

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 국제특허출원의 출원공개공보(A)

(51) Int. Cl.⁶

C07D 279/12

A61K 31/54

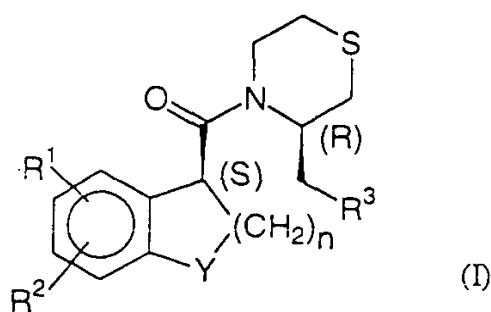
(11) 공개번호 특1995-0702972

(43) 공개일자 1995년08월23일

(21) 출원번호	특1995-0700804	(87) 국제공개번호	WO 94/005646
(22) 출원일자	1995년02월28일	(87) 국제공개일자	1994년03월17일
번역문제출일자	1995년02월28일		
(86) 국제출원번호	PCT/JP 93/001210	(87) 국제공개번호	WO 94/005646
(86) 국제출원출원일자	1993년08월27일	(87) 국제공개일자	1994년03월17일
(81) 지정국	EP 유럽특허 : 오스트리아 벨기에 스위스(리히텐슈타인) 독일 덴마크 스페인 프랑스 그리스 영국 아일랜드 이태리 룩셈부르크 모나코 네 델란드 포르투갈 스웨덴 국내특허 : 호주 캐나다 체코 핀란드 헝가리 대한민국 노르웨이 뉴질 랜드 러시아연방 미국		
(30) 우선권 주장	92-229970 1992년08월28일 일본(JP)		
(71) 출원인	상교 가부시끼가이샤(SANKYO COMPANY, LIMITED.) 가와무라 요시부미 일본국 도오교도 주오구 니혼바시혼쵸 3쵸메 5방 1고		
(72) 발명자	데라다 아쓰스게 일본국 도오교도 시나가와구 히로마찌 1쵸메 2방 58고 상교 가부시끼가이샤 나이 이이즈카 요시오 일본국 도오교도 시나가와구 히로마찌 1쵸메 2방 58고 상교 가부시끼가이샤 나이 와찌 가즈유키 일본국 도오교도 시나가와구 히로마찌 1쵸메 2방 58고 상교 가부시끼가이샤 나이 후지바야시 겐지 일본국 도오교도 시나가와구 히로마찌 1쵸메 2방 58고 상교 가부시끼가이샤 나이		
(74) 대리인	이준구, 박해선		

심사청구 : 없음(54) 광학활성 카르복실산 아미드 유도체(OPTICALLY ACTIVE CARBOXYAMIDE DERIVATIVE)요약

일반식



(식중, R¹은 수소원자 또는 할로겐원자를 나타내고, R²은 할로겐원자를 나타내고, R³은 피롤리디노기 또는 피페리디노기를 나타내고, Y는 메틸렌기 또는 카르보닐기를 나타내고 n은 1또는 2를 나타낸다.)를 갖는 광학활성인 카르복실산 아미드 유도체 또는 그의 약리상 허용되는 염이 화합물은 뛰어난 진통 작용을 갖고 진통제로서 유용하다.

명세서

[발명의 명칭]

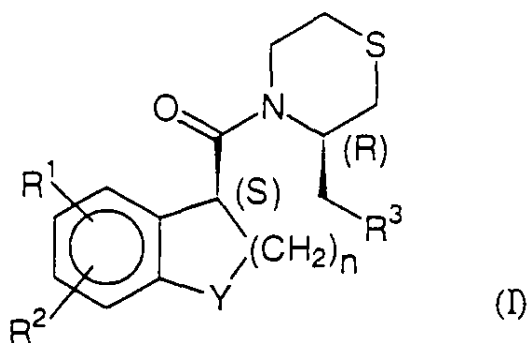
광학활성 카르복실산 아마이드 유도체(OPTICALLY ACTIVE CARBOXYAMIDE DERIVATIVE)

본 내용은 요구공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식



(식중, R^1 은 수소원자 또는 할로겐원자를 나타내고, R^2 은 할로겐원자를 나타내고, R^3 은 피롤리디노기 또는 피페리디노기를 나타내고, Y는 메틸렌기 또는 카르보닐기를 나타내고 n은 1 또는 2를 나타낸다.)를 갖는 광학활성인 카르복실산 아마이드 유도체 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 2

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자인 화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, R^2 가 불소원자 또는 염소원자인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서, R^3 이 피롤리디노기인 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서, Y가 메틸렌기인 화합물.

청구항 6

제1항에 있어서, n이 1인 화합물.

청구항 7

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자인 화합물.

청구항 8

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y가 메틸렌기인 화합물.

청구항 10

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, n이 1인 화합물.

청구항 11

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메틸렌기인 화합물.

청구항 12

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 13

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 14

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 15

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자인 화합물.

청구항 16

제1항에 있어서, R^2 가 염소원자인 화합물.

청구항 17

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 화합물.

청구항 18

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 화합물.

청구항 19

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기인 화합물.

청구항 20

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n 이 1인 화합물.

청구항 21

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기인 화합물.

청구항 22

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 23

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 24

제1항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이고, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 25

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자인 화합물.

청구항 26

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 화합물.

청구항 27

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이고 R^3 이 피롤리디노기인 화합물.

청구항 28

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기인 화합물.

청구항 29

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n 이 1인 화합물.

청구항 30

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기인 화합물.

청구항 31

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 32

제1항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 화합물.

청구항 33

(3R)-3-(1-피롤리딘메틸)-4-[(1S)-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 34

(3R)-3-(1-피롤리딘메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 35

(3R)-3-(1-피롤리딘메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일] 티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 36

(3R)-3-(1-피페리딘메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-1,2,3,4-테트라히드로-1-나프토일] 티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 37

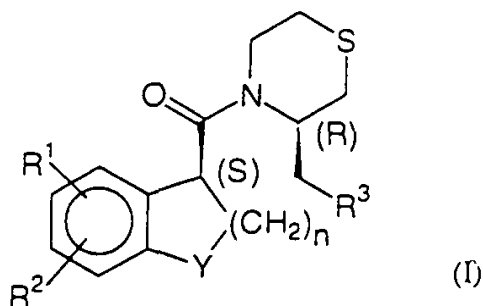
(3R)-3-(1-피페리딘메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일] 티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 38

(3R)-3-(1-피페리딘메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5-클로로-1-인단카르보닐]티오모르폴린 또는 그의 약리상 허용되는 염.

청구항 39

일반식



(식중, R^1 은 수소원자 또는 할로겐원자를 나타내고, R^2 은 할로겐원자를 나타내고, R^3 은 피롤리디노기 또는 피페리디노기를 나타내고, Y 는 메틸렌기 또는 카르보닐기를 나타내고, n 은 1또는 2를 나타낸다.)를 갖는 광학 활성인 카르복실산 아마이드 유도체 또는 그의 약리상 허용되는 염을 유효성분으로 하는 진통제.

청구항 40

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자인 진통제.

청구항 41

제39항에 있어서, R^2 가 불소원자 또는 염소원자인 진통제.

청구항 42

제39항에 있어서, R^3 이 피롤리디노기인 진통제.

청구항 43

제39항에 있어서, Y가 메틸렌기인 진통제.

청구항 44

제39항에 있어서, n이 1인 진통제.

청구항 45

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자인 진통제.

청구항 46

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기 진통제물.

청구항 47

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y가 메틸렌기인 진통제.

청구항 48

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, n이 1인 진통제.

청구항 49

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메틸렌기인 진통제.

청구항 50

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n이 1인 진통제.

청구항 51

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y가 메틸렌기이며, n이 1인 진통제.

청구항 52

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메틸렌기이며, n이 1인 진통제.

청구항 53

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자인 진통제.

청구항 54

제39항에 있어서, R^2 가 염소원자인 진통제.

청구항 55

제39항에 있어서, R^1 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 진통제.

청구항 56

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 진통제.

청구항 57

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y가 메틸렌기인 진통제.

청구항 58

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n이 1인 진통제.

청구항 59

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메

틸렌기인 진통제.

청구항 60

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 진통제.

청구항 61

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 진통제.

청구항 62

제39항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이고, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 진통제.

청구항 63

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자인 진통제.

청구항 64

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 진통제.

청구항 65

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 진통제.

청구항 66

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기인 진통제.

청구항 67

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n 이 1인 진통제.

청구항 68

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기인 진통제.

청구항 69

제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 진통제.

청구항 70

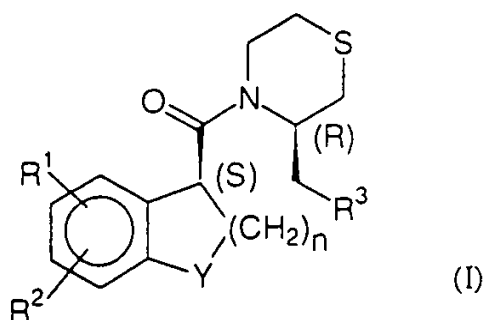
제39항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 진통제.

청구항 71

(3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피페리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-1,2,3,4-테트라히드로-1-나프토일] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피페리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5-클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린 또는 그것들의 약리상 허용되는 염을 유효 성분으로 하는 진통제.

청구항 72

일반식



(식중, R^1 은 수소원자 또는 할로겐원자를 나타내고, R^2 는 할로겐원자를 나타내고, R^3 은 피롤리디노기 또는 피페리디노기를 나타내고, Y는 메틸렌기 또는 카르보닐기를 나타내고, n은 1또는 2를 나타낸다.)를 갖는 광학활성인 카르복실산 아마이드 유도체 또는 그의 약리상 허용되는 염을 유효성분으로 하는 k-리셉터 애거니스트.

청구항 73

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 74

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 75

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y가 메틸렌기인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 76

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, n이 1인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 77

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메틸렌기인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 78

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n이 1인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 79

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, Y가 메틸렌기이며, n이 1인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 80

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자, 불소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 불소원자 또는 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y가 메틸렌기이며, n이 1인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 81

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 82

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 83

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y가 메틸렌기인 k-리셉터 애거니스트.

청구항 84

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 85

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 86

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 87

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 88

제72항에 있어서, R^1 이 수소원자 또는 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 89

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 90

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 91

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 92

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 93

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 94

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, Y 가 메틸렌기인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 95

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, R^3 이 피롤리디노기이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 96

제72항에 있어서, R^1 이 염소원자이며, R^2 가 염소원자이며, Y 가 메틸렌기이며, n 이 1인 k -리셉터 애거니스트.

청구항 97

(3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5,6-디클로로-1-인단카르보닐] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일] 티오모르폴린, (3R)-3-(1-피페리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-1,2,3,4-테트라히드로-1-나프토일] 티오모르폴린, (3R) - 3-(1-피페리디닐메틸)-4-[(1S)-6,7-디클로로-4(3H)-옥소-1,2-디히드로-1-나프토일]티오모르폴린, (3R) - 3-(1-피롤리디닐메틸)-4-[(1S)-3-옥소-5-클로로-1-인단카르보닐] 디오모르폴린 또는 그것들의 약리상 허용되는 염을 유효 성분으로 하는 k -리셉터 애거니스트.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.