬에 의하여 치환된 일반식(I)화합물을 가수분해시켜 R^1그룹이 카르복시에 의하여 치환된 일반식(I)의 화합물로 전환시키거나 R^1그룹이 CN에 의하여 치환된 일반식(I)화합물을 아자이드와 반응시켜 R^1그룹이 테트라졸-5-일에 의하여 치환된 일반식(I)의 화합물로 전환시키고, 그후 임의로 약제학적으로 선택되는 염을 형성시킴을 특징으로 하여, 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식(I)의 화합물을 아자이드와 반응시켜 R^1그룹이 테트라졸-5-일에 의하여 치환된 일반식(I)의 화합물로 전환시키고, 그 후 임의로 약제학적으로 선택되는 염을 형성시킴을 특징으로 하여, 제1항에서 정의된 바와 같은 일반식(I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 방법.



(II)

상기식에서 R^2, R^3, R^4, R^5, X 와 m은 제1항에서 정의한 바와 같고, R^1는 제1항에서 정의한 바와같으며, 단 R^1그룹에서 치환체는 테트라졸-5-일, OH 또는 CO_2H를 포함해서는 안된다.

청구항 8

안지오텐신 II수용체 길항작용이 인자된 질병의 치료를 위한 약제를 제조하는데 있어서 제1항에서 정의한 바와같은 일반식(I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염의 용도.

청구항 9

고혈압 치료를 위한 약제를 제조하는데 있어서 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식(I)의 화합물 또는 이의약제학적으로 허용되는 염의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.