(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
A61K 37/02

(11) 공개번호 특1994-0013531
(43) 공개일자 1994년07월15일

(21) 출원번호 특1993-0027166
(22) 출원일자 1993년12월10일
(30) 우선권주장 P42 41 829.1 1992년12월11일 독일(DE)
P43 26 777.7 1993년08월10일 독일(DE)
(71) 출원인 훽스트 아크티엔게젤 샤프트 엥엘하르트, 루쯔
독일연방공화국 데-65926 프랑크푸르트 암 마인
(72) 발명자 빌헬름 슈탈
독일연방공화국 데-65929 프랑크푸르트/마인 드로쎌베크 5
미카엘 알레르스
독일연방공화국 데-55127 마인쯔 임 뮌히펠트 11
악셀 발히
독일연방공화국 데-60487 프랑크푸르트/마인 한스-작스-슈트라쎄 5
엑크하르트 바르트닉
독일연방공화국 데-65205 비스바덴 카를스루허 슈트라쎄 8
게르하르트 크레쯔슈마르
독일연방공화국 데-65760 에슈보른 올멘베크 10
주잔네 그라블라이
독일연방공화국 데-61462 쾨니히슈타인 휠데를린슈트라쎄 7
루돌프 슐라이어바흐
독일연방공화국 데-65719 호프하임/타우누스 핀켄베크 10
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 생리학적으로 내성이 있고 분해가능한 중합체계 탄수화물 수용체 차단제, 이의 제조방법 및 이의 용도

요약

본 발명은 HLB*가 10 내지 20이고 탄소화물 잔기, 이관능성 스페이서, 생분해가능한 친수성 중합체 및 효능 증진제를 함유하는 (여기서, 동일하거나 상이한 1개 내지 20개의 천연 모노삭카라이드 단위로 이루어진 탄수화물 잔기는 천연 또는 합성 분자인 하나 이상의 이관능성 스페이서를 통하여 생분해가능한 친수성 중합체와 커플링되고, 이러한 중합체는 하나 이상의 스페이서의 캐리어이며, 생분해가능한 친수성 중합체는 가교결합제, 소수성, 친수성 또는 이온성을 나타내는 하나 이상의 그룹 또는 용해도 증진제인 효능 증진제에 부가적으로 연결된다), 생리적으로 내성이 있고 분해가능한 중합체계 탄수화물 수용체 차단제, 이의 제조방법 및 생체내에서 탄수화물 인지 수용체를 차단하기 위한 이의 용도에 관한 것이다.

당해 탄수화물 수용체 차단제는 이의 본래의 형태로서든 또는 이의 분해 생성물 형태로서든 생체내에서 어떠한 불내성 반응을 유발시키지 않는다.

명세서

[발명의 명칭]

생리학적으로 내성이 있고 분해가능한 중합체계 탄수화물 수용체 차단제, 이의 제조방법 및 이의 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

HLB*가 10 내지 20이고 탄수화물 잔기, 이관능성 스페이서, 생분해가능한 친수성 중합체 및 효능증진제를 함유하는 (여기서, 동일하거나 상이한 1개 내지 20개의 천연 모노삭카라이드 단위로 이루어진 탄수화물 잔기는 천연 또는 합성 분자인 하나 이상의 이관능성 스페이서를 통하여 생분해가능한 친수성 중합체와 커플링되고, 이러한 중합체는 하나 이상의 스페이서의 캐리어이며, 생분해가능한 친수성 중합체는 가교결합제, 소수성, 친수성 또는 이온성을 나타내는 하나 이상의 그룹 또는 용해도 증진제인 효능 증진제에 부가적으로 연결된다), 생리적으로 내성이 있고 분해가능한 중합체계 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 2

동일하거나 상이한 1개 내지 20개의 천연 모노삭카라이드 단위로 이루어진 탄수화물 잔기; 천연 또는 합성 분자인 이관능성 스페이서; 생분해가능한 친수성 중합체 및 가교결합제, 소수성, 친수성 또는 이온성을 나타내는 하나 이상의 그룹 또는 용해도 증진제인 효능 증진제를 공유화학적, 화학효소적 및/또는 효소적 결합시켜 수득할 수 있는, HLB*가 10 내지 20인 생리학적으로 내성이 있고 분해가능한 중합체계 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 분자량이 70kd 이하인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, 중합체의 HLB*가 14 내지 20인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 5

제1항 또는 제2항에 있어서, 스페이서를 통해 탄수화물 잔기를 부하하는 정도가 0.5 내지 50%인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 6

제1항 또는 제2항에 있어서, 탄수화물 잔기가 바이러스 또는 세포 표면 상의 당단백질, 당지질 또는 프로테오글리칸인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 7

제1항 또는 제2항에 있어서, 탄수화물 잔기가 치환되고/되거나 치환되지 않은, 동일하거나 상이한 1개 내지 15개의 천연 모노삭카라이드 단위로 이루어진 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 8

제1항, 제2항 및 제7항 중의 어느 한항에 있어서, 탄소쇄의 탄소수가 6보다 많은 치환된 모노삭카라이드 단위가 사용되는 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 9

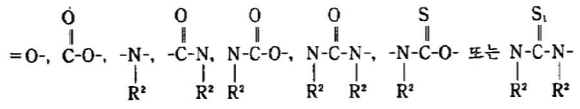
제1항, 제2항 및 제6항 중의 어느 한항에 있어서, 탄수화물 잔기가 시알릴-루이스 X, 시알릴-루이스 A 또는 VIM-2인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 10

제1항 또는 제2항에 있어서, 이관능성 스페이서가 다음 일반식을 나타내는 탄수화물 수용체 차단제.

(탄수화물 잔기)-A_1-[B-C_z]$_y$-D_x-A_2-(생분해가능한 친수성 중합체-효능 증진제)

상기 식에서, x는 0 또는 1이고, y는 1 내지 7이며, z는 0 또는 1인데, 단 z는 x가 1일때 1일 수 있으며, B 및 D는 동일하거나 상이하며, 직쇄, 측쇄, 일환식 또는 이환식일 수 있고, 치환되지 않거나 치환되며 단일 결합 및/또는 이중결합 또는 1개 내지 3개의 방향족 환을 함유하는 탄소수 0 내지 30의 알킬렌이고, C는 다음 일반식의 치환체



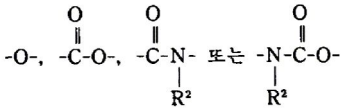
[여기서, R^2는 서로 독립적으로 수소이거나, 메틸, 에틸, 벤질, 프로필, 아세틸 또는 벤조일 그룹일 수 있다]이며, 치환체 y에 의해 정의된 반복단위는 동일하거나 상이할 수 있고, A_1 및 A_2는 동일하거나 상이하며, 각 경우에 있어서, 하나의 반응성 그룹을 하나의 활성화 그룹과 공유결합시켜 제조한다.

청구항 11

제1항, 제2항 및 제10항 중의 어느 한 항에 있어서, B 또는 D가 서로 독립적으로 탄소수 0 내지 15의 알킬렌인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 12

제1항, 제2항 및 제10항 중의 어느 한항에 있어서, C가 다음 일반식의 치환체인 탄수화물 수용체 차단제.



상기식에서, R^2는 제10항에서 정의한 바와 같다.

청구항 13

제1항 또는 제2항에 있어서, 생분해가능한 친수성 중합체가 선형, 측쇄 형태, 환 형태, 별 모양 또는 구 모양으로 함께 연결되는 2개 이상의 동일하거나 상이한 단량체 단위로 이루어진 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 14

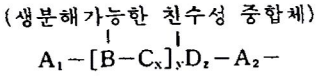
제13항에 있어서, 폴리카보네이트, 폴리에스테르, 폴리아미드, 포릴이미노카보네이트, 폴리무수물, 폴리오르토에스테르, 폴리디옥산은, 폴리포스파젠, 폴리하이드록시카복실산, 폴리아미노산 또는 폴리삭카라이드가 사용되는 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 15

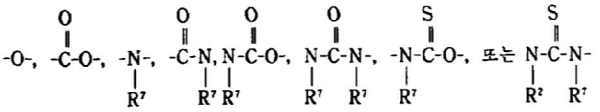
제1항 또는 제2항에 있어서, 효능 증진제가 분자내 가교결합제, 소수성, 친수성 또는 이온성 그룹 또는 용해도 증진제인 탄수화물 수용체 차단제.

청구항 16

제1항, 제2항 및 제15항 중의 어느 한항에 있어서, 효능 증진제가 다음 일반식을 나타내는 탄수화물 수용체 차단제.



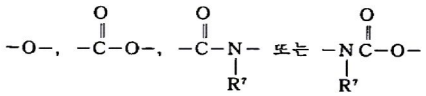
상기식에서, x는 0 또는 1이고, y는 1 내지 20이며, z는 0 또는 1인데, 단 z는 x가 1이면 1일 수 있고, B 및 D는 동일하거나 상이하고, 직쇄, 측쇄, 일환힉 또는 이환식일 수 있고, 치환되지 않거나 치환되며 단일결합 및/또는 이중결합 또는 1개 내지 2개의 방향족 환을 함유하는 탄소수 0 내지 20의 알킬렌이고, C는 다음 일반식의 치환체



[여기서, R^7은 서로 독립적으로 수소이거나, 메틸, 에틸, 벤질, 프로필 또는 아세틸 그룹일 수 있다]이고, 치환체 y애 의해 정의된 반복단위는 동일하거나 상이할 수 있으며, A_1 및 A_2는 동일하거나 상이하고, 각 경우에 있어서 하나의 반응성 그룹들 하나의 활성화 그룹과 공유결합시켜 제조한다.

청구항 17

제1항, 제2항, 제15항 및 제16항 중의 어느 한 항에 있어서, C가 다음 일반식의 치환체인 탄수화물 수용체 차단제.



상기식에서, R^7은 제16항에서 정의한 바와 같다.

청구항 18

제1항 또는 제2항에 따르는 탄수화물 수용체 차단체와 경우에 따라 약제학적 비히클을 포함하는 약제학적 조성물.

청구항 19

탄수화물 잔기, 이관능성 스페이서, 생분해가능한 친수성 중합체 및 효능 증진제를 효소적, 화학적 및/또는 화학 효소적 결합시킴을 포함하여, HLB*가 10 내지 20이고 생리학적으로 내성이 있으며 분해가능한

제1항에 따르는 중합체계 탄수화물 수용체 차단제를 제조하는 방법.

청구항 20

제19항에 있어서, 탄수화물 잔기와 이관능성 스페이서 간에 공유결합을 형성시킨 다음, 탄수화물 잔기-스페이서 복합체를 생분해가능한 친수성 중합체와 공유결합시키고, 최종적으로 탄수화물 잔기-스페이서-중합체 복합체를 효능 증진제와 공유결합시키는 방법.

청구항 21

제19항에 있어서, 한편으로는, 생분해가능한 친수성 중합체를 효능 증진제와 반응시키고, 다른 한편으로는, 탄수화물 잔기와 이관능성 스페이서를 반응시켜 공유결합을 형성시킨 다음, 연속적으로 중합체-효능 증진제 복합체를 탄수화물 잔기-이관능성 스페이서 복합체와 공유결합시키는 방법.

청구항 22

세균성 또는 바이러스성 간염 뿐만 아니라 전이성 종양 및 염증성 질환과 연관이 있는 질병을 억제하는데 있어서의 진단용, 치료용 또는 예방용 약제를 제조하기 위한, 제1항 또는 제2항에 따르는 탄수화물 수용체 차단제의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.