

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵
A61K 31/13

(11) 공개번호 특1990-0007406
(43) 공개일자 1990년06월01일

(21) 출원번호 특1989-0015626
(22) 출원일자 1989년 10월 30일
(30) 우선권주장 265,654 1988년 11월 01일 미국(US)
(71) 출원인 메렐 다우 파마슈티칼즈 인코포레이티드 게리 디. 스트리트
미합중국 오하이오 45215 신시내티 이스트 갈브레이스 로드 2100
(72) 발명자 제임스 레이 맥카리
미합중국 오하이오 45069 웨스트 체스터 폭스뷰 플레이스 6448
도날드 피. 매튜스
미합중국 오하이오 45069 웨스트 체스터 레드 밀 드라이브 7911
샷럿 엘. 바니
미합중국 오하이오 45212 신시내티 페어웨이 드라이브 6152
필립 베이
미합중국 오하이오 45242 신시내티 아이비게이트 레인 7875
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 리실 옥시마제의 억제제

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

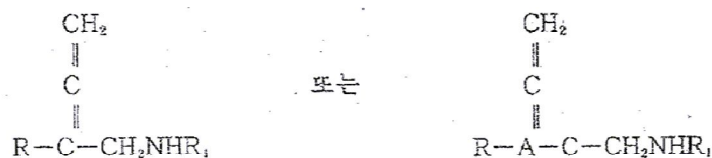
리실 옥시마제의 억제제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

유효량의 일반식(1) 화합물 또는 이의 약학적으로 허용되는 염을 환자에게 투여함을 특징으로 하여, 환자의 비정상적인 콜라겐 축적과 관련된 질환 및 증상을 치료하는 방법.



상기식에서, R₁은 수소 또는 (C₁-C₄)알킬그룹이고,

A는 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CH}(\text{CH}_2)_m-$, $(\text{CH}_2)_p-\text{D}-(\text{CH}_2)_q-$, 및 $-(\text{CH}_2)_r-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_s$ 로 구성된 그룹에서 선택되는 2가 라디칼이며, R₂는 수소, 메틸 또는 에틸이고, D는 산소 또는 황이며, R은 메틸그룹, (C₃-C₈)사이클로알킬 그룹, 페닐, 또는 (C₁-C₅)알킬, (C₁-C₅)알콕시, 하이드록시, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오드, 트리플루오로메틸, 니트로, (C₁-C₅)알킬카보닐, 벤조일, 또는 페닐로 구성된 그룹에서 선택되는 1또는 2개의 그룹으로 치환된 페닐이거나; 1-또는 2-나프틸, 1-, 2-, 또는 3-인데닐, 1-, 2-, 또는 9-플루오레닐, 1-, 2-, 또는 3-피페리디닐, 2-또는 3-피롤릴, 2-또는 3-티에닐, 2-또는 3-푸라닐, 2-또는 3-인돌릴, 2-또는 3-티아나풀틸레닐, 또는 2- 또는 3-벤조푸라닐이고;



단 A가 $-(CH_2)_m-CH(CH_2)_n-$ 인 경우엔 R이 추가로 $-NH_2$ 그룹일 수도 있으며, m 및 n은 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, m+n은 17을 초과할 수 없고, p 및 q는 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, p+q는 17을 초과할 수 없고, s 및 r은 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, r+s는 16을 초과할 수 없다.

청구항 2

제1항에 있어서, R이 페닐이거나, (C_1-C_5) 알킬, (C_1-C_5) 알콕시, 하이드록시, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오드에 의해 일-또는 이-치환된 페닐, 2-또는 3-테에닐, 2-또는 3-푸라닐, 2-또는 3-티아니프테닐, 또는 2-또는 3-벤조나프테닐인 방법.

청구항 3

제1항에 있어서, R은 메틸그룹이고, A가 존재하는 경우,



A는 $-(CH_2)_m-CH(CH_2)_n-$ [여기에서, R_2 는 수소, 메틸 또는 에틸이고, m 및 n은 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, 단 m+n은 17을 초과할 수 없다]에서 선택되는 2가 라디칼인 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, R은 메틸그룹이고, A가 존재하는 경우,



A가 $-(CH_2)_m-CH(CH_2)_n-$ [여기에서, R_2 는 수소, 메틸 또는 에틸이고, m은 0 내지 16인 정수이며, n은 0이다]에서 선택되는 2가 라디칼 방법.

청구항 5

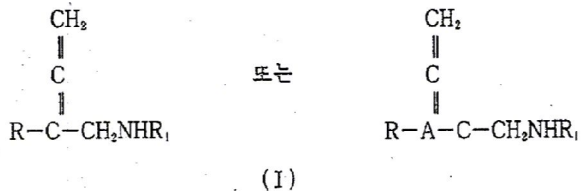
제1항에 있어서, R이 페닐, p-메톡시페닐, p-하이드록시페닐, p-메틸페닐, 클로로페닐, p-플루오로페닐, 2-티에닐, 2-티아나프테닐, 또는 사이클로펜틸 그룹인 방법.

청구항 6

제5항에 있어서, A그룹이 존재하지 않거나, A가 메틸렌 또는 에틸렌 그룹인 방법.

청구항 7

유효량의 일반식 (I) 화합물 또는 이의 약학적으로 허용되는 염을 환자에게 투여함을 특징으로 하여, 환자의 리실옥시다제 활성을 억제하는 방법.



상기식에서, R_1 은 수소 또는 (C_1-C_4) 알킬그룹이고,



A는 $-(CH_2)_m-CH(CH_2)_n-$, $(CH_2)_r-D-(CH_2)_s-$, 및 $-(CH_2)_r-CH=CH-(CH_2)_s$ 구성된 그룹에서 선택되는 2가 라디칼이며, R_2 는 수소, 메틸 또는 에틸이고, D는 산소 또는 황이며, R은 메틸그룹, (C_3-C_8) 사이클로알킬그룹, 페닐 또는 (C_1-C_5) 알킬, (C_1-C_5) 알콕시, 하이드록시, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오드, 트리플루오로메틸, 니트로 (C_1-C_5) 알킬카보닐, 벤조일, 또는 페닐로 구성된 그룹에서 선택되는 1또는 2개의 그룹으로 치환된 페닐이거나; 1-또는 2-나프틸, 1-, 2-, 또는 3-인데닐, 1-, 2-, 또는 9-플루오레닐, 1-, 2-, 또는 3-피페리디닐, 2-또는 3-피롤릴, 2-또는 3-티에닐, 2-또는 3-푸라닐, 2-또는 3-인돌릴, 2-또는 3-티아나프테닐레닐, 또는 2- 또는 3-벤조푸라닐이고;



단 A가 $-(CH_2)_m-CH(CH_2)_n-$ 인 경우엔 R이 추가로 $-NH_2$ 그룹일 수도 있으며, m 및 n은 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, m+n은 17을 초과할 수 없고, p 및 q는 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, p+q는 17을 초과할 수 없고, s 및 r은 각기 독립적으로 0 내지 16인 정수이며, r+s는 16을 초과할 수 없다.

청구항 8

제7항에 있어서, R이 페닐이거나, (C₁-C₅)알킬, (C₁-C₅)알콕시, 하이드록시, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오드에 의해 일-또는 이-치환된 페닐, 2-또는 3-태에닐, 2-또는 3-푸라닐, 2-또는 3-티아니프테닐, 또는 2-또는 3-벤조나프테닐인 방법.

청구항 9

제7항에 있어서, R은 메틸그룹이고, A가 존재하는 경우,

$$\begin{array}{c} R_2 \\ | \\ A - (CH_2)_m - CH(CH_2)_n - \end{array}$$

A는 $-(CH_2)_m - CH(CH_2)_n -$ 여기서, R₂는 수소, 메틸 또는 에틸이고, m 및 n은 각기 독립적으로 0내지 16인 정수이며, 단 m+n은 17을 초과할수 없다]에서 선택되는 2가 라디칼인 방법.

청구항 10

제7항에 있어서, 제1항에 있어서, R은 메틸그룹이고, A가 존재하는 경우,

$$\begin{array}{c} R_2 \\ | \\ A - (CH_2)_m - CH(CH_2)_n - \end{array}$$

A는 $-(CH_2)_m - CH(CH_2)_n -$ [여기에서, R₂는 수소, 메틸 또는 에틸이고, m은 0내지 16인 정수이며, n은 0이다]에서 선택되는 2가 라디칼 방법.

청구항 11

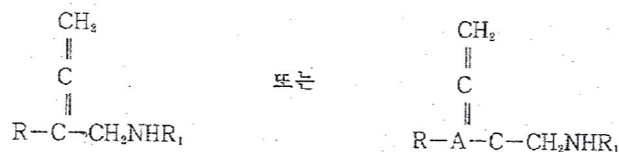
제7항에 있어서, R이 페닐, 메톡시페닐, 하이드록시페닐, 다하이드록시페닐, 클로로페닐, 또는 디클로로페닐인 방법.

청구항 12

제11항에 있어서, A그룹이 존재하지 않거나, A가 메틸렌 또는 에틸렌 그룹인 방법.

청구항 13

리실옥시다제 억제량의의 페닐실라민과 함께 유효량의 일반식 (1) 화합물 또는 이의 약학적으로 허용되는 염을 환자에게 투여함을 특징으로 하며, 비정상적인 콜라겐 축적과 관련된 환자의 질환 및 증상을 치료하는 방법.



상기식에서, R₁은 수소 또는 (C₁-C₄)알킬그룹이고,

$$\begin{array}{c} R_2 \\ | \\ A - (CH_2)_m - CH(CH_2)_n - \end{array}$$

A는 $-(CH_2)_m - CH(CH_2)_n -$, $(CH_2)_p - D - (CH_2)_q -$, 및 $-(CH_2)_r - CH=CH - (CH_2)_s$ 로 구성된 그룹에서 선택되는 2가 라디칼이며, R₂는 수소, 메틸 또는 에틸이고, D는 산소 또는 황이며, R은 메틸그룹, (C₃-C₈)사이클로알릴그룹, 페닐 또는 (C₁-C₅)알킬, (C₁-C₅)알콕시, 하이드록시, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오드, 트리플루오로메틸, 니트로 (C₁-C₅)알킬카보닐, 벤조일, 또는 페닐로 구성된 그룹에서 선택되는 1또는 2개의 그룹으로 치환된 페닐이거나; 1-또는 2-나프틸, 1-, 2-, 또는 3-인데닐, 1-, 2-, 또는 9-플루오레닐, 1-, 2-, 또는 3-피페리디닐, 2-또는 3-피롤릴, 2-또는 3-티에닐, 2-또는 3-푸라닐, 2-또는 3-인돌릴, 2-또는 3-티아나플틸레닐, 또는 2- 또는 3-벤조푸라닐이고;

$$\begin{array}{c} R_2 \\ | \\ A - (CH_2)_m - CH(CH_2)_n - \end{array}$$

단 A가 $-(CH_2)_m - CH(CH_2)_n -$ 인 경우엔 R이 추가로 -NH₂그룹일 수도 있으며, m 및 n은 각기 독립적으로 0내지 16인 정수이며, m+n은 17을 초과할 수 없고, p 및 q는 각기 독립적으로 0내지 16인 정수이며, p+q는 17을 초과할수 없고, s 및 r은 각기 독립적으로 0내지 16인 정수이며, r+s는 16을 초과할수 없다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.