

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 국제특허출원의 공개특허공보

(51) Int. Cl. ⁵ C07C 277/00	(11) 공개번호 특1993-7000423	(43) 공개일자 1993년03월 15일
(21) 출원번호 (22) 출원일자 번역문제출일자 (86) 국제출원번호 (86) 국제출원출원일자 (81) 지정국	특1992-7002121 1992년09월03일 1992년09월03일 PCT/US 91/01448 1991년03월04일 국내특허 : 호주 바바도스 불가리아 브라질 캐나다 핀란드 헝가리 일본 북한 한국 스리랑카 모나코 마다가스카르 말라위 노르웨이 루 마니아 수단 러시아 폴란드 오스트리아 벨기에 스위스(리히텐슈타인) 독일 덴마크 스페인 프랑스 영국 이태리 룩셈부르크 네덜란드 스웨 덴 그리스 베닌 브르키나파소 카메룬 중앙아프리카공화국 차드 콩고 가봉 말리 마리타니아 세네갈 투고	(87) 국제공개번호 W0 91/13056 (87) 국제공개일자 1991년09월05일
(30) 우선권주장 (71) 출원인	487,033 1990년03월02일 미국(US) 스테이트 오브 오리건, 액팅 바이 앤드 쓰루 더 오리건 스테이트 보오드 오브 하이어 에듀케이션, 액팅 포 앤드 온 비헬프 오브 더 오리건 헬스 사이 언스 유니버시티, 포트랜드, 오리건, 앤드 더 유니버시티 오브 오리건, 유 젠, 오리건	
(72) 발명자	미합중국, 오리건 97201, 포트랜드, 에스. 더블유. 샘 잭슨 파크 로드 3181 웨이 에카드 미합중국, 캘리포니아, 92651, 레이거나 비취, 델 미아 애비뉴 1560 키이나, 존, 에프., 더블유.	
(74) 대리인	미합중국, 오리건 97405, 유젠, 오닉스 스트리트 3854 나영환, 도두형	

심사청구 : 없음

(54) N,N-이치환된 구아니딘과 흥분유발 아미노산 길항제로서 그 사용방법

요약

내용 없음.

대표도

도1

명세서

[발명의 명칭]

N,N-이치환된 구아니딘과 흥분유발 아미노산 길항제로서 그 사용방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

NMDA 수용체-채널 복합체에서 PCP 수용체에 대한 높은 결합활성을 나타내고, 비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘, 비스-1,3-(m-이소프로필페닐) 구아니딘, 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘 및 비스-1,3-(m-메톡시페닐)구아니딘 또는 생리학적으로 허용가능한 그들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것으로서, 신경보호작용을 하는 대칭적인 N,N'-이치환된 구아니딘.

청구항 2

비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘.

청구항 3

비스-1,3-(*m*-이소프로필페닐)구아니딘.

청구항 4

비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘.

청구항 5

비스-1,3-(*m*-메톡시페닐)구아니딘.

청구항 6

NMDA 수용체-채널 복합체에서 PCP 수용체에 대하여 높은 결합 활성을 나타내고, N-(1-나프틸)-N'-(*o*-요오도페닐)구아니딘, N-(1-나프틸)-N'-(*m*-에틸페닐)구아니딘, 및 N-(1-나프틸)-N'-(*o*-이소프로필페닐)구아니딘; 또는 생리학적으로 허용가능한 이들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것으로서, 신경보호 작용을 하는 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘.

청구항 7

N-(1-나프틸)-N'-(*o*-요오도페닐)구아니딘.

청구항 8

N-(1-나프틸)-N'-(*m*-에틸페닐)구아니딘.

청구항 9

N-(1-나프틸)-N'-(*o*-이소프로필페닐)구아니딘.

청구항 10

신경독성을 나타내거나 또는 그에 민감한 포유동물에서 신경독성과 관련된 NMDA 수용체-이온 채널을 저해하는 방법으로서, 신경세포의 PCP 수용체에 높은 친화도를 갖는 비스-1,3-(*o*-이소프로필페닐)구아니딘, 비스-1,3-(*m*-이소프로필페닐)구아니딘, 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘 및 비스-1,3-(*m*-시페닐)구아니딘 또는 생리학적으로 허용가능한 그들의 염으로 구성된 그룹에서 선택된 대칭적인 N,N'-이치환된 구아니딘을 상기 포유동물에게 상기 신경독성을 저해하는데 유효한 양만큼 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 11

제10항에 있어서, 신경독성이, 저산소증, 저혈당증, 뇌나 척수 인대의 구소빈혈 또는 뇌나 척수 인대의 외상으로 인한 내인성 글루타메이트의 과도한 방출에 의해 야기되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 12

제10항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘의 비스-1,3-(*o*-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 13

제10항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘의 비스-1,3-(*m*-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 14

제10항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘의 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘인 방법.

청구항 15

제10항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘의 비스-1,3-(*m*-메톡시페닐)구아니딘인 방법.

청구항 16

신경독성을 나타내거나 또는 그에 민감한 포유동물에서 신경독성에 관련 NMDA 수용체-이온 채널을 저해하는 방법으로서, 상기 포유 동물에 신경세포의 PCP 수용체에 높은 친화도를 가지고 있는 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘을 신경독성을 저해하는데 유효한 양으로 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 17

제16항에 있어서, 신경독성이 저산소증, 저혈당증, 뇌나 척수 인대의 국소빈혈, 또는 뇌나 척수 인대의 외상으로 인한 내인성 글루타메이트의 과도한 방출에 의해 야기되는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 18

제16항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(나프틸)-N'-(*o*-요오도페닐)구아니딘, N-(1-나프틸)-N'-(*m*-에틸페닐)구아니딘 및 N-(1-나프틸)-N'-(*o*-이소프로필페닐)구아니딘; 또는 생리학적으로 허용가능한 이들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것인 방법.

청구항 19

제18항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(*o*-요오도페닐)구아니딘인 방법.

청구항 20

제18항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(m-에틸페닐)구아니딘인 방법.

청구항 21

제18항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 22

질병의 병리생리학적상 NMDA 수용체의 작동제로 인해 신경세포의 과도한 흥분이 일어나는 신경계의 질병을 치료하는 방법으로서, 이러한 질병의 증상을 나타내거나 이러한 질병에 민감한 포유동물에, 신경세포의 PCP 수용체에 대하여 높은 친화도를 가지고 있는 비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘, 비스-1,3-(m-이소프로필페닐)구아니딘, 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘, 및 비스-1,3-(m-메톡시페닐)구아니딘 또는 생리학상으로 허용가능한 그들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 대칭적인 N,N'-이치환된 구아니딘을 상기 질병을 치료하는데 유효한 양으로 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 23

제22항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 24

제22항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(m-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 25

제22항에 있어서, N,N'-이치환된 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘인 방법.

청구항 26

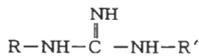
제22항에 있어서, N,N'-이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(m-메톡시페닐)구아니딘인 방법.

청구항 27

질병의 병리생리학상 NMDA 수용체의 작동제로 인해 신경세포의 과도한 흥분이 일어나는 신경계의 질병을 치료하는 방법으로서, 이와같은 질병의 증상을 나타내거나 이러한 질병에 민감한 포유동물에, 신경세포의 PCP 수용체에 대하여 높은 친화도를 가지고 있는 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘을 이들 질병을 치료하는데 유효한 양만큼 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 28

제27항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 하기식으로 표시되는 것임을 특징으로 하는 방법;



상기식에서, R과 R'는 서로 다르며, C₄-C₁₂인 알킬기, C₃-C₁₂인 시클로 알킬기, C₆-C₁₈이며 1-3개의 베타의 고리 또는 융합된 고리를 함유하는 카르보시클릭아릴, 알카릴, 아랄킬, 또는 헤테로 시클릭기이다.

청구항 29

제28항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(o-요오도페닐)구아니딘, N-(1-나프틸)-N'-(m-에틸페닐)구아니딘, 및 N-(1-나프틸)-N'-(o-이소프로필페닐)구아니딘 또는 생리학적으로 허용가능한 이들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것인 방법.

청구항 30

제29항에 있어서, 비대칭적인 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(o-요오도페닐)구아니딘인 방법.

청구항 31

제29항에 있어서, 비대칭적인 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(m-에틸페닐)구아니딘인 방법.

청구항 32

제29항에 있어서, 비대칭적 N,N'-이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N'-(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 33

제22항에 있어서, 상기 질병이 알츠하이머병, 헌팅톤병, 아미오트로픽 래터럴 스크레로시스, 다운증후군 또는 코르사코프병인 방법.

청구항 34

제33항에 있어서, 상기 N,N'-이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 35

제33항에 있어서, 상기 N,N-이치환된 비스-1,3-(m-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 36

제33항에 있어서, 상기 N,N-이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘인 방법.

청구항 37

제33항에 있어서, 상기 N,N' -이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(m-메톡시페닐)구아니딘인 방법.

청구항 38

제27항에 있어서, 상기 질병이 알츠하이머병, 헌팅톤병, 아마요트로픽 레터럴 스크레로시스, 다운증후군 또는 코르사코프병인 방법.

청구항 39

제38항에 있어서, 비대칭적인 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-요오도페닐)구아니딘, N-(1-나프틸)-N' -(m-에틸페닐)구아니딘, 및 N-(1-나프틸)-N' -(o-이소프로필페닐)구아니딘; 또는 생리학적으로 허용가능한 그 이들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것인 방법.

청구항 40

제39항에 있어서, 비대칭적 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-요오도페닐)구아니딘.

청구항 41

제39항에 있어서, 비대칭적인 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(m-에틸페닐)구아니딘인 방법.

청구항 42

제39항에 있어서, 상기 비대칭적인 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 43

제22항에 있어서, 포유동물이 간질로 고통받는 사람인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 44

제43항에 있어서, 상기 N,N' -이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 45

제43항에 있어서, 상기 N,N' -이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(m-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

청구항 46

제43항에 있어서, N,N' -이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(1-나프틸)구아니딘인 방법.

청구항 47

제43항에 있어서, 상기 N,N' -이치환된 구아니딘이 비스-1,3-(m-메톡시페닐)구아니딘인 방법.

청구항 48

제27항에 있어서, 포유동물이 간질로 고통받는 사람인 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 49

제48항에 있어서, 비대칭적 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-요오도페닐)구아니딘, N-(1-나프틸)-N' -(m-에틸페닐)구아니딘, 및 N-(1-나프틸)-N' -(o-이소프로필페닐)구아니딘; 또는 생리학적으로 허용가능한 그들의 염으로 구성된 그룹으로부터 선택된 것인 방법.

청구항 50

제49항에 있어서, 비대칭적 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-요오도페닐)구아니딘인 방법.

청구항 51

제49항에 있어서, 비대칭적 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(m-에틸페닐)구아니딘인 방법.

청구항 52

제49항에 있어서, 비대칭적 N,N' -이치환된 구아니딘이 N-(1-나프틸)-N' -(o-이소프로필페닐)구아니딘인 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면

도면1

