(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07K 5/08

(11) 공개번호 특1991-0006323
(43) 공개일자 1991년04월29일

(21) 출원번호 특1990-0015471
(22) 출원일자 1990년09월28일
(30) 우선권주장 3932390.0 1989년09월28일 독일(DE)
1013149.1 1990년04월25일 독일(DE)
(71) 출원인 훽스트 아크티엔게젤샤프트 오일러, 라피스
독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80
(72) 발명자 칼 하인쯔 부트
독일연방공화국 데-6233 켈크하임 (타우누스)암 플라흐슬란트 18
베른트 스토바서
독일연방공화국 데-6114 그로스-움스타트 필거파트 24
디터 루페르트
독일연방공화국 데-6242 크론베르그 슈레이어스트라세 30
크리스토프 마이흐스너
독일연방공화국 데-6238 호프하임 암 타우누스 비너스스트라세 30
아놀트 파에센스
독일연방공화국 데-5657 한 스트레세만 스트라세 51
우타 한센
독일연방공화국 데-5600 부페르탈 클라우디우스벡 9
요한 크놀레
독일연방공화국 데-6239 크리프텔 훽스터 스트라세 21
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 레트로바이러스 프로테아제 억제제

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

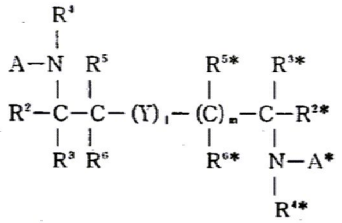
레트로바이러스 프로테아제 억제제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

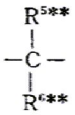
청구항 1

일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.



(Ⅰ)

상기식에서, Y는 산소, 황, 일반식(Ⅱ)의 라디칼 또는 일반식(Ⅲ)의 라디칼이고

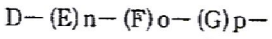


(Ⅱ)

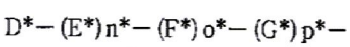


(Ⅲ)

1 및 m은 각각 독립적으로 0 또는 1이며, a는 일반식(Ⅳ)의 라디칼이고, A^*는 일반식($Ⅳ^*$)의 라디칼이며

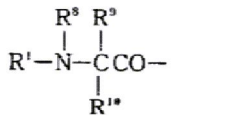


(Ⅳ)

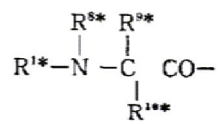


(Ⅳ*)

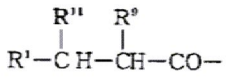
E, E^*, F, F^*, G 및 G^*는 각각 독립적으로 천연 또는 합성 아미노산, 아자아미노산 또는 이미노산이고, n, n^*, o, o^*, p 및 p^*는 각각 독립적으로 0 또는 1이며; D는 R^1 또는 일반식(Ⅴ), (Ⅵ) 또는 (Ⅶ)의 라디칼이고; D^*는 R^{1*}또는 일반식 R의 라디칼이며



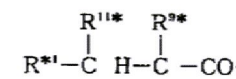
(Ⅴ)



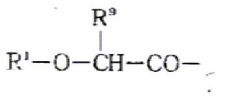
(Ⅴ*)



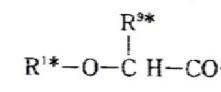
(Ⅵ)



(Ⅵ*)



(Ⅶ)



(Ⅶ*)

; R^1 및 R^{1*}는 각각 독립적으로, a_1)-수소; -카복실; -임의로 일- 또는 이불포화되고, 머캅토; 하이드록실; (C_1 내지 C_7)알콕시; 카바모일; (C_1 내지 C_8)알카노일옥시; 카복실; (C_1 내지 C_7)알콕카보닐; F; Cl; Br 또는 I; 아미노; (C_1 내지 C_8)알킬 라디칼 1 내지 3개에 의해 임의로 치환될 수 있는 아미디노; 벤질옥시카보닐 라디칼 1 또는 2개에 의해 또는 (C_1 내지 C_8)-알킬 라디칼 1 내지 4개에 의해 임의로 치환될 수 있는 구아니디노; (C_1 내지 C_7)알킬아미노; 디-(C_1 내지 C_7)알킬아미노; (C_1 내지 C_6)알콕시카보닐아미노; (C_7 내지 C_{15})아르알콕시카보닐; (C_7 내지 C_{15})아르알콕시카보닐아미노; 페닐-(C_1 내지 C_4)알콕시; 9-플루오레닐메톡시카보닐아미노; (C_1 내지 C_6)알킬설포닐; (C_1 내지 C_6)알킬설피닐; (C_1 내지 C_6)알킬티오; 하이드록스아미노; 하이드록스이미노; 설파모일; 설포; 카복스아미도; 포르밀; 하이드라조노; 이미노; 및 일반식 $CONR_{12}R_{13}$ 또는 $CONR_{12}R^{13*}$의 라디칼로 이루어진 그룹 중에서 선택된 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해, 6개 이하로 하이드록실에 의해 또는 5개 이하의 (C_1 내지 C_8)알카노일옥시에 의해 임의로 치환된 (C_1 내지 C_{18})-알킬; 각각의 경우에 사이클로알킬 부분이 F, Cl, Bl, I, 카복실, 카바모일, 카복시메톡시, 하이드록실, (C_1 내지 C_7)-알콕시 (C_1 내지 C_6)알킬, (C_1 내지 C_7)-알콕시카보닐, 아미노, (C_1 내지 C_6)-알킬아미노-(C_1 내지 C_6)알킬, 디-(C_1 내지 C_6)-알킬아미노-(C_1 내지 C_6)알킬, 아미디노, 하이드록스아미노, 하이드록스이미노, 하이드라조노, 이미노, 구아니디노, (C_1 내지 C_6)알콕시설포닐, (C_1 내지 C_6)알콕시설피닐, (C_1 내지 C_6)알콕시카보닐아미노, (C_1 내지 C_{12})-아릴-(C_1 내지 C_4)-알콕시카보닐아미노, (C_1 내지 C_7)알킬아미노, 디-(C_1 내지 C_7)알킬아미노 및 트리플루오로메틸로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환된 모노-, 비- 또는 트리사이클

릭(C_3 내지 C_{18})-사이클로알킬 또는 (C_3 내지 C_{18})-사이클로알킬-(C_1 내지 C_6)-알킬; 각각의 경우에 아릴부분이 F, Cl, Br, I, 하이드록실, 모노-, 디- 또는 트리하이드록시(C_1 내지 C_4)알킬, 트리플루오로메틸, 포르밀, 카복스아미도, 모노- 또는 디-(C_1 내지 C_4)알킬아미노카보닐, 니트로(C_1 내지 C_7)알콕시, (C_4 내지 C_7)알킬, (C_1 내지 C_7)알콕시카보닐, 아미노, (C_1 내지 C_7)알킬아미노, 디-(C_1 내지 C_7)알킬 아미노, 카복실, 카복시메톡시, 아미노-(C_1 내지 C_7)알킬, (C_1 내지 C_7)알킬아미노(C_1 내지 C_7)알킬, 디-(C_1 내지 C_7)알킬아미노(C_1 내지 C_7)알킬, (C_1 내지 C_7)알콕시카보닐 메톡시, 카바모일, 설파모일, (C_1 내지 C_7)알콕시 설포닐, (C_1 내지 C_8)알킬설포닐, 설포-(C_1 내지 C_8)알킬, 구아니디노-(C_1 내지 C_8)알킬 및 (C_1 내지 C_6)알콕시카보닐 아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 내지 3개의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C_6 내지 C_{14})아릴; (C_6 내지 C_{14})-아릴-(C_1 내지 C_6)알킬; (C_6 내지 C_{14})-아릴옥시-(C_1 내지 C_6)-알킬 또는 (C_6 내지 C_{14})-아릴-(C_3 내지 C_8)-사이클로알킬; 각각의 경우에 Het가 벤조-융합된 방향족, 부분적으로 수소화되거나 완전히 수소화될 수 있고 헤테로 원소로서 N, O, S, NO, SO, 및 SO_2로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 내지 4개의 상이한 라디칼을 함유할 수 있으며, 하이드록실 1 내지 6개에 의해 치환될 수 있고 a_1)에서 (C_6 내지 C_{14})아릴에 대해 정의한 바와 같이 및/또는 옥소에 의해 임의로 일-, 이- 또는 삼치환된 5- 내지 7-원 모노사이클릭 또는 8- 내지 10-원 비사이클릭 환 시스템의 라디칼을 나타내는 Het; Het-(C_1 내지 C_6)-알킬; Het-(C_3 내지 C_8)-사이클로알킬; Het-(C_3 내지 C_8)-사이클알킬-(C_1 내지 C_4)-알킬; Het-(C_3 내지 C_8)-사이클로알콕시-(C_1 내지 C_4)-알킬; Het-티오-(C_1 내지 C_6)-알킬; Het-티오-(C_3 내지 C_8)-사이클로알킬; Het-티오-(C_3 내지 C_8)-사이클로알킬(C_1 내지 C_4)-알킬이거나, 또는 라디칼 $NR_{12}R_{13}$ 또는 $NR_{12}^*R_{13}^*$이거나 , a_2)일반식(Ⅷ) 또는 (Ⅷ*)의 라디칼

$$R^{1a}-W \qquad (Ⅷ)$$

$$R^{1a*}-W^* \qquad (Ⅷ^*)$$

[여기서, R^{1a} 및 R_1^*는 a_1] 에서 R_1 및 R_1^*에 대해 정의한 바와 같고, W 및 W*는 -CO-, -CS, -O-CO-, $-SO_2-$, -SO-, -S, -NHSO-, CH(OH)-, -N(OH)- 또는 -CO-V-(여기서, V는 아미노산 1 내지 10개를 함유하는 펩타이드이다)이다] 이거나, R^1 및 R^{1*}는 서로 독립적으로, R^{11} 및 R^{11*}및 이를 함유하는 원자와 함께 탄소 이외에 황원자 1개를 함유할 수 있고 임의로 설폭사이드 또는 설폰으로 산화될 수 있는 모노- 또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 5- 내지 12-원 환 시스템을 형성하거나; 또는 a_3)-천연 알도테트로즈, 알도펜토즈, 알도헥소츠, 케토펜토즈, 케토헥소즈, 데옥시알도즈, 아미노알도즈 또는 올리고사카라이드 또는 이의 입체이성체로부터 유도된 글리코실 라디칼, 바람직하게는 글루코푸라노실 또는 글루코피라노실 라디칼이고; R^2 및 R^{2*}는 각각 독립적으로 a_1) 또는 a_2)에서 R^1 및 R^{1*}에 대해 정의한 바와 같거나, R^4과 R^{4*}및 이를 함유하는 원자와 함께 모노- 또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 5- 내지 12-원 시스템을 형성하거나, R_3 또는 R_{3*}및 이를 함유하는 원자와 함께 사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 3- 내지 12-원 환 환시스템을 형성하며, R_3 또는 R_{3*}은 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1 내지 C_3)알킬이고, R_4 및 R_{4*}은 각각 독립적으로 수소 (C_1 내지 C_8)알킬이며; R_3, R_{3*} 및 각각 독립적으로 수소, 하이드록실, 아미노 또는 카복실이거나, R_3, R_{3*}은 이를 함유하는 탄소원자와 함께 각각의 경우 서로 독립적으로 케토그룹을 형성하고; R_6, R_{6*}은 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1 내지 C_6)알킬이거나, 필요에 따라, 1이 0인 경우 R^6 및 R^{6*}은 통상적인 결합을 형성하며; R^7은 수소, 하이드록실 또는 (C_1 내지 C_6)알킬이고, R^8 및 R^{8*}은 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1 내지 C_8)알킬이거나, R^9 및 R^{9*} 및 이를 함유하는 원자와 함께 모노- 또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 5- 내지 12-원 환 시스템을 형성하며, R^9 및 R^{9*}은 각각 독립적으로 a_1)에서 R^1 및 R^{1*}에 대해 정의된 바와 같거나, 하이드록실 또는 (C_1 내지 C_4)알카노일옥시이거나, R^{10} 또는 R^{10*} 및 이를 함유하는 원자와 함께 사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 3- 내지 12-원 환 시스템을 형성하거나, R^{11} 또는 R^{11*} 및 이를 함유하는 원자와 함께 탄소 이외에 황원자 1개를 함유할 수 있고 임의로 설폭사이드 또는 설폰으로 산화될 수 있거나, 질소원자 1개를 함유할 수 있고 임의로 아미노에 의해 치환될 수 있는 모노- 또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 5- 내지 12-원 환 시스템을 형성하고, R_{10} 및 R_{1*}은 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1 내지 C_6)알킬이고, R_{11} 및 R_{1*}은 각각 독립적으로 수소, 하이드록실, (C_1 내지 C_4)알카노일옥시 또는 (C_1 내지 C_8)알킬이며, R_{12} 및 R_{12*}, R_{13*}및R_{13*}은 각각 독립적으로 수소, 아미노, (C_1 내지 C_4)알킬아미노, 디-(C_1 내지 C_4)알킬아미노, 머캅토, 카복실, 하이드록실, (C_1 내지 C_4)알콕시, (C_1 내지 C_7)사이클로알킬, (C_1 내지 C_4)알콕시카보닐, 아릴 부분이 R^1 및 R^{1*}에 대해 기술된 바와 같이 치환될 수 있는 (C_6 내지 C_{14})알릴 또는 (C_6 내지 C_{14})-아릴-(C_1 내지 C_4)-알콕시카보닐로 치환될 수 있는 (C_1 내지 C_8)알킬; Het가 R^1 및 R^{1*}에 대해 기술된 바와 같이 정의되는 Het 또는 Het-(C_1 내지 C_4)-알킬이거나, R^{12} 및 R^{13} 또는 R^{12*} 및 R^{13*}은 이를 함유하는 질소원자와 함께는 탄소 이외에 추가의 환 구성원소로서 질소원자 1 또는 2개, 황원자 또는 산소원자 1개를 함유할 수 있고 (C_1 내지 C_4)알킬에 의해 치환될 수 있는 모노- 또는 비사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 또는 방향족 환 시스템을 형성하고, 상기한 일반식(Ⅰ)의 화합물에서 주쇄의

하나 이상의 아미드 그룹 -(CONH-)은 $-CH_2NR^{14}-$, CH_2S-, $-CHH-$, $CH-CH-$, $CH=CH-$(시) $-CH_2NR^{14}-$, $-COCH-$, $-CH(OH)CH-$, $-CH\ SO-$, CH

$SO-$, $-COO-$, $P(O)(OR)_2CH-$ 및 $P(O)(OR)NH-$ 또는 극광성 아미드 그룹 (-NHCO-)으로 치환될 수 있으며; R_4 및 R_4, R는 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1 내지 C_4)알킬이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 별표가 있거나 또는 라디칼 및 부호가 각 경우에는 동일한 화합물.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 화합물이 (C_2)대칭체인 화합물.

청구항 4

제1항 내지 제3항중 어느 한 항에 있어서, ^2Y가 일반식(II) 또는 일반식(III)의 라디칼이고, l, m, A, A,*D, D*, n, n*, o, o*p 및p* 가 제1항에서 정의된 바와 같으며, E,E*,F,F*,G및G*가 각각 독립적으로 천연 또는 합성된 α-아미노산 또는 α-아미노산이고, R^1 및 R^{1*}가 독립적으로 a_1)-수소, -카복실; -임의로 일불포화되고 하이드록실, (C_1 내지 C_4)알콕시, 카바모일, (C_1 내지 C_8)-알카노일옥시, 카복실, (C_1 내지 C_4)알콕시 카보닐, F, 아미노, (C_1 내지 C_7)-알킬아미노, 디-(C_1 내지 C_7)-알킬아미노, (C_1 내지 C_6)-알콕시카보닐아미노, 벤질옥시 카보닐, 벤질옥시카보닐아미노, 9-플루오레닐메톡시카보닐아미노, (C_1 내지 C_6)-알킬설포닐, 라디칼 $CONR^{12}R^{13}$ 또는 $CONR^{12*}R^{13*}$으로 이루어진 그룹 중에서 선택된 2개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해, 6개 이하의 하이드록실에 의해 또는 4개 이하의 (C_1 내지 C_8)-알카노일옥시에 의해 임의로 치환된 (C_1 내지 C_{16})알킬; -각 경우 사이클로알킬 부분이 F, 카복실, 카바모일, 하이드록실, (C_1-C_7)-알콕시, (C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, 아미노, (C_1-C_6)-알콕시카보닐아미노, 벤질옥시카보닐아미노, (C_1-C_4)알킬아미노 및 디-(C_1-C_4)-알킬아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1개 또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환된 모노- 또는 비사이클릭(C_3-C_{12})사이클로알킬 또는 (C_3-C_{12})사이클로알킬-(C_1-C_6)-알킬; -각 경우 아릴 부분이 F, Cl, Br 또는 하이드록실-(C_1-C_4)-알킬, 카복스아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_4)-알킬아미노카보닐,(C_1-C_4)-알콕시; (C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, 아미노,(C_1-C_4)-알킬아미노, 디-(C_1-C_4)-알킬아미노, 카복실, 카바모일 및 (C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 내지 3개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C_6-C_{10})-아릴, (C_6-C_{10})-아릴옥시-(C_1-C_6)알킬 또는 (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_6)-알킬; -각 경우 Het가 부분적으로 수소화되거나 완전히 수소화된 방향족일 수 있고, N, O, S, NO, SO, 및 SO_2로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 내지 4개의 상이한 라디칼을 헤테로원소로서 함유할 수 있으며, 1 내지 4개의 하이드록실로 치환될 수 있고 a_1)하에서 (C_6-C_{10})-아릴에 대해 정의한 바와 같이 임의로 일- 또는 이치환되고/되거나 옥소로 임의로 치환된 또는 이치환된 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 8- 내지 10-원 비사이클릭 환 시스템의 라디칼인 Het, Het-(C_1-C_6)-알킬, Het-(C_5-C_6)-사이클로알킬, Het-티오-(C_1-C_4)-알킬, Het-티오-(C_5 -C_6)-사이클로알킬이거나, 또는 라디칼 $NR_{12}R_{13}$ 또는 $NR_{12*}R_{13*}$이거나 ,a_2)일반식(VIII) 또는 (VIII*)의 라디칼 $a_{1a}-W(VIII)R_1a_*-W_*(VIII_*)$ (여기서, R_{1a} 및 R_{a*}는 a_1)에서 R_1 및 R_{1*}에 대해 정의한 바와 같고 W 및 W*는 -CO-, -O-CO-, $-SO_2-$, -SO-, -S-, -NHCO- 또는 -CH(OH)-이다)이거나; R^1 및 R^{1*}가 독립적으로, R^{11} 및 R^{11*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께 탄소 이외에, 1개의 황원자를 함유할 수 있고 임의로 설폭사이드 또는 설폰으로 산화될 수 있는 5 내지 8-원 모노 사이클릭, 포화 또는 부분적으로 불포화된 환 시스템을 형성하거나; a_3)-제1항에서 정의된 바와 같은 글리코실 라디칼이며; R^2 및 R^{2*}는 각각 독립적으로 b_1)-수소; -카복실; -임의로 일- 또는 이불포화되고 하이드록실, (C_1-C_7)-알콕시, (C_1-C_7)-알킬티오, (C_1-C_7)-알킬설포닐, (C_1-C_7)-알킬설포닐, (C_1-C_7)-알킬노일옥시, 카복실 (C_1-C_7)-알콕시카보닐, Cl, Br, 아미노, 아미노, 이미다노 구아니디노, N, N-디-벤질옥시카보닐-구아니디노, 카바모일(C_7-C_{15})-아르알콕시카보닐, (C_1-C_5)-알콕시카보닐아미노, (C_1-C_{15})-아르알콕시 카보닐아미노 또는 9-플루오레닐메톡시카보닐 아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C_1-C_{10})-알킬; -(C_3-C_{12})-사이클로알킬; -(C_3-C_{12})-사이클로알킬; -(C_1-C_3)-알킬; -각 경우 아릴 부분이 F, Cl, Br, I, 하이드록실, (C_1-C_7)-알콕시, (C_1-C_7)-알킬, (C_1-C_7)-알콕시카보닐, 아미노 및 트리플루오로메틸로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1 내지 3개의 동일하거나 상이한 라디칼로 임의로 치환된 (C_6-C_{14})-아릴 또는 (C_6-C_{14})-아릴-(C_1-C_3)-알킬; 또는 -Het가 환원소로서 하나 이상의 탄소원자 1 내지 4개의 질소원자 및/또는 1 내지 2개의 황원자 및/또는 1 내지 2개의 산소원자를 함유하고 제1항의 아릴 부분에 대해 기술된 바와 같이 임의로 일- 또는 이치환된, 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 이치환된, 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 이치환된, 5- 또는 6-원 모노사이클릭 또는 9- 내지 10-원 비사이클릭, 임의로 부분적으로 또는 완전히 수소화된 헤테로방향족의 라디칼인 Het-(C_1-C_6)-알킬이거나; b_2) R^4 또는 R^{4*} 및 이들을 함유하는 원

자와 함께 사이클로펜틸, 사이클로헥실 또는 페닐과 융합될 수 있는 피롤리딘 또는 피페리딘을 형성하거나, R^3 또는 R^{3*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께 사이클릭, 포화 또는 부분적으로 불포화된 3 내지 8-원환 시스템을 형성하며; R^3 및 R^{3*} 가 각각 독립적으로 수소, 메틸 또는 에틸이며; R^4 및 R^{4*}가 독립적으로 수소 또는 (C_1-C_4)-알킬이며; R^5,R^5 및 R^{5**}가 독립적으로 제1항에서 정의한 바와 같고; R^6, R^{6*} 및 R^{6**}가 독립적으로 수소 또는 (C_1-C_4)-알킬이며, R^7이 수소, 하이드록실 또는 (C_1-C_4)-알킬이고; R^8 및 R^{8*}가 각각 독립적으로 수소 또는 (C_1-C_8)-알킬이거나, R^9 또는 R^{9*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께 사이클로펜틸, 사이클로헥실 또는 페닐과 추가로 융합될 수 있는 피롤리딘 또는 피페리딘을 형성하며, R^9 및 R^{9*}가 각각 독립적으로 b_1)에서 R^2 및 R^{2*}에 대해 정의된 바와 같거나, (C_1-C_8)-알카노일옥시이거나, R^{10} 또는 R^{10*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께, 사이클릭, 포화되거나 부분적으로 불포화된 5 내지 12-원 환 시스템을 형성하거나, R^{11} 또는 R^{11*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께 탄소원자 이외에, 1개의 황원자를 함유할 수 있고 설폭사이드 또는 설폰으로 임의로 산화될 수 있는 모노- 또는 비사이클릭 포화되거나 부분적으로 불포화된 5 내지 12-원 환 시스템을 형성하며; R^{10} 및 R^{10*}가 독립적으로 수소 또는 (C_1-C_4)-알킬이고; R^{11} 및 R^{11*}가 독립적으로 수소, 하이드록실, (C_1-C_4)-알카노일옥시 또는 (C_1-C_4)-알킬이고; R^{12}, R^{12*}.R^{13}및R^{13*} 및 R^{13*}이 각각 독립적으로 수소; 아미노, (C_1-C_4)-알킬아미노, 디-(C_1-C_4)-알킬아미노, 카복실, 하이드록실 또는 (C_1-C_4)-알콕시로 치환될 수 있는 (C_1-C_8)-알킬; (C_1-C_4)-알콕시카보닐, R^1 및 R^{1*}에 대해 기술된 바와 같이 치환될 수 있는 (C_6-C_{10})-아릴, (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_4)-알콕시카보닐, Het가 R^1 및 R^{1*}에 대해 기술된 바와 같이 정의된 Het 또는 Het-(C_1-C_4)-알킬이고, 상기 일반식(Ⅰ)의 화합물에서 주쇄의 하나 이상의 아미드 그룹 (-CONH-)가 $-CH_2NR_{14}-$, $-CH_2O-$, $-OCH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-COCH_2-CH(OH)CH_2-$ 또는 -COO-로 이루어진 그룹 중에서 선택된 그룹에 의해 또는 역극성 (-NHCO-)의 아미드 그룹에 의해 치환될 수 있으며; R^{14}가 수소 또는 (C_1-C_4)-알킬인 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.

청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한 항에 있어서, Y가 일반식(Ⅱ)의 라디칼 또는 일반식(Ⅲ)의 라디칼이고; l, m, A, A^*,D,D^*,n,n^*,O, 및 $\overset{*}{O}$가 제1항에서 정의한 바와 같으며; p 및 $\overset{*}{p}$가 1이고; R^1 및 R^{1*}가 각각 독립적으로 수소 또는 카복실; (C_1-C_{10})-알킬; (C_1-C_8)-사이클로알킬; (C_3-C_8)-사이클로알킬-(C_1-C_{10})-알킬; 제4에서 정의된 바와 같이 페닐 부분이 치환될 수 있는 페닐-(C_1-C_8)-알킬; 임의로 보호된 모노- 또는 디아미노-(C_1-C_{12})-알킬 또는 아미노-(C_6-C_{10})-아릴(C_1-C_4)-알킬 또는 아미노-(C_3-C_{10})-사이클로알킬; -(C_1-C_4)-알킬; 모노-, 디-, 트리-, 테트라-, 펜타- 또는 헥사하이드록시-(C_1-C_{10})-알킬; 또는 -알카노일; (C_1-C_4)-알콕시카보닐-(C_1-C_{10})-알킬; (C_1-C_{10})-알킬설포닐, (C_1-C_8)-알킬설피닐; 모노-, 디- 또는 트리하이드록시-(C_1-C_8)-알킬설포닐; 모노-, 디- 또는 트리하이드록시-(C_1-C_8)-알킬설피닐; 모노-, 디-, 트리- 또는 테트라-(C_1-C_8)-알카노일옥시-(C_1-C_{10})-알킬; (C_1-C_{14})-알카노일; 임의로 보호된 아미노-(C_1-C_{11})-알카노일; 디-(C_1-C_7)-알킬아미노-(C_2-C_{11})-알카노일; (C_1-C_9)-사이클로알킬카보닐, 아미노-치환된(C_3-C_9)-사이클로알킬카보닐, 아미노-치환된(C_3-C_9)-사이클로알킬설포닐; (C_6-C_{10})-아릴-(C_2-C_{11})-알카노일; (C_6-C_{10})-아릴옥시-(C_2-C_{11})-알카노일; 아미노, 할로겐, (C_1-C_7)-알콕시 또는 (C_1-C_7)-알콕시카보닐에 의해 임의로 치환된 벤조일, 벤젠 설포닐 또는 (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_4)-알킬 카보닐 또는 설포닐; (C_1-C_{10})-알콕시카보닐; 치환된(C_1-C_{10})-알콕시카보닐; (C_6-C_{14})-아릴-(C_1-C_6)-알콕시카보일, 임의로 보호된 아미노 또는 하이드록실에 의해 치환된 (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_8)-알킬, (C_3-C_{10})-사이클로알킬-(C_1-C_8)-알킬 또는 (C_1-C_{10})-알킬 9-플루오레닐메톡시카보닐; 케토헥소실; 케토펜토실; 데옥헥소케토실; 데옥시펜토케토실; 알도헥소실, 알도펜토실; 데옥시헥소알도실; 데옥시펜토알도실; 2-아미노-2-데옥시헥소실; 2-아세트아미드-2-데옥시헥소실; 락토실 또는 말토실(여기서, 결합된 당들은 피라노스 또는 푸라노스 형태로 존재할 수 있다); Het-(C_1-C_6)-알킬; Het -카보닐 또는 -설포닐; Het-(C_1-C_6)-알킬카보닐 또는 -설포닐 또는 Het-머캅토-(C_1-C_6)-알킬카보닐 또는 -설포닐〔여기서, Het는 각각의 경우에, 푸릴, 티에닐, 벤조티에닐, 벤조디옥솔라닐, 피롤릴, 이미다졸릴, 이숙사졸릴, 티아졸릴, 피라졸릴, 트리아졸릴, 피리딜, 피리미딜, 피라지닐, 피라다지닐, 트리아지닐, 피롤라딜, 피페리딜, 피레라지닐, 모르폴리노, 티오모로, 폴리노, 테트라하이드로푸릴, 테트라하이드로피릴, 테트라하이드로티에닐, 인돌릴, 퀴놀릴 또는 이소퀴놀린이며; (C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_4)-알콕시, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, (C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노, 하이드록실, 아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_4)-알킬아미노 및 옥시도로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1개 또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 치환될 수 있다〕이며; R^2 및 R^{2*}가 각각 독립적으로 수소; 카복실, 하이드록실, (C_1-C_4)-알콕시, (C_1-C_4)-알킬티오, (C_1-C_4)-알킬설피닐, (C_1-C_4)-알킬설포닐, (C_1-C_4)-(C_1-C_4)-알카노일옥시, 카복실, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, 아미노, 아미디노, 구아니디노, N, N´ -디-(벤질옥시카보닐)-디아니디노, 카바모일, (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_3)-알콕시카보닐, (C_1-C_5)-알콕시카보닐아미노 및 (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_3)-알콕시카보닐아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 2개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환된 (C_1-C_8)-알킬, 또는 (C_3-C_{10})-사이클로알킬; (C_3-C_{10})-사이클로알킬-(C_1-C_3)-알킬; (C_1-C_4)-알킬-$(C_3-$

C_{10})-사이클로알킬-(C_1-C_3)-알킬; (C_6-C_{10})-아릴 또는 (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_3)-알킬〔여기서, 각각의 경우에 아릴 부분은 F, Cl, Br, 하이드록실, (C_1-C_4)-알콕시, (C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_4)-알콕시카보닐 및 아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1개 내지 3개의 동일하거나 상히한 라디칼에 의해 임의로 치환된다〕 또는 Het-(C_1-C_4)-알킬(여기서, Het는 R_1 및 R_{1*}에서 정의한 바와 같다)이고, R_3 및 R_3^*가 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이며; R_4 및 R_4^*가 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이고; R^5 및 R^{5*} 및 R^{5**}가 각각 독립적으로 수소, 하이드록실, 아미노 또는 카복실이며; R^6 및 R^{6*}민 R^{6**}가 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이고; R^7이 수소, 하이드록실 또는 메틸이며; R^8 및 R^{8*}가 각각 독립적으로 수소, 메틸, 에틸 또는 n-프로필이거나, R^9 또는 R^{9*}및 이들을 함유하는 원자들과 함께 1,2,3,4-테트라하이드로 이소놀린 또는 2-아자비사이클로옥탄 구조를 형성하고; R^9 및 R^{9*}가 각각 독립적으로 제4항에서 R^2 및 R^{2*}에 대해 정의한 바와 같거나, (C_1-C_8)-알카노일옥시 이거나, R^{10} 또는 R^{10*} 및 이들을 함유하는 원자들과 함께 5 내지 7-원 환을 갖는 사이클릭 환 시스템을 형성하거나, R^{11} 또는 R^{11*}와 함께 티오크로만 시스템을 형성하거나(이의 황원자는 임의로 설폰으로 산화될 수 있다); R^{10} 또는 R^{10*}가 각각 독립적으로 수소 또는 메틸이고, R^{11} 또는 R^{11*}가 제4항에서 정의한 바와 같으며; 일반식(Ⅰ)의 화합물에서, 주쇄의 하나 이상의 아미드 그룹 (-CONH-)이 제4항에서 정의한 바와 같이 치환될 수 있고; R_{14}가 수소 또는 메틸인 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.

청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 있어서, R^1 및 R^{1*}이 서로 독립적으로 a_1) 수소; (C_1-C_{16})-알킬설포닐; (C_1-C_8)-알킬설피닐; (C_1-C_8)-모노, 디- 또는 -하이드록시알킬설포닐; 하이드록시-(C_1-C_{10})-알카노일; 모노-, 디-, 트리- 또는 테트라하이드록시-(C_1-C_4)-알킬; (C_1-C_8)-알카노일옥시-(C_1-C_{10})-알킬; 1,2-디아세톡시메틸, 1,2,3-트리아세톡시프로필; (C_1-C_{14})-알카노일; 아미노-(C_1-C_{12})-알카노일; N-(C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노-(C_1-C_8)-알킬; 디-(C_1-C_7)-알킬아미노-(C_2-C_{11})-알카노일; (C_3-C_9)-사이클로알킬카보닐; 아미노-(C_3-C_8)-사이클로알킬카보닐; 아미노-(C_3-C_8)-사이클로알킬설포닐; 페닐; (C_6-C_{10})-아릴옥시-(C_2-C_{11})-알카노일; 할로겐, 아미노, (C_1-C_7)-알킬, (C_1-C_7)-알콕시 또는 (C_1-C_7)-알콕시카보닐에 의해 임의로 치환된 벤조일 또는 벤젠설포닐; 할로겐, 아미노, (C_1-C_7)-알킬, (C_1-C_7)-알콕시 또는 (C_1-C_7)-알콕시카보닐에 의해 임의로 치환된 벤질설포닐, 벤질설피닐 또는 벤질티오; 아미노; (C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노; 하이드록실, 아미노에 의해 및 임의로 페닐 또는 사이클로헥실에 의해 임의로 치환된 (C_1-C_{12})-알카노일; 임의로 보호된 아미노- 치환된(C_6-C_{10})-아릴 또는 (C_3-C_{10})-사이클로알킬-(C_1-C_4)-알킬 또는 (C_1-C_8)-알킬, (C_1-C_{10})-알콕시카보닐; 치환된 (C_1-C_{10})-알콕시카보닐; (C_6-C_{14})-아릴-(C_1-C_6)-알콕시카보닐; 9-플루오레닐메톡시카보닐; 1-데옥헥소케토실; 또는 1-데옥사펜케토실; 헥소실 또는 펜토실 6-에옥시헥소실, 아미노-당 라디칼; 락토실; 말토실 (이때, 결합된 당은 피라노스/또는 푸라노스 형태일 수 있다); Het; Het-카보닐 또는 Het-설포닐; Het-(C_1-C_6)-알킬; Het-(C_1-C_6)-알카노일; Het-(C_1-C_6)-알킬 설포닐 또는 Het 머캅토-(C_1-C_3)-알킬설포닐(이때, Het는 각각의 경우 필롤릴, 아미다졸릴, 피리딜, 피리미딜, 피롤리딜, 피페리딜, 모르폴리노, 퀴놀릴 또는 이소퀴놀릴이며; 또한 이들은 (C_1-C_4)-알킬, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, (C_1-C_4)-알콕시카보닐, 아미노, 하이드록실, 아미노 및 모노- 또는 디-(C_1-C_4)-알킬아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1개 또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼로 치환될 수 있다)이고; R^2 및 R^{2*}가 서로 독립적으로 수소; 카복실; 메틸, 에틸, 이소프로필, n-프로필, n-부틸, 이소부틸, 2급-부틸, n-펜틸, n-헥실; 사이클로헥실; 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로헵틸메틸; 4-메틸사이클로헥실메틸; 1-데카하이드로나프틸메틸, 2-데카하이드로나프틸, 메틸; 페닐; 벤질; 2-페닐에틸; 1-나프틸에틸, 2-나프틸메틸; 2-메틸벤질, 3-메틸벤질, 4-메틸벤질; 2,4,6-트리메틸벤질; 4-3급-부틸벤질; 4-3급-부톡시벤질; 4-하이드록실벤질; 5-메톡시벤질; 2,4-디메톡시벤질; 3,4-디하이드록시벤질; 3,4-디메톡시벤질; (벤조디옥솔란-5-일)메틸; 4-클로로벤질; 하이드록시메틸; 1-하이드록시에킬; 4-피리딜; 4-(N-옥시도피리딜); 2-피리딜메틸, 3-피리딜메틸, 4-피리딜메틸; 2-(4-피리딜)에킬; 2-티에닐메틸, 3-티에닐메틸; 2-(2-티에닐)에틸, 2,-(3-티에닐)에틸; 인돌-2일-메틸, 인돌3-일-메틸; (1-메틸이미다졸-4-일)메틸; 이미다졸-4-일-메틸; 이미다졸-4-일-메틸; 이미다졸-4-일-메틸; 이미다졸-1-일-메틸; 2-티아졸리메틸; 3-피리졸릴메틸; 4-피리미딜메틸; 2-벤조〔b〕티에닐메틸, 3-벤조〔b〕티에닐메틸; 2-푸릴메틸; 2-(메틸티오)-에틸; 2-(메틸설피닐)-에틸 또는 2-(메틸설포닐)-에틸이며; R^3,R^{3*},R^4,R^{4*},R^6,R^{6*},R^{10} 및 R^{10*}은 수소이고, R^5, R^{5*}는 각각 독립적으로 수소; 하이드록실 또는 아미노이며; R^7은 수소; 하이드록실 또는 메틸이고; R^8 및 R^{8*}은 각각 독립적으로 수소이거나, 또는 R^9 또는 R^{9*} 및 이들을 함유하는 원자와 함께 1,2,3,4-테트라하이드로이소퀴놀린 또는 2-아자비사이클로옥탄 구조를 형성하며; R^9 및 R^{9*}는 각각 독립적으로, R^2 또는 R^{2*}에 대해 정의한 바와 같거나, 또는 하이드록실; 아세톡시; 3급-부톡시메틸; 3-구아니디노프로필; 카바모일메틸, 카바모일에틸; 카복시메틸, 카복시에틸; 머캅토메틸; (1-머캅토-1-메틸)에틸; 아미노메틸, 2-아미노에틸, 3-아미노프로필, 4-아미노부틸; N, N-디메틸아미노; N,N′ -디-(벤질옥시카보닐)-구아니디노게로필; 2-벤질옥시카보닐에틸, 벤질옥시카보닐메틸; 3급-부틸설포메틸 또는 4-벤질카보닐아미노부틸이고; R_{11} 및 R_{11*}은 각각 독립적으로 수소; 하이드록실 또는 아세톡시이며; 이때, 본 발명의 상기 화합물에서 주쇄의 하나 또는 그 이상의 아미드 그룹 (-CONH-)은 $-CH_2NR_{14}-$ 또는 $-CH(OH)CH_2-$로

치환될 수 있고; R_{14}는 수소 또는 메틸인 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.

청구항 7

제1항 내지 제6항중 어느 한 항에 있어서, R^1 및 R^{1*}가 각각 독립적으로 a_1) 수소; 카복실; (C_1-C_{16})-알킬설포닐; (C_1-C_8)-모노- 또는 -디하이드시알킬설포닐; -노모-, 디- 또는 트리하이드록시-(C_1-C_3)-알킬; (C_1-C_8)-알콕시카보닐; (C_1-C_{14})-알카노일; 아미노-(C_1-C_{12})-알카노일; (C_6-C_{10})-아릴-(C_1-C_4)-알콕시카보닐; (C_6-C_{10})-아릴(C_1-C_4)-알킬카보닐; 9-플루오레닐메톡시카보닐; (C_1-C_4)-알카노일옥시-(C_1-C_6)-알킬; 1,2-디아세톡시에틸; 1,2,3-트리아세톡시프로필; 페닐; 할로겐, 아미노, (C_1-C_4)-알킬 또는 메톡시에 의해 임의로 치환된 벤질설포닐; 할로겐, 아미노, (C_1-C_4)-알킬 또는 메톡시에 의해 임의로 치환된 벤질-설포닐, -설피닐 또는 -티오; Het 또는 Het-설포닐; Het-(C_1-C_4)-알카노일; Het-머캅토-(C_1-C_3)-알킬카보닐〔각각의 경우에서, Het는 피롤릴, 이미다졸릴, 피리딜, 피리미딜, 피롤리딜, 퀴놀릴, 이소퀴놀릴, 피페리딜 또는 모르폴리노이며; 또한 Het는 메틸, 아미노 및 (C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노로 이루어진 그룹 중에서 선택된 1개 또는 2개의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 치환될 수 있다〕; 아미노-(C_3-C_6)-사이클로알킬카보닐; 하이드록실 또는 아미노에 의해 치환되고 또한 페닐 또는 사이트로헥실에 의해 임의로 치환된 (C_1-C_8)-알카노일; 임의로 보호된 아미노- 치환된 페닐-또는 사이클로헥실-(C_1-C_6)-알킬; 아미노; (C_1-C_4)-알콕시카보닐아미노; 벤질옥시카보닐아미노; 1-데옥시헥소케토실 또는 1-데옥시펜토케토실; 헥소실 또는 펜토실〔여기서, 결합된 당은 피라노스 또는 푸라노 형태일 수 있다〕이고; R^2 및 R^{2*}는 각각 독립적으로 수소; 메틸, 에틸, 이소프로필, n-프로필, n-부틸, 이소부틸, 2급-부틸, 페틸, 헥실; 사이클로펜틸메틸; 사이클로헥실메틸, 4-메틸사이클로헥실메틸; 벤질; 2-페닐에틸; 1-나프틸메틸, 2-나프틸메틸; 2-메틸벤질, 3-메틸벤질, 4-메틸벤질; 2,4,6-트리메틸벤질; 4-3급-부틸벤질; 4-메톡시벤질; 3,4-하이드록실벤질; 2,4-디메톡시벤질; 3,4-디메톡시벤질; 2-피리딜메틸, 3-피리딜메틸; 4-피리딜메틸; 3,4-메닐렌디옥시벤질 또는 2-(4-피리딜)에틸이며; R^3,R^{3*} R^4,R^{4*},R^6,R^{6*},R^9,R^{10}및 R^{10*}은 수소이고, R^5 및 R^{5*}는 각각 독립적으로 수소 또는 하이드록실이며; R^8 및 R^{8*}은 각각 독립적으로 제8항에서 정의한 바와 같고; R^9 및 R^{9*}는 각각 독립적으로 제6항에서 R^9 및 R^{9*}에 대해 정의한 바와 같으며; R^{11} 및 R^{11*}는 각각 독립적으로 제6항에서 정의한 바와 같은 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.

청구항 8

제1항 내지 제7항중 어느 한 항에 있어서, Y가 일반식(Ⅲ)의 라디칼이고; 1은 0 또는 1이며; m은 1이고; A, A^*, D 및 D′ 는 제1항에서 정의한 바와 같으며; n,n^*,o,o^*,p 및 p^*는 각각 독립적으로 0 또는 1이고; E,E^*F,F^*,G 및 G^*는 각각 독립적으로 Val, Lys, Lys(Z), Phe, Chg, Ser, Asn, Gly, Ile, Tbg, Nva 또는 Npg로 이루어진 그룹 중에서 선택된 아미노산이며; R^1 및 R^{1*}는 각각 독립적으로 수소; 카복실; 메틸설포닐; 3급-부틸설포닐; 3급-부톡시카보닐; 2-하이드록시에틸설포닐; 1,2,3-트리하이드록시프로필; 1,2,3-트리아세톡시프로필; 벤질옥시카보닐; 4-메틸페닐설포닐; 4-클로로벤질티오; 벤질설피닐; 4-클로로벤질설포닐; 헥사데실설포닐; 4-아미노-1-피페리딜설포닐; N-3급-부톡시카보닐-4-아미노-1-피페리딜설포닐; 4-아미노-1-피페리딜카보닐; N-3급-부톡시카보닐-4-아미노-1-피페리딜카보닐; 2-아미노-3-페닐프로필; N-3급-부톡시카보닐-2-아미노-3-페닐프로필; N-3급-부톡시카보닐-2-아미노-3-페닐프로필; 2-아미노- -하이드록시-4-메틸펜틸; 데옥시프럭토스-1-일; 만노푸라노실; 4-아미노 사이클로헥실카보닐; 2-피리딜아세틸; 4-피리딜티올아세틸; 2-퀴놀릴카보닐; 1-나프틸아세틸; 1-나프틸옥시아세틸; 1-(4-피리딜)-에틸설포닐; 12-아미노도데카노일; 4-(N-옥시도피리딜); 4-피리딜; 테트라데카노일; 페닐; 아미노 또는 3급-부톡시카보닐아미노이고; R^2 및 R^{2*}는 각각 독립적으로 수소; 2-(4-피리딜)에틸; 이소프로필; 이소부틸; n-펜틸; 3,4-메틸렌디옥시벤질; 2,4-디메톡시벤질; 4-3급-부틸벤질; 2-페닐에틸 또는 사이클로헥실메틸이며; R^3,R^{3*},R^4,R^{4*},R^6,R^{6*},R^7,R^{10}및 R^{10*}는 수소이고, R^5 및 R^{5*}는 각각 독립적으로 수소 또는 하이드록실이며; R^8 및 R^{8*}는 수소이거나 R^9 또는 R^{9*}및 이들을 함유하는 원자와 함께 1,2,3,4-테트라하이드로퀴놀린-3,4-디일 시스템을 형성하고; R^9 및 R^{9*}는 각각 독립적으로 수소; 하이드록실; 아세톡시; n-프로필; 이소프로필; 이소부틸; 아미노메틸; 4-아미노부틸; 하이드록시메틸; 3급-부톡시메틸; 아미노카보메틸; 2-벤질옥시카보닐에틸; 4-벤질옥시카보닐아미노부틸; N, N^0 -디-(벤질옥시카보닐)-구아니디노프로필; 사이클로헥실; 사이클로헥실메틸; 벤질; 2-페닐에틸; 4-하이드록시벤질; 4-메톡시벤질; 4-3급-부톡시벤질; 1-나트틸메틸; 2-티에닐메틸; 1-이미다졸릴메틸; 3-인돌릴메틸; 4-피리딜메틸; 4-(N-옥시도피리딜)메틸; 2-메틸티오에틸; 2-메틸설포닐에틸; 3급-부틸설포닐메틸 또는 2-카복실에틸이며; R^{11} 및 R^{11*}는 각각 독립적으로 수소, 하이드록실 또는 아세톡시이며; 상기 화합물에서 주쇄의 하나 이상의 아미드 그룹 (-CONH-)이 $-CH_2NH-$ 또는 $-CH(OH)CH_2-$로 치환될 수 있는 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적으로 허용되는 이의 염.

청구항 9

제1항 내지 제8항중 어느 한 항에 있어서, 1=0이고; m=1이며; n+o+p=1이고; D 및 D^*는 일반식(Ⅳ) 또는 (Ⅳ*)의 라디칼이며; R^1 및 R^{1*}는 하이드록실, 아미노 및 카복실을 포함하는 그룹 중에서 선택된 3개 이하의 동일하거나 상이한 라디칼에 의해 임의로 치환될 수 있는 (C_1-C_{12})-알킬설포닐이고; R^2 및 R^{2*}는 각각 독립적으로 수소, 카복실, 메틸, 에틸, 이소프로필, n-프로필, n-부틸, 이소부틸, 2급-부틸, 펜틸, 헥실, 사이클로헥실, 사이클로펜틸메틸, 사이클로헥실메틸, 사이클로헵틸메틸, 4-메틸사이클로헥실메틸;

1-데카하이드로나프틸메틸, 2-데카하이드로나프틸메틸; 페닐, 벤질, 2-페닐에틸, 1-나프틸메틸 2-나프틸메틸; 2-메틸벤질, 3-메틸벤질, 4-메틸벤질; 2,4,6-트리메틸벤질; 4-3급-부틸벤질; 4-3급-부톡시벤질; 3,4-하이드록실벤질; 4-메톡시벤질; 2,4-디메톡시벤질; 4-디하이드록시벤질, 3,4-디메톡시벤질, (벤조디옥소란-4-일)메틸, 4-클로로벤질, 하이드록시메틸, 1-하이드록시에틸, 2-피리딜메틸, 3-피리딜메틸, 4-피리딜메틸, 2-(4-피리딜)에틸, 2-피리닐메틸, 3-피에닐메틸, 2-(2-티에닐)에틸, 2-(3-티에닐)에틸, 인돌-2-일메틸, 인돌3-일에틸, (1-메틸이미다졸-4-일)메틸, 이미다졸-4-일메틸, 이미다졸-1-일메틸, 2-티아졸릴메틸, 3-피라졸릴메틸, 4-피리미딜메틸, 2-벤조〔b〕티에닐메틸, 3-벤조[b]티에닐메틸, 2-푸릴메틸, 2-(메틸티오)에틸, 2-(메틸설피닐)에틸 또는 2-(메틸설포닐)에틸이며; R^{3},R^{3*},R^{4},R^{4*},R^{6},R^{6*},R^{11} 및 R^{11*}는 수소이고; R^{5} 및 R^{5*}는 하이드록실이며; R^{9} 및 R^{9*}는 제8항에서 정의한 바와 같은 일반식(Ⅰ)의 화합물 또는 생리학적 허용되는 이의 염.

청구항 10

말단 하이드록실 그룹 또는 이의 반응성 유도체를 가진 단편을 유리 아미노 그룹을 가진 상응하는 단편과 커플링시키고, 필요에 따라, 다른 작용성 그룹들을 보호하기 위해 일시적으로 도입된 보호그룹(들)을 분리시키고, 필요에 따라 수득된 화합물을 이의 생리학적으로 허용되는 염으로 전환시킴을 포함하는, 제1항 내지 제9항중 어느 한 항에서 청구된 일반식(Ⅰ) 화합물의 제조방법.

청구항 11

제1항 내지 제9항중 어느 한 항에서 청구된 일반식(Ⅰ) 화합물의 의약으로서의 용도.

청구항 12

제1항 내지 제9항중 어느 한 항에서 청구된 일반식(Ⅰ) 화합물의 레트로바이러스프로테아제 억제용으로서의 용도.

청구항 13

제1항 내지 제9항중 어느 한 항에 있어서, 청구된 일반식(Ⅰ) 화합물의 "후천성면역 결핍증" 치료용으로서의 용도.

청구항 14

제1항 내지 제9항중 어느 한 항에서 청구된 일반식(Ⅰ) 화합물 및 필요에 따라, 하나 이상의 부형제를 함유하는 약제학적 제제.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.