

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>  
A61K 31/66

(11) 공개번호 특허1994-0005279  
(43) 공개일자 1994년03월21일

(21) 출원번호	특1993-0011295
(22) 출원일자	1993년06월21일
(30) 우선권주장	01 984/92-6 1992년06월22일 스위스(CH)
(71) 출원인	시바-가이키 에이지 베르너 발데크
(72) 발명자	스위스연방 4002 바슬 클리벡스트라세 141 크누트 아. 예기
(74) 대리인	스위스연방 4054 바슬 게네랄 귀잔-스트라세 44 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

(54) 아미딘을 함유하는 약제학적 조성물 및 아미딘

요약

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



상기식에서, R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> 및 q는 명세서에서 정의한 바와 같다. 이는 공지된 방법 그 자체로 제조된다.

명세서

[발명의 명칭]

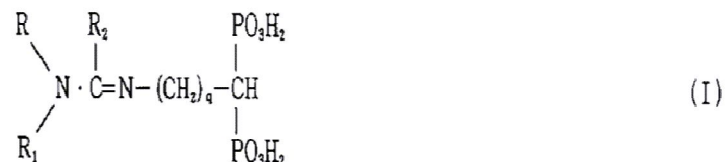
아미딘을 함유하는 약제학적 조성물 및 아미딘

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 조성물.



상기식에서, R, R<sub>1</sub> 및 R<sub>2</sub>는 각각 서로 독립적으로 수소 또는 저급알킬 이거나, R과 R<sub>1</sub>이 함께 2가 라디칼(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-X-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>을 형성하며, 여기서 m 및 n은 각각 서로 독립적으로 1 내지 6이고 m과 n의 합은 2 내지 7이고, X는 -CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-, -O-, -N(R<sub>3</sub>)-또는 -S(O)<sub>p</sub>-그룹(여기서 R<sub>3</sub>은 수소, 저급알킬, 페닐 - 저급알킬 또는 저급알카노일 이고, p는 0 내지 2이다)이고, q는 0 내지 6이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R및 R<sub>1</sub>이 각각 서로 독립적으로 저급알킬 이거나, R과 R<sub>1</sub>이 결합된 질소원자와 함께 피페리디노, 피롤리디노, 디하이드로-1H-피롤-1-일, 1, 2, 5, 6-테트라하이드로피리딘-1-일, 모르폴리노, 헥사 하이드로-3-옥사-1H-아제핀 -1-알, 피페라지노, 4-저급알킬-피페라지노, 4-페닐-저급 알킬피페라지노, 4-저급알카노일피페라지노, 티오모르폴리노, S-옥소티오모르폴리노 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 하나 이상의 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 티오모르폴리노중에서 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-디메틸포름아미디노메탄비스포스포산 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 함유하는 약제학적 조성물.

### 청구항 6

제1항에 있어서, 피페리디노포름아미디노메탄비스포스포산 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  $(CH_2)_m-X-(CH_2)_n$ 을 형성하며, 여기서  $m$  및  $n$ 은 각각 서로 독립적으로 1 내지 6이고,  $m$ 과  $n$ 의 합은 2 내지 7이고,  $X$ 는  $-CH_2-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-O-$ ,  $-N(R_3)-$  또는  $-S(O)_p-$ 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-일, 피페라지노, 4-저급알킬 피페라지노, 4-페닐-저급알킬피페라지노, 4-저급알카노일피페라지노, 티오모르폴리노, S-옥소티오모르폴리노 및 S,S-디오소티오모르폴리노 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,  $R$ 이  $C_1$ - $C_7$ 알킬이고,  $R_1$ 이  $C_3$ - $C_7$ 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, 피페리디노포름아미디노메탄비스포스포산 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 제10항중의 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 이렇게 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 q는 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.