

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

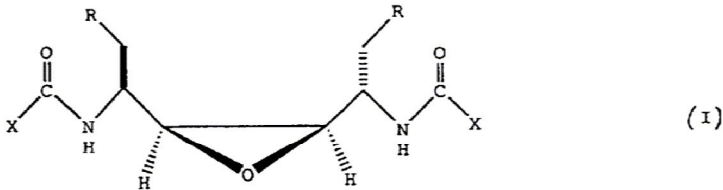
(51) Int. Cl. ⁵ C07D 405/06	(11) 공개번호 특 1994-0005620
	(43) 공개일자 1994년 03월 21일
(21) 출원번호	특 1993-0011214
(22) 출원일자	1993년 06월 18일
(30) 우선권주장	901,447 1992년 06월 19일 미국(US)
(71) 출원인	일라이 릴리 앤드 캄파니 리로이 휘테커 미합중국 인디애나 46285 인디애나폴리스 릴리 코포레이트 센터 존 에드윈 먼로
(72) 발명자	미합중국 인디애나 46220 인디애나 폴리스 롤링 파인스 코트 5783 월리엄 조셉 호른백 미합중국 인디애나 46256 인디애나 폴리스 파인스프링스 이스트 드라이브 7649
(74) 대리인	김창세, 장성구

심사청구 : 없음

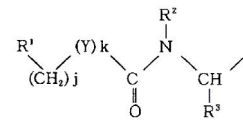
(54) 에이즈의 치료에 유용한 에이치아이브이(HIV) 프로테아제 억제제

요약

본 발명은 하기 일반식 (1)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염인 신규한 HIV 프로테아제 억제제, 상기 화합물을 함유하는 약학 조성물 및 그의 사용방법을 제공한다.



상기식에서, R은 C₁-C₆알킬, 사이클로알킬, 헤테로사이클, 불포화 헤테로 사이클, 아릴, 사이클로아릴(C₁-C₄)알킬, 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 불포화 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 아릴(C₁-C₄)알킬 또는 일반식 -A-(CH₂)_a-R⁰를 갖는 구조이고, 이때 A는 -O-, -NH- 또는 -S-이고, a는 0, 1, 2 또는 3이고, R⁰는



사이클로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, X는 이고, 여기에서 R¹은 아릴, 사이클로알킬, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, R²는 수소 또는 C₁-C₄알킬이고, R³는 아미노산 측매 -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -CH₂(CH₂)₂CH₃, -C(CH₃)₃, 시아노(C₁-C₄)알킬, 불포화 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 아릴(C₁-C₄)알킬 또는 -(CH₂)₃-A⁰-(CH₂)_r-R⁴ 또는 -CH-C(O)-NR²-(CH₂)_r-R⁵를 갖는 구조이고, 이때 s는 1, 2, 3 또는 4이고, r은 0, 1, 2 또는 3이고, A⁰는 -O-, -NH- 또는 -S- 이고, R⁴는 C₁-C₆알킬, 사이클로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, R⁵는 사이클로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, j는 0, 1, 2, 3 또는 4이고, k는 0 또는 1이고, Y는 -O-, -N(R²)- 또는 -S-이다.

명세서

[발명의 명칭]

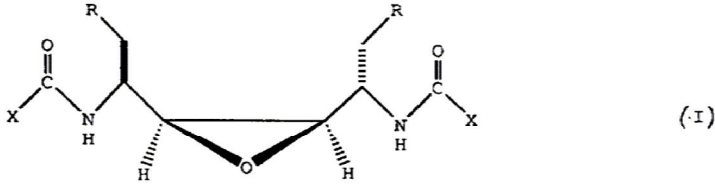
에이즈의 치료에 유용한 에이치아이브이(HIV) 프로테아제 억제제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

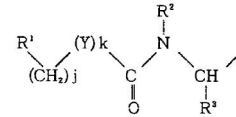
(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식 (1)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염 :



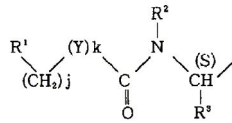
상기식에서, R은 C₁-C₆알킬, 사이클로알킬, 헤테로사이클, 불포화 헤테로 사이클, 아릴, 사이클로아릴(C₁-C₄)알킬, 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 불포화 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 아릴(C₁-C₄)알킬 또는 일반식 -A-(CH₂)_q-R⁰를 갖는 구조이고, 이때 A는 -O-, -NH- 또는 -S-이고, q는 0,1,2 또는 3이고, R⁰



는 사이클 로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, X는

이고, 여기에서 R¹은 아릴, 사이클로알킬, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, R²는 수소 또는 C₁-C₄ 알킬이고, R³는 아미노산 측쇄 -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂, -CH₂(CH₂)₂CH₃, -C(CH₃)₃, 시아노(C₁-C₁)알킬, 불포화 헤테로사이클(C₁-C₄)알킬, 아릴(C₁-C₄) 알킬 또는 -(CH₂)₃-A⁰-(CH₂)_r-R⁴ 또는 -CH-C(O)-NR²-(CH₂)_r-R⁵를 갖는 구조이고, 이때 s는 1,2,3 또는 4이고, r은 0,1,2 또는 3이고, A⁰는 -O-, -NH- 또는 -S- 이고, R⁴는 C₁-C₈알킬, 사이클로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, R⁵는 사이클로알킬, 아릴, 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, j는 0,1,2,3 또는 4이고, k는 0또는 1이고, Y는 -O-, -N(R²)- 또는 -S-이다.

청구항 2



제1항에 있어서, X가 이고, 상기식에서, R¹은 아릴 또는 불포화 헤테로사이클이고, j는 0.1 또는 2이고, Y는 -O- 또는 -N(R²)-이고, k는 1이고, R²는 수소 또는 메틸이고, R³는 아미노산 측쇄 -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂, -CH₂(CH₂)₂CH₃, -C(CH₃)₃ 또는 일반식 -CH₂-C(O)-NR²-(CH₂)_r-R⁵이고, 이때, r은 0,1,2 또는 2이고, R⁵는 사이클로알킬 아릴 헤테로사이클 또는 불포화 헤테로사이클이고, R⁰이 아릴, 아릴(C₁-C₄)알킬 또는 일반식 -A-(CH₂)_q-R⁰이고, 이때 A는 -S-이고, q는 0이고, R⁰는 아릴인 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 3

1,6-디페닐-2(S),5(S)-디(N-[2(S)-N((퀴놀린-2-일메톡시)카보닐)아미노부타노일]아미노)-3,4-시스-에폭시핵산, 1,6-디페닐-2(S),5(S)-디[N-[2(S)-N([N(메틸)-N(퀴놀린-2-일메틸)아미노]카보닐)아미노부타노일]아미노]3,4-시스-에폭시핵산, 1,6-디페닐-2(S),5(S)-디[N-[2(S)-N[8-플루오로퀴놀린-2-일메톡시)카보닐]아미노-3-메틸부타노일]아미노]-3,4-시스-에폭시핵산, 1,10-디페닐-4(S),7(S)-디[N-2(S)-N([N(메틸)-N(퀴놀린-2-일메틸)아미노]카보닐)아미노부타노일]아미노]-5,6-시스-에폭시데칸, 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 4

하나 이상의 약학적으로 허용가능한 담체, 부형제 또는 희석제와 함께 제1항 내지 제3항중 어느 한 항에 청구된 일반적(1)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염을 포함하는 약학 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.