

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
A61K 31/55

(11) 공개번호 특1990-0000083
(43) 공개일자 1990년01월30일

(21) 출원번호	특1989-0008876
(22) 출원일자	1989년06월27일
(30) 우선권주장	212544 1988년06월28일 미국(US)
(71) 출원인	메렐 다우 파마슈티칼스 인크. 게리 디.스트리트
(72) 발명자	미합중국 45215 오하이오주 신시내티 이스트 갈브레이스 로드 2110 마이클 지.팔프레이만
	미합중국 45269 오하이오주 신시내티 애플잭 코우트 11515 쉬엔 씨.첸
	미합중국 45246 오하이오주 신시내티 캔트렐 드라이브 12079 노버트 엘.위치
	미합중국 45244 오하이오주 신시내티 크릿텐든 드라이브 6296 존 엠.케인
	미합중국 45236 오하이오주 신시내티 디어웨스터 드라이브 6813
(74) 대리인	이세진, 장수길

심사청구 : 없음

(54) 칼슘 길항제인 락탐아미드

요약

내용 없음

대표도

도1

명세서

[발명의 명칭]

칼슘 길항제인 락탐아미드

[도면의 간단한 설명]

제1도는 d-및 1-시스-틸티아젠티 및 관련 락탐아미드에 의한 [3H]d-시스-틸티아젠티의 억제를 예시하는 그래프.

제2도는 K^+ -감극 기니아픽 회장의 Ca^{++} 유발 농도에 미치는 딜티아젠티의 효과를 예시하는 그래프.

제3도는 K^+ -감극 기니아픽 회장의 Ca^{++} 유발 농도에 미치는 시험 화합물 1의 효과를 예시한 그래프.

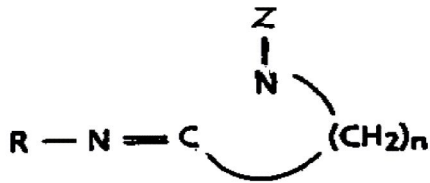
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

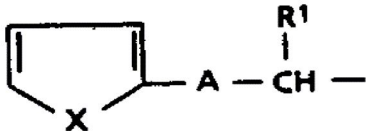
청구항 1

환자에게 하기 일반식의 화합물 또는 그의 제약학적 허용 산 부가염 또는 각각의 광학 또는 기하 이성질체를 칼슘 길항작용 유효량으로 투여하는 것을 특징으로 하는 칼슘 길항작용을 필요로 하는 환자에 있어

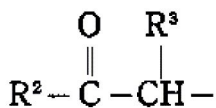
서 칼슘 길항작용을 발효시키는 방법.



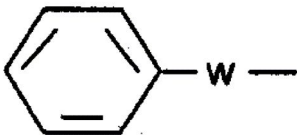
상기식중, Z는 수소 또는 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알킬기이고, n은 3내지 16의 정수이고, R은 탄소원자수 8내지 15개의 직쇄 또는 분지쇄 알킬기, 또는 알킬 성분이 8내지 15개의 탄소원자를 갖고 알콕시 성분이 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알콕시 알킬기, 알킬 성분이 1내지 6개의 탄소원자수를 갖고 페닐 성분이 비치환되거나 또는 페닐 고리의 오르토, 메타, 파라 위치가 염소, 불소, 브롬, 탄소 원자수 1내지 4개의 저급 알킬, 탄소원자수 1내지 4개의 알콕시, 히드록시 또는 메틸렌디옥시기로 치환된 페닐알킬기, 하기식의 기.



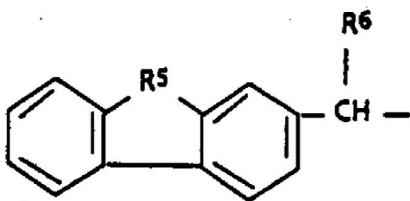
(식중, X는 산소 또는 황이고, A는 하나의 결합이거나 또는 탄소원자수 1내지 3개의 알킬렌 사슬이고, R¹은 수소, 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 직쇄 또는 분지쇄 저급 알킬기, 3내지 4개의 탄소원자수를 갖는 직쇄 또는 분지쇄 저급 알케닐기, 3내지 6개의 탄소원자수를 갖는 시클로 알킬기 또는 페닐기임)하기식의 기,



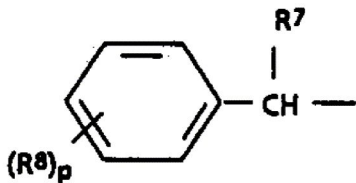
(식중, R²는 페닐기 또는 3내지 6개의 탄소원자수를 갖는 시클로알킬기이고, R³는 수소 또는 메틸기임)하기식의 기,



(식중, W는 6개의 탄소원자중 어느 하나에 1개의 페닐기 1-또는 2-아다만틸 또는 1-또는 2-노르보르닐기가 치환된 2내지 6개의 탄소원자수를 갖는 직쇄 또는 분지쇄 알킬렌 사슬이되, 단 환외(環外)질소원자에 인접한 탄소원자는 그에 결합된 수소를 적어도 1개 가져야 함)하기식의 기,

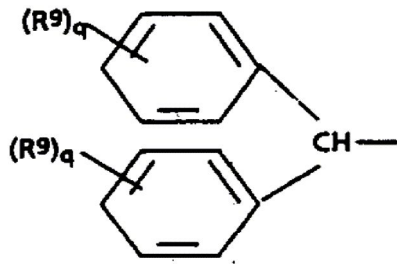


(식중, R⁵는 산소, 황, -CH₂-, -CH₂CH₂- 또는 -CH=CH-이고, R⁶은 수소 또는 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알킬기임)하기식의 기,

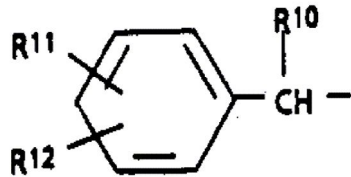


(식중, R⁷은 탄소원자수 3내지 5개의 시클로알킬기이고, R⁸은 수소, 탄소원자수 1내지 4개의 저급 알콕시

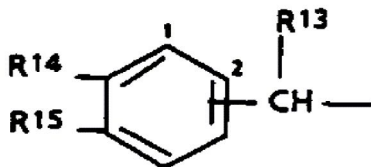
기 또는 탄소원자수 1내지 4개의 저급 알킬기이고, p는 1또는 2의 정수임)하기식의 기,



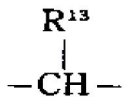
(식중, R^9 은 수소, 탄소원자수 1내지 4개의 직쇄 또는 분지쇄 저급 알킬기, 염소 불소, 브롬, CF_3 , SCF_3 , OCF_3 , 페닐, 페녹시 또는 탄소원자수 1내지 4개의 저급 알콕시기이고, q는 1내지 3의 정수임) 하기식의 기, 또는



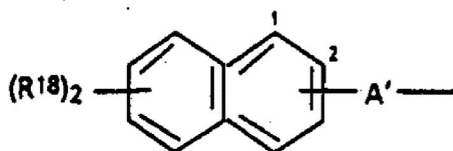
(식중, R^{10} 은 탄소원자수 1내지 4개의 저급 알킬기이고, R^{11} 은 수소 또는 탄소원자수 1내지 4개의 저급 알킬기이고, R^{12} 은 8내지 14개의 탄소원자수를 갖는 알킬기, 8내지 14개의 탄소원자수를 갖는 알콕시기, 5내지 14의 탄소원자수를 갖는 시클로 알킬기, 알킬 성분이 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 페닐알킬, 알콕시 성분이 2내지 4개의 탄소원자수를 갖는 페닐알콕시, 2,2-디페닐 비닐 또는 플루오렌-9-일리덴임) 하기식의 기이다.



(식중, 페닐 성분은 페닐 고리의 1- 또는 2-위치를 통해서 $\begin{matrix} R^{13} \\ | \\ -CH- \end{matrix}$ 성분에 결합되고,



R^{13} 은 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알킬기이고, R^{14} 및 R^{15} 는 함께 $(-CH_2-)_2$, $-CH_2CH_2C(CH_3)_2-$, $-(CH_2)_4-$ 또는 $-C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2-$ 임),



(식중, A' 는 탄소원자수 1내지 6개의 직쇄 또는 분지쇄 알킬렌기 또는 벤질기, 염소, 불소, 브롬 트리플루오로메틸, 탄소원자수 1내지 12개의 분지쇄 알킬, 탄소원자수 1내지 3개의 알콕시 또는 NO_2 , 1-또는 2-아다만틸기, 1-또는 2-노르보르닐기, 오르토-, 메타-또는 파라-비페닐기, 각 방향족 고리의 이용가능한 4개의 탄소중 어느 하나에 부착될 수 있고, 염소, 브롬, 불소, 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알킬기, 1내지 4개의 탄소원자수를 갖는 저급 알콕시기 또는 NO_2 가 치환된 치환 9-플루오레닐 또는 비치

환된 9-플루오레닐기, 디벤조시킴렌테닐기, 단 R^2 은 $\begin{matrix} O & R^3 \\ || & | \\ R^2-C & -CH \end{matrix}$ 이고, Z는 수소임)

청구항 2

제1항에 있어서, n은 정수 1인 방법.

청구항 3

제1항에 있어서, R이 1-또는 2-아다만틸 또는 1-또는 2-노르보르닐기인 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, R이 2-노르보르닐기인 방법.

청구항 5

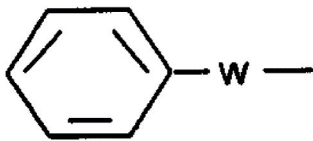
제3항 또는 제4항에 있어서, n이 정수 1인 방법.

청구항 6

제1항에 있어서, 화합물이 2-(2-노르보르닐이미노)아자시클로트리데칸 또는 그이 제약상 허용되는 염인 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, R이 하기식으로 표시되는 기인 방법.



식중, W는 2내지 6개의 탄소원자수를 갖는 직쇄 또는 분지쇄 알킬렌 사슬로서, 6개의 탄소원자중 어느 하나에 1개의 페닐기, 1-또는 2-아다만틸기, 또는 1-또는 2-노르보르닐기로 치환하되, 단, 환외 질소원자에 인접한 탄소원자는 그에 결합된 수소를 적어도 1개 이상 가져야 한다.

청구항 8

제1항에 있어서, R가 2,2-디페닐펜틴기인 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, R가 α -(1-아다만틸)벤질기인 방법.

청구항 10

제1항에 있어서, R가 3,3-디페닐프로필기인 방법.

청구항 11

제7항 내지 제10항중 어느 한항에 있어서, n이 정수 1인 방법.

청구항 12

제1항에 있어서, R이 오르토-, 메타- 또는 파라-비페닐기인 방법.

청구항 13

제1항에 있어서, R이 오르토-비페닐기인 방법.

청구항 14

제12항 또는 제13항에 있어서, n이 정수 1인 방법.

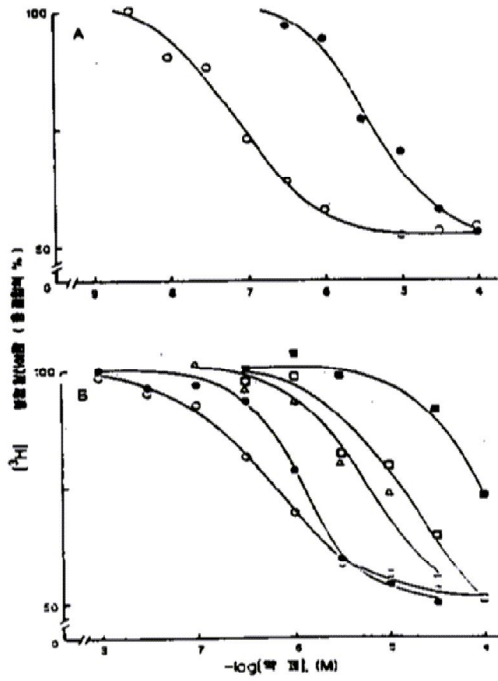
청구항 15

제1항에 있어서, 화합물이 2-(α -비페닐이미노)아자시클로트리데칸 또는 그의 제약상 허용되는 염인 방법.

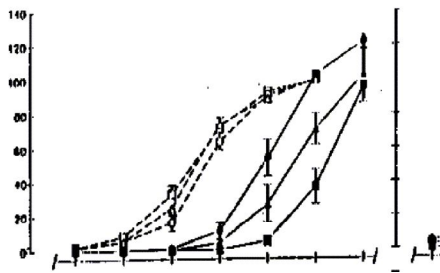
※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면

도면1



도면2



도면3

