

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07C 153/05	(11) 공개번호 특 1988-0007451
	(43) 공개일자 1988년 08월 27일
(21) 출원번호	특 1987-0015022
(22) 출원일자	1987년 12월 23일
(30) 우선권주장	8630928 1986년 12월 24일 영국(GB) 8717924 1987년 07월 29일 영국(GB)
(71) 출원인	비이참 그루우프 피이엘시이 데이빗 로버츠 영국 미들섹크스주 티이다블류8 9비이디이(TW8 9B0) 부렌트호오드시 그레이트 웨스트로오드 비이참 하우스
(72) 발명자	로저 에드워드 마아크 웰 영국 에섹스주 시이엠19 5에이디이(CM19 5AD) 하아로우시 더 피너클즈 코올드 하아버어 로오드 비이참 화아마슈티칼즈 스티븐 앨런 스미스 영국 에섹스주 시이엠19 5에이디이(CM19 5AD) 하아로우시 더 피너클즈 코올드 하아버어 로오드 비이참 화아마슈티칼즈 이언 휴우즈 영국 에섹스주 시이엠19 5에이디이(CM19 5AD) 하아로우시 더 피너클즈 코올드 하아버어 로오드 비이참 화아마슈티칼즈
(74) 대리인	차윤근, 차순영

심사청구 : 없음

(54) 신규한 화합물

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

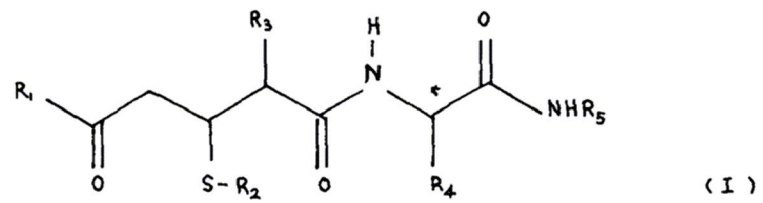
신규한 화합물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

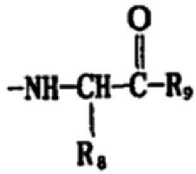
청구항 1

하기 일반식(I)의 화합물이나 그의 염, 용매화물이나 수화물:

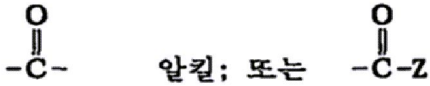


상기식에서: R<sub>1</sub>은 -OH; 알콕시; 아릴옥시; 아릴킬옥시; -NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>(여기서 각 R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 수소나 알킬; 또는 R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 그들이 결합되어 있는 질소원자와 함께 임의의 산소, 황 또는 임의로 치환된 질소원자를 고리

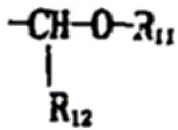
속에 갖는 5-, 6-또는 7-각 고리를 형성함); 또는 하기의 기



(여기서 R<sub>8</sub>은 수소; 알콕시, -NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 구아니딘, -CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, SH, S-알킬 또는 -OH로 임의로 치환된 알킬; 또는 -CHP<sub>2</sub>-Ar (Ar은 임의로 치환된 아릴임)이고; R<sub>9</sub>은 알콕시; OH; 또는 -NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> 임)이며; R<sub>2</sub>는 수소:



(여기서 Z는 임의 치환된 아릴임)이고; R<sub>3</sub>는 C<sub>3-6</sub> 알킬이며; R<sub>4</sub>는 수소;알킬; -CH<sub>2</sub>-R<sub>10</sub> (여기서 R<sub>10</sub>은 임의 치환된 페닐이나 헤테로 아릴임); 또는 하기의 기,



(여기서 R<sub>11</sub>은 수소; 알킬; 또는 -CH<sub>2</sub>-Ph (Ph는 임의 치환된 페닐임)이고; R<sub>12</sub>는 수소나 알킬임); 이며 R<sub>5</sub>는 수소나 알킬; 또는 하기의 기



(여기서 R<sub>13</sub>은 수소; 알킬; R<sub>14</sub>는 히드록시; 알콕시; 또는 -NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> 임)이다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sub>1</sub>이 히드록시, C<sub>1-4</sub> 알콕시, 벤질옥시, 아미노, 메틸아미노, N'-메틸-N-피페라지닐, N-모르폴리닐이나 -NH-CH(R<sub>6</sub>)COR<sub>9</sub> 여기서 (R<sub>6</sub>은 수소나 이소부틸이고 R<sub>9</sub>은 OH, NH<sub>2</sub>; 에톡시 또는 t-부톡시 임) 이고; R<sub>2</sub>는 수소, 아세틸 또는 벤조일이며; R<sub>3</sub>는 n-부틸, 이소-부틸이나 2차-부틸이고; R<sub>4</sub>는 이소-부틸, 벤질, 4-메톡시 벤질, 1-(벤질옥시)에틸 또는 3-인돌릴메틸이며; R<sub>5</sub>는 수소, 메틸, 또는 1-(메톡시 카르보닐) 에틸인 화합물.

**청구항 3**

제1항에 있어서, R<sub>1</sub>은 메톡시, 아미노, 메틸아미노 또는 -NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H 이고; R<sub>2</sub>는 수소, 아세틸 또는 벤질이며; R<sub>3</sub>는 이소-부틸이고; R<sub>4</sub>는 벤질 또는 4-메톡시벤질이며 R<sub>5</sub>가 메틸인 화합물.

**청구항 4**

제1항 내지 제3항중 어느 한 항에 있어서, 일반식(1)의 별표로 표시된 편광 중심이 S- 배열을 갖는 화합물.

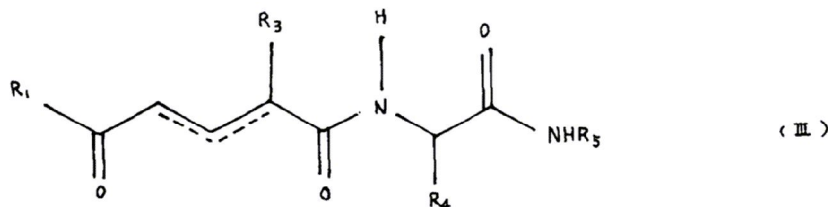
**청구항 5**

제1항에 있어서, 하기와 같은 화합물: 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노) 카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 메틸 에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노)-카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 메틸 에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노)-카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 3-메르캅토-5-메틸 N' [1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메틸프로필)-펜탄디아미드, 2-[3-메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노)-카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노일아미노]에타노익산, N<sup>5</sup>-(아미노카르보닐)메틸-3-메르캅토-N' -[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메틸프로필)펜탄디아미드, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노) 카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 벤질 에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노) 카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 3-벤조일메르캅토-N<sup>5</sup>-메틸-N<sup>1</sup>-[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페)에틸]-2-(2-메틸프로필)펜탄디아미드, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노)-카르보닐]-2-페닐에틸]아미노]카르보닐]헵타노익산, 메틸 에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-페닐에틸]아미노]카르보닐]헵타노익산, 메틸에스테르, 3-아세틸메르캅토-N<sup>5</sup>-메틸-N<sup>1</sup>-[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메

틸-프로필)펜탄디아미드, 2-[3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노일아미노]에타노익산, t-부틸에스테르, 2-[3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노일아미노]에타노익산, t-부틸 에스테르, 2-[3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노일아미노]에타노익 산, 3-아세틸메르캅토-N<sup>5</sup>-(아미노카르보닐)메틸-N<sup>1</sup>-[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메틸프로필)펜탄디아미드, 1-[3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노일]-4-메탈피페라진, 1-[3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노일]-4-메탈피페라진, 1-[3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노일]모르폴린 수화물, 1-[3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노일]모르폴린 반수화물, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]-헵타노익산, 3차-부틸에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노익산, 3차-부틸에스테르, 1-[3-메르캅토-6-메틸-4-[[[2-(R)-벤질옥시-1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]프로필]아미노]카르보닐]헵타노익산, 메틸에스테르, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(3-인돌린)에틸]아미노]카르보닐]헵타노익산, 메틸 에스테르, 3-아세틸메르캅토-N<sup>1</sup>-[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메틸프로필)펜탄디아미드, 3-메르캅토-N<sup>1</sup>-[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-2-(2-메틸프로필)펜탄디아미드, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]카르보닐]헵타노일글리신, 메틸에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-5-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]아미노]-카르보닐]헵타노일글리신, 메틸 에스테르, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(아미노 카르보닐)-2-페닐에틸]아미노] 카르보닐] 헵타노익산, 메틸 에스테르, 3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(아미노카르보닐)-2-페닐에틸]아미노]카르보닐]헵타노익산, 메틸에스테르, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-아미노]카르보닐]헵타노일-D-류신, 3차-부틸에스테르, 3-아세틸메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-아미노]카르보닐]헵타노일-D-류신, 3-메르캅토-6-메틸-4-[[[1-(S)-[(메틸아미노)카르보닐]-2-(4-메톡시페닐)에틸]-아미노]카르보닐]헵타노일-D-류신, N-[N-[3-아세틸메르캅토-2-(2-메틸프로필)-1-옥소-4-[(페닐메톡시)카르보닐]부틸]-L-류실-L-알라닌 메틸 에스테르, 또는 N-[N-[3-메르캅토-2-(2-메틸프로필)-1-옥소-4-[(페닐메톡시)카르보닐]부틸]-L-류실-L-알라닌 메틸 에스테르.

**청구항 6**

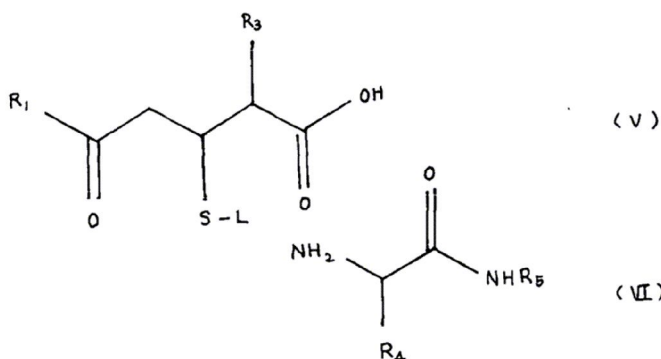
하기 (a) 또는 (b)에 의해 하기 일반식(III)의 화합물을 얻고 이어, 일반식(I)의 화합물에서 R<sub>2</sub>가 수소인 경우에는 L기를 이탈시키는 것으로 구성되는, 제1항에서와 같은 화합물의 제조방법: (a) 하기 일반식(III)의 화합물을 하기 일반식(IV)의 화합물과 반응시킨다:



**L<sub>1</sub>-SH**

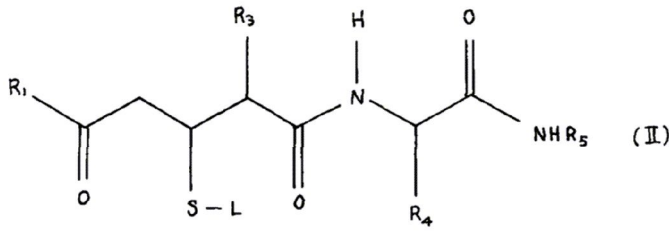
**(IV)**

상기식에서 R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> 및 R<sub>5</sub>는 일반식(I)에서 정의한 바와같고 L<sub>1</sub>은 통상의 황 보호기이다; 또는 (b) 하기 일반식(V)의 화합물을 하기 일반식(VI)의 화합물과 반응시킨다:



상기식에서 R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> 및 R<sub>5</sub>는 일반식(I)에서 정의한 바와같고 L은 통상적인 황보호기인 L<sub>1</sub>이거나 R-S-

기 (여기서 R은 R-S기가 이탈가능한 디설파이드 결합을 제공하도록 하는 어떤 유기 잔류기임)인 L<sub>2</sub>이다.



상기식에서 R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> 및 R<sub>5</sub>는 일반식(1)에서 정의한 바와같고 L은 L<sub>1</sub> 또는 L<sub>2</sub>이다.

**청구항 7**

제6항에 있어서, L이 아세틸이나 벤조일인 L<sub>1</sub>인 방법.

**청구항 8**

제1항 내지 제5항중 어느 한 항의 화합물과 제약학상 허용가능한 담체를 포함하는 제약학적 조성물.

**청구항 9**

제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 있어서, 활성 치료물질로서 사용하기 위한 화합물.

**청구항 10**

제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 있어서, 포유 동물의 결합 조직 질병과 같은 콜라겐 분해 상태를 치료하는데 사용하기 위한 화합물.

**청구항 11**

제1항 내지 제5항중 어느 한 항의 화합물을, 결합 조직의 질병과 같은 콜라겐 분해 상태를 치료하기 위한 약물 제조시에 이용하는 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.