

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

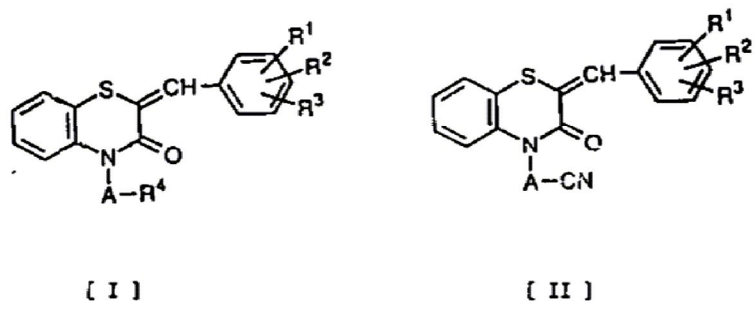
|  |                             |
|--|-----------------------------|
| (51) Int. Cl. <sup>6</sup><br>C07D 279/16  | (11) 공개번호<br>특 1995-0017982 |
|  | (43) 공개일자<br>1995년 07월 22일  |
| (21) 출원번호<br>특 1994-0033420  |                             |
| (22) 출원일자<br>1994년 12월 09일   |                             |
| (30) 우선권주장<br>93-309131 1993년 12월 09일 일본(JP)   |                             |
| (71) 출원인<br>산텐 세이야쿠 가부시카가이샤 모리타 다카가즈   |                             |
| (72) 발명자<br>일본국 오사카후 오사카시 히가시요도가와쿠 시모신쥬 3쥬메 9반 19고<br>가와시마 요이치<br>일본국 교토후 교토시 니시교쿠 오히라노니시 사카이다니쥬 3쥬메 8반 54고<br>오타 아츠토시<br>일본국 오사카후 오사카시 죠토쿠 후루이치 3쥬메 18반 23고-814고<br>모리카와 유코<br>일본국 오사카후 네야가와시 미쯔이가와카 4쥬메 9반 79-404고<br>미브 히로유키<br>일본국 오사카후 오사카시 쥬오쿠 호엔사카 1쥬메 5반 8-14고 |                             |
| (74) 대리인<br>이성섭, 나영환   |                             |

심사청구 : 없음

(54) 신규한 3-옥소-1, 4-벤조티아진 유도체

요약

본 발명은 백내장 치료에 유용한 하기 일반식 [I] 화합물 및 하기 일반식 [II]의 합성 중간물질에 관한 것이다.



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 보호기로 보호될 수 있는 히드록시이고; R<sup>2</sup>는 저급 알킬이고; R<sup>3</sup>는 수소, 저급 알킬, 보호기로 보호될 수 있는 히드록시, 또는 저급 알콕시이며, 상기 저급 알킬은 보호기로 보호될 수 있는 히드록시, 아미노 또는 저급 알킬아미노로 치환될 수 있으며; R<sup>4</sup>는 테트라졸릴, 포스포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르 또는 설포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르이고; 및 A는 알킬렌이다.

명세서

[발명의 명칭]

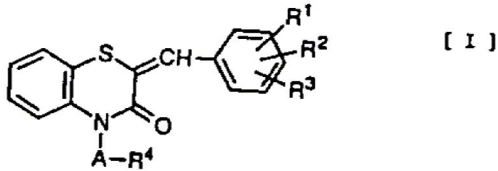
신규한 3-옥소-1, 4-벤조티아진 유도체

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

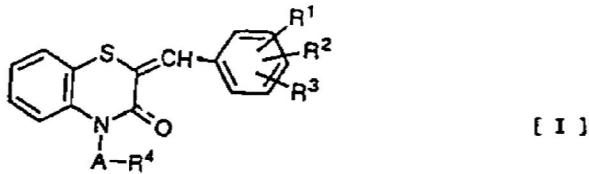
하기 일반식 [I]을 갖는 화합물 및 이의 염;



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 보호기로 보호될 수 있는 히드록시이고; R<sup>2</sup>는 저급 알킬이고; R<sup>3</sup>는 수소, 저급 알킬, 보호기로 보호될 수 있는 히드록시, 또는 저급 알콕시이며, 상기 저급 알킬은 보호기로 보호될 수 있는 히드록시, 아미노 또는 저급 알킬아미노로 치환될 수 있으며; R<sup>4</sup>는 테트라졸릴, 포스포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르 또는 설포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르이고; 및 A는 알킬렌이다.

**청구항 2**

하기 일반식 [I]의 화합물 및 이의 염;



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 저급 알카노일옥시, 저급 알콕시에틸옥시, 벤조일옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로 피라닐옥시 또는 트리메틸실릴옥시이며; R<sup>2</sup>는 저급 알킬이고; R<sup>3</sup>는 수소, 저급 알킬, 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로피라닐옥시, 트리메틸실릴옥시 또는 저급 알콕시이며, 상기 저급알킬은 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 저급알카노일옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로피라닐옥시, 트리메틸실릴옥시, 아미노 또는 저급 알킬아미노로 치환될 수 있으며; R<sup>4</sup>는 테트라졸리, 포스포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르, 또는 설포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르이며; 및 A는 알킬렌이다.

**청구항 3**

제2항에 있어서, R<sup>1</sup>이 히드록시인 화합물 및 이의 염.

**청구항 4**

제2항에 있어서, R<sup>1</sup>이 히드록시이고; R<sup>3</sup>가 저급 알킬 또는 히드록시 저급 알킬인 화합물 및 이의 염.

**청구항 5**

제2항에 있어서, R<sup>1</sup>이 히드록시이고; R<sup>3</sup>가 저급 알킬 또는 히드록시 저급 알킬이고; R<sup>4</sup>가 테트라졸릴, 포스포닐 또는 설포닐인 화합물 및 이의 염.

**청구항 6**

2-(3, 5-디-t-부틸-4-히드록시벤질리덴)-3,4-디히드로-3-옥소-4-포스포노메틸-2H-1, 4-벤조티아진.

**청구항 7**

2-(3, 5-디-t-부틸-4-히드록시벤질리덴)-3,4-디히드로-3-옥소-4-(1H-테트라졸-5-일메틸)-2H-1, 4-벤조티아진.

**청구항 8**

2-[5-t-부틸-3-(2-히드록시, -1, 1-디메틸에틸)-4-히드록시벤질리덴]-3,4-디히드로-3-옥소-4-(1H-테트라졸-5-일메틸)-2H-1, 4-벤조티아진.

**청구항 9**

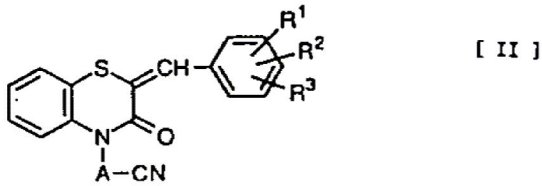
제1항의 화합물 또는 이의 염 및 약학적으로 허용가능한 담체를 포함하는 약학적 조성물.

**청구항 10**

제9항에서 정의된 조성물을 투여하는 것을 포함하는 백내장 치료 방법.

**청구항 11**

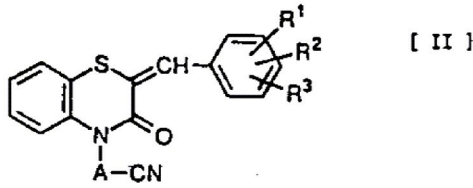
하기 일반식[III]을 갖는 화합물 및 이의 염;



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 보호기로 보호될 수 있는 히드록시이고; R<sup>2</sup>는 저급 알킬이고; R<sup>3</sup>는 수소, 저급 알킬, 보호기로 보호될 수 있는 히드록시, 아미노 또는 저급 알킬아미노로 치환될 수 있으며; 및 A는 알킬렌이다.

**청구항 12**

하기 일반식[II]의 화합물 및 이의 염;



상기 식에서, R<sup>1</sup>은 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 저급 알카노일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤조일옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로 피라닐옥시 또는 트리메틸실릴옥시이며; R<sup>2</sup>는 저급 알킬이고; R<sup>3</sup>는 수소, 저급 알킬, 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로피라닐옥시, 트리메틸실릴옥시 또는 저급 알콕시이며, 상기 저급알킬은 히드록시, 저급 알킬설포닐옥시, 아릴설포닐옥시, 저급알카노일옥시, 벤조일옥시, 저급 알콕시메틸옥시, 벤질옥시메틸옥시, 테트라히드로피라닐옥시, 트리메틸실릴옥시, 아미노 또는 저급 알킬아미노로 치환될 수 있으며; R<sup>4</sup>는 테트라졸리, 포스포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르, 또는 설포닐 또는 이의 저급 알킬 에스테르이며; 및 A는 알킬렌이다.

**청구항 13**

제12항에 있어서, R<sup>1</sup>이 히드록시인 화합물 및 이의 염.

**청구항 14**

제12항에 있어서, R<sup>1</sup>이 히드록시이고; R<sup>3</sup>가 저급 알킬 또는 히드록시 저급 알킬인 화합물 및 이의 염.

**청구항 15**

2-(3,5-디-t-부틸-4-히드록시벤질리덴)-4-시아노메틸-3,4-디히드로-3-옥소-2H-1, 4-벤소티아진.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.