

# (19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>  
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	핵스트 아크티엔게젤샤프트 이젠브루크, 라피체 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 50 아달베르트 바그너 독일연방공화국 데-6238 호프하임 암 타우누스 클라이스트스트라세 9 라이너 헨닝 독일연방공화국 데-6234 하테르스하임 암 마인 임 힐헨 16 볼프-올리히 니켈 독일연방공화국 데-6238 호프하임 암 타우누스 스포르트플라츠스트라세 20아 이병호, 최달용
(72) 발명자	
(74) 대리인	

심사청구 : 없음

(54) 아미노디올 유도체

## 요약

내용 없음

## 명세서

[발명의 명칭]

아미노디올 유도체

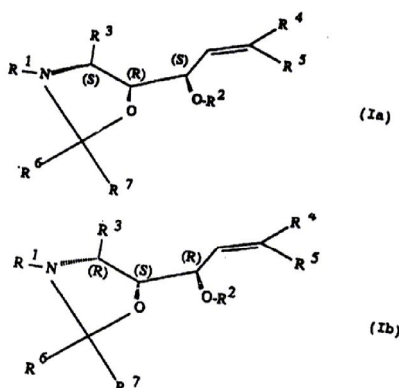
[도면의 간단한 설명]

"본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음"

## (57) 청구의 범위

### 청구항 1

일반식 (Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 R<sup>a</sup>-W-이고, W는 -CO-, -O-CO-, -SO<sub>2</sub>- 또는 -NH-CO-이며, R<sup>a</sup>는 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화되어 있고, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알카노일옥시, 카복실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 할로겐, 아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-알콕시카보닐아미노 및 (C<sub>7</sub>-C<sub>15</sub>)-아르알콕시카보닐아미노를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 3개 이하의 라디칼에 의해 임의

로 치환된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬, F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-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<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴, 아릴 잔기가 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐, 아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노, 카복실, 카복시메톡시, 아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-아릴아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬아미노-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시카보닐메톡시, 카보모일, 설파모일, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시설파닐 및 설파를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1 또는 2개의 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-아킬, F, Cl, Br, 하이드록실, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알콕시, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-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<sup>2</sup>는 H 또는 하이드록실 보호 그룹이며, R<sup>3</sup>는 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, 또는 사이클로알킬 잔기가 각각 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬에 의해 임의로 치환된 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬 또는 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이고, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 동일하거나 상이하며, 수소 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, 아랄이 각각 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 및 할로겐을 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1 내지 3개의 라디칼에 의해 치환된 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, 또는 Het가 벤젠에 임의로 융합되고, 부분적으로 수소화되거나 완전히 수소화된 방향족일 수 있으며, N, O, S, NO, SO 및 SO<sub>2</sub>를 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1개 또는 2개의 라디칼을 헤테로 그룹으로서 함유하고 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 및 할로겐을 포함하는 그룹에서 동일하거나 상이한 1개 또는 2개의 라디칼에 의해 치환될 수 있는 5-, 6- 또는 7-원 헤테로사이클릭 환인 Het-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이며, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>는 동일하거나 상이하고, 수소 (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, 또는 아랄이 각각 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시 및 할로겐을 포함하는 그룹중에서 선택된 동일하거나 상이한 1개 내지 3개의 라디칼에 의해 치환될 수 있는 (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이거나, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>이 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬을 형성한다.

## 청구항 2

R<sup>a</sup>가 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬 또는 하나 이상의 탄소원자, 1 내지 4개의 질소 원자 및/또는 1개의 황 또는 산소원자를 한 원자로서 부가적으로 함유하는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭 헤테로사이클의 라디칼이고, R<sup>3</sup>가 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬, 또는 모노-, 비- 또는 트리-사이클릭 (C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-알킬이며, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>이 동일하거나 상이하고, 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬 또는 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이거나, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>이 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-사이클로알킬을 형성하고, 다른 라디칼들은 제1항에서 정의한 바와 같은, 일반식 (Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.

## 청구항 3

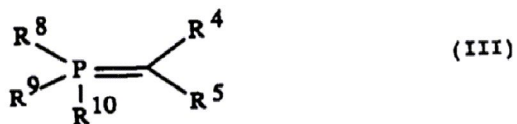
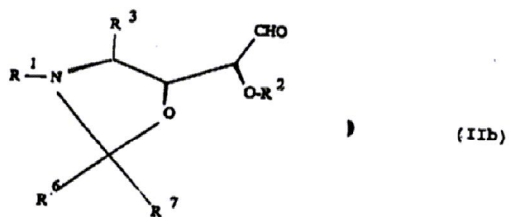
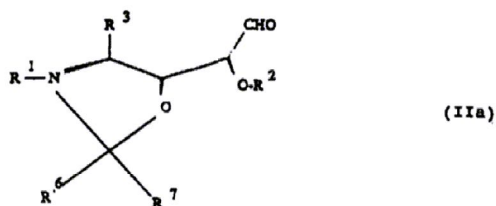
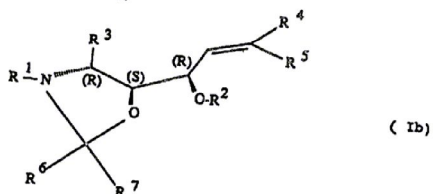
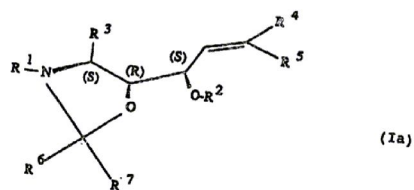
제1항 또는 제2항에 있어서, W가 -CO-, -O-CO-이고, R<sup>a</sup>는 수소, 임의로 일- 또는 이-불포화된 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬이거나, 하나 이상의 탄소원자, 1 내지 4개의 질소 원자 및/또는 하나의 황 또는 산소 원자를 한 원자로서 함유하는 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 또는 10-원 비사이클릭 헤테로사이클의 라디칼이며, R<sup>3</sup>가 메틸, 에틸, n-프로필, n-부틸, 2-메틸프로필, 2-에틸부틸, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸 또는 사이클로헵틸메틸이고, R<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>이 동일하며, 수소 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬이거나, 이들을 연결시키는 탄소 원자와 함께 (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)-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<sup>1</sup> 및 R<sup>3</sup>는 제3항에서 정의한 바와 같고, R<sup>4</sup> 및 R<sup>5</sup>는 동일하거나 상이하며, 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-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<sup>6</sup> 및 R<sup>7</sup>은 동일하며, 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬 또는 이들을 연결시키는 탄소원자와 함께 (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>)-사이클로알킬을 형성하고 다른 라디칼들은 제1항에서 정의한 바와 같은, 일반식 (Ia) 또는 (Ib)의 화합물 및 이의 염.

## 청구항 5

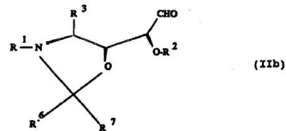
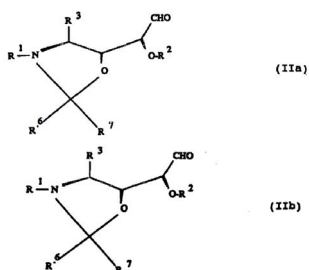
일반식 (IIa) 또는 (IIb)의 화합물을 일반식(III)의 포스포란과 반응시킴을 특징으로 하여, 제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 따른 일반식(Ia) 또는 (Ib)의 화합물을 제조하고, 경우에 따라 수득된 화합물을 이의 염으로 전환시킴을 특징으로 하는 방법.



상기 식에서,  $R^1$  내지  $R^7$ 은 제1항에서 정의한 바와 같고,  $R^8$ ,  $R^9$  및  $R^{10}$ 은 동일하거나 상이한 아릴 라디칼이다.

## 청구항 6

일반식(IIa) 또는 (IIb)의 화합물.



상기 식에서,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$  및  $R^7$ 은 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.