(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07C 249/02

(11) 공개번호 특1992-0000706
(43) 공개일자 1992년01월29일

(21) 출원번호 특1991-0009638
(22) 출원일자 1991년06월12일
(30) 우선권주장 537,407 1990년06월13일 미국(US)
(71) 출원인 산도즈 리미티드 쟝 크라머, 한스 루돌프 하우스
스위스연방 CH-4002 바즐 리흐트스트라세 35
(72) 발명자 프라사드 코데스와라 카파
미합중국 뉴저지 07054 파시패니 훼이버 로드 4
죠오지 티엔-산 리
미합중국 뉴저지 07003 블룸필드 맥클레오드 레인 16
제프리 나델슨
미합중국 뉴저지 07834 덴빌 베네딕트 크레센트 12
윌리암 로날드 제임스 심프슨
미합중국 뉴저지 07945 멘드 햄 린 덴 레인 4
우스탄 베커 서네이
미합중국 뉴저지 07857 네트콩 레일로드 애비뉴 46
(74) 대리인 김창세, 김영, 장성구

심사청구 : 없음

(54) N-옥시이미드산 유도체

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

N-옥시이미드산 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

유리 형태 또는 염, 또는 경우에 따라서는 약제학적으로 허용 가능하고 생리학적으로 가수분해 가능한 에스테르 형태의 하기 일반식(I)의 화합물.

@

상기식에서, R_1은 탄소수 1 내지 6의 알킬, 탄소수 3 내지 5의 알케닐(여기서, 이중결합은 적어도 2개의 탄소원자에 의해 산소 원자로부터 분리된다.)7개 이하의 하이드록시 그룹(여기서, 하이드록시 그룹들은 적어도 2개의 탄소원자에 의해 R_1이 결합되어 있는 산소원자로부터 분리된다)을 가진 탄소수 2 내지 8의 모노-또는 폴리하이드록시 알킬, 알콕시 그룹내의 탄소수가 1내지 4이고, 알킬렌 그룹내의 탄소수가 2내지 8인 7개 이하의 알콕시 그룹(여기서, 알콕시 그룹들은 적어도 2개의 탄소원자에 의해 R_1이 결합되어 있는 산소 원자로부터 분리된다)을 가진 모노-또는 폴리알콕시알킬, 페닐 또는 탄소수 7내지 11의 직쇄 페닐알킬(여기서, 페닐 환은 양자 모두 원자번호 9내지 53의 할로겐, 하이드록시, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1내지 4의 알콕시에 의해 임의로 일치환 되거나 독립적으로 이치환된다), 총 탄소수 2내지 6의 카복시알킬, 알콕시 그룹의 탄소수가 1내지 4이고 카보닐알킬 그룹의 총탄소수가 2내지 6인 알콕시카보닐알킬 또는 4-피발로일벤질이고, R_2가 탄소수 1내지 4의 알킬, 페닐 또는 탄소수 7 내지 11의 직쇄 페닐알킬(여기서, 페닐 환은 양자 모두 원자번호 9 내지 53의 할로겐,하이드록시, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시에 의해 임으로 일치환되거나 독립적으로 이치환되거나. 또는 페닐 환의 4-위치가 피발로일에 의해 일치환된다)이고. R_3가 4-피발로일벤조일이거나,또는 R_2가 4-피발로일페

닐이고, R_3가 탄소수 1 내지 4의 알킬, 페닐 환이 원자번호 9 내지 53의 할로겐, 하이드록시, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시에 의해 임의로 일치환되거나 독립적으로 이치환되거나, 또는 페닐환의 4-위치가 피발로일에 의해 일치환된 탄소수 7내지 11의 직쇄 페닐 알킬, 총 탄소수 2 내지 5의 알킬카보닐. 또는 원자번호 9 내지 53의 할로겐, 하이드록시, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시에 의해 임의로 일치환되거나 독립적으로 이치환된 벤조일이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 하기 일반식 (Is)의 화합물.

@

상기식에서, R_1^s는 탄소수 1 내지 4의 알킬, 알릴, 탄소수 2내지 4의 모노- 또는 디하이드록시알킬(여기서,하이드록시 그룹들은 적어도 2개의 탄소원자에 의 해 R_1^s가 결합되어 있는 산소원자로부터 분리된다), 2-메톡시에틸, 페닐 또는 벤질, 총탄소수2내지 5의 카복시알킬, 알콕시 고룹의 탄소수가 1내지 4이고, 카보닐알킬그룹의 총탄소수가 2 내지 5인 알콕시카보닐알킬, 또는 4-피발로일벤질이고, R_2^s가 탄소수 1 내지 4의 알킬, 또는 4-위치가 피발로일에 의해 임의로 일치환된 페닐이고, R_3^s가 4-피발로일벤조일이거나, 또는 R_2^s가 4-피발로일페닐이고, R_3^s가 총 탄소수 2 내지 5의 알킬카보닐, 또는 벤조일이다.

청구항 3

제1항에 있어서, 하기 일반식 (IP)의 화합물

@

상기식에서, R_1^p는 탄소수 1내지 4의 알킬 탄소수 1내지 4의 알킬, 탄소수 3내지 5의 알켈닐(여기서, 이중결합은 적어도 2개의 탄소 원자에 의해 산소원자로부터 분리된다) , 탄소수 2내지 의 모노-, 디- 또는 트리하이드록시알킬 (여기서, 하이드록시 그룹들은 적어도 2개의 탄소원자에 의해 R_1^p가 결합되어 있는 산소 원자로부터 분리된다) , 알콕시 그룹의 탄소수가 1 내 지 4이고 알킬렌 그룹의 탄소수가 2 내지 6인 모노-, 디 - 또는 트리알콕시알킬(여기서, 알콕시 그룹들은 적어도 2개의 탄소원자에 의해 R_1^p가 결합되어 있는 산소 원자로부터 분리된다), 또는 페닐 또는 탄소수 7 내지 11의 직쇄 페닐 알킬(여기서, 페닐 환은 양자 모두 원자번호 9 내지 53의 할로겐, 하이드록시. 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 탄소수 1 내지 4의 알콕시에 의해 임의로 일치환되거나 독립적으로 이치환된다)이고, R_2^p 및 R_3^p는 각각 R_2 및 R_3에 대해 상기 정의된 바와 같은 의미를 갖는다.

청구항 4

제1항에 있어서, 4-피발로일벤조일-N-메톡시-4-피발로일벤즈이미데이트인 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서, 4-피발로일벤조일-N- (2-하이드록시에톡시) -4-피발로일벤즈이미데이트 또는 4-피발로일벤조일-N-카복시메톡시-4-피발로일벤즈이미데이트이거나. 또는 R_1, R_2 및 R_3가 각각 2,3-디-OH-프로필, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 2-07-에틸, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 이소프로필, 4-피발로일페닐 및 4-괴발로일벤조일이거나, 또는 페닐, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 벤질, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 알릴, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸, 페닐 및 4-퍼발로일벤조일이거나, 또는 메틸. t-부틸 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸. 메틸 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸. 4-피발로일페닐 및 피발로일이거나, 또는 메틸, 4-피발로일페닐 및 벤조일이거나, 또는 메틸, 4-피발로일페닐 및 아세틸이거나, 또는 에틸, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 t-부틸, 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸, 4-OH-페닐 및 4-피발로일벤조일이거나. 또는 메틸, 4-Cl-페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸, 4-Me-페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸, 4-MeO-페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 메틸, 4-피발로일페닐 및 벤질이거나, 또는 t-부톡시카보닐메틸, 4-피발로일패닐 및 4-피발로 일벤조일이거나, 또는 t-부톡시카보닐프로필, 4-피발로일패닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 t-부톡시카보닐프로프-2-일. 4-피발로일페닐 및 4-피발로일벤조일이거나, 또는 카복시프로필, 4-퍼발로일페닐 및 4-피발로일벤조일 거나 또는 2-카복시 -2-프로필, 4-피발로일페 닐 및 4-피발로일렌조일이거나, 또는 4-피발로일벤질, 4-피발로일페널 및 4-피발로일벤조일인 유리 형태 또는 염, 또는 경우에 따라서는 약제학적으로 허용가능하고 생리학적으로 가수분해가능한 에스테르 형태의 일반식(I)의 화합물.

청구항 6

(a)하기 일반식(II)외 화합물을 하기 일반식(III)의 화합물과 반응시키거나, 또는 :

@

[상기식들에서, R_1'는 특정의 하이드록시 알킬 또는 하이드록시페닐 치환체의 하이드록시 그룹이 임의로는 보호된 형태라는 것을 제외하고는 R_1에 대해 제1항에서 정의한 바와 같은 의미를 갖고, R_2 및 R_3는

제1항에서 정의된 바와 같으며. X는 반응성 그룹이다]

(b)하기 일반식(IVa)의 화합물을 제조하기 위해서는, 하기 일반식 (IV)의 화합물을 하기 일반식(Ⅴ)의 3급 아민 및 하기 일반식 (VI)의 화합물과 반응시키고

@

[상기식들에서, R_1은 제1항에 정의된 바와 같고, R_2^a는4-피발로일페닐이며, R_2^a는 4-피발로일페닐이며, R_3는 4-피발로일벤조일이고, R_4, R_5및 R_6는 독립적으로 저급 알킬 또는 아릴이며, X및 R_1'는 상기 정의된 바와 같다] 바람직하게는, 특정의 보호된 하이드록시 알킬 또는 하이드록시 페닐 치환체를 탈보호시킨 다음, 생성된 유리형태 또는 염, 또는 경우에 따라서는 약제학적으로 혀용가능하고 생리학적으로 가수분해 가능한 에스테르 형태의 일반식(I)의 화합물을 회수함을 포함하는 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 제조방법.

청구항 7

유래 형태 또는 약제학적으로 허용가능한 염, 또는 경우에 따라서는 약제학적으로 허용가능하고 생리학적으로 가수분해 가능한 에스테르 형태의 제1항에 따른 화합물을 약제학적으로 허용 가능한 담체 또는 희석재와 함께 포함하는 약제학적 조성물.

청구항 8

제7항에 정의된 화합물의 약제로서의 용도.

청구항 9

제 8항에 있어서, 제7항에 정의된 화합물의 당뇨병 치료제 및 형중 콜레스테롤 및 트리글리세리드 수준 강하제로서의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.