

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵A61K 31/66

(11) 공개번호 특 1994-0005279

(43) 공개일자 1994년03월21일

(21) 출원번호 특 1993-0011295
 (22) 출원일자 1993년06월21일

(30) 우선권주장 01 984/92-6 1992년06월22일 스위스(CH)

(71) 출원인 시바-가이기 에이지 베르너 발데크

스위스연방 4002 바슬 클리벡스트라세 141

(72) 발명자 크누트 아. 예기

스위스연방 4054 바슬 게네랄 귀잔-스트라쎄 44

(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음**(54) 아미딘을 함유하는 약제학적 조성을 및 아미딘****요약**

일반식 (I)의 화합물은 귀중한 약리학적 특성이 있고 칼슘대사 조절제로서 특히 유효하다.



상기식에서, R, R₁, R₂ 및 q는 명세서에서 정의한 바와같다. 이는 공지된 방법 그 자체로 제조된다.

명세서

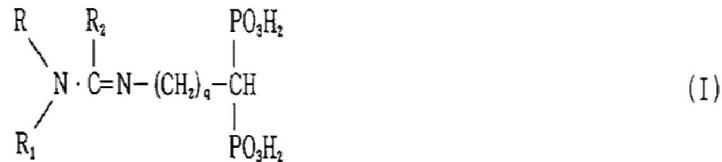
[발명의 명칭]

아미딘을 함유하는 약제학적 조성을 및 아미딘

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위**청구항 1**

일반식 (1)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성을.



상기식에서, R, R₁ 및 R₂는 각각 서로 독립적으로 수소 또는 저급알킬 이거나, R과 R₁이 함께 2가 라디칼(CH₂)_m-X-(CH₂)_n-을 형성하며, 여기서 m 및 n은 각각 서로 독립적으로 1 내지 60이고 m과 n의 합은 2 내지 70이고, X는 -CH₂-,-CH=CH-, -O-, -N(R₃)-또는 -S(O)_p-그룹(여기서 R₃은 수소, 저급알킬, 페닐-저급알킬 또는 저급알카노일 이고, p는 0 내지 20이다)이고, q는 0 내지 60이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R 및 R₁이 각각 서로 독립적으로 저급알킬 이거나, R과 R₁이 결합된 질소원자와 함께 피페리디노, 피롤리디노, 디하이드-1H-피롤-1-일, 1, 2, 5, 6-테트라하이드로피리딘-1-일, 모르폴리노, 헥사하이드로-3-옥사-1H-아제핀-1-일, 피페라지노, 4-저급알킬-피페라지노, 4-페닐-저급알킬피페라지노, 4-저급알카노일피페라지노, 티오모르폴리노, S-옥소티오모프폴리노 및 S,S-디옥소티오모르폴리노 중

에서 선택된 그룹을 형성하고, R_2 가 수소 또는 저급알킬이고, q 가 0 내지 6인 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 3

제1항에 있어서, R 및 R_1 이 각각 서로 독립적으로 저급알킬 이거나, R 과 R_1 이 결합된 질소원자와 함께 피페리디노, 피롤리디노 모르폴리노. 피페라지노 및 티오모르폴리노종에서 선택된 그룹을 형성하고. R_2 가 수소 또는 저급알킬이고 q 가 0인 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 4

제1항에 있어서, R 및 R_1 이 각각 서로 독립적으로 메틸 또는 에틸기이고, R_2 가 수소이고 q 가 0인 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 5

제1항에 있어서, N-N-디메틸포름아미디노메탄비스포스폰산 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 6

제1항에 있어서, 피페리디노포름아미디노메탄비스포스폰산 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 7

일반식(I)의 화합물 또는 이의 염.



상기식에서, R , R_1 및 R_2 는 각각 서로 독립적으로 수소 또는 저급알킬 이거나, R 과 R_1 이 함께 2가 라디칼 ($\text{CH}_2\text{)}_m\text{-X-}(\text{CH}_2\text{)}_n$ -을 형성하며, 여기서 m 및 n 은 각각 서로 독립적으로 1 내지 6이고, m 과 n 의 합은 2 내지 7이고, X 는 $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH=CH}-$, $-0-$, $-\text{N}(\text{R}_3)-$ 또는 $-\text{S(O)}_p-$ 그룹(여기서 R_3 은 수소, 저급알킬, 페닐-저급알킬 또는 저급알카노일 이고, p 는 0 내지 2이다)이고, q 는 0 내지 6이며, 단, 치환제 R_1 및 R_2 둘다는 각각 서로 독립적으로 수소, 메틸 또는 에틸이며 q 가 0인 경우에는 R_2 는 수소가 아니다.

청구항 8

제7항에 있어서, R 및 R_1 이 각각 서로 독립적으로 저급알킬 이거나, R 과 R_1 이 결합된 질소원자와 함께 피페리디노, 피롤리디노, 디하이드-1H-피롤-1-일, 1,2,5,6-테트라하이드로피리딘-1-일, 모르폴리노, 헥사하이드로-3-옥사-1H-아제핀-1-알, 피페라지노, 4-저급알킬 피페라지노, 4-페닐-저급알킬피페라지노, 4-저급알카노일피페라지노, 티오모르폴리노, S-옥소티오모프리노 및 S,S-디옥소티오모프리노 중에서 선택된 그룹을 형성하고, R_2 가 수소 또는 저급알킬이고, q 가 0 내지 6이며, 단 치환제 R_1 및 R_2 둘다는 서로 독립적으로 메틸 또는 에틸이며 q 가 7인 경우 R_2 는 수소가 아닌 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염

청구항 9

제7항에 있어서, R_1 이 $\text{C}_1\text{-}\text{C}_7$ 알킬이고, R_1 이 $\text{C}_3\text{-}\text{C}_7$ 알킬이거나, R 과 R_1 이 결합된 질소원자와 함께 피페리디노, 피롤리디노, 모르폴리노, 피페리디노 및 티오모르폴리노 중에서 선택된 그룹을 형성하고, R_2 가 수소 또는 저급알킬이고 q 가 0인 일반식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 10

제7항에 있어서, 피페리디노포름아미디노메탄비스포스폰산 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 11

제7항 내지 제10항중의 어느 한 항에 따른 화합물 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 12

제7항 내지 제10항중의 어느 한 항에 있어서, 동물체 또는 인체의 치료학적 처리방법에 사용하기 위한 화합물.

청구항 13

제7항 내지 제10항 중의 어느 한 항에 있어서, 칼슘대사 장애와 관련된 질환의 처리방법에 사용하기 위한 화합물.

청구항 14

약제학적 조성물을 제조하기 위한 제7항 내지 제10항 중의 어느 한 항에 따른 화합물의 용도.

청구항 15

칼슘대사 장애와 관련된 질환 치료용 약제학적 조성물을 제조하기 위한 제7항 내지 제10항 중의 어느 한 항에 따른 화합물의 용도.

청구항 16

a) 일반식 (II)의 화합물에서 작용성이 개질된 포스포노 X_1 및 임의로 X_2 를 유리 포스포노그룹으로 전환시키거나, b) 일반식(III)의 화합물 또는 이의 작용성 유도체를 일반식(IV)의 화합물 또는 이의 적합한 염과 반응시키고, 경우에 따라 이될게 수득된 일반식(I)의 화합물을 다른 일반식(I)의 화합물로 전환시키고/시키거나, 경우에 따라 염을 유리 화합물 또는 다른 염으로 전환시키고/시키거나, 경우에 따라 염 형성 특성을 지닌 일반식(I)의 유리 화합물을 염으로 전환시킴을 특징으로 하여, 제7항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, R, R_1 , R_2 및 q 는 일반식(I)에서 정의된 바와같고, X_1 은 작용성이 개질된 포스포노그룹이고, X_2 는 유리 또는 작용성이 개질된 포스포노그룹이다.

* 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.