

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵
C07C 217/30

(11) 공개번호 특1992-0021491
(43) 공개일자 1992년 12월 18일

(21) 출원번호	특1992-0008404
(22) 출원일자	1992년 05월 19일
(30) 우선권주장	9111425.6 1991년 05월 28일 영국(GB)
(71) 출원인	임페리얼 케미칼 인더스트리스 피엘씨 수잔 제인 젠틀
(72) 발명자	영국, 에스 더블유 1피 3제이에프, 런던, 밀뱅크, 임페리얼 케미칼 하우스 할로웨이, 브라이언 로이 영국, 지비-에스케이10 4티지, 체셔, 맥클레스필드, 엘더리 파크 호위, 랄프 영국, 지비-에스케이10 4티지, 체셔, 맥클레스필드, 엘더리 파크 라오, 발비어 싱그 영국, 지비-에스케이10 4티지, 체셔, 맥클레스필드, 엘더리 파크
(74) 대리인	나영환, 도두형

심사청구 : 없음

(54) 2-히드록시-2-페닐에틸아미노 화합물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

2-히드록시-2-페닐에틸아미노 화합물

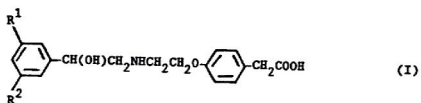
[도면의 간단한 설명]

"본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음"

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식 (I)의 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염:



상기식에서 R¹은 클로로, 플루오로, 브로모, 트리플루오로메틸 또는 메틸이며; R²는 수소원자 또는 플루오로이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R¹이 클로로, 플루오로 또는 브로모이고 R²가 수소원자인 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, R¹이 트리플루오로메틸이고 R²가 수소원자인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서, R¹이 클로로이고 R²가 수소원자인 화합물.

청구항 5

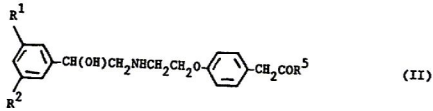
제1항 내지 제4항중 어느 한 항에 있어서, 카르복실산 또는 그것의 약학 허용염의 형태인 화합물.

청구항 6

제5항에 있어서, 염산에 의해 형성된 염의 형태인 화합물.

청구항 7

제1항에 있어서, 하기 일반식(II)로 표시되는 화합물 또는 그것의 약학적 허용 염:



상기식에서 R¹은 클로로, 플루오로, 브로모, 트리플루오로메틸 또는 메틸이며; R²는 수소원자 또는 플루오로이며, R⁵는 C₁₋₆ 알콕시이다.

청구항 8

제7항에 있어서, R⁵가 메톡시인 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서, (R)-메틸 4-[2-(2-히드록시-2-(3-트리플루오로메틸페닐)에틸아미노)에톡시]페닐아세테이트, (R)-4-[2-(2-히드록시-2-(3-트리플루오로메틸페닐)에틸아미노)에톡시]페닐아세트산, 메틸 4-[2-(2-[3-클로로페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세테이트 염산염, 4-[2-(2-[3-클로로페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세트산, 메틸 4-[2-(2-[3-플루오로페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세테이트 염산염, 4-[2-(2-[3-플루오로페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세트산, 메틸 4-[2-(2-[3-브로모페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세테이트 염산염, 4-[2-(2-[3-브로모페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세트산, 4-[2-(2-[3,5-디플루오로페닐]-2-히드록시에틸아미노)에톡시]페닐아세트산, 4-[2-(2-히드록시-2-(3-메틸페닐)에틸아미노)에톡시]페닐아세트산 또는 이들의 약학적 허용염인 화합물.

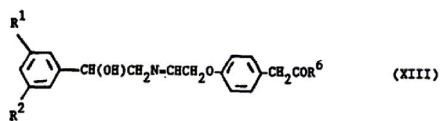
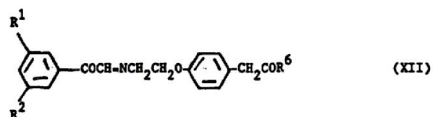
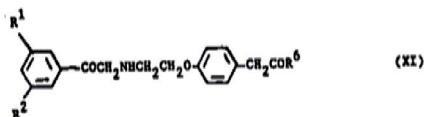
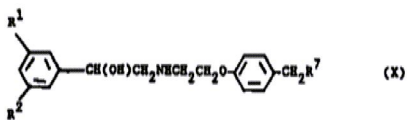
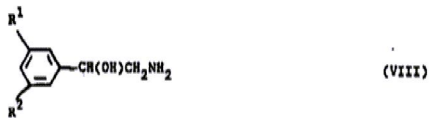
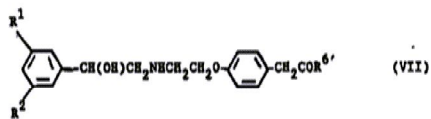
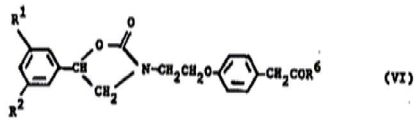
청구항 10

제1항에 의한 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염과 약학적 허용 부형제를 포함하는 약학 조성물.

청구항 11

(a) 하기 일반식(III) 또는 (IV)의 화합물과 하기 일반식(V)의 화합물을 반응시키거나, (b) 하기 일반식(VI)의 화합물을 가수분해하거나, (c) 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해 하기 일반식(VII)의 화합물을 가수분해하거나, (d) 하기 일반식(VIII)의 화합물과 하기 일반식(IX)의 화합물을 반응시키거나, (e) 하기 일반식(X)의 화합물의 보호기를 제거하거나, (f) 일반식(I)의 화합물을 생물학적 전구체로, 또는 그 역으로 전환시키거나, 또는 일반식(I)의 화합물의 생물학적 전구체를 일반식(I)의 화합물의 또다른 생물학적 전구체로 전환시키거나, (g) 하기 일반식(XI)화합물을 환원시키거나, (h) 하기 일반식(XII)의 화합물을 환원시키거나, (i) 하기 일반식(XIII)의 화합물을 환원시키고, 작용기는 임의로 보호한 후에 필요에 따라 (i) 보호기를 제거하고, (ii) 약학적 허용염을 형성시키는 단계를 포함하는 제1항에 의한 화합물의 제조방법:





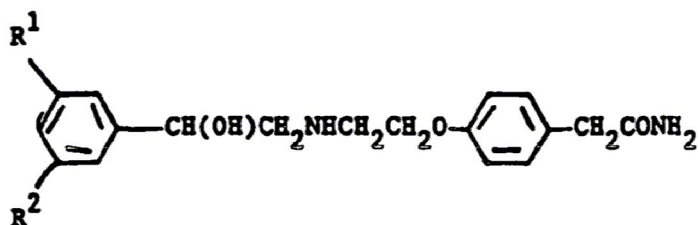
상기식에서 R¹은 클로로, 플루오로, 브로모, 트리플루오로메틸 또는 메틸이며; R²는 수소원자 또는 플루오로이고, -COR⁶는 카르복시기 또는 그것의 생물학적 전구체이고, L과 L'는 각각 치환 가능한 기이고, R⁶은 가수분해 가능한기이며 R⁷은 -COR⁶기의 보호된 유도체이다.

청구항 12

제11항에 정의한 일반식(VI), (VII), (X), (XI), (XII) 또는 (XIII)의 화합물.

청구항 13

하기 일반식으로 표시되는 화합물:



청구항 14

제1항에 의한 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염을 β₃-아드레날린 수용체를 통해 매개되는 질병 증상의 치료에 사용하는 방법.

청구항 15

제1항에 의한 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염을 열 발생을 자극하는 방법 및/

또는 글루코오스 내성을 향상시키기는 방법에 사용하는 방법.

청구항 16

제1항에 의한 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염을 비만증, 성숙기 개시 당뇨병, NIDDM, 고혈압 및/또는 과지질혈증의 치료에 사용하는 방법.

청구항 17

제1항에 의한 화합물 또는 그것의 생물학적 전구체 또는 약학적 허용염을 과글리세리드혈증, 콜레스테롤 과잉혈증, 아테롬성 경화증 및 HDL 농도 저하 증상의 치료에 사용하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.