

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵

C07D 263/03

(11) 공개번호 특 1992-0009806

(43) 공개일자 1992년 06월 25일

(21) 출원번호 특 1991-0020895
(22) 출원일자 1991년 11월 22일

(30) 우선권주장 P4037437.8 1990년 11월 24일 독일(DE)
(71) 출원인 퀄스트 아크티엔게젤샤프트 이전브루크, 라피체
독일연방공화국 대-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 50
(72) 발명자 아달베르트 바그너
독일연방공화국 대-6238 호프하임 암 타우누스 클라이스트스트라세 9
라이너 헨닝
독일연방공화국 대-6234 하테르스하임 암 마인 임 훌헨 16
볼프-울리히 낙켈
독일연방공화국 대-6238 호프하임 암 타우누스 스포르트플라츠스트라세 20
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음**(54) 아미노디올 유도체****요약**

내용 없음

형세서

[발명의 명칭]

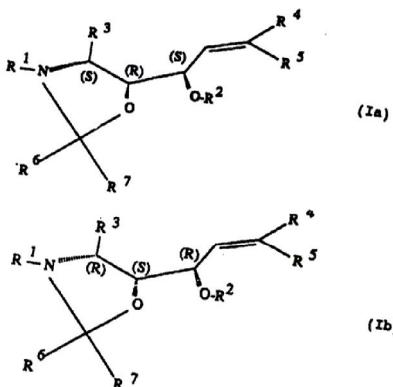
아미노디올 유도체

[도면의 간단한 설명]

"본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음"

(57) 청구의 범위**청구항 1**

일반식(Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.



상기 식에서, R¹은 R^a-W이고, W는 -CO-, -O-CO-, -SO₂- 또는 -NH-CO-이며, R^a는 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화되어 있고, 하이드록실, (C₁-C₇)-알콕시, (C₁-C₇)-알카노일옥시, 카복실, (C₁-C₇)-알콕시카보닐, 할로겐, 아미노, (C₁-C₇)-알킬아미노, 디-(C₁-C₇)-알킬아미노, (C₁-C₅)-알콕시카보닐아미노 및 (C₇-C₁₅)-아르알콕시카보닐아미노를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 3개 이하의 라디칼에 의해 임의

로 치환된 (C_1-C_{10}) -알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬- (C_1-C_{10}) -알킬, F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C_1-C_7) -알콕시, (C_1-C_7) -알킬, (C_1-C_7) -알콕시카보닐, 아미노, 및 2개 이하의 할로겐에 의해 임의로 치환된 아닐리노 및 트로플루오로메틸을 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1 또는 2개의 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C_6-C_{14}) -아릴, 아릴 잔기가 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C_1-C_7) -알콕시, (C_1-C_7) -알킬, (C_1-C_7) -알콕시카보닐, 아미노, (C_1-C_7) -알킬아미노, 디- (C_1-C_7) -알킬암노, 카복실, 카복시메톡시, 아미노- (C_1-C_7) -알킬, (C_1-C_7) -아킬아미노- (C_1-C_7) -알킬, 디- (C_1-C_7) -알킬아미노- (C_1-C_7) -알킬, (C_1-C_7) -알콕시카보닐메톡시, 카보모일, 설파모일, (C_1-C_7) -알콕시설포닐 및 설포를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1 또는 2개의 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C_6-C_{14}) -아릴- (C_1-C_6) -아킬, F, Cl, Br, 하이드록실, (C_1-C_7) -알콕시, (C_1-C_7) -알킬, (C_1-C_7) -알콕시카보닐, 아미노 및 트로플루오로메틸을 포함하는 그룹 중에서 선택된 하나 이상의 라디칼에 의해 임의로 일-, 이- 또는 삼-치환된 하나 이상의 탄소원자 1 내지 4개의 질소 원자 및/또는 하나의 황 또는 산소 원자를 환원자로서 함유하는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭 헤테로사이클의 라디칼이며, R^2 는 H 또는 하이드록실 보호 그룹이며, R^3 는 (C_1-C_{12}) -알킬, 또는 사이클로알킬 잔기가 각각 (C_1-C_6) -알킬에 의해 임의로 치환된 모노, 비- 또는 트리-사이클릭 (C_3-C_{18}) -사이클로알킬 또는 모노, 비- 또는 트리-사이클릭 (C_3-C_{18}) -사이클로알킬로 알킬-(C_1-C_6)-알킬이고, R^4 및 R^5 는 동일하거나 상이하며, 수소 (C_1-C_{12}) -알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬- (C_1-C_6) -알킬, 아릴이 각각 (C_1-C_6) -알킬 및 할로겐을 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1 내지 3개의 라디칼에 의해 치환된 (C_6-C_{14}) -아릴- (C_1-C_6) -알킬, 또는 Het가 벤젠에 임의로 융합되고, 부분적으로 수소화되거나 완전히 수소화된 방향족일 수 있으며, N, O, S, NO, SO 및 SO₂를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1개 또는 2개의 라디칼을 헤테로 그룹으로서 함유하고 (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시 및 할로겐을 포함하는 그룹에서 동일하거나 상이한 1개 또는 2개의 라디칼에 의해 치환될 수 있는 5-, 6- 또는 7-원 헤테로사이클릭 환인 Het- (C_1-C_6) -알킬이며, R^6 및 R^7 는 동일하거나 상이하고, 수소 (C_1-C_{12}) -알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬- (C_1-C_6) -알킬, 또는 아릴이 각각 (C_1-C_6) -알킬, (C_1-C_4) -알콕시 및 할로겐을 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1개 내지 3개의 라디칼에 의해 치환될 수 있는 (C_6-C_{14}) -아릴- $(C-C_6)$ -알킬이거나, R^6 및 R^7 이 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C_3-C_{12}) -사이클로알킬을 형성한다.

청구항 2

R^a 가 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화된 (C_1-C_{10}) -알릴, (C_3-C_6) -사이클로알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬- (C_1-C_6) -알킬, (C_6-C_{14}) -아킬, (C_6-C_{14}) -아릴- (C_1-C_6) -알킬 또는 하나 이상의 탄소원자, 1 내지 4개의 질소원자 및/또는 1개의 황 또는 산소원자를 환원자로서 부가적으로 함유하는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭 헤테로사이클의 라디칼이고, R^3 가 (C_1-C_6) -알킬, 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C_3-C_{18}) -사이클로알킬, 또는 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C_3-C_{18}) -사이클로알킬- (C_1-C_3) -알킬이며, R^6 및 R^7 이 동일하거나 상이하고, 수소, (C_1-C_{12}) -알킬, (C_3-C_{12}) -사이클로알킬 또는 (C_3-C_{12}) -사이클로알킬- (C_1-C_6) -알킬이거나, R^6 및 R^7 이 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C_3-C_{12}) -사이클로알킬을 형성하고, 다른 라디칼들은 제1항에서 정의한 바와 같은, 일반식(Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.

청구항 3

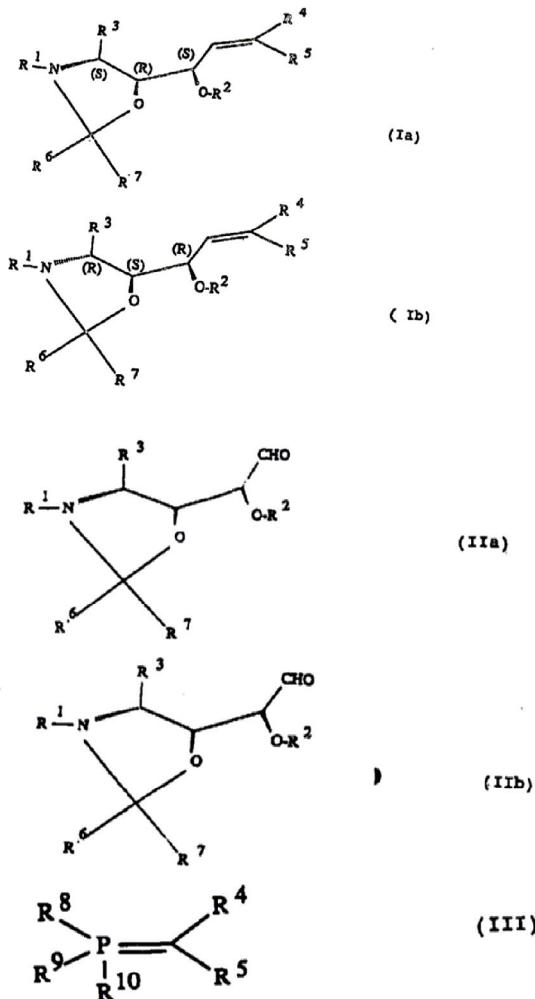
제1항 또는 제2항에 있어서, W가 -CO-, -O-CO-이고, R^a 는 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화된 (C_1-C_{10}) -알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬, (C_3-C_8) -사이클로알킬- (C_1-C_6) -알킬, (C_6-C_{14}) -아릴, (C_6-C_{14}) -아릴- (C_1-C_6) -알킬이거나, 하나 이상의 탄소원자, 1 내지 4개의 질소원자 및/또는 하나의 황 또는 산소원자를 환원자로서 함유하는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭 헤테로사이클의 라디칼이며, R^3 가 메틸, 에틸, n-프로필, n-부틸, 2-메틸프로필, 2-에틸부틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸 또는 사이클로헵틸메틸이고, R^6 및 R^7 이 동일하며, 수소 또는 (C_1-C_4) -알킬이거나, 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C_5-C_7) -사이클로알킬을 형성하며, 다른 라디칼은 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식(Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한 항에 있어서, R^1 및 R^3 는 제3항에서 정의한 바와 같고, R^4 및 R^5 는 동일하거나 상이하며, 수소, (C_1-C_4) -알킬, (C_5-C_7) -사이클로알킬, (C_5-C_7) -사이클로알킬- (C_1-C_3) -알킬, 페닐, 벤질, 2-피리딜, 3-피리딜, 4-피리딜, 2-티아졸릴, 4-티아졸릴, 5-티아졸릴, 2-티에닐, 3-티에닐, 1-메틸이미다졸-2-일, 1-메틸이미다졸-4-일 또는 1-메틸이미다졸-5-일이며, R^6 및 R^7 은 동일하며, 수소, (C_1-C_4) -알킬 또는 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C_5-C_7) -사이클로알킬을 형성하고 다른 라디칼들은 제1항에서 정의한 바와 같은, 일반식(Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.

청구항 5

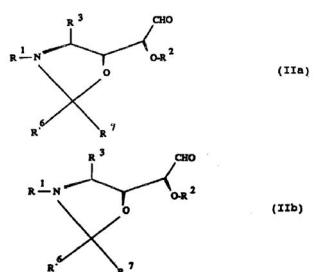
일반식 (IIa) 또는 (IIb)의 화합물을 일반식 (III)의 포스포란과 반응시킴을 특징으로 하여, 제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 따른 일반식 (Ia) 또는 (Ib)의 화합물을 제조하고, 경우에 따라 수득된 화합물을 이의 염으로 전환시킴을 특징으로 하는 방법.



상기 식에서, R¹ 내지 R⁷은 제1항에서 정의한 바와 같고, R⁸, R⁹ 및 R¹⁰은 동일하거나 상이한 아릴 라디칼이다.

청구항 6

일반식 (IIa) 또는 (IIb)의 화합물.



상기 식에서, R¹, R², R³, R⁶ 및 R⁷은 제1항에서 정의한 바와 같다.

청구항 7

레닌 및 HIV 프로테아제 억제제를 제조하기 위한 제1항 내지 제4항에 따른 화합물의 용도.

*참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.