

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07D 311/22	(11) 공개번호 특 1989-0006610
	(43) 공개일자 1989년 06월 14일
(21) 출원번호	특 1988-0013144
(22) 출원일자	1988년 10월 08일
(30) 우선권주장	소 62-254251 1987년 10월 08일 일본(JP)
	소 63-119990 1988년 05월 17일 일본(JP)
(71) 출원인	도야마 케미칼 캄파니 리미티드
(72) 발명자	일본국 도오교 신주꾸-꾸 니시신주꾸 3-쵸메 2-5 다까노 순따로
	일본국 도야마-시 이나리모또마찌-3-쵸메 8-44-607 요시다 쵸사꾸
	일본국 다카오까-시 구마노마찌 5-27 이나바 다끼히로
	일본국 나메리가와-시 다까쵸까 1823 다나까 게이이찌
	일본국 도야마-시 시모신끼따마찌 1-31 다께노 류꼬
	일본국 도야마-겐 나까니이가와-군 다떼야마마찌 리따 2441-1 나가끼 히데요시
	일본국 도야마-시 야마우로 252-2 시모또리 도야마
	일본국 도야마-시 고수기 175-3 마끼노 신지
(74) 대리인	일본국 구로베-시 미까이찌 3490 이병호, 최달용

심사청구 : 있음

(54) 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염, 이의 제조방법, 및 활성성분으로 이를 함유하는 억제학적 조성물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

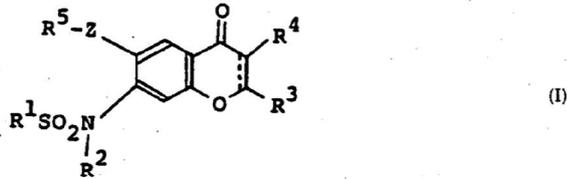
4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염, 이의 제조방법, 및 활성성분으로 이를 함유하는 억제학적 조성물

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐그룹이고; R⁴는 수소 또는 할로겐 원자이거나, 니트로, 시아노, 카복실, 아실, 하이드록실 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 알킬티오, 페닐티오, 저급 알킬닐, 저급알케닐, 설파모일, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 아미디노, 페닐 또는 헤

테로사이클릭그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} -N & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \end{matrix}$ 또는 $\begin{matrix} -CON & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설포닐, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이미노그룹이며; 점선은 단일 또는 이중 결합을 의미한다.

청구항 2

제1항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급알킬 또는 저급알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³ 및 R⁴는 동일하거나 상이할 수 있으며, 수소원자, 카바모일, 카복실, 포르밀, 하이드록실 또는 알콕시 카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시 또는 페닐 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이며; 점선은 이중 결합을 의미하는 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 3

제1항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급알케닐 그룹이고; R²는 수소원자, 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카바모일, 카복실, 하이드록실, 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁴

는 일반식 $\begin{matrix} -N & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자이거나, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 또는 사이클로알킬 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 4- 내지 6-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이며; 점선은 이중 결합을 의미하는 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 4

제1항 내지 제3항중 어느 한 항에 있어서, Z가 산소원자인 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급알킬 그룹인 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 있어서, R²이 수소원자인 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 7

제1항 내지 제6항중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 일반식 (I)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 8

제1항에 있어서, R⁴가 치환되거나 비치환된 알킬티오, 페닐티오, 알킬설피닐 또는 알킬설포닐 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} -N & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \\ & \text{또는} & -CON & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶ 및 R⁷은 제1항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 일반식 (1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 9

제1항에 있어서, R⁴가 알킬티오, 포르밀아미노 또는 카바모일 그룹인 일반식 (1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 10

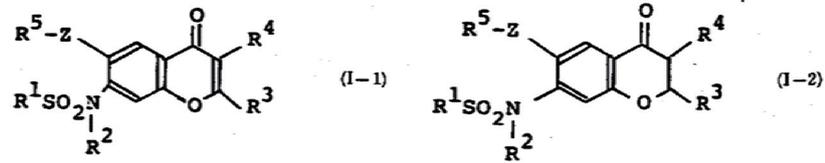
제9항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 일반식 (1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 11

제10항에 있어서, R⁵가 할로겐 원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 일반식 (1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염.

청구항 12

하기 일반식 (1-2)의 화합물 또는 이의 염을 탈수소화시킴을 특징으로 하여, 하기 일반식 (1-1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급알킬, 저급알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐그룹이고; R⁴는 수소 또는 할로겐 원자이거나, 니트로, 시아노, 카복실, 아실, 하이드록실 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 알킬티오, 페닐티오, 저급알킬닐, 저급알케닐, 설파모일, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 아미디노, 페닐 또는 헤테

로사이클릭 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} -N & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \\ & \text{또는} & -CON & \begin{matrix} R^6 \\ R^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설포닐, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이미노 그룹이다.

청구항 13

제12항에 있어서, 탈수소화 반응을 탈수소화제를 사용하여 수행하는 방법.

청구항 14

제13항에 있어서, 탈수소화제가 2,3-디클로로-5,6-디시아노-1,4-벤조퀴논, 클로라닐, 트리틸 퍼클로레이트, 트리틸 플루오로보레이트, 이산화셀레늄 또는 팔라듐-탄소인 방법.

청구항 15

제12항에 있어서, 탈수소화 반응을, 화합물을 할로겐화제와 반응시킨후, 할로겐화 생성물을 염기와 반응시킴으로써 수행하는 방법.

청구항 16

제15항에 있어서, 할로겐화제가 염소, 브롬 또는 설퍼릴 클로라이드이고, 염기는 트리에틸아민, 1,8-디아자비사이클로[5.4.0]운데르-7-엔, 피리딘, 탄산나트륨 또는 탄산칼륨인 방법.

청구항 17

제12항 내지 제16항중 어느 한 항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³ 및 R⁴는 동일하거나 상이할 수 있으며, 수소원자, 카바모일, 카복실, 포르밀, 하이드록실 또는 알콕시 카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시 또는 페닐 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 18

제12항 내지 제16항중 어느 한 항에 있어서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카바모일, 카복실, 하이드록실, 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시,

아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁴는 일반식 $\begin{matrix} -N-R^6 \\ | \\ -R^7 \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소 원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬 또는 사이클로알킬 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 4- 내지 6-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 19

제12항 내지 제18항중 어느 한 항에 있어서, Z가 산소 원자인 방법.

청구항 20

제12항 내지 제19항중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 21

제12항 내지 제20항중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 22

제12항 내지 제21항중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 23

제12항에 있어서, R⁴가 치환되거나 비치환된 알킬티오, 페닐티오, 알킬설피닐 또는 알킬설포닐 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} -N-R^6 \\ | \\ -R^7 \end{matrix}$ 또는 $\begin{matrix} -CON-R^6 \\ | \\ -R^7 \end{matrix}$ (여기에서, R⁶ 및 R⁷은 제12항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 방법.

청구항 24

제23항에 있어서, R⁴가 알킬티오, 포르밀아미노 또는 카바모일 그룹인 방법.

청구항 25

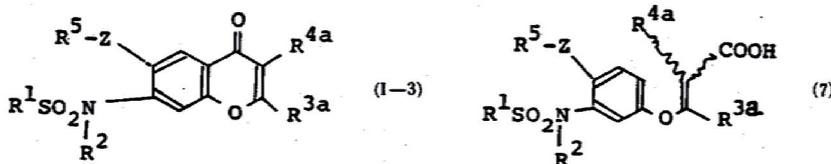
제24항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 26

제25항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹 중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 27

하기 일반식(7)의 화합물 또는 이의 염을 폐환 반응시킴 특징으로 하여, 하기 일반식(1-3)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염을 제조하는 방법:



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실 그룹이며; R^{3a} 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로

알킬 또는 페닐 그룹이고; R^{4a}는 수소원자, 알콕시카보닐, 시아노 또는 아실 그룹이거나, 치환되거나 비치환된 알킬 또는 페닐 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} -\text{CON} < \begin{matrix} \text{R}^6 \\ \text{R}^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설폰일, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소 원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이미노그룹이며, mm 는 (E)이성체, (Z)이성체 또는 이의 혼합물을 의미한다.

청구항 28

제27항에 있어서, 폐환 반응을 촉합제를 사용하여 수행하는 방법.

청구항 29

제28항에 있어서, 촉합제가 할로게노설폰산, 황산무수물, 오산화인, 폴리인산, 염화아연, 진한 황산 또는 진한 황산-아세틸 클로라이드인 방법.

청구항 30

제27항에 있어서, 폐환 반응을, 화합물을 산-할로겐화제와 반응시킨후, 생성물을 프리델-크래프트(Friedel-Crafts) 반응시킴으로써 수행하는 방법.

청구항 31

제30항에 있어서, 산-할로겐화제가 티에닐 클로라이드 또는 오염화인인 방법.

청구항 32

제27항 내지 제31항중 어느 한 항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R^{3a}는 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬 또는 페닐 그룹이고, R^{4a}는 수소원자, 카바모일 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 33

제27항 내지 제32항 중 어느 한 항에 있어서, Z가 산소 원자인 방법.

청구항 34

제27항 내지 제33항 중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 35

제27항 내지 제34항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 36

제27항 내지 제35항 중 어느 한 항에 있어서, R^{3a}가 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 37

제27항에 있어서, R^{4a}가 일반식 $\begin{matrix} -\text{CON} < \begin{matrix} \text{R}^6 \\ \text{R}^7 \end{matrix} \end{matrix}$ (여기에서, R⁶ 및 R⁷은 제27항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 방법.

청구항 38

제27항에 있어서, R^{4a}가 카바모일 그룹인 방법.

청구항 39

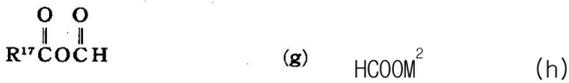
제38항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 40

제39항에 있어서, R⁵가 할로겐 원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 41

제41항에 있어서, 환-형성제가 하기 일반식(g) 및 (h)의 화합물들의 혼합물인 방법.



상기식에서, R¹⁷은 저급 알킬 그룹이고; M²는 알칼리 금속이다.

청구항 48

제41항에 있어서, 환-형성제가 하기 일반식(i)의 화합물인 방법.



상기식에서, R¹⁷은 저급 알킬 그룹이다.

청구항 49

제41항 내지 제48항 중 어느 한 항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³ 및 R⁴는 동일하거나 상이할 수 있으며, 수소원자, 카바모일, 카복실, 포르밀, 하이드록실 또는 알콕시 카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시 또는 페닐 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 50

제4항 내지 제49항 중 어느 한 항에 있어서, Z가 산소 원자인 방법.

청구항 51

제41항 내지 제50항 중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 52

제41항 내지 제51항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 53

제41항 내지 제52항 중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 54

제41항에 있어서, R⁴가 치환되거나 비치환된 알킬티오, 페닐티오, 알킬설피닐 또는 알킬설포닐 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{array}{c} \text{R}^6 \\ \text{---N} \\ \text{R}^7 \end{array}$ 또는 $\begin{array}{c} \text{R}^6 \\ \text{---CON} \\ \text{R}^7 \end{array}$ (여기에서, R⁶ 및 R⁷은 제41항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 방법.

청구항 55

제54항에 있어서, R⁴가 알킬티오, 포르밀아미노 또는 카바모일 그룹인 방법.

청구항 56

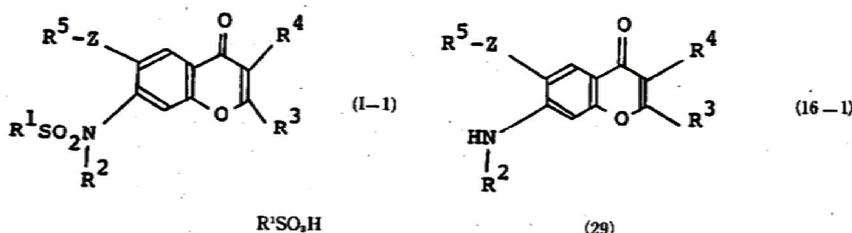
제55항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 57

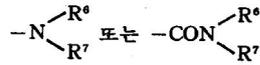
제56항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 58

하기 일반식(16-1)의 화합물 또는 이의 염을 하기 일반식(29)의 화합물의 반응성 유도체와 반응시킴을 특징으로 하여, 일반식(1-1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁴는 수소 또는 할로겐 원자이거나, 니트로, 시아노, 카복실, 아실, 하이드록실 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 알킬티오, 페닐티오, 저급 알킬닐, 저급 알케닐, 설파모일, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 아미디노, 페닐 또는



헤테로사이클릭그룹이거나, 또는 일반식 (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설포닐, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황 원자이거나, 또는 이미노그룹이다.

청구항 59

제58항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³ 및 R⁴는 동일하거나 상이할 수 있으며, 수소원자, 카바모일, 카복실, 포르밀, 하이드록실 또는 알콕시 카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시 또는 페닐 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 60

제58항 또는 제59항에 있어서, Z가 산소 원자인 방법.

청구항 61

제58항 또는 제60항 중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 62

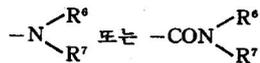
제58항 내지 제61항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 63

제58항 내지 제62항 중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 64

제58항에 있어서, R⁴가 치환되거나 비치환된 알킬티오, 페닐티오, 알킬설피닐 또는 알킬설포닐 그룹이거나,



나, 또는 일반식 (여기에서, R⁵ 및 R⁷은 제58항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 방법.

청구항 65

제64항에 있어서, R⁴가 알킬티오, 포르밀아미노 또는 카바모일 그룹인 방법.

청구항 66

제66항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

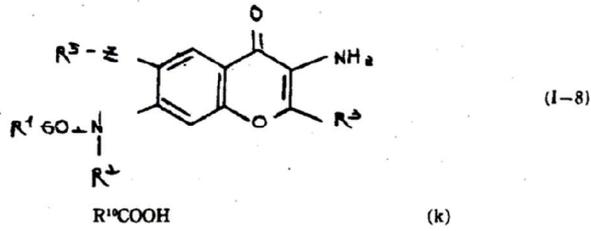
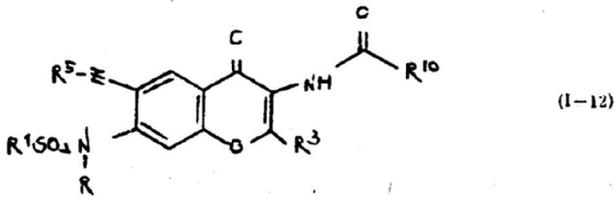
청구항 67

제66항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 68

하기 일반식(41-1)의 화합물 또는 이의 염을 하기 일반식(30)의 화합물의 반응시킴을 특징으로 하여, 일

제조하는 방법.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; R¹⁰은 수소원자 또는 알콕시 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이크로알킬, 아실, 알콕시 카보닐 또는 페닐 그룹이며; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이민노그룹이다.

청구항 78

제77항에 있어서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자, 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카바모일, 카복실, 하이드록실, 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; R¹⁰은 수소원자 또는 알콕시 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이크로알킬, 아실, 또는 페닐 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자방법.

청구항 79

제77항 또는 제78항에 있어서, Z가 산소 또는 황원자인 방법.

청구항 80

제77항 또는 제79항중 어느 한 항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 81

제77항 내지 제80항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 82

제77항 내지 제81항 중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 83

제77항 내지 82항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 84

제77항 내지 제83항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹 중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

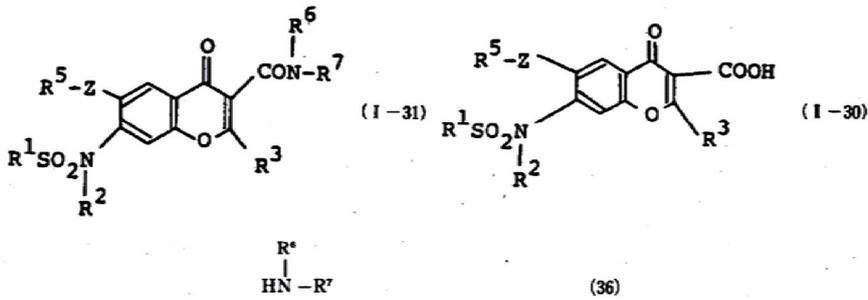
청구항 85

제77항 내지 제84항 중 어느 한 항에 있어서, R¹⁰이 수소원자인 방법.

청구항 86

하기 일반식(1-30)의 화합물 또는 이의 반응성 유도체 또는 이의 염을 하기 일반식(36)의 화합물 또는 이의 염과 반응시킴을 특징으로 하여, 일반식(1-31)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염을 제조

하는 방법.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 그룹이며; R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설포닐, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성하며; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이미노그룹이다.

청구항 87

제86항에 있어서, Z가 산소원자인 방법.

청구항 88

제86항 또는 제87항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 89

제86항 내지 제88항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 90

제86항 내지 제89항 중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 91

제86항 내지 제90항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 92

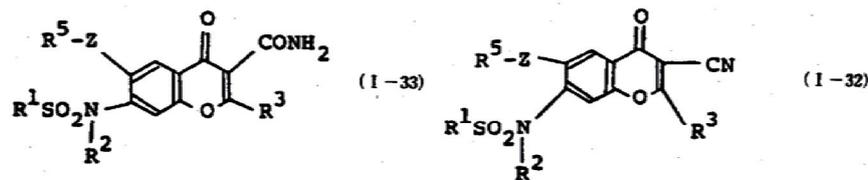
제86항 내지 제91항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 93

제86항 내지 제92항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵ 및 R⁶ 중 어느 하나 또는 둘다 수소원자인 방법.

청구항 94

하기 일반식(I-32)의 화합물 또는 이의 염을 가수분해시킴을 특징으로 하여, 일반식(I-33)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는

피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이민노그룹이다.

청구항 95

제94항에 있어서, Z가 산소원자인 방법.

청구항 96

제94항 또는 제95항에 있어서, R¹이 저급 알킬 그룹인 방법.

청구항 97

제94항 내지 제96항 중 어느 한 항에 있어서, R²가 수소원자인 방법.

청구항 98

제94항 내지 제97항 중 어느 한 항에 있어서, R³이 수소원자 또는 알킬 그룹인 방법.

청구항 99

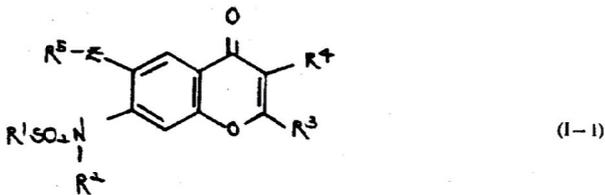
제94항 내지 제98항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 방법.

청구항 100

제94항 내지 제99항 중 어느 한 항에 있어서, R⁵가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 방법.

청구항 101

하기 일반식 (I-1)의 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염 유효량을 함유함을 특징으로 하는 억제학적 조성물



상기식에서, R¹은 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬, 저급 알케닐 또는 아릴 그룹이고; R²는 수소원자이거나, 또는 알킬 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 포르밀 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페녹시, 사이클로알킬, 카바모일, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁴는 수소 또는 할로겐 원자이거나, 니트로, 시아노, 카복실, 아실, 하이드록실 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 알킬티오, 페닐티오, 저급 알킬닐, 저급 알케닐, 설파모일, 알킬설피닐, 알킬설포닐, 아미디노, 페닐 또는

헤테로사이클릭그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} \text{R}^6 \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{R}^7 \end{matrix}$ 또는 $\begin{matrix} \text{R}^6 \\ \diagdown \\ \text{CON} \\ \diagup \\ \text{R}^7 \end{matrix}$ (여기에서, R⁶은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 알킬설포닐, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R⁷은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 페닐, 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R⁶ 및 R⁷이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 3- 내지 7-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐, 티에닐, 푸릴 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자이거나, 또는 이민노그룹이다.

청구항 102

제101항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자 또는 아실 그룹이며; R³ 및 R⁴는 동일하거나 상이할 수 있으며, 수소 원자, 카바모일, 카복실, 포르밀, 하이드록실 또는 알콕시 카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시 또는 페닐 그룹이며; R⁵는 치환되거나 비치환된 페닐 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 억제학적 조성물.

청구항 103

제101항에 있어서, R¹이 비치환되거나 할로겐-치환된 저급 알킬 또는 저급 알케닐 그룹이고; R²는 수소원자, 또는 아실그룹이며; R³은 수소 또는 할로겐 원자이거나, 시아노, 아지도, 카복실, 하이드록실, 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 알콕시, 아미노 또는 페닐 그룹이고; R⁴는 알

반식 $\begin{matrix} & R^6 \\ & \diagup \\ -N & \\ & \diagdown \\ & R^7 \end{matrix}$ (여기에서, R^6 은 수소원자, 하이드록실, 시아노 또는 알콕시카보닐 그룹이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 사이클로알킬, 페닐, 아미노, 아실, 카바모일, 이미노메틸 또는 아미디노 그룹이고, R^7 은 수소원자이거나, 또는 치환되거나 비치환된 알킬, 또는 사이클로알킬 또는 헤테로사이클릭 그룹이거나, 또는 R^6 및 R^7 이, 이들이 결합되어 있는 질소원자와 함께는 치환되거나 비치환된 4- 내지 6-원 헤테로사이클릭 그룹을 형성한다)의 그룹이며; R^5 는 치환되거나 비치환된 페닐, 또는 피리딜 그룹이고; Z는 산소 또는 황원자인 약제학적 조성물.

청구항 104

제101항 내지 제103항 중 어느 한 항에 있어서, Z가 산소원자인 약제학적 조성물.

청구항 105

제101항 내지 제104항 중 어느 한 항에 있어서, R^1 이 저급 알킬 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 106

제101항 내지 제105항 중 어느 한 항에 있어서, R^2 가 수소원자인 약제학적 조성물.

청구항 107

제101항 내지 제106항 중 어느 한 항에 있어서, R^3 이 수소원자 또는 알킬 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 108

제101항에 있어서, R^4 가 치환되거나 비치환된 알킬티오, 알킬설피닐 또는 알킬설포닐 그룹이거나, 또는 일반식 $\begin{matrix} & R^6 \\ & \diagup \\ -N & \\ & \diagdown \\ & R^7 \end{matrix}$ 또는 $\begin{matrix} & R^6 \\ & \diagup \\ -CON & \\ & \diagdown \\ & R^7 \end{matrix}$ (여기에서, R^6 및 R^7 은 제101항에서 정의된 바와 같다)의 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 109

제108항에 있어서, R^4 가 알킬티오, 포르밀 아미노 또는 카바모일 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 110

제109항에 있어서, R^5 가 치환되거나 비치환된 페닐 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 111

제110항에 있어서, R^5 가 할로겐원자, 하이드록실 그룹, 아미노 그룹, 카복실 그룹, 할로알킬 그룹, 알킬 그룹, 알콕시 그룹, 알콕시카보닐 그룹, 아실아미노 그룹 및 카바모일 그룹중에서 선택된 하나 이상의 치환체로 치환될 수 있는 페닐 그룹인 약제학적 조성물.

청구항 112

염증성, 발열성, 무통증 또는 류마티스성 질환의 치료제를 제조하기 위한, 제1항에서 청구된 4H-1-벤조피란-4-온 유도체 또는 이의 염의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개는 것임.