

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>4</sup> C07D 487/04	(11) 공개번호 특 1991-0000734
	(43) 공개일자 1991년 01월 30일
(21) 출원번호	특 1989-0008457
(22) 출원일자	1989년 06월 20일
(30) 우선권주장	209,245 1988년 06월 20일 미국(US)
(71) 출원인	메렐 다우 파마슈티칼즈 인코포레이티드 게리 디. 스트리트 미합중국 오하이오 45215 신시내티 이스트 갈브레이스 로드 2110
(72) 발명자	에사 테로 자르비 미합중국 오하이오 45236 신시내티 에스티. 존스 테라스 3953 제임스 레이 맥카티 미합중국 오하이오 45069 웨스트 체스터 폭스뷰 플레이스 6448 넬리쿤야 자야 프라카쉬 미합중국 오하이오 45241 신시내티 웨게이트 레인 10871
(74) 대리인	이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 네플라노신 유도체

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

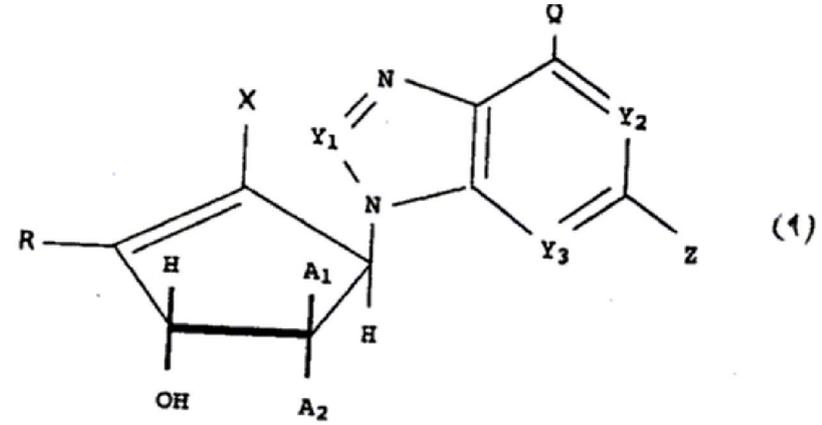
네플라노신 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(1)의 네플라노신(neplanocin) 유도체 및 이의 약제학적으로 허용되는 염.



상기 식에서, R은 수소; 또는 하이드록시 그룹으로 임의 치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알킬이고, X는 할로겐이며, A<sub>1</sub> 및 A<sub>2</sub>는 각각 독립적으로 수소, 할로겐 또는 하이드록시이고, 단 A<sub>1</sub>이 하이드록시인 경우, A<sub>2</sub>는 수소이며, A<sub>2</sub>가 하이드록시인 경우, A<sub>1</sub>은 수소이고, Y<sub>1</sub>은 질소, CH그룹, CF그룹, CCl그룹, CBr그룹 또는 CNH<sub>2</sub>그룹이며, Y<sub>2</sub> 및 Y<sub>3</sub>는 각각 독립적으로 질소 또는 CH그룹이고, Q는 NH<sub>2</sub>, NHOH, NHCH<sub>3</sub> 또는 수소이며, Z는 수소, 할로겐 또는 NH<sub>2</sub>이다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, A<sub>2</sub>가 하이드록시인 화합물.

**청구항 3**

제2항에 있어서, X가 불소인 화합물.

**청구항 4**

제2항에 있어서, X가 염소인 화합물.

**청구항 5**

제3항 또는 4항에 있어서, Y<sub>2</sub>가 질소인 화합물.

**청구항 6**

제3항 또는 4항에 있어서, Y<sub>3</sub>가 질소인 화합물.

**청구항 7**

제3항 또는 4항에 있어서, Z가 수소인 화합물.

**청구항 8**

제3항 또는 4항에 있어서, R가 수소인 화합물.

**청구항 9**

제3항 또는 4항에 있어서, R이 하이드록시메틸인 화합물.

**청구항 10**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 11**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -플루오로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 12**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 13**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -플루오로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 14**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] -3-데아자아데닌인 화합물.

**청구항 15**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -플루오로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -사이클로펜트-4' -에닐] -3-데아자아데닌인 화합물.

**청구항 16**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] -3-데아자아데닌인 화합물.

**청구항 17**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -플루오로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] -3-데아자아데닌인 화합물.

**청구항 18**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' (α-하이드록시메틸)-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 19**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-시스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로

펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 20**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] -8-클로로아데닌인 화합물.

**청구항 21**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] -6-N-메틸아데닌인 화합물.

**청구항 22**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-4' -하이드록시메틸-사이클로펜트-4' -에닐] -2-클로로아데닌인 화합물.

**청구항 23**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-시스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] 아데닌인 화합물.

**청구항 24**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] -8-클로로아데닌인 화합물.

**청구항 25**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] -6-N-메틸아데닌인 화합물.

**청구항 26**

제1항에 있어서, (-)-9- [5' -클로로-트랜스-2' , 트랜스-3' -디하이드록시-사이클로펜트-4' -에닐] -2-클로로아데닌인 화합물.

**청구항 27**

AdoMet(S-Adenosyl-L-Methionine)-의존성 메틸기전이활성을 억제할 필요가 있는 환자에게 억제 유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 환자중의 AdoMet-의존성 메틸기전이활성을 억제하는 방법.

**청구항 28**

이상조직 발생증상(neoplastic disease state)이 있는 환자에게 이상조직 발생억제 유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 환자를 치료하는 방법.

**청구항 29**

바이러스성 감염된 환자에게 항바이러스성 유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 환자를 치료하는 방법.

**청구항 30**

이상조직 발생증상이 있는 환자에게 이상조직 발생억제 유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 환자중의 이상조직(neoplasm)의 성장을 제어(control)하는 방법.

**청구항 31**

바이러스성 감염된 환자에게 항바이러스성 유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 환자중의 바이러스성 감염을 제어하는 방법.

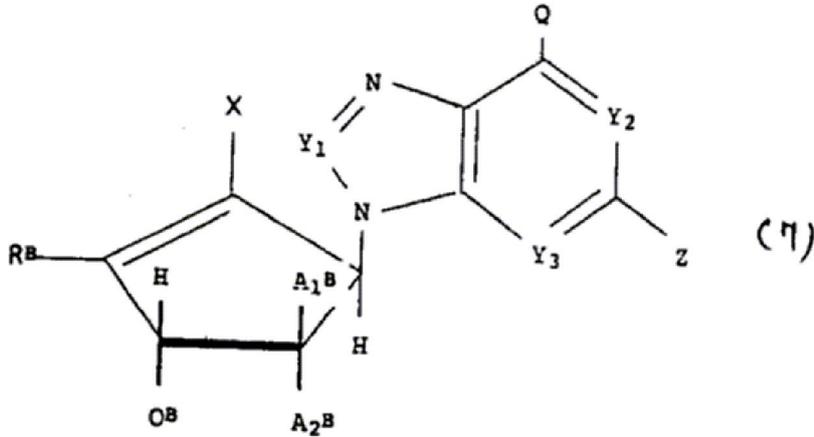
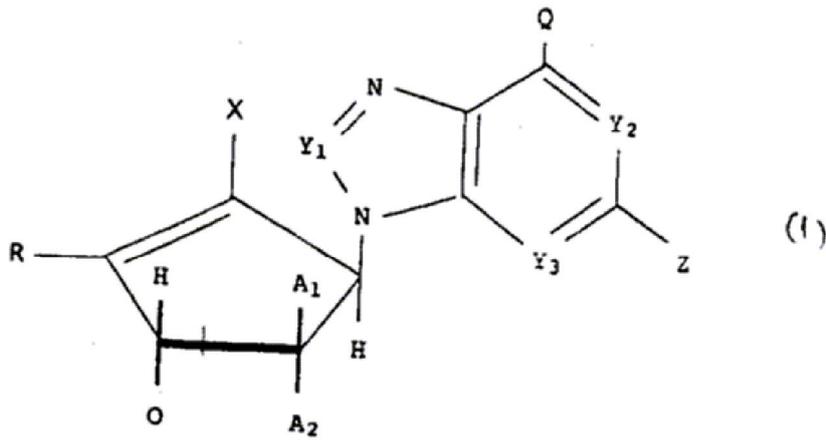
**청구항 32**

메틸기전이 의존성 질병증상에서 비롯된 포유동물 세포에 억제유효량의 제1항에 따른 화합물을 투여함을 특징으로 하여, 상기 포유동물 세포의 성장을 제어하는 방법.

**청구항 33**

하기 일반식(7)의 화합물을 산으로 처리하고 임의로, 약제학적으로 허용되는 산을 갖는 화합물을 산부가 염으로 전환시킴을 특징으로 하여, 일반식(1)의 네플라노신 유도체 및 이의 약제학적으로 허용되는 염을

제조하는 방법.



상기 식에서, R은 수소; 또는 하이드록시 그룹으로 임의 치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알킬이고, X는 할로겐이며, A<sub>1</sub> 및 A<sub>2</sub>는 각각 독립적으로 수소, 할로겐 또는 하이드록시이고, 단 A<sub>1</sub>이 하이드록시인 경우, A<sub>2</sub>는 수소이며, A<sub>2</sub>가 하이드록시인 경우, A<sub>1</sub>은 수소이고, Y<sub>1</sub>은 질소, CH그룹, CF그룹, CCl그룹, CBr그룹 또는 CNH<sub>2</sub>그룹이며, Y<sub>2</sub> 및 Y<sub>3</sub>는 각각 독립적으로 질소 또는 CH그룹이고, Q는 NH<sub>2</sub>, NHOH, NHCH<sub>2</sub> 또는 수소이며, Z는 수소, 할로겐 또는 NH<sub>2</sub>이고, O<sup>B</sup>는 보호된 하이드록시 그룹이며, A<sub>1</sub><sup>B</sup> 및 A<sub>2</sub><sup>B</sup>는 A<sub>1</sub> 또는 A<sub>2</sub>가 하이드록시인 경우, 보호된 하이드록시 그룹을 나타내고, A 또는 A<sub>2</sub>가 하이드록시를 제외한 다른것인 경우, A<sub>1</sub> 또는 A<sub>2</sub>을 나타내며, R<sup>B</sup>는 RO이 하이드록시 그룹을 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알킬인 경우, 보호된 하이드록시 그룹을 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알킬을 나타내고, RO이 하이드록시 그룹을 갖는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알킬을 제외한 다른것은 경우, R을 나타낸다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.