

〔J. Med. Chem., 22, 53 (1979)〕

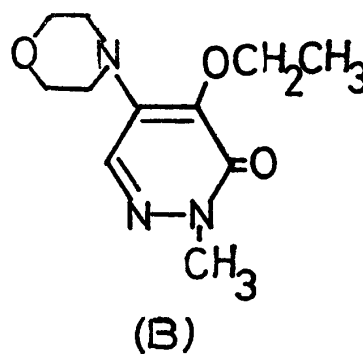
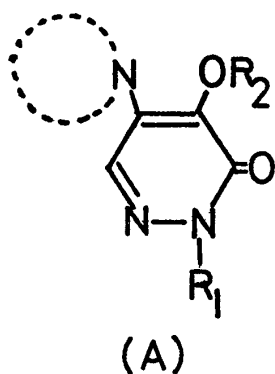
A New Nonsteroidal Analgesic-Antiinflammatory Agent. Synthesis and Activity of 4-Ethoxy-2-methyl-5-morpholino-3(2H)-pyridazinone and Related Compounds

MASAHIRO TAKAYA*, MAKOTO SATO*, KENJU TERASHIMA*,
HISAYUKI TANIZAWA*, YOSHIFUMI MAKI

新非ステロイド系鎮痛消炎剤, 4-Ethoxy-2-methyl-5-morpholino-3-(2H)-Pyridazinone および関連化合物の合成と薬理活性

高谷昌弘*, 佐藤 誠*, 寺島建樹*, 谷沢久之*, 牧 敬文

種々の 2-alkyl-or 2-alkenyl-4-alkoxy-5-(substituted amino)-3 (2H)-pyridazinone 類(A) を合成して鎮痛消炎作用を検討した。その中 2-methyl-4, 5-dichloro-3 (2H)-pyridazinone に morpholine を, さらにアルコールを作用して容易に得られる 4-ethoxy-2-methyl-5-morpholino-3 (2H)-pyridazinone (B) は最も優れた鎮痛消炎作用を示し, 毒性も極めて少ないことが判った。また (A) の合成に際し, 3(2H)-pyridazinone 環における求核的置換反応につき興味ある結果を得た。(A) および 2, 3 の関連化合物の薬理活性から構造-活性相関についても若干の知見を得た。



R_1 =alkyl or aryl

R_2 =alkyl