

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁵ C07H 15/08	(11) 공개번호 특 1990-0009678
	(43) 공개일자 1990년 07월 05일
(21) 출원번호	특 1989-0018428
(22) 출원일자	1989년 12월 12일
(30) 우선권주장	8829592.8 1988년 12월 19일 영국(GB)
(71) 출원인	비이참 그루우프 피이엘시이 데이빗 로버츠 영국 미들섹크스주 티이다블류8 9비이디이(TW8 9BD) 부렌트호오드시 그레이트 웨스트 로오드 비이참 하우스
(72) 발명자	마이클 존 드라이버 영국 서리주 케이티이18 5엑스큐우(KT18 5XQ)엡섬시 유우트리 바텀 로오드 그레이트 버어그 비이참 화아마슈티칼즈 앨릭잔더 리차아드 그린리즈 영국 서리주 케이티이18 5엑스큐우(KT18 5XQ)엡섬시 유우트리 바텀 로오드 그레이트 버어그 비이참 화아마슈티칼즈 데이빗 티모시 먹펠슨 영국 서리주 케이티이18 5엑스큐우(KT18 5XQ)엡섬시 유우트리 바텀 로오드 그레이트 버어그 비이참 화아마슈티칼즈
(74) 대리인	차윤근, 차순영

심사청구 : 없음

(54) 신규 화합물들

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

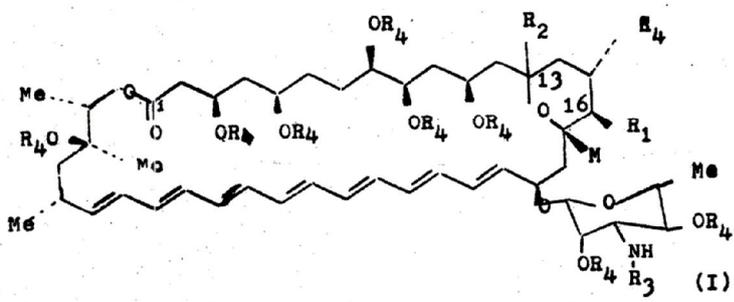
신규 화합물들

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반 구조식 (I) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염 :



상기식에서, R₁은 기- X- Y이며, 이때 X는 카르보닐기이며 Y는 수소, C₁₋₈ 알킬, C₂₋₈알케닐 또는 임의 치환된 아릴 또는 헤테로아릴이며; R₂는 히드록시 또는 C₁₋₈알콕시이며; R₃은 수소 또는 아민 보호기이며; 각 R₄는 수소이다.

청구항 2

제 1항에 있어서, R₁이 포르밀, 아세틸, 펜트-4-엔오일, 벤조일 또는 2-피롤일카르보닐인 화합물.

청구항 3

제 1항 또는 제 2항에 있어서, R₂가 히드록시 또는 메톡시인 화합물.

청구항 4

제 1항 내지 제 3항 중 어느 한 항에 있어서, R₃이 수소, 아세틸, 트리플루오로아세틸 또는 9-플루오레닐 메톡시 카르보닐인 화합물.

청구항 5

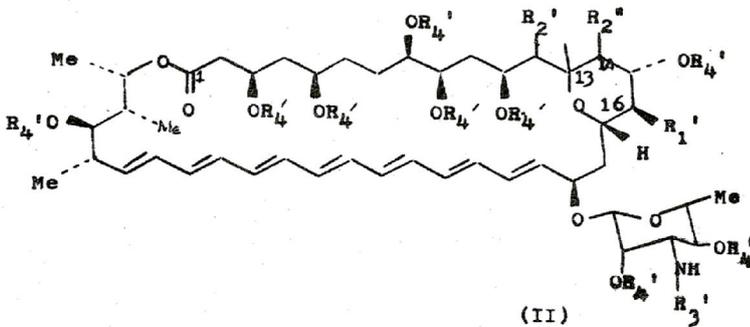
제 1항 내지 제 4항중 어느 한 항에 있어서, R₁이 포로밀, 아세틸, 펜트-4-엔오일, 벤조일 또는 2-피롤일 카르보닐이며; R₂가 히드록시 또는 메톡시이며; R₃가 수소, 아세틸, 트리플루오로아세틸 또는 9-플루오레닐 메톡시카르보닐이며; 각 R₄가 수소인 화합물.

청구항 6

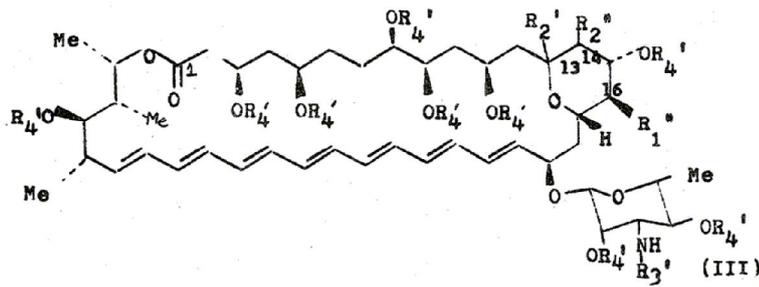
N-아세틸-16-아세틸-16-데카르복시아포테리신 B; 16-아세틸-16-데카르복시아포테리신 B; 16-벤조일-16-데카르복시아포테리신 B; 16-(3-부테닐카르보닐)-16-데카르복시아포테리신 B; 또는 16-데카르복시-16-(2-피롤일카르보닐)아포테리신 B.

청구항 7

하기 일반 구조식(II) 화합물;



(상기식에서 R₁'는 활성화된 카르복실산 유도체이며 R₂'는 C₁₋₈알콕시이며 R₂''는 수소이거나 R₂' 및 R₂''는 함께 하나의 결합이며; R₃'는 아민 보호기이며 각 R₄'는 실릴 보호기임)을 (a) 유기 금속 시약 Y-M(이 때 Y는 C₁₋₈알킬, C₂₋₈알케닐 또는 임의 치환된 아릴 또는 헤테로아릴이며 M은 금속 잔기임)과 반응시켜 하기 일반 구조식(III) 화합물;



(상기식에서 R₁''는 기 -X-Y이며 이때 X는 카르보닐기이며 Y는 C₁₋₈알킬, C₂₋₈알케닐 또는 임의 치환된 아릴 또는 헤테로아릴이고; R₂', R₂'', R₃' 및 R₄'는 일반 구조식(II)에 정의 되었음)을 제공하거나 (b) 환원제와 반응시켜 R₂''가 -CH₂OH이며; R₂', R₂'', R₃' 및 R₄'가 일반구조식(II)에 정의된 바와 같은 일반구조식(III) 화합물을 얻은 후 R₁''-CH₂OH기를 산화시켜 R₁''가 -CHO이며; R₂', R₂'', R₃' 및 R₄'가 일반구조식(II)에 정의된 바와같은 일반구조식(III) 화합물을 제공한 다음, 임의로 또는 필요한 경우, 임의의 적당한 순서로 R₁''를 R₁''으로 전환시키고, R₂''가 수소인 경우 R₂''를 R₂''로 전환시키거나, R₂' 및 R₂''가 함께 하나의 결합인 경우, R₂''를 R₂''로, R₂''를 수소로 전환시키고 R₃'를 R₃''로 전환시키고, R₄' 실릴 보호기를 제거시키고 R₂''를 상호전환시키고, R₃''를 상호전환시키고 제약학적으로 허용가능한 염을 형성시키는 것으로 구성된 제 1항에서 정의된 일반 구조식(1) 화합물의 제조 방법.

청구항 8

제 7항에 있어서, R₁'가 알킬, 아릴 또는 헤테로아릴 에스테르 또는 티오에스테르, 산 할로겐화물, 산무

수물 또는 아미드인 방법.

청구항 9

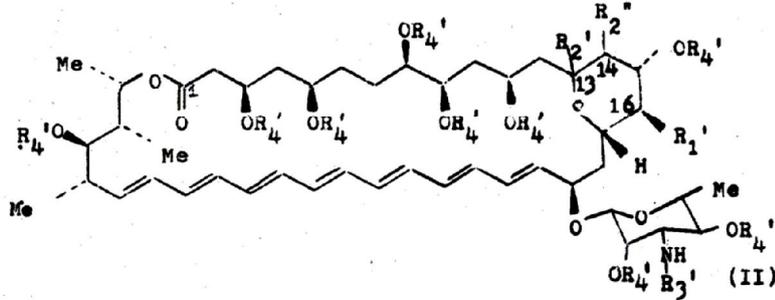
제 7항 또는 제 8항에 있어서, 공정(a)의 유기금속 시약 Y-MOI 그리나드 시약인 방법.

청구항 10

제 7항 또는 8항에 있어서, 공정(b)의 환원제가 붕수소화물 환원제인 방법.

청구항 11

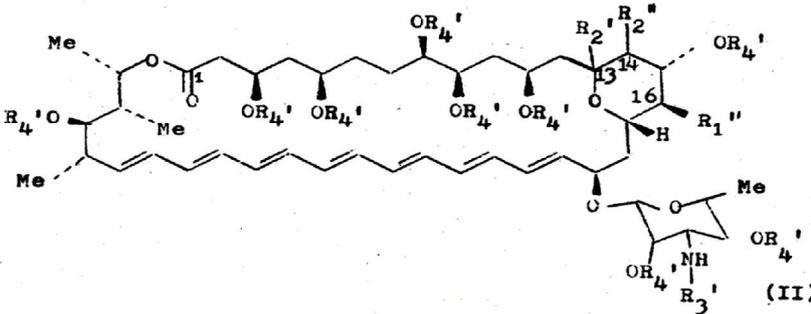
하기 일반 구조식(II) 화합물;



상기식에서 R₁'는 2-피리딜티오펜카르보닐이며; R₂'는 C₁₋₈알콕시이며; R₂'는 수소이며; R₃'는 아민 보호기이며 각 R₄'는 실릴 보호기이다.

청구항 12

하기 일반 구조식(III) 화합물;



상기식에서 R₁''는 기 -X -Y(X는 카르보닐기이며 Y는 수소, C₁₋₈알킬, C₂₋₈알케닐 또는 임의 치환된 아릴 또는 헤테로아릴임)이거나 -CH₂OH이며; R₂'는 C₁₋₈알콕시이며; R₂'는 수소이며; R₃'는 아민 보호기이며 각 R₄'는 실릴 보호기이다.

청구항 13

N-(9-플루오레닐메톡시카르보닐)-13-O-메틸-암포테리신 B; N-(9-플루오레닐메톡시카르보닐)-13-O-메틸-3, 5, 8, 9, -11, 15, 35, 2', 4'-노나-O-트리에틸실릴암포테리신 B; N-트리플루오로아세틸암포테리신 B; 또는 N-트리플루오로아세틸-13-O-메틸-3, 5, 8, 9, 11,-15, 35, 2', 4'-노나-O-트리에틸실릴암포테리신 B.

청구항 14

제약학적으로 허용가능한 희석제 또는 담체와 함께, 제 1항에서 정의된 일반구조식(I) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염으로 구성된 제약학적 조성물.

청구항 15

활성 치료 물질로서 사용하기 위한 제 1항에서 정의된 일반구조식(I) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염.

청구항 16

균류 감염의 치료에 사용하기 위한 제 1항에서 정의된 일반구조식(I) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염.

청구항 17

인간을 포함한 동물의 균류 감염을 치료하기 위한 약제를 제조하기 위해, 제 1항에 정의된 일반구조식(I) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염.

1) 화합물 또는 제약학적으로 허용가능한 이들의 염의 사용.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.