

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>  
C07C 317/50

(11) 공개번호 특1996-0014100  
(43) 공개일자 1996년05월22일

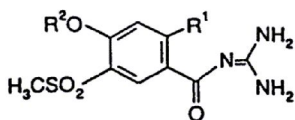
(21) 출원번호	특1995-0036489
(22) 출원일자	1995년 10월 20일
(30) 우선권주장	P4437874.2 1994년 10월 22일 독일(DE)
(71) 출원인	메르크 파텐트 게젤샤프트 미트 베슈랭크터 하프퉁 위르겐 호이만, 라인 하르트 쉬틀러
(72) 발명자	독일연방공화국 데-64293 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 로프 게릭케
	독일연방공화국 데-64271 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250, 에. 메르 크사 내
	디터 도르쉬
	독일연방공화국 데-64271 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250, 에. 메르 크사 내
	만프레트 바움가르쓰
	독일연방공화국 데-64271 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250, 에. 메르 크사 내
	클라우스-오토 밍크
	독일연방공화국 데-64271 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250, 에. 메르 크사 내
	노르베르트 바이에르
	독일연방공화국 데-64271 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250, 에. 메르 크사 내
(74) 대리인	송재련, 한규환

심사청구 : 없음

(54) 알킬-5-메틸술포닐벤조일구아니딘 유도체

요약

본 발명은 하기 일반식(I)으로 표시되는 벤조일구아니딘 유도체 및 이의 생리학적으로 허용되는 염을 제공한다.



(I)

(단, 상기 식에서, R<sup>1</sup>은 메틸 또는 에틸기이고, R<sup>2</sup>은 H, 직쇄 또는 측쇄 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-또는 -알켄일기, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-시클로알킬, 벤질 또는 메틸, 메톡시, 아미노, F, Cl, Br 또는 CF<sub>3</sub>로 일-, 이-또는 삼치환되거나 또는 비치환된 페닐기이다)

본 발명의 화합물은 세포내 Na<sup>+</sup>/H<sup>+</sup> 상호수송기의 억제제로서 작용하고 항부정맥 특성을 나타낸다.

명세서

[발명의 명칭]

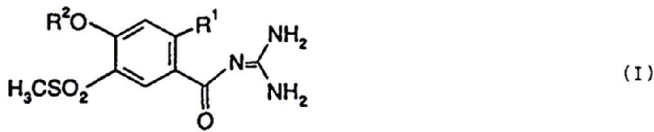
알킬-5-메틸수포닐벤조일구아니딘 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

## (57) 청구의 범위

### 청구항 1

일반식(I)으로 표시되는 벤조일구아니딘 유도체 및 이들의 생리학적으로 허용되는 염.



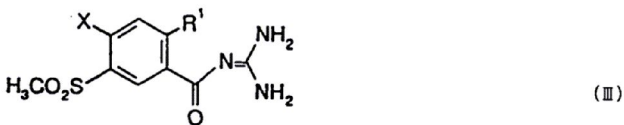
(단, 상기 식에서, R<sup>1</sup>은 메틸 또는 에틸기이고, R<sup>2</sup>은 H, 직쇄 또는 측쇄 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-알킬-또는 -알켄일기, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-시클로알킬, 벤질 또는 메틸, 메톡시, 아미노, F, Cl, Br 또는 CF<sub>3</sub>로 일-, 이-또는 삼치환되거나 또는 비치환된 페닐기이다)

### 청구항 2

제1항에 있어서, 상기한 일반식(I)의 화합물이 하기 (a) 내지 (e)인 것을 특징으로 하는 화합물 및 이들의 생리학적으로 허용되는 염 : (a) N-디아미노메틸렌-2-메틸-4-페녹시-5-메틸술포닐벤조아미드; (b) N-디아미노메틸렌-2-에틸-4-페톡시-5-메틸술포닐벤조아미드; (c) N-디아미노메틸렌-2-메틸-4-에톡시-5-메틸술포닐벤조아미드; (d) N-디아미노메틸렌-2-메틸-4-(2-클로로페녹시)-5-메틸술포닐벤조아미드; (e) N-디아미노메틸렌-2-메틸-4-(4-클로로페녹시)-5-메틸술포닐벤조아미드.

### 청구항 3

제1항에 따른 일반식(I)으로 표시되는 벤조일구아니딘 유도체 및 이들이 염중 하나를 제조하는 방법에 있어서, 하기 일반식(II)으로 표시되는 화합물을 구아니딘과 반응시키거나, 또는 필요시, 알콕시드로 전환시킨, 하기 일반식(IV)으로 표시되는 알코올 또는 페놀을 하기 일반식(III)으로 표시되는 벤조일구아니딘과 반응시키거나, 또는 R<sup>2</sup>가 H이고, R<sup>1</sup>이 상기한 의미를 갖는 일반식(I)으로 표시되는 알코올(페놀)을 R<sup>2</sup> 및 X가 상기한 의미를 갖는 일반식 R<sup>2</sup>-X로 표시되는 화합물과 반응시키거나, 또는 하나 이상의 수소원자 대신에 하나 이상의 환원성 기 및/또는 하나 이상의 추가의 C-C 및/또는 C-N결합을 가지며 그 밖에는 일반식(I)과 일치하는 화합물을 환원제로 처리하거나, 또는 하나 이상의 수소원자 대신에 하나 이상의 가용매분해성기를 가지며 그밖에는 일반식(I)과 일치하는 화합물을 가용매분해제로 처리하거나 및/또는 생성된 일반식(I)의 염기를 산으로 처리함으로써 이의 염중의 하나로 전환시키는 것을 특징으로 하는 제조방법.



(단, 상기 식에서 R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>는 상기에서 정의된 바와 같고, Q는 Cl, Br, OA, O-CO-A, O-CO-Ph 또는 OH 또는 기타 반응적으로 에스테르화된 OH기 또는 친핵적으로 쉽게 치환될 수 있는 이탈기이고, A는 탄소 수가 1 내지 6인 알킬이며, X는 F, Cl, Br, I 또는 다른 적합한 이탈기이다.)

### 청구항 4

제1항에 따른 일반식(I)으로 표시되는 화합물 및/또는 이의 생리학적으로 허용되는 염중의 하나를 1종 이상의 고체, 액체 또는 반고체 부형제 또는 보조물질과 함께 적합한 투여 형태로 만드는 것을 특징으로 하는 약제학적 제형의 제조방법.

### 청구항 5

제1항에 따른 일반식(I)으로 표시되는 화합물 1종 이상 및/또는 이의 생리학적으로 허용되는 염중의 하나를 함유하는 것을 특징으로 하는 약제학적 제형.

### 청구항 6

질병의 치료를 위한 약물제조에 사용되는 제1항에 따른 일반식(I)으로 표시되는 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용되는 염.

#### 청구항 7

질병의 치료에 사용되는 제1항에 따른 일반식(1)으로 표시되는 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용되는 염.

#### 청구항 8

부정맥증, 협심증 및 경색증의 치료, 또는 상기 질병의 예방치료용 약물의 제조에 사용되는 제1항에 따른 일반식(1)으로 표시되는 화합물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.