

(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07F 9/36	(11) 공개번호 (43) 공개일자	특 1991-0000766 1991년 01월 30일
(21) 출원번호	특 1990-0008137	
(22) 출원일자	1990년 06월 02일	
(30) 우선권 주장	89128144 1989년 06월 03일 스위스(CH)	
(71) 출원인	시바-가이키 에이치 베르너 발데그	
(72) 발명자	스위스연방 4002 바슬 클리벡스트라세 141 스튜어트 제이.미켈 스위스연방 4415 라우젠 후페르스트라세 15 게오르크 폰 스프레헤 스위스연방 4104 오베르빌 넬켄베크 5	
(74) 대리인	이병호, 최달용	

심사청구 : 없음

(54) P-치환된 프로판-포스핀산 화합물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

P-치환된 프로판-포스핀산 화합물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염.



상기 식에서, R₁은 할로겐이고, R₁'는 할로겐 또는 수소이며, R₂ 및 R₂'는 수소이거나, R₁ 및 R₂'는 수소이거나, R₂는 지방족 또는 방향족 라디칼이고, R₂'는 하이드록시이거나, R₂ 및 R₂'는 함께 옥소이며, R은 탄소수 2이상의 지방족, 지환족, 지환족-지방족 또는 아르지방족 라디칼이거나, R₁ 및 R₁'가 수소이고, R₂가 방향족 라디칼이고, R₂'가 하이드록시일 경우 R은 메틸이다.

청구항 2

제 1항에 있어서, R₁이 할로겐이고, R₁'가 할로겐 또는 수소이며, R₂ 및 R₂'가 수소이거나; R₁ 및 R₁'가 수소이고, R₂가 방향족 라디칼이며, R₂'가 하이드록시이거나 R₂ 및 R₂'가 함께 옥소이거나; R이 탄소수 2이상의 지방족, 지환족, 지환족-지방족 또는 아르지방족인 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 3

제 1항에 있어서, R₁이 할로겐이고, R₁'가 할로겐 또는 수소이며, R₂ 및 R₂'가 수소이거나; R₁ 및 R₁'가 수소이고, R₂가 저급 알킬; 페닐, 하로겐, 저급 알킬, 저급 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 일-또는 이치환된 페닐; 또는 피리딜이며, R₂'가 하이드록시이거나, R₂ 및 R₂'가 함께 옥소이고, R이 탄소수 2이상의 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 환 탄소수 3내지 6의 사이클로알킬, 하이드록시사이클로알킬, 사이클로알킬-저급 알킬, 사이클로알킬-(하이드록시)저급 알킬 또는 저급 알킬티오사이클로알킬-(하이드록시)-저급 알킬 그룹, 옥소-저급 알킬, 아미노-저급 알킬, 저급 알카노일아미노-저급 알킬, 프탈이

미도-저급알킬, 모노-또는 디하이드록시-저급 알킬, 하이드록시-저급알케닐, 아미노-(하이드록시)저급 알킬, 저급 알카노일아미노-(하이드록시)저급 알킬, 프탈이미도-(하이드록시)저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-저급 알케닐, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-(하이드록시)저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-(하이드록시)저급 알케닐, 아미노 저급 알콕시-저급 알킬, 저급 알킬티오-저급 알킬, 저급 알칸설퍼닐-저급 알킬, 저급 알판설퍼닐-저급 알킬, 디-저급 알콕시-저급 알킬, 디-저급 알킬티오-저급 알킬, 저급 알콕시-(하이드록시)저급 알킬, 저급 알콕시-(할로게노)저급 알킬, 페닐-저급 알킬; 페닐 부분에서 할로겐, 저급 알킬, 저급 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 일-또는 이치환된 페닐-저급 알킬; 나프틸-저급 알킬, 환탄소수 2내지 6의 옥사-또는 티아사이클로알킬, 또는 환탄소수 3내지 6의 디옥사-, 옥사티아-또는 디타아사이클로알킬이거나; R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 가 페닐; 할로겐, 저급 알킬, 저급 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 일-또는 이치환된 페닐; 또는 피리달이며, R'_2 가 하이드록시일 경우, R은 메틸인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 4

제 2항에 있어서, R_1 이 할로겐이고, R'_1 가 할로겐 또는 수소이며, R_2 및 R'_2 가 수소이거나; R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 가 페닐; 또는 할로겐, 저급 알킬, 저급 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 일-또는 이치환된 페닐이며, R'_2 가 하이드록시이거나, R_2 및 R'_2 가 함께 옥소이며, R이 탄소수 2이상의 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알킬닐, 환탄소수 3내지 6의 사이클로알킬, 하이드록시사이클로알킬, 사이클로알킬-, 저급 알킬, 사이클로알킬-(하이드록시)저급 알킬 또는 저급 알킬티오사이클로알킬-(하이드록시)저급 알킬 그룹, 옥소-저급 알킬, 아미노-저급 알킬, 저급 알타노일아미노-저급 알킬, 프탈이미도-저급 알킬, 모노-또는 디하이드록시-저급 알킬, 하이드록시-저급 알케닐, 아미노-(하이드록시)저급 알킬, 저급 알카노일아미노-(하이드록시)저급 알킬, 프탈이미도-(하이드록시)저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-저급 알케닐, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-(하이드록시)저급 알킬, 모노-, 디-또는 폴리할로게노-(하이드록시)저급 알케닐, 아미노 저급 알콕시-저급 알킬, 저급 알킬티오-저급 알킬, 저급알칸설퍼닐-저급알킬, 저급알칸설퍼닐-저급알킬, 디-저급 알콕시-저급알킬, 디-저급 알킬티오-저급 알킬, 저급 알콕시-(하이드록시)저급 알킬, 저급 알콕시-(할로게노)저급 알킬, 페닐-저급 알킬; 페닐 부분에서 할로겐, 저급 알킬, 저급 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 일-또는 이치환된 페닐-저급 알킬; 나프틸-저급 알킬, 환탄소수 2내지 5의 옥사-또는 티아사이클로알킬, 또는 환탄소수 3내지 5의 디옥사-, 옥사티아-또는 디타아사이클로알킬인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 5

제 2항에 있어서, R_1 및 R'_2 가 플루오로이고, R_2 및 R'_2 가 수소이거나, R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 가 페닐; 또는 할로겐, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 치환된 페닐이며, R'_2 가 하이드록시이거나; R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 및 R'_2 가 함께 옥소이며, R이 C_2-C_7 -알킬, C_2-C_{12} -알케닐, C_2-C_7 -알킬닐, 모노-또는 디하이드록시- C_2-C_7 -알킬, 옥소- C_3-C_7 -알킬, 아미노- C_3-C_6 알킬, 프탈이미도- C_3-C_6 알킬 또는 프탈이미도- C_3-C_7 (하이드록시)알킬인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 6

제 2항에 있어서, R_1 가 R'_2 가 플루오로이고, R_2 및 R'_2 가 수소이거나; R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 및 R'_2 가 함께 옥소이며, R이 C_2-C_7 -알킬, α -포화된 C_3-C_7 -알케닐, α -포화된 C_3-C_7 -알킬닐, α -, β -, γ - 또는 α -하이드록시- C_2-C_7 -알킬, α -, α -디플루오로- C_2-C_4 -알킬, 모노-, 디-또는 트리플루오로- α -하이드록시- C_3-C_7 -알킬, 모노-디-또는 트리할로게노- α -하이드록시- C_3-C_7 -알케닐, C_1-C_4 -알콕시- C_1-C_4 -알킬, 디- C_1-C_4 -알콕시- C_1-C_4 -알킬, C_3-C_6 -사이클로알킬- C_1-C_4 -알킬, α -하이드록시- C_3-C_6 -사이클로알킬 또는 C_3-C_6 -사이클로 알킬 α -하이드록시- C_1-C_4 -알킬인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 7

제 1항에 있어서, R_1 및 R'_1 가 수소이고 R_2 가 페닐; 또는 할로겐, C_1-C_4 -킬, C_1-C_4 -알콕시 및/또는 트리플루오로메틸로 치환된 페닐이며, R'_2 가 하이드록시이고, R이 C_1-C_7 -알킬인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 8

제 2항에 있어서, R이 C_1-C_7 -알킬이고, R_1 및 R'_2 가 플루오로이며, R_2 및 R'_2 가 수소이거나; R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 및 R'_2 가 함께 옥소인 일반식(1)의 화합물 또는 이의 염.

청구항 9

3-아미노-2-옥소-프로필(n-부틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 10

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시-프로필(n-부틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 11

3-아미노-1, 1-디플루오로-프로필(n-부틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 12

3-아미노-2-옥소-프로필(사이클로프로필메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 13

3-아미노-2-옥소-프로필(사이클로헥실메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 14

3-아미노-2-하이드록시-2-메틸-프로필(n-부틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 15

3-아미노-1-플루오로-프로필(n-부틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 16

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시-프로필(사이클로헥실메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 17

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시-프로필(벤질)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 18

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시프로필(사이클로프로필메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 19

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시프로필(사이클로프로필메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 20

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-옥소-프로필(디에톡시메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 21

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-옥소-하이드록시-프로필(디에톡시메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 22

3-아미노-2-(4-클로로페닐)-2-하이드록시-프로필(메틸)포스핀산 또는 이의 염.

청구항 23

제 1항 내지 22항 중 어느 한 항에 청구한 화합물 하나 이상을 통상의 약제학적 부형제와의 혼합물로 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 24

a)일반식(II)의 화합물에서, R₅또는 R₆그룹을 수소로 치환시키고/시키거나 Z₀그룹을-NH₂로 전환시키거나;
b)일반식(III)의 화합물에서, X그룹을 구조식(1a)의 그룹으로 전환시키거나; c)일반식(IV)의 화합물을 환원시키고, 필요한 경우 이 방법에서 생성된 염을 유리 화합물 또는 다른 염으로 전환시키고/시키거나, 필요한 경우 생성된 이성체의 혼합물을 각각의 이성체로 분할함을 특징으로 하여, 일반식(I)의 화합물

또는 이의 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R_1 은 할로겐이고, R'_1 은 할로겐 또는 수소이며, R_2 및 R'_2 는 수소가거나; R_1 및 R'_1 는 수소이고, R_2 는 지방족 또는 방향족 라디칼이며, R'_2 는 하이드록시이거나, R_2 및 R'_2 는 함께 옥소이며, R 은 탄소수 2이상의 지방족, 지환족, 지화족-지방족 또는 아르지방족 라디칼이거나, R_1 및 R'_1 가 수소이고, R_2 가 방향족 라디칼이며, R'_2 가 하이드록시일 경우, R 은 메틸이며, Z 는 보호되거나 잠재적인 아미노 그룹 Z_0 이고, R_4 는 수소 또는 하이드록시-보호 그룹 R_5 이며, R 및/또는 하이드록시 R'_2 또는 옥소 $\text{R}_2 + \text{R}'_2$ 의 성분으로서 아미노가 일시적으로 보호된 형태로 존재할 수 있고, X 는 구조식 (Ia)의 그룹으로 전환될 수 있는 그룹이며, R' 은 R 이 저급 알킬인 일반식 (I)의 화합물을 제조하기 위해서는 저급 알케닐, 저급 알카디에닐 또는 저급 알키닐로부터 선택될 수 있거나, R 이 사이클로헥실인 일반식 (I)의 화합물을 제조하기 위해서는 페닐로부터 선택될 수 있다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.