

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

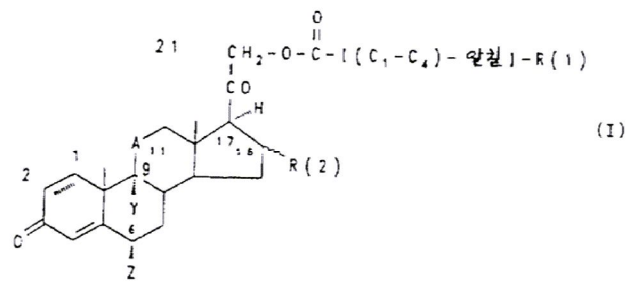
(51) Int. Cl. ⁶ C07J 9/00	(11) 공개번호 특 1996-0010681
	(43) 공개일자 1996년 04월 20일
(21) 출원번호	특 1995-0030850
(22) 출원일자	1995년 09월 20일
(30) 우선권주장	P4433374.9 1994년 09월 20일 독일(DE)
(71) 출원인	헥스트 아크티엔게젤샤프트 로제르트, 루츠 독일연방공화국 데-65926 프랑크푸르트 암 마인
(72) 발명자	올리히 슈타체 독일연방공화국 데-65719 호프하임 골트그라벤 20 한스-게오르크 알페르만 독일연방공화국 데-61462 퀴니히슈타인 암 아이크코프 10 만프레트 본 독일연방공화국 데-65719 호프하임 슈베리너 벡 10
(74) 대리인	이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 17-데옥시코르티코스테로이드-21-(0)- 카복실산 에스테르, 이의 제조방법 및 이를 함유하는 약제

요약

본 발명은 다음 일반식 (I)의 17-데옥시코르티코스테로이드-21-[0]-카복실산 에스테르, 이의 제조방법 및 이를 함유하는 약제에 관한 것이다.



상기 식에서, A, Y, Z, R(1) 및 R(2)는 명세서에서 정의한 바와 같다.
일반식 (I)의 화합물은 매우 강력한 국부 및 국소 소염 작용을 나타내며, 소염 효능의 국부/전신 비가 매우 우수하며, 종종 이 비는, 구조적으로 관련된, 21-에스테르 잔기에 어떠한 아릴 또는 헥사아릴 그룹도 수반하지 않는 코르티코이드 21-에스테르 또는 에스테르화되지 않은, 즉 유리 21-하이드록실 그룹을 포함하는 유사한 17-데옥시코르티코이드의 비에 의해 매우 우수하다.

명세서

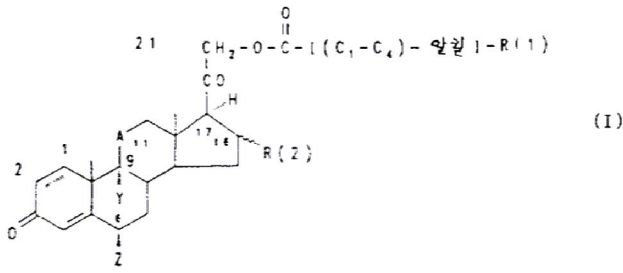
[발명의 명칭]
17-데옥시코르티코스테로이드-21-[0]-카복실산 에스테르, 이의 제조방법 및 이를 함유하는 약제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식 (I)의 17-데옥시시크로티코이드-21-카복실산 에스테르.



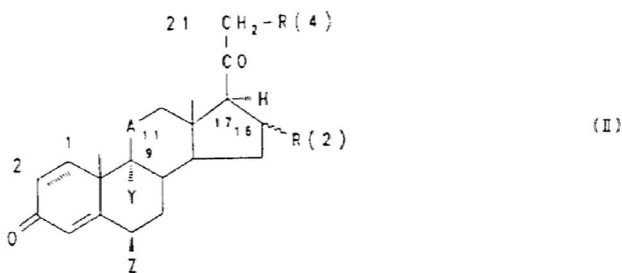
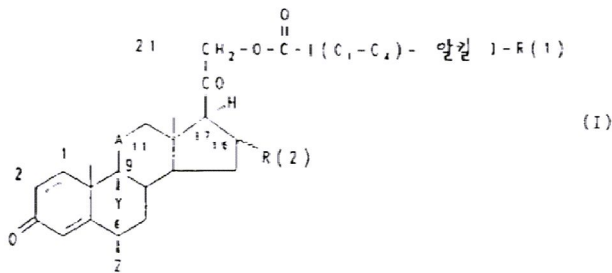
상기 식에서, A는 임의의 입체 배열 상태로 존재하는 CHOH 및 CHCl, CH₂, C=O 또는 9(11) 이중결합이고, Y는 수소, 불소 또는 염소이며, Z는 수소, 불소 또는 메틸이고, R(1)은 임의로 치환되거나 융합된 아릴 또는 헤테아릴이거나, 포화되거나, C₂에서 1회 불포화되거나, C₃에서 1회 이상 불포화되거나 또는 추가의 알킬그룹에 의해 환식으로 축쇄화되거나 헤테로 원자 O, S 또는 N에 의해 치환되거나 삽입된 [(C₁-C₄)-알킬][여기서, 1, 2위치는 포화되거나 불포화된(1,2-이중결합) 상태로 존재한다]이고, R(2)는 수소, α-메틸 또는 β-메틸이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R(1)이 제1항에서 정의한 바와 동일하고, A가(β 배열 상태로 존재하는)CHOH이고, Y가 F 이며, Z가 수소이고, R(2)가 α-메틸인 17-데옥시시크로티코이드-21-카복실산 에스테르.

청구항 3

(a)일반식 (II)의 화합물을 (a1) 일반식(III)의 활성화 카복실산, 바람직하게는 할라이드 또는 무수물 또는 아졸리드와 반응시키거나 또는 (a2)탈수제 (DCCl 등)의 존재하에 일반식(III)의 카복실산 자체와 반응 시키거나, (b)일반식(II)의 화합물을 일반식 (III)의 카복실산의 염, 바람직하게는 K또는 Na염 또는 트리알킬암모늄 염과 반응시켜 제1항에 I 서 청구한 일반식 (I)의 화합물을 제조하는 방법.



상기 식에서, A는임의의 입체 배열 상태로 존재하는 CHOH 및 CHCl, CH₂, C=O 또는 9(11) 이중결합이고, Y는 수소, 불소 또는 염소이며, Z는 수소, 불소 또는 메틸이고, R(1)은 임의로 치환되거나 융합된 아릴 또는 헤테아릴이거나, C₂에서 1회 포화되거나, 불포화되거나, C₃에서 1회 이상 불포화되거나 또는 추가의 알킬그룹에 의해 환식으로 축쇄화되거나 헤테로원자 O, S또는 N에 의해 치환되거나 삽입된 [(C₁-V₄)-알킬][여기서, 1,2위치는 포화되거나 불포화되거나 불포화된 (1,2-이중결합) 상태로 존재한다.]이고, R(2)는 수소, α-메틸 또는 β-메틸이며, R(4)는 방법 (a)에서는 OH이고, 방법 (b)에서는 Br, I 또는 설포산 아릴 에스테르 그룹 또는 설포산 알킬 에스테르 그룹이며, R(5)는 방법(a1)에서는 C1, Br, -O[-CO-[(C₁-C₄)-알킬]-R(1)]_n, -OC(O)CF₃또는 다른 활성화 산 라디칼이고, 방법(a2)에서는 OH이며, 방법(b)에서는 -[O⁻Me⁺](여기서, Me⁺는 바람직하게는 알칼리 금속염 또는 트리알킬암모늄 염의 양이온이다)이다.

청구항 4

제1항 에서 청구한 일반식 (I)의 화합물을 유효량 함유하는 약재.

청구항 5

약제학적으로 통상적인 첨가제와 배합된 제1항에서 청구한 일반식 (I)의 화합물 유효량을 손상된 피부

부위에 처리하여 피부 질환을 치료하는 방법.

청구항 6

피부 질환 치료용 약제를 제조하기 위한, 제 1항에서 청구한 일반식 (1)의 화합물의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.