

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

| | | |
|-------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| (51) Int. Cl. ⁴ C07C 143/78 | (11) 공개번호 (43) 공개일자 | 특 1988-0013886 1988년 12월 22일 |
| (21) 출원번호 | 특 1988-0006342 | |
| (22) 출원일자 | 1988년 05월 28일 | |
| (30) 우선권 주장 | 8712647 1987년 05월 29일 영국(GB) 8724903 1987년 10월 23일 영국(GB) 8800871 1988년 01월 15일 영국(GB) | |
| (71) 출원인 | 후지사와 야구형 고교 가부시끼가이샤 후지사와 도모끼찌로 | |
| (72) 발명자 | 일본국 오사까시 히가시구 도쇼마찌 4쵸메 3 마쓰오 마사아끼 일본국 도요나까시 나까사꾸라즈까 5-2-1-619 쓰지 기요시 일본국 기시와따시 하따쵸 170 고니시 노부끼요 일본국 나가오까교시 아오타나이 22-7 오꾸무라 히로유키 일본국 이바라끼시 미즈오 1-15-28 | |
| (74) 대리인 | 이세진, 장수길 | |

심사청구 : 없음

(54) 신규 알칸술폰아닐리드 유도체, 그의 제조방법 및 이를 함유하는 제약 조성물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

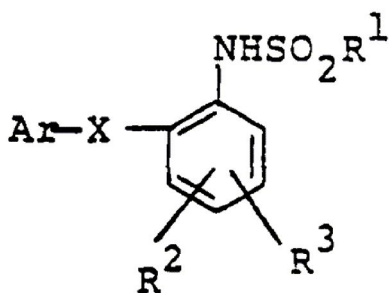
신규 알칸술폰아닐리드 유도체, 그의 제조방법 및 이를 함유하는 제약 조성물

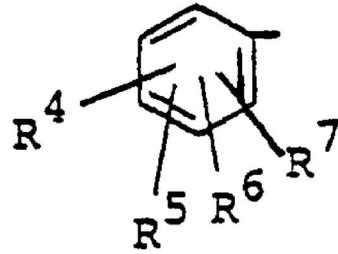
본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식으로 표시되는 알칸술폰아닐리드 유도체 및 그의 제약상 허용되는 염류.

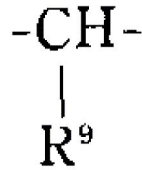




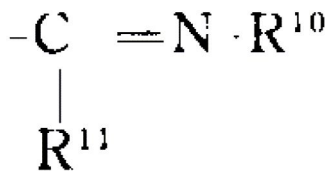
상기 식중 Ar은 일반식 Ar 의 기로서, 여기에서 R^4 , R^5 , R^6 및 R^7 은 각각 수소, 할로겐, 할로(저급)알킬 또는 저급 알콕시기이거나, 또는 할로겐 또는 저급 알킬기를 가질 수 있



는 헤테로시클릭기이고, X는 (여기에서 n은 0, 1 또는 2임), (여기에서 R^8 은 수소

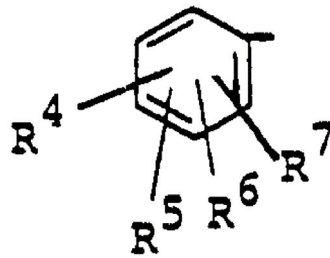


또는 저급 알킬기임), $-\text{CO}-$, $-\text{NHCO}-$, $-\text{CONH}-$ 또는 $-\text{R}^9$ (여기에서 R^9 은 수소 또는 히드록시기임)이고, R^1 은 저급알킬 또는 할로(저급)알킬기이고, R^2 은 아실, 시아노, 카복시, (저급)알킬(이 기는 히드록시, 아미노 및 벤질기 중에서 선택되는 1개 이상의 치환체를 가질 수 있음), 저급 알킬티오, 저급 알킬술폰, 저급 알카노일(저급)알케닐, 헤테로시클릭기(이 기는 아미노 또는 저급 알킬술폰아미노기를 가질 수 있음), 또는 하기 일반식의 기



[여기에서 R^{10} 은 히드록시, 우레이도 또는 저급 알콕시기이고, R^{11} 은 저급 알킬기임)이고, R^3 은 수소, 니트로, 저급 알킬 또는 저급 할로겐이다.

청구항 2

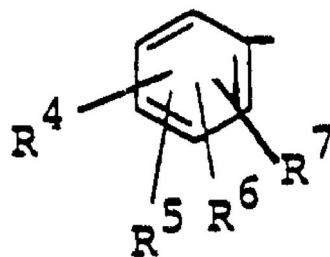


제1항에 있어서, Ar이 일반식 Ar 의 기인 화합물. (여기에서 R^4 내지 R^7 은 각각 제1항에서 정

청구항 3

제2항에 있어서, R^4 및 R^5 가 각각 할로겐이고, R^6 및 R^7 이 각각 수소인 화합물.

청구항 4



제1항에 있어서, Ar이 일반식 Ar 의 기이고, X가 $-\text{S}-$ 또는 $-\text{NH}-$ 이고, R^1 이 저급 알킬기이고, R^2 가 아실기이고, R^3 이 수소인 화합물. (여기에서 R^4 및 R^5 는 각각 할로겐이고, R^6 및 R^7 은 각각 수소임)

청구항 5

제4항에 있어서, R^2 가 저급 알카노일기인 화합물.

청구항 6

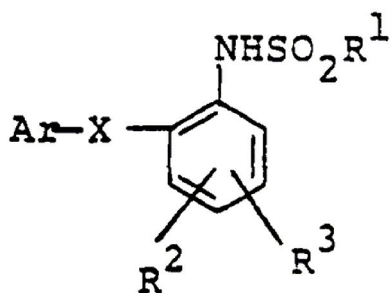
제4항에 있어서, R^1 이 메틸기이고, R^2 가 아세틸기인 화합물.

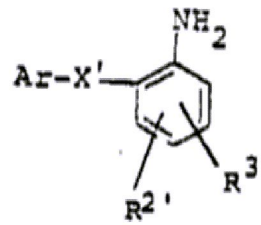
청구항 7

제1항에 있어서, 4'-아세틸-2'-(2, 4-디플루오로페닐티오)메탄술폰아닐리드 또는 4'-아세틸-2'-(2, 4-디플루오로페닐아미노)메탄술폰아닐리드인 화합물.

청구항 8

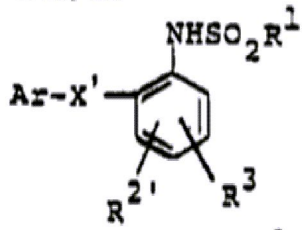
하기 일반식(II)의 화합물 또는 그 염을 하기 일반식(III)의 술폰화제 또는 그의 반응성 유도체와 반응시켜서 하기 일반식(I^a)의 화합물 또는 그 염을 얻거나, 또는 하기 일반식(I^b)의 화합물 또는 그 염을 하기 일반식(IV)의 아민 화합물 또는 그 염과 반응시켜서 하기 일반식(I^c)의 화합물 또는 그 염을 얻거나, 또는 하기 일반식(I^d)의 화합물 또는 그 염을 환원시켜서 하기 일반식(I^e)의 화합물 또는 그 염을 얻는 것으로 되는 하기 일반식(I)로 표시되는 화합물 및 그 염의 제조방법.



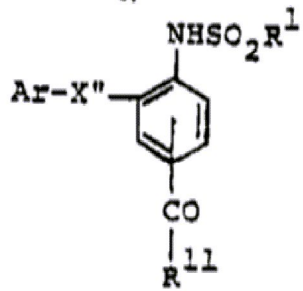


(II)

R^1SO_2OH



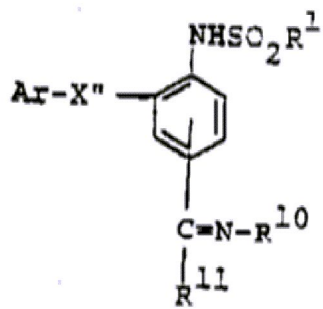
^a
(I)



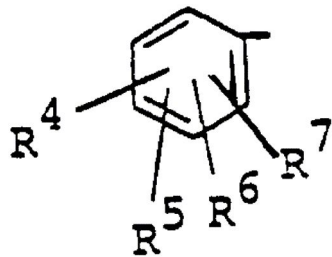
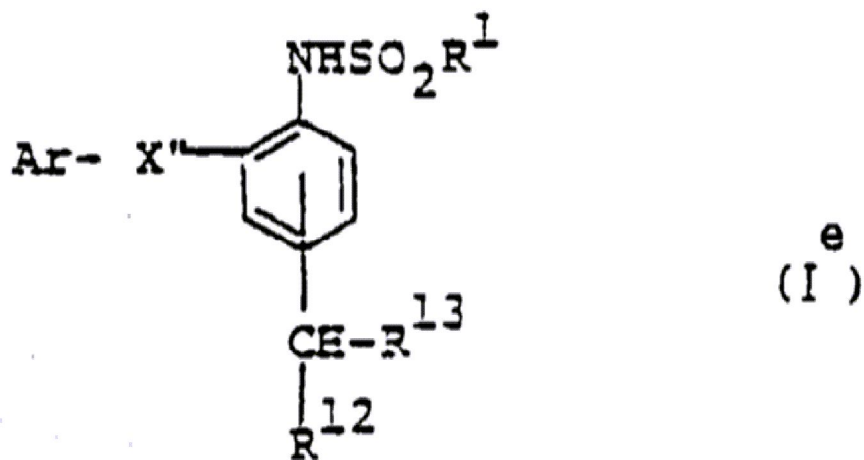
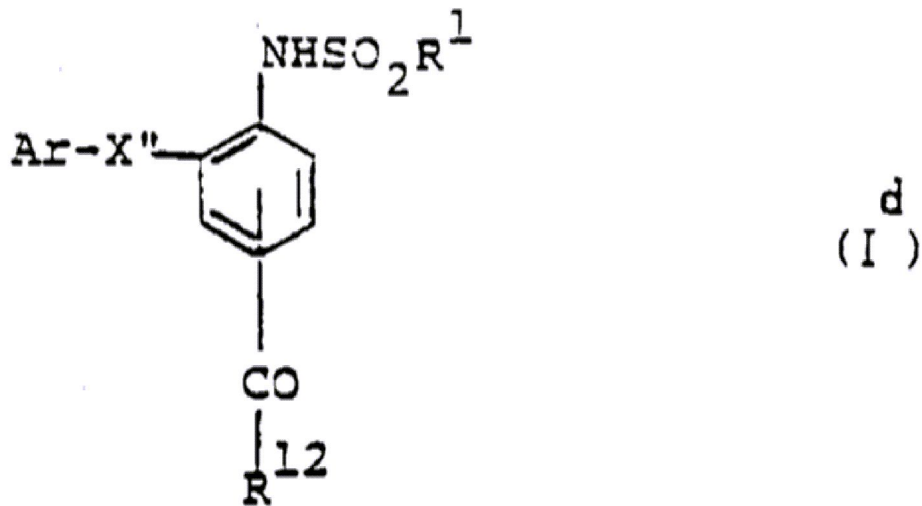
^b
(I)

H_2N-R^{10}

(IV)



^c
(I)

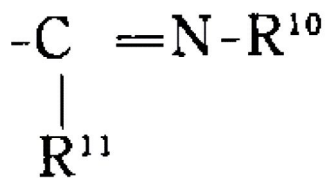


상기 식중 Ar은 일반식 C_6H_4 의 기로서, 여기에서 R^4 , R^5 , R^6 및 R^7 은 각각 수소, 할로겐, 할로(저급)알킬 또는 저급 알콕시기이거나, 또는 할로겐 또는 저급 알킬기를 가질 수 있

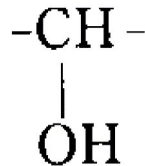
는 헤테로시클릭기이고, X는 $\text{-(O)}_n\text{-S-}$ (여기에서 n은 0, 1 또는 2임), $\text{-N-R}^8\text{-}$ (여기에서 R^8 은 수

소 또는 저급 알킬기임), $\text{-CH-R}^9\text{-}$ (여기에서 R^9 은 수소 또는 히드록시기 임)이고, R^1 은 저급알킬 또는 할로(저급)알킬기이고, R^2 는 아실, 시아노, 카르복시, (저급)알킬(이 기는 히드록시, 아미노 및 벤질기 중에서 선택되는 1개 이상의 치환체를 가질 수 있음), 저급 알킬티오, 저급 알킬술폰, 저급 알카노일(저급)알케닐, 헤테로시클릭기(이 기는 아미노 또는 저급 알킬술폰아미

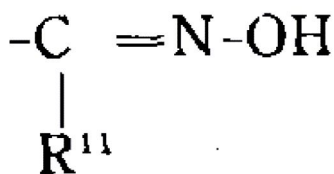
노기를 가질 수 있음), 또는 하기 일반식의 기



[여기에서 R^{10} 은 히드록시, 우레이도 또는 저급 알콕시기이고, R^{11} 은 저급 알킬기임]이고, R^3 은 수소,



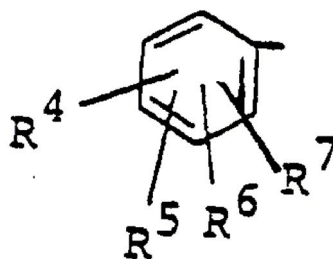
니트로, 저급 알킬 또는 저급 할로겐이고, X' 는 OH 를 제외하고는 X에서 정의한 바와 같고, X'' 는 $-\text{CO}-$ 를 제외하고는 X에서 정의한 바와 같고, R^{12} 는 수소, 저급 알킬 또는 벤질기이고, R^{13} 은 히드록시 또는 아미노기이고, R^{21} 는 히드록시 또는 아미노기를 갖는 저급 알킬, 아미노기를 갖는 헤테로시클릭기



또는 일반식

의 기를 제외하고는 R2에서 정의한 바와 같다.

청구항 9



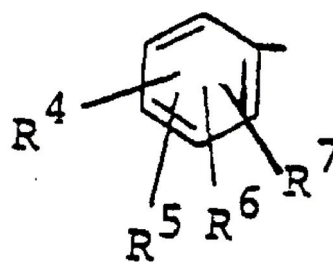
제8항에 있어서, Ar이 일반식 의한 바와 같음)의 기인 방법.

(여기에서 R^4 내지 R^7 은 각각 제8항에서 정

청구항 10

제9항에 있어서, R^4 및 R^5 가 각각 할로겐이고, R^6 및 R^7 이 각각 수소인 방법.

청구항 11



제8항에 있어서, Ar이 일반식 (여기에서 R^4 및 R^5 는 각각 할로겐이고, R^6 및 R^7 은 각각 수소임)의 기이고, X가 $-\text{S}-$ 또는 $-\text{NH}-$ 이고, R^1 이 저급 알킬기이고, R^2 및 R^{21} 가 아실기이고, R^3 이 수소인 방법.

청구항 12

제11항에 있어서, R^2 및 R^{21} 가 저급 알카노일기인 방법.

청구항 13

제11항에 있어서, R^1 이 메틸기이고, R^2 및 R^{21} 가 아세틸기인 방법.

청구항 14

유효성분으로서 제1항에 의한 알칸술폰아닐리드 유도체 또는 그의 제약상 허용되는 염을 1개 이상 함유하는 제약 조성물.

청구항 15

유효 성분으로서 제1항에 의한 알칸술폰아닐리드 유도체 또는 그의 제약상 허용되는 염을 1개 이상 함유하는 소염 조성물.

청구항 16

유효 성분으로서 제1항에 의한 알칸술폰아닐리드 유도체 또는 그의 제약상 허용되는 염을 1개 이상 함유하는 진통 조성물.

청구항 17

의약품으로서 용도의 제1항에 의한 화합물 또는 그의 제약상 허용되는 염류.

청구항 18

염증 또는 통증의 치료 또는 예방 용도의 제1항에 의한 화합물 또는 그의 제약상 허용되는 염류.

청구항 19

제1항에 의한 화합물 및 그의 제약상 허용되는 염의 의약품 제조 및 염증 또는 통증 치료 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.