

(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07C 149/40	(11) 공개번호 (43) 공개일자	특 1991-0000614 1991년 01월 29일
(21) 출원번호 (22) 출원일자	특 1989-0008639 1989년 06월 21일	
(30) 우선권주장 (71) 출원인	8814813.5 1988년 06월 22일 영국(GB) 비이참 그루우프 피이엘시이 데이빗 로버츠	
(72) 발명자	영국 미들섹크스주 티이다볼류 8 9비이디이(TW8 9BD) 부렌트호오드시 그레이트 웨스트 로오드 비이참 하우스 이언 휴즈	
(74) 대리인	영국 에섹스주 시이엠 19 5에이디이(CM19 5AD) 하아로우시 더 피너클즈 코울드 하아버어 로오드 비이참 화아마슈티칼즈 차윤근, 차순영	

심사청구 : 없음

(54) 신규 화합물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

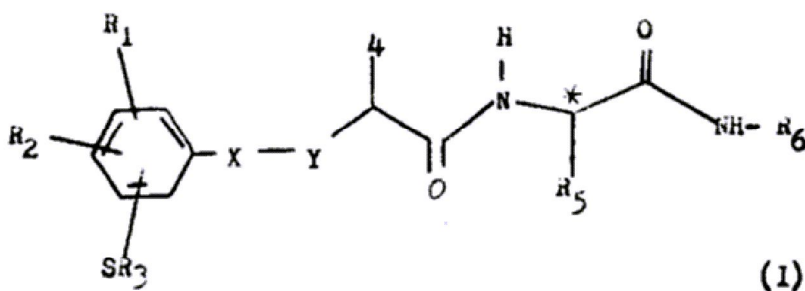
신규 화합물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(I)의 화합물 또는 이들의 염, 용매화물 또는 수화물 :



상기식에서, R₁ 및 R₂는 각각 수소; 알킬; 알콕시; 할로겐; 또는 CF₃이고; R₃는 수소; 아실, 예컨대

—C(=O)—알킬—C(=O)—Z (여기서, Z는 임의로 치환된 아릴임), 또는 RS⁻기(여기서, R은 RS⁻기가 생체내에서 분해될 수 있는 이황화 결합을 제공하도록 하는 유기잔기임)이고 ; R₄는 C₃₋₆ 알킬이고 ; R₅는 수소, 알킬,

—CH—O—R_{11}
|
R₁₂
기(여기서, R₁₁은 수소;알킬;또는 $\text{—CH}_2\text{—ph}$ (여기서, ph는 임의로 치환된 페닐임)이고 R₁₂는 수소 또는 알킬임)이고 R₆는 수

—CH—COR_{14}
|
R₁₃
소, 알킬 또는 기(여기서, R₁₃는 수소 또는 알킬이고, R₁₄는 히드록시, 알콕시 또는 NR_{7a}R₈(여기서 각각의 R_{7a} 및 R₈은 임의의 산소, 황 또는 고리에서 임의로 치환된 질소원자를 갖는 5-, 6-

또는 7-개의 구성원자 고리를 형성함)이다)이거나 ; R_5 및 R_6 는 $-(CH_2)_m$ (여기서 m 은 4-12의 정수임)으로 함께 연결되고, x 은 $(CH_2)_n$ (여기서 n 은 0, 1 또는 2임)이고, Y 는 CH_2 이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R_1 및 R_2 가 각각 수소, C_{1-4} 알킬, C_{1-4} 알콕시, 할로겐 또는 트리플루오로 메틸인 화합물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, R_3 가 수소, 아세틸, 벤조일 또는 $\bar{R}\bar{S}$ 기(여기서, R 은 일반식(1)이 화합물이 이황화 결합 주위에 있는 이합체를 형성하도록하는 유기 잔기 이거나 C_{1-6} 알킬임)인 화합물.

청구항 4

제1항 내지 제3항중 어느 한항에 있어서, R_4 가 n -부틸, 이소-부틸 또는 이차-부틸인 화합물.

청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한항에 있어서, R_5 가 이소-부틸, 벤질, 4-메톡시벤질, 1-(벤질옥시)에틸 또는 3-인돌릴메틸인 화합물.

청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한항에 있어서, R_6 가 수소, 메틸, 에틸 또는 1-(메톡시카르보닐)에틸인 화합물.

청구항 7

제1항 내지 제4항중 어느 한항에 있어서, R_5 및 R_6 가 $-(CH_2)_m$ (여기서, $m=10$ 임)으로 함께 연결된 화합물.

청구항 8

제1항 내지 제7항중 어느 한 항에 있어서, n 이 0인 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서, R_1 및 R_2 가 각각 수소, 메틸, 메톡시, 클로로 또는 폴리플루오로메틸이고, R_3 가 수소 또는 2-((2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸)아미노카르보닐)-4-메틸펜틸)페닐티오이고 ; R_4 가 이소-부틸이고 ; R_5 가 4-메톡시벤질 또는 3-인돌릴메틸이고 R_6 가 메틸이거나, R_5 및 R_6 가 $-(CH_2)_m$ (여기서, $m=10$ 임)으로 함께 연결되고 ; n 이 0 또는 1인 화합물.

청구항 10

제1항 내지 제9항중 어느 한 항에 있어서, 키랄 중심이 S-배열을 가진 일반식(1)에서 별표로 표시된 화합물.

청구항 11

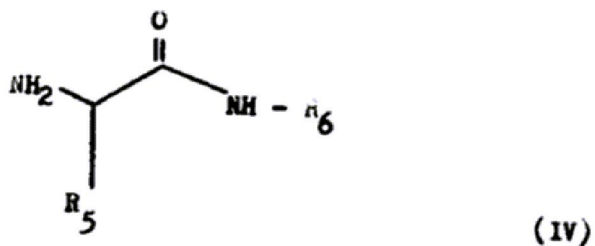
하기로부터 선택된 화합물 ; 2-머캅토-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노-카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 2-머캅토-3-메톡시-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노-카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 2-머캅토-4-메톡시-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 3-트리플루오로메틸-2-머캅토-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 4-클로로-2-머캅토-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 2-머캅토-4-메틸-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 2-클로로-6-머캅토-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 4-클로로-2-머캅토-N-[2-(3-인돌릴)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 2-머캅토-4-메톡시- α -(2-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐프로판아미드 ; 3-클로로-2-머캅토- α -(2-메틸프로필)-N-[2-옥소-3-아자시클로트리데실)페닐프로판아미드 ; 디-[2-((2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸-아미노카르보닐)에틸)아미노카르보닐)-4-메틸 펜틸)페닐] 이황화물 ; 및 2-머캅토-N-[2-(4-메톡시페닐)-1-(S)-(메틸아미노카르보닐)에틸]- α -(2-메틸프로필)페닐-부탄아미드.

청구항 12

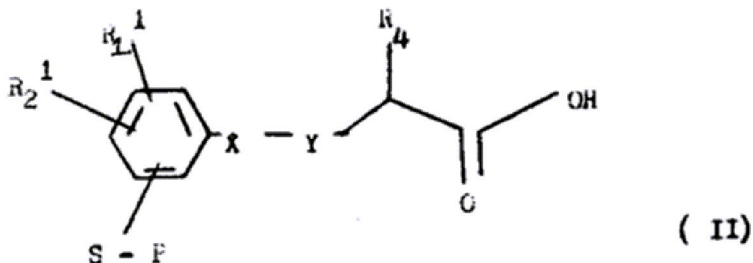
제1항 내지 제11항중 어느 한항에 있어서, 화합물의 제약학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 수화물.

청구항 13

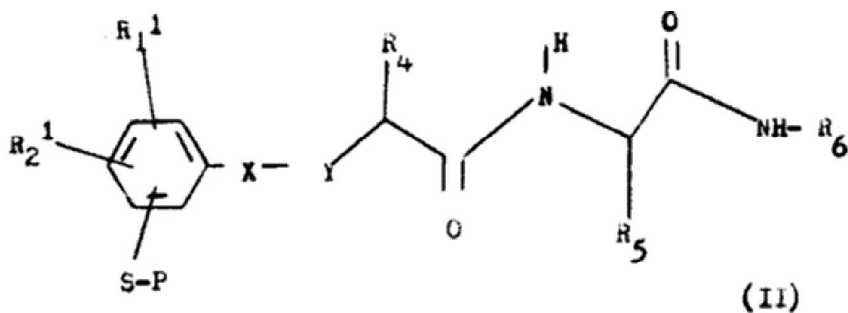
일반식(IV)



(여기서, R₅ 및 R₆는 제1항에서 일반식(I)에 대해 정리된 것과 같음)의 화합물과 일반식(III)



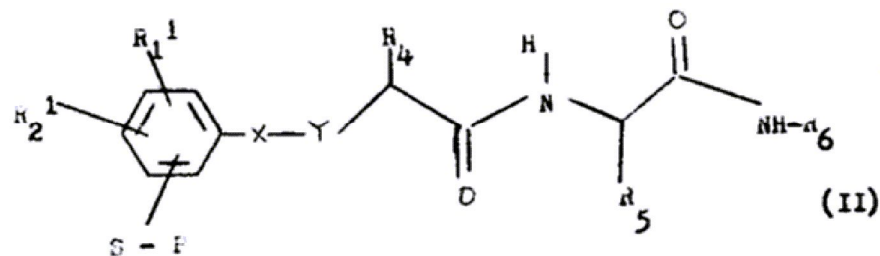
(여기서, R₁¹ 및 R₂²는 제1항에서 일반식(I)에 대해 정의된 것처럼 각각 R₁ 및 R₂이거나 그것으로 전환될 수 있는 기이고, R₄, X 및 Y는 제1항에서 일반식(I)에 대해 정의된 것과 같고, p는 통상적인 황보호기인 p₁ 또는 -R' -S기(여기서, R' 는 -R' -S가 분해될 수 있는 이황화 결합을 제공하기 위한 임의의 유기 잔기임)인 p₂이다)의 화합물의 반응에 의해 일반식(II)



(여기서, R₁¹, R₂², R₄, X, Y 및 P는 일반식(III)에서 정의된 것과 같고 R₅ 및 R₆는 일반식 (IV)에서 정의된 것과 같고 계속해서, 일반식(I)의 화합물에서 R₃는 수소, 분해되는 p기이고 요구한다면 R₁¹에서 R₁ 및 R₂²에서 R₂로 전환됨)의 화합물을 얻는 것을 포함하는 제1항에서 정의된 바와 같은 일반식(I)의 화합물의 제조방법.

청구항 14

일반식(II)



(여기서, R₁¹, R₂², R₄, X, Y, R₅ 및 R₆는 제13항에서 정의된 것과 같고 p는 벤질, 4-메톡시벤질 또는 삼차-부틸임)의 화합물.

청구항 15

제항에서 정의된 일반식(I)의 화합물 또는 그들의 제약학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 수화물 및 제약학적으로 허용가능한 담체로 구성되는 제약학적 조성물.

청구항 16

활성치료학적 물질로 사용하기 위한 제1항에서 정의된 일반식(I)의 화합물 또는 그들의 제약학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 수화물.

청구항 17

포유동물에 있어서, 교원질분해 상태의 치료에서 사용되기 위한 제1항에서 정의된 일반식(I)의 화합물 또는 그들의 제약학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 수화물.

청구항 18

포유동물에 있어서, 교원질분해 상태의 치료를 위한 약물의 제조에서 제1항에서 정의된 일반식(I)의 화합물 또는 그들의 제약학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 수화물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.