

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
H03M 1/12

(11) 공개번호 특 1995-0022159
(43) 공개일자 1995년 07월 28일

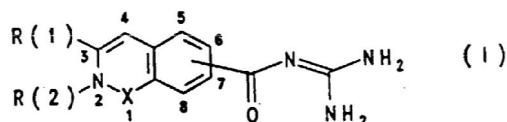
(21) 출원번호	특 1994-0036479
(22) 출원일자	1994년 12월 23일
(30) 우선권주장	172646 1993년 12월 23일 미국(JP)
(71) 출원인	헥스트 아크티엔게젤샤프트 엘겔하르트, 바인 독일 연방공화국 데-65926 프랑크푸르트 암 마인 안드레아스 바이케르트
(72) 발명자	독일연방공화국 데-63329 엥겔스바크 라이프찌거 슈트라쎄 21 하인쯔-베르너 클레에만 독일연방공화국 데-61350 바트 흄부르크 안 데어 훌렌 아이케 3 한스-요헨 랑 독일연방공화국 데-65719 호프하임 뤼데스하이머 슈트라쎄 7 안-로베르트 쉬바르크 독일연방공화국 데-65929 프랑크푸르트 로렐라이슈트라쎄 63 우도 알부스 독일연방공화국 데-61197 플로르슈타트 암 뢰메르카슈텔 9 볼프강 솔쯔 독일연방공화국 데-65760 에쉬보른 운테로르트슈트라쎄 30 (74) 대리인 이병호, 최달용

심사첨구 : 있음

(54) 치환된 1-옥소-1,2-디하이드로이소퀴놀리노일구아니딘 및 1,1-디옥소-2H-1,2-벤조티아지노일구아니딘, 이들의 제조방법, 약제 또는 진단제로서의 이들의 용도 및 이들을 포함하는 약제

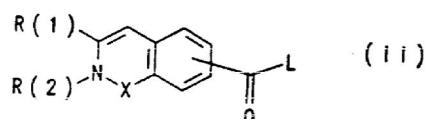
요약

본 발명은 일반식(I)의 아실구아니딘 I 및 이의 약제학적으로 적합한 염에 관한 것이다. :



상기식에서, X는 카보닐 또는 설포닐이고, R(1)은 H, (사이클로)알킬 또는 페닐이며, R(2)는 H는 또는 알킬이다.

이들 화합물은 일반식(II)의 화합물을 구아니딘과 반응시켜 수득한다:



이들 화합물은 바람직하지 않은 염류 이뇨 특성이 없이 매우 우수한 항부정맥 특성을 갖는다. 이들 화합물은 세로성Na⁺/H⁺교환 기작을 억제하므로 모든 급성적 또는 만성적 혀혈-유발된 손상을 치료하는데 사용될 수 있다.

명세서

[발명의 명칭]

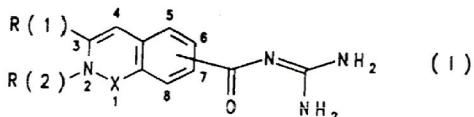
치환된 1-옥소-1,2-디하이드로이소퀴놀리노일구아니딘 및 1,1-디옥소-2H-1,2-벤조티아지노일구아니딘, 이들의 제조방법, 약제 또는 진단제로서의 이들이— 용도 및 이들을 포함하는 약제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(I)의 아실구아니딘 및 이의 약제학적으로 적합한 염.



상기식에서, X는 카보닐 또는 설포닐이고, R(1)은 H, 비치환되거나 하이드록실로 치환된 (C_1-C_8)-알킬, (C_3-C_8)-사이클로알킬, 또는 비치환되거나, F, CL, CF_3 , CH_3 , 메톡시, 하이드록실, 아미노, 메틸아미노 또는 디메틸아미노로 이루어진 그룹중의 1내지3개의 치환제로 치환된 페닐이며, R(2)는 H또는(C_1-C_4) -알킬이다.

청구항 2

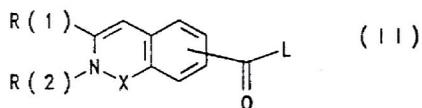
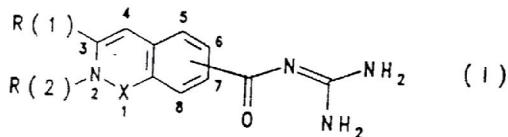
제1항에 있어서, X가 설포닐이고, R(1)은 H, 비치환되거나 하이드록실로 치환된 (C_1-C_8)-알킬, (C_3-C_8)-사이클로알킬, 또는 비치환되거나, F, CL, CF_3 , CH_3 , 메톡시, 하이드록실, 아미노, 메틸아미노 또는 디메틸아미노로 이루어진 그룹중의 1내지3개의 치환제로 치환된 페닐이며, R(2)는 H또는(C_1-C_4) -알킬인 일반식(I)의 화합물

청구항 3

제1항에 있어서, 카보닐 구아나이드 [-CO-N=C(NH₂)₂] 특정 벤젠 핵상의 7위치에 위치된 일반식 (I)의 화합물.

청구항 4

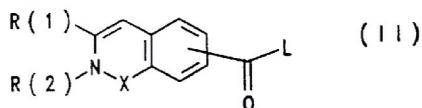
일반식(II)의 화합물을 구아니딘과 반응시키는 단계를 포함하여, 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서, X,R(1)및 R(2)는 제1항에서 정의한 바와 같고, L은 용이하게 친핵성 치환될 수 있는 이탈그룹이다.

청구항 5

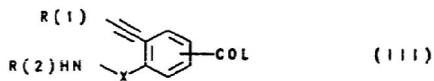
일반식(II)의 화합물.



상기식에서, X는 카보닐 또는 설포닐이고, R(1)은 H, 비치환되거나 하이드록실로 치환된 (C_1-C_8)-알킬, (C_3-C_8)-사이클로알킬, 또는 비치환되거나, F, CL, CF_3 , CH_3 , 메톡시, 하이드록실, 아미노, 메틸아미노 또는 디메틸아미노로 이루어진 그룹중의 1내지3개의 치환제로 치환된 페닐이며, R(2)는 H또는(C_1-C_4) -알킬이고, L은 용이하게 친핵성 치환될 수 있는 이탈그룹이다.

청구항 6

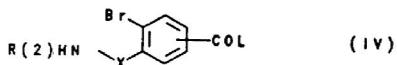
일반식(III)의 화합물.



상기식에서, X는 카보닐 또는 설포닐이고, R(1)은 H, 비치환되거나 하이드록실로 치환된 (C_1-C_8)-알킬, (C_3-C_8)-사이클로알킬, 또는 비치환되거나, F, Cl, CF_3 , CH_3 , 메톡시, 하이드록실, 아미노, 메틸아미노 또는 디메틸아미노로 이루어진 그룹중의 1내지3개의 치환제로 치환된 페닐이며, R(2)는 H또는(C_1-C_4) -알킬이고, L은 용이하게 친핵성 치환될 수 있는 이탈그룹이다.

청구항 7

일반식(IV)의 화합물.



상기식에서, X는 카보닐 또는 설포닐이고, R(2)은 H, (C_1-C_6)-알킬이며, L은 용이하게 친핵성 치환될 수 있는 이탈그룹이다.

청구항 8

부정맥 치료용 약제 제로를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 9

통상의 첨가제와 혼합된 적합한 용량 형태의 유효량의 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물을 투여하는 단계를 포함하여, 부정맥을 치료하는 방법.

청구항 10

심근 경색 치료 또는 예방용 약제 제로를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 11

협심증 치료 또는 예방용 약제 제로를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 12

심장의 허혈 상태 치료 또는 예방용 약제 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 13

말초신경계 및 종주신경계의 허혈 상태 및 발작 치료 또는 예방용 약제 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 14

말초기관 및 수족의 허혈 상태 치료 또는 예방용 약제 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 15

속 상태 치료용 약제 제로를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 16

외과 수술 및 기관 이식에 사용하기 위한 약제 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 17

외과 수술 수행용 이식 조직의 보관 및 저장용 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 18

세포증식이 1차적 또는 2차적 원인인 질병 치료용 약제로서 아테롬성 동맥경화증 치료제, 또는 당뇨병, 암, 폐 성유증, 간 성유증 또는 신장 성유증과 같은 성유형성 장애. 전립선 과형성증의 후기 합병증 예방제로서 사용하는 약제 제조를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 19

고혈압 및 증식성 장애 진단용의 Na^+/H^+ 교환기 억제용 과학적 수단의 제로를 위한 제1항에 따른 일반식(I)의 화합물의 용도.

청구항 20

유효량의 제1항에 따른 른 일반식(I)의 화합물과 통상의 첨가제를 포함하는 약제.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.