

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07J 1/00	(11) 공개번호 특1988-0009037	(43) 공개일자 1988년09월13일
(21) 출원번호	특1988-0000896	
(22) 출원일자	1988년01월30일	
(30) 우선권주장	8812 1987년01월03일 미국(US)	
	90634 1987년08월28일 미국(US)	
(71) 출원인	이.아이.듀퐁 드 네모아 앤드 캄파니	
(72) 발명자	미합중국 델라웨어 19898 윌밍톤 10번 앤드 마켓 스트리트 제임스 레로이 가일러	
	미합중국 델라웨어 19707 록 케신 켄트 드라이브 18 로버트 폴 존슨	
	미합중국 델라웨어 19713 네왁 호바트 드라이브 377 수 성 고	
	미합중국 델라웨어 19810 윌밍톤 드렉셀 드라이브 3215 로널드 루이스 마골다	
	미합중국 펜실바니아 19014 아스톤 비숍 드라이브 239 시몬 헨드릭 스타	
	미합중국 캘리포니아 95139 산 조세 카탐 코우트 36 제임스 마이클 트르자스코스	
(74) 대리인	미합중국 펜실바니아 19061 부산원 우드랜드 에이커스 마리안 드라이브 3666 이병호	

심사청구 : 없음

(54) 14,15-치환된 라노스테롤 및 그의 콜레스테롤 저하제로서의 용도

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

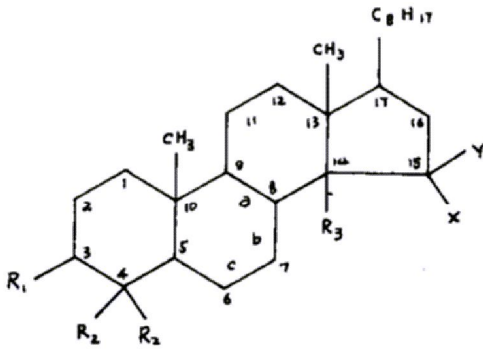
14,15-치환된 라노스테롤 및 그의 콜레스테롤 저하제로서의 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식 (1)의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염.



상기식에서, R₁은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시) C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₅NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C=CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C=C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C=C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C=C-C(R₄)₂OR, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₅, 또는 CR₄W₅SR₄이며 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬 ; C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃ 이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄, SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂ 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유 하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHOH이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =C, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₂는 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₃가 αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₁은 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고 ; i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆ 알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 αOH이고, X가 αOH, Y는 수소이고, 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OCOCH₃가 아니어야 하고 ; k) R₃는 CN, 또는 CHNOH이고, 7-8의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OCOCH₃가 아니어야 하고 R₂는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, X 및 Y는 수소가 아니어야 하고 ; l) R₃는 CONHOH 또는 CONHOCOCH₃이고, X 및 Y 모두가 수소이고, R₂가 CH₃이고, 7-8의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고 ; m) R₃가 C₁-C₆ 알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 2

제1항에 있어서, R₂은 수소, C₁-C₆ 알킬, 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에

폭시)C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄, SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅이거나, X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, 또는 CR₅R₅인 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, R₂가 C₂-C₆ 알케닐, 또는 C₂-C₆ 알키닐인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서, R₃가 COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₅NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C=CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C=C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C=C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C=C-C(R₄)₂OR, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, CR₄W₅OR₅, 또는 CR₄W₅SR₄인 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서, R₃가 COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₅NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C=CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C=C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C=C-C(R₄)₂OR₅, CR=CR₅C(R)OR, C=C-C(R)OR, C(S)NROR, C(S)NROR, C(R)OR, C(R)OR, CHRNRSOW, CHCHNRNSOW, C(R)CRNOR, C(R)CRNOR, CRWOR, 는 CR₄W₅SR₄인 화합물.

청구항 6

제1항에 있어서, X 및 Y가 독립적으로 NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂, 또는 산소인 화합물.

청구항 7

제1항에 있어서, R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시)C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, 또는 CHR₄NR₄OR₅인 화합물.

청구항 8

제1항에 있어서, R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, C₁-C₆ 알키닐, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOHOW₂, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시)C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂ ; CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, 또는 CHR₄NR₄OR₅인 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서, X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, OR₄, OR₅, SR₅, SR₄, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅ 이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅ 또는 S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, 또는 CR₄R₅인 화합물.

청구항 10

제1항에 있어서, X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₅, SR₄, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅ 이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, 또는 CR₄R₅인 화합물.

청구항 11

제1항에 있어서, R₁은 OH이고 ; R₂는 수소, 또는 CH₃이고 ; R₃는 CHF₂, CHOHCCH₂, CHNOH, CN, CH₃, CH₂CH=CH₂, 또는 OH이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, 불소, 또는 OH이거나 ; X 및 Y는 함께 NOH인 화합물.

청구항 12

제1항에 있어서, R₁은 OH이고 ; R₂는 수소, 또는 CH₃이고 ; R₃는 CHF₂, CHOHCCH₂, CHNOH, 또는 CH₂CH=CH₂ 이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소 또는 OH인 화합물.

청구항 13

제1항에 있어서, R₁은 OH, 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 페닐 또는 CH₃이다)이고 ; R₂는 수소, 또는 CH₃이고 ; R₃는 수소, CHO, CH₂OR₄(여기에서 R₄는 수소 또는 C₁-C₆알킬, CHNOH, CH₃, CN, OH, 또는 CHR₄N(R₄)₂(여기에서 R₄는 수소 또는 CH₃이다)이다)이고 ; X 및 Y가 독립적으로 H, F 또는 OH이거나, X 및 Y가 함께 NOH인 화합물.

청구항 14

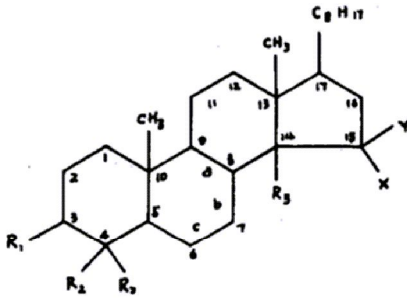
제1항에 있어서, R₁은 OH이고 ; R₂는 CH₃이고 ; R₃는 CH₃, CN, 또는 OH이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, 불소, 또는 OH이거나 ; X 및 Y가 함께 NOH인 화합물.

청구항 15

제1항에 있어서, 32,32-디플루오로-라노스트-8-엔-3β-올; 32,32-디플루오로-라노스트-7-엔-3β-올; 4,4-디메틸-14α-(1'-하이드록시-2'-프로페닐)-5α-콜레스트-8-엔-3β-올; 14α-알릴-4,4-디메틸-5α-콜레스트-8-엔-3β-올-15-옥심; 라노스트-8-엔-32-알독심-3β-올; 라노스트-7-엔-32-알독심-3β-올; 14α-시아노-4,4-디메틸-5α-콜레스트-8-엔-3β-올; 3β-하이드록시-라노스트-8-엔-15-옥심; 3β-하이드록시-라노스트-7-엔-15-옥심; 4,4-디메틸-5α-콜레스트-8-엔-3β, 14α, 15α-트리올; 5α-콜레스트-8-엔-3β, 14α, 15α-트리올; 3β-하이드록시-라노스트-8-엔-32-오하이드록삼산; 3β, 15α-디하이드록시-라노스트-8-엔-32-알; 3β-하이드록시-라노스트-8-엔-32-알독심-15-옥심; 3β-아세톡시-라노스트-8-엔-32-알독심; 3β-아세톡시-라노스트-7-엔-15-옥심; 라노스트-6-엔-32-알독심-3β-올; 15α-아미노-라노스트-8-엔-3β-올; 14α-아미노-4,4-디메틸-5α-콜레스트-8-엔-3β-올; 4,4-디메틸-14α-(N-포르밀-아미노)-5α-콜레스트-8-엔-3β-올; 4,4-디메틸-14α-(N-에톡시카보닐-아미노)-5α-콜레스트-8-엔-3β-올; 및 32-에틸닐-라노스트-8-엔-3β, 32-디올인 화합물.

청구항 16

i) 유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염, 및 ii) 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제로 이루어진, 라노스테롤-8,24-디엔-3β-올 14α-메틸-탈메틸효소 활성을 저해하는데 적합한 조성물.

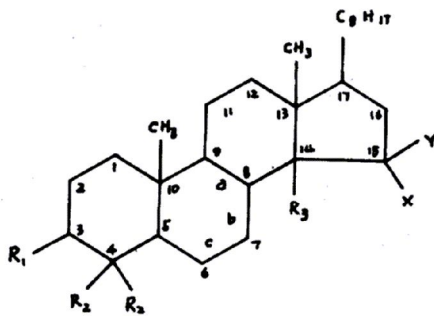


상기식에서, R₁은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알킬닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알킬닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시), C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄, NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C=CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C=C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C=C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C=C-C(R₄)₂OR₄, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₄, 또는 CR₄W₅SR₄이며 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알킬닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂ 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알킬닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알킬닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알킬닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알킬닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHOO이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃가

아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₁ 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₁ αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₁은 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고 ; i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆ 알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 H 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 17

i) 유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염, 및 ii) 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제로 이루어진, 3-하이드록시-3-메틸-글루타릴 조효소 A환원효소 활성을 저해하는데 적합한 조성물.

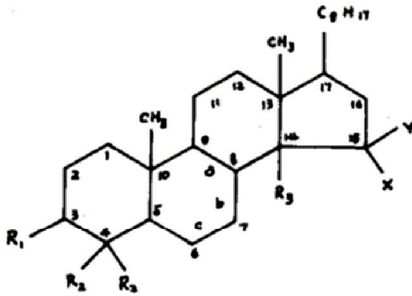


상기식에서, R₁은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알킬닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알킬닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시) C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₅NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C=CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C=C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C=C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C=C-C(R₄)₂OR, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₅, 또는 CR₄W₅SR₄이며 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알킬닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, ·OR₄, OR₅, SR₄, SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂ 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알킬닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알킬닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알킬닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알킬닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHO이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O

또는 $\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{CH}_3$ 가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH 가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 수소 또는 CH_3 가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 OH 가 아니어야 하고, R_2 는 수소가 아니어야 하고 ; g) R_2 가 수소이고, R_3 가 αOH 이고, X가 βOH 이고, Y가 αH 이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R_1 은 OH 가 아니어야 하고 ; h) X가 OH , OR_5 , $\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, NR_4R_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , 또는 NR_4OR_5 인 경우, Y는 Z, OH , OR_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , NR_4OR_5 , $\text{N}(\text{R}_4)_2$, 또는 $\text{N}(\text{R}_5)_2$ 가 아니어야 하고 ; i) R_3 가 수소, OH , 또는 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R_3 가 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 18

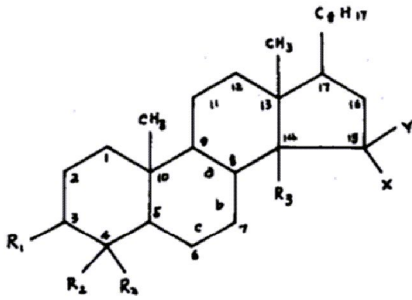
i) 유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염, 및 ii) 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제로 이루어진, 콜레스테롤의 생성을 감소시키는데 적합한 조성물.



상기식에서, R_1 은 $=\text{O}$, OH , 또는 OCOR_1 이고 ; R_2 는 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐 또는 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -알킬이고 ; R_3 는 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -알킬, CHO , CH_2OR_4 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_4$, CHNOR_4 , CH_2SR_4 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SR}_4$, CHOR_4W_2 , CHOR_5W_2 , CN , CHZ_2 , CH_2Z , CHS , $\text{CHR}_4\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Z}$, $\text{N}(\text{R}_4)_2$, SR_4 , OR_4 , $\text{CH}=\text{NNHR}_4$, 폴리-(OR_4 , OR_5 , 에폭시) $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, NR_4R_5 , SR_5 , OR_5 , $\text{CH}=\text{NNHR}_5$, CH_2OR_5 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_5$, CHNOR_5 , CH_2SR_5 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SR}_5$, $\text{CHR}_4\text{N}(\text{R}_5)_2$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}_5)_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}_4\text{OR}_4$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{OR}_5$, COW_4 , CSW_4 , $\text{C}(\text{NR}_4)\text{W}_4$, $\text{C}(\text{NR}_4)\text{SR}_4$, $\text{C}(\text{S})\text{SR}_4$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{CHR}_4\text{NR}_5\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{CHR}_4\text{NR}_5\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{N}(\text{R}_5)_2$, $\text{CHR}_4\text{NR}_5\text{N}(\text{R}_5)_2$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}_4\text{OR}_5$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{OR}_4$, $\text{CHR}_4\text{NR}_5\text{OR}_5$, $\text{CHR}_4\text{NR}_5\text{OR}_4$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}_5\text{OR}_5$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}_5\text{OR}_4$, $\text{CR}_4=\text{CR}_4\text{R}_5$, $\text{C}=\text{CR}_5$, $\text{CR}_4=\text{CR}_4\text{C}(\text{R}_4)_2\text{Z}$, $\text{C}=\text{C}-\text{C}(\text{R}_4)_2\text{Z}$, $\text{CR}_4=\text{CH}_4\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}_5$, $\text{C}=\text{C}-\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}_5$, $\text{CR}_4=\text{CR}_4\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}_4$, $\text{C}=\text{C}-\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}_4\text{OR}_4$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}_4\text{OR}_5$, $\text{C}(\text{S})\text{NR}_4\text{OR}_4$, $\text{C}(\text{S})\text{NR}_4\text{OR}_5$, $\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}_4$, $\text{C}(\text{R}_4)_2\text{OR}_5$, $\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{SO}_2\text{W}_4$, $\text{CH}_2\text{CHR}_4\text{NR}_4\text{SO}_2\text{W}_4$, $\text{CR}_4\text{W}_5\text{OR}_5$, $\text{CR}_4\text{W}_5\text{OR}_4$, 또는 $\text{CR}_4\text{W}_5\text{SR}_4$ 이며 ; R_4 는 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, 아릴, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -알킬, 또는 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐이고 ; R_5 는 COW_3 , CSW_3 , 또는 $\text{C}(\text{NR}_4)\text{W}_3$ 이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, Z, OR_4 , OR_5 , SR_4 , SR_5 , $\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, NR_4R_5 , NR_4OR_4 , NR_4OR_5 , $\text{NR}_4\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{NR}_4\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{NR}_4\text{N}(\text{R}_5)_2$, $\text{NR}_5\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{NR}_5\text{NR}_4\text{R}_5$, 또는 $\text{NR}_5\text{N}(\text{R}_5)_2$ 이거나 ; X 및 Y가 함께 NR_4 , NR_5 , NOR_4 , NOR_5 , S, $\text{C}(\text{R}_4)_2$, $\text{C}(\text{R}_5)_2$, CR_5R_4 , $\text{NN}(\text{R}_4)_2$, NNR_4R_5 , $\text{NN}(\text{R}_5)_2$ 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W_1 은 수소, $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ 알케닐, 아릴, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 알킬, 또는 $\text{C}_2\text{-C}_{20}$ 알킬닐이고 ; W_2 는 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, 아릴, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -알킬, 또는 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐이고 ; W_3 는 수소, $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, 아릴, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐, OR_4 , 또는 $\text{N}(\text{R}_4)_2$ 이고 ; W_4 는 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐, 아릴, 아릴- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -알킬, $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알킬닐, OR_4 , 또는 $\text{N}(\text{R}_4)$ 이고 ; W_5 는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬 및 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R_3 가 CHO 이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 OH 또는 OCOCH_3 가 아니어야 하고, R_2 는 CH_3 가 아니어야 하고 ; b) R_3 가 CH_3 이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 OH 또는 OCOCH_3 가 아니어야 하고, R_2 는 CH_3 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH , OCOCH_3 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R_1 이 $=\text{O}$, 또는 OW_1 (여기에서 W_1 은 수소 또는 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬이다), 또는 OCOW_1 (여기에서 W_1 은 수소 또는 $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 알킬 또는 페닐)이고, X가 OR_4 (여기에서 R_4 는 수소이다) 또는 OR_5 (여기에서 R_5 는 COW_3 (W_3 는 $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 알킬 또는 페닐)이다)이고, Y가 수소 또는 OH 인 경우, R_3 는 수소 또는 $\alpha\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R_3 는 CH_2OH 또는 $\text{CH}_2\text{OCOCH}_3$ 이고, R_2 는 수소 또는 CH_3 이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 $=\text{O}$ 또는 OH 또는 OCOCH_3 가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH 가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 수소 또는 CH_3 가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 OH 가 아니어야 하고, R_2 는 수소가 아니어야 하고 ; g) R_2 가 수소이고, R_3 가 αOH 이고, X가 βOH 이고, Y가 αH 이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R_1 은 OH 가 아니어야 하고 ; h) X가 OH , OR_5 , $\text{N}(\text{R}_4)_2$, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, NR_4R_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , 또는 NR_4OR_5 인 경우, Y는 Z, OH , OR_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , NR_4OR_5 , $\text{N}(\text{R}_4)_2$, 또는 $\text{N}(\text{R}_5)_2$ 가 아니어야 하고 ; i) R_3 가 수소, OH , 또는 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R_3 가 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 19

i) 유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염, 및 ii) 약제학적으로 허용되는 당체 또는 희석제로 이루어진, 혈청 콜레스테롤 농도를 저하시키는데 적합한 조성물.

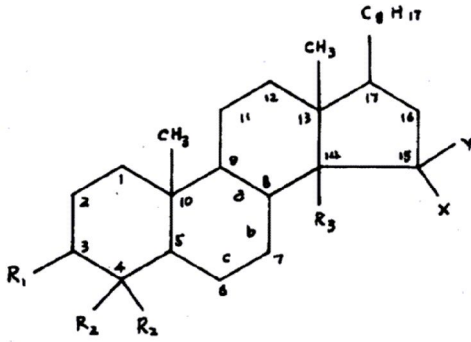


상기식에서, R^1 은 =O, OW_1 , 또는 $OCOW_1$ 이고 ; R^2 는 수소, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐 또는 아릴- C_1-C_6 -알킬이고 ; R_3 는 수소, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, 아릴- C_1-C_6 -알킬, CHO , CH_2OR_4 , $CH_2CH_2OR_4$, $CHNOR_4$, CH_2SR_4 , $CH_2CH_2SR_4$, $CHOR_4W_2$, $CHOR_5W_2$, CN , CHZ_2 , CH_2Z , CHS , $CHR_4N^-(R_4)_2$, $CH_2CH_2N(R_4)_2$, CH_2CH_2Z , $N(R_4)_2$, SR_4 , OR_4 , $CH=NNHR_4$, 폴리-(OR_4 , OR_5 , 에폭시), C_1-C_6 알킬, $N(R_5)_2$, NR_4R_5 , SR_5 , OR_5 , $CH=NNHR_5$, CH_2OR_5 , $CH_2CH_2OR_5$, $CHNOR_5$, CH_2SR_5 , $CH_2CH_2SR_5$, $CHR_4N(R_5)_2$, $CHR_4NR_4R_5$, $CH_2CH_2N(R_5)_2$, $CH_2CH_2NR_4R_5$, $CH_2CH_2NR_4OR_4$, $CHR_4NR_4OR_5$, COW_4 , CSW_4 , $C(NR_4)W_4$, $C(NR_4)SR_4$, $C(S)SR_4$, $CHR_4NR_4N(R_4)_2$, $CHR_4NR_5N(R_4)_2$, $CHR_4NR_4NR_4R_5$, $CHR_4NR_4N(R_5)_2$, $CHR_4NR_5N(R_5)_2$, $CH_2CH_2NR_4OR_5$, $CHR_4NR_4OR_4$, $CHR_4NR_5OR_5$, $CHR_4NR_5OR_4$, $CH_2CH_2NR_5OR_5$, $CH_2CH_2NR_5OR_4$, $CR_4=CR_4R_5$, CCR_5 , $CR_4=CR_4C(R_4)_2Z$, $C-C-C(R_4)_2Z$, $CR_4=CH_4C(R_4)_2OR_5$, $C-C-C(R_4)_2OR_5$, $CR_4=CR_4C(R_4)_2OR_4$, $C-C-C(R_4)_2OR_4$, $C(O)NR_4OR_4$, $C(O)NR_4OR_5$, $C(S)NR_4OR_4$, $C(S)NR_4OR_5$, $C(R_4)_2OR_4$, $C(R_4)_2OR_5$, $CHR_4NR_4SO_2W_4$, $CH_2CHR_4NR_4SO_2W_4$, $C(R_4)_2CR_4NOR_4$, $C(R_4)_2CR_4NOR_5$, $C(R_4)_2W_5$, $CR_4W_5OR_4$, 또는 $CR_4W_5SR_4$ 라고 ; R^4 는 수소, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, 아릴, 아릴- C_1-C_6 -알킬, 또는 C_1-C_6 알키닐이고 ; R_5 는 COW_3 , CSW_3 , 또는 $C(NR_4)W_3$ 이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C_1-C_6 알킬, Z, OR_4 , OR_5 , SR_4 , SR_5 , $N(R_4)_2$, $N(R_5)_2NR_4R_5$, NR_4OR_4 , NR_4OR_5 , $NR_4N(R_4)_2$, $NR_4NR_4R_5$, $NR_4N(R_5)_2$, $NR_5N(R_4)_2$, $NR_5NR_4R_5$, 또는 $NR_5N(R_5)_2$ 이거나 ; X 및 Y가 함께 NR_4 , NR_5 , NOR_4 , NOR_5 , S, $C(R_4)_2$, $C(R_5)_2$, CR_5R_4 , $NN(R_4)_2$, NNR_4R_5 , $NN(R_5)_2$, 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W_1 은 수소, C_1-C_{20} 알킬, C_2-C_{20} 알케닐, 아릴, 아릴- C_1-C_{20} -알킬, 또는 C_2-C_{20} 알키닐이고 ; W_2 는 수소, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, 아릴, 아릴- C_1-C_6 -알킬, 또는 C_2-C_6 알키닐이고 ; W_3 는 수소, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, 아릴, 아릴- C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 알키닐, OR_4 , 또는 $N(R_4)_2$ 이고 ; W_4 는 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, 아릴, 아릴- C_1-C_6 -알킬, C_2-C_6 알키닐, OR_4 , 또는 $N(R_4)$ 이고 ; W_5 는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하면, 환이 C_1-C_6 알킬 및 C_2-C_6 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R_3 가 CHO 이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 OH 또는 $OCOCH_3$ 가 아니어야 하며, R_2 는 CH_3 가 아니어야 하고 ; b) R_3 가 CH_3 이고 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 OH 또는 $OCOCH_3$ 가 아니어야 하고, R_2 는 CH_3 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH , $OCOCH_3$ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R_1 이 =O, 또는 OW_1 (여기에서 W_1 은 수소 또는 C_1-C_6 알킬이다), 또는 $OCOW_1$ (여기에서 W_1 은 수소 또는 C_1-C_{20} 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR_4 (여기에서 R_4 는 수소이다) 또는 OR_5 (여기에서 R_5 는 COW_3 (W_3 는 C_1-C_{20} 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH 인 경우, R^3 는 수소 또는 αC_1-C_6 알킬이 아니어야 하며 ; d) R_3 는 CH_2OH 또는 CH_2OCOCH_3 이고, R_2 는 수소 또는 CH_3 이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R_1 은 =O 또는 OH 또는 $OCOCH_3$ 가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH 가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 수소 또는 CH_3 가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R_3 는 OH 가 아니어야 하고, R_2 는 수소가 아니어야 하고 ; g) R_2 가 수소이고, R_3 가 αOH 이고, X가 βOH 이고, Y가 αH 이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R_4 은 OH 가 아니어야 하고 ; h) X가 OH , OR_5 , $N(R_4)_2$, $N(R_5)_2$, NR_4R_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , 또는 NR_4OR_5 인 경우, Y는 Z, OH , OR_5 , SR_5 , NR_4OR_4 , NR_4OR_5 , $N(R_4)_2$, 또는 $N(R_5)_2$ 가 아니어야 한다.

청구항 20

유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염을 투여함을 특징으로 하여,

라노스테롤-8,24-디엔-3β-올 14α-메틸-탈메틸효소 활성을 저해하는 방법.

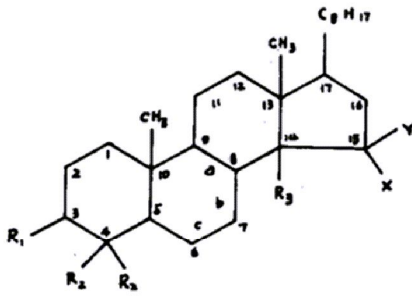


상기식에서, R₁은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시), C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C C-C(R₄)₂OR₄, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₄, 또는 CR₄W₅SR₄라고 ; R⁴는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄, SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂, 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHO이고, X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하며, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₂은 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₂는 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₃가 αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₄은 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고, i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 21

유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염을 투여함을 특징으로 하여 3-하이드록

시-3-메틸글루타릴 조효소 A 환원효소 활성을 억제하는 방법.

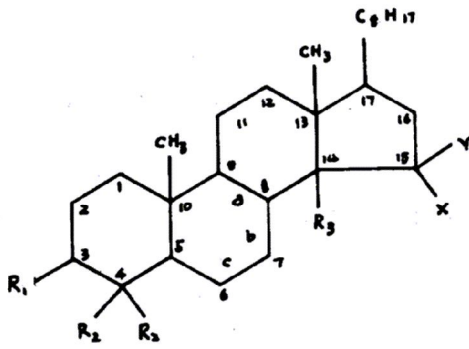


상기식에서, R¹은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시) C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C C-C(R₄)₂OR₄, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₄, 또는 CR₄W₅SR₄라고 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂, 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆-알키닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHO이고 X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 CH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하며, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₂는 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₃가 αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₄는 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고, i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 22

유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염을 투여함을 특징으로 하여, 콜레스테롤

생성을 감소시키는 방법.

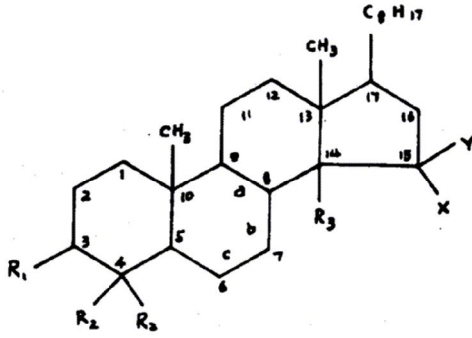


상기식에서, R₁은 =O ; OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CH₂Z, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 폴리-(OR₄, OR₅, 에폭시) C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C CR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂Z, C C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C C-C(R₄)₂OR₄, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₄, 또는 CR₄W₅SR₄라고 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, Z, OR₄, OR₅, SR₄, SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂, 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CHOH이고 X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하며, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₂는 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₃가 αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₁은 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고 ; i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 OH 또는 할로겐이 아니어야 한다.

청구항 23

유효량의 하기 일반식의 화합물 및 생리적으로 허용되는 그의 염을 투여함을 특징으로 하여, 혈청 콜레

스테롤 농도를 저하시키는 방법.



상기식에서, R₁은 =O, OW₁, 또는 OCOW₁이고 ; R₂는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐 또는 아릴-C₁-C₆-알킬이고 ; R₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 아릴-C₁-C₆-알킬, CHO, CH₂OR₄, CH₂CH₂OR₄, CHNOR₄, CH₂SR₄, CH₂CH₂SR₄, CHOR₄W₂, CHOR₅W₂, CN, CHZ₂, CHS, CHR₄N(R₄)₂, CH₂CH₂N(R₄)₂, CH₂CH₂Z, N(R₄)₂, SR₄, OR₄, CH=NNHR₄, 플리-(OR₄, OR₅, 에폭시 C₁-C₆ 알킬, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, OR₅, CH=NNHR₅, CH₂OR₅, CH₂CH₂OR₅, CHNOR₅, CH₂SR₅, CH₂CH₂SR₅, CHR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₄R₅, CH₂CH₂N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄R₅, CH₂CH₂NR₄OR₄, CHR₄NR₄OR₅, COW₄, CSW₄, C(NR₄)W₄, C(NR₄)SR₄, C(S)SR₄, CHR₄NR₄N(R₄)₂, CHR₄NR₅N(R₄)₂, CHR₄NR₄NR₄R₅, CHR₄NR₄N(R₅)₂, CHR₄NR₅N(R₅)₂, CH₂CH₂NR₄OR₅, CHR₄NR₄OR₄, CHR₄NR₅OR₅, CHR₄NR₅OR₄, CH₂CH₂NR₅OR₅, CH₂CH₂NR₅OR₄, CR₄=CR₄R₅, C CR₅, CR₄=CR₄(R₄)₂Z, C C-C(R₄)₂Z, CR₄=CH₄C(R₄)₂OR₅, C C-C(R₄)₂OR₅, CR₄=CR₄C(R₄)₂OR₄, C C-C(R₄)₂OR₄, C(O)NR₄OR₄, C(O)NR₄OR₅, C(S)NR₄OR₄, C(S)NR₄OR₅, C(R₄)₂OR₄, C(R₄)₂OR₅, CHR₄NR₄SO₂W₄, CH₂CHR₄NR₄SO₂W₄, C(R₄)₂CR₄NOR₄, C(R₄)₂CR₄NOR₅, C(R₄)₂W₅, CR₄W₅OR₄, 또는 CR₄W₅SR₄라고 ; R₄는 수소, C₁-C₆알킬, C₂-C₆알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, 또는 C₂-C₆ 알키닐이고 ; R₅는 COW₃, CSW₃, 또는 C(NR₄)W₃이고 ; X 및 Y는 독립적으로 수소, C₁-C₆ 알킬, OR₄, OR₅, SR₄SR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, NR₄N(R₄)₂, NR₄NR₄R₅, NR₄N(R₅)₂, NR₅N(R₄)₂, NR₅NR₄R₅, 또는 NR₅N(R₅)₂이거나 ; X 및 Y가 함께 NR₄, NR₅, NOR₄, NOR₅, S, C(R₄)₂, C(R₅)₂, CR₅R₄, NN(R₄)₂, NNR₄R₅, NN(R₅)₂, 또는 산소이고 ; Z는 할로겐이고 ; W₁은 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₂는 수소, C₁-C₂₀ 알킬, C₂-C₂₀ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₂₀-알킬, 또는 C₂-C₂₀ 알키닐이고 ; W₃는 수소, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₄는 C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, 아릴, 아릴-C₁-C₆-알킬, C₂-C₆ 알키닐, OR₄, 또는 N(R₄)₂이고 ; W₅는 환의 부분으로서 질소원자 1 또는 2개를 함유하며, 환이 C₁-C₆ 알킬 및 C₂-C₆ 알케닐로 이루어진 그룹으로부터 선택된 치환체에 의해 임의로 치환된 5- 또는 6-원 방향족 헤테로사이클릭 환을 나타내며 ; 단, a) R₃가 CH₃이고 X 및 Y 모두가 수소이고, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃가 아니어야 하고 ; b) R₃가 CH₃이고 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, R₂는 CH₃ 또는 수소가 아니어야 하며, X 및 Y는 OH, OCOCH₃ 또는 수소가 아니어야 하고 ; c) R₁이 =O, 또는 OW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다), 또는 OCOW₁(여기에서 W₁은 수소 또는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이고, X가 OR₄(여기에서 R₄는 수소이다) 또는 OR₅(여기에서 R₅는 COW₃(W₃는 C₁-C₂₀ 알킬 또는 페닐이다)이다)이고, Y가 수소 또는 OH인 경우, R₃는 수소 또는 αC₁-C₆ 알킬이 아니어야 하며 ; d) R₃는 CH₂OH 또는 CH₂OCOCH₃이고, R₂는 수소 또는 CH₃이고, 6-7, 7-8 또는 8-9의 탄소가 불포화된 경우, R₁은 =O 또는 OH 또는 OCOCH₃가 아니어야 하고, X는 수소 또는 OH가 아니어야 하며, e) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 수소 또는 CH₃가 아니어야 하고, f) X 및 Y 모두가 수소인 경우, R₃는 OH가 아니어야 하고, R₂는 수소가 아니어야 하고 ; g) R₂가 수소이고, R₃가 αOH이고, X가 βOH이고, Y가 αH이고, 6-7, 7-8 및 8-9의 탄소가 포화된 경우, R₁은 OH가 아니어야 하고 ; h) X가 OH, OR₅, N(R₄)₂, N(R₅)₂, NR₄R₅, SR₅, NR₄OR₄, 또는 NR₄OR₅인 경우, Y는 Z, OH, OR₅, SR₅, NR₄OR₄, NR₄OR₅, N(R₄)₂, 또는 N(R₅)₂가 아니어야 하고 ; i) R₃가 수소, OH, 또는 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 함께 산소가 아니어야 하고 ; j) R₃가 C₁-C₆알킬인 경우, X 및 Y는 또는 할로겐이 아니어야 한다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.