

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>3</sup> C07D 209/76	(11) 공개번호 특 1984-0007585
	(43) 공개일자 1984년 12월 08일
(21) 출원번호	특 1984-0000070
(22) 출원일자	1984년 01월 10일
(30) 우선권주장	P3300774,8 1983년 01월 12일 독일(DE)
(71) 출원인	헥스트 아크티엔게젤샤프트 하인리히 벡커, 베른하르트 벡
(72) 발명자	독일연방공화국 데 6230 프랑크푸르트 암 마인 80, 브뤼닝스트라세 45 라이너 헤닝
(74) 대리인	독일연방공화국 데-6000 프랑크푸르트 암 마인 71, 쉘클링거 베그 56 이병호, 김성기

심사청구 : 없음

(54) 스피로 사이클릭 아미노산 유도체의 제조방법

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

스피로 사이클릭 아미노산 유도체의 제조방법

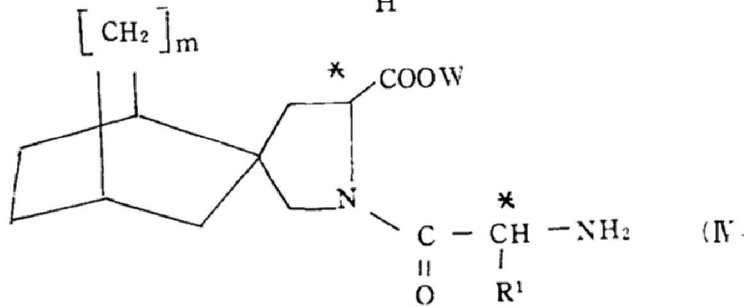
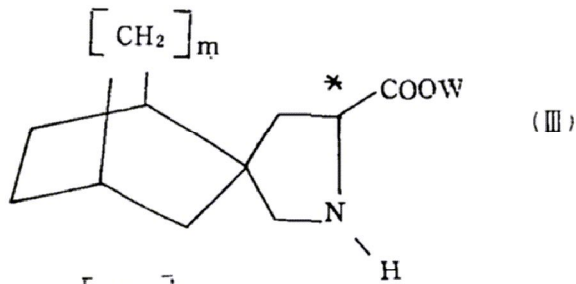
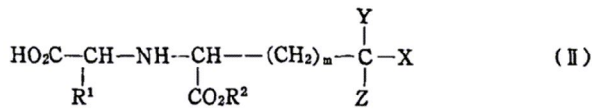
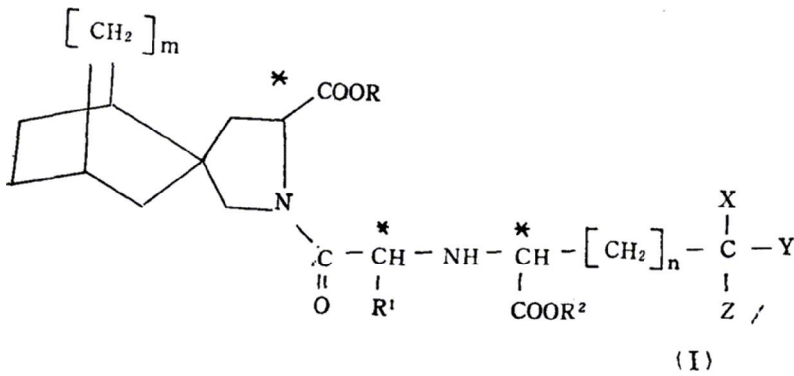
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

a) 일반식(II) 화합물을 일반식(III) 화합물과 반응시키고, 다음에 적절하게는 W 및/또는 R<sup>1</sup>을 분해하여 유리카복실그룹을 형성시키거나, b) Y 및 Z가 함께 산소를 나타내는 일반식(I) 화합물을 제조하기 위해, 일반식(IV) 화합물을 일반식(V) 화합물과 반응시킨후 적절하게는 W 및 /또는 R<sup>2</sup>를 분해하여 유리카복실그룹을 형성시키거나, 언급된 일반식(IV) 화합물을 일반식(VI) 화합물 및 일반식(VII) 화합물과 반응시킨 후 적절하게는 W 및/또는 R<sup>2</sup>를 분해하여 유리카복실 그룹을 형성시키거나, c) Y 및 Z가 각각 수소를 나타내는 일반식(I) 화합물을 제조하기 위해, 언급된 일반식(IV) 화합물을 일반식(VIII) 화합물과 반응시킨 후 생성된 슈프염기(schiff's base)를 환원시킨 다음 적절하게는 W 및/또는 R<sup>2</sup>를 분해하여 유리카복실 그룹을 형성시키거나, d) Y가 하이드록실을 나타내고, Z가 수소를 나타내는 일반식(I) 화합물을 제조하기 위해, Y 및 Z가 함께 산소를 나타내는 일반식(I) 화합물을 보라네이트착물 또는 보란-아민 착물로 환원시키고 임의로는 a) 내지 b)에 따라 수득된 일반식(I)의 화합물(R=수소)을 RO(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알킬 또는 (C<sub>7</sub> 내지 C<sub>9</sub>)-아르알킬을 나타내는 일반식(I)의 에스테르로 전환시킴을 특징으로 하여 일반식(I) 화합물

및 그의 생리학적으로 무독한 염을 제조하는 방법.



상기식에서, m은 1 또는 2를 나타내고, n은 0 또는 1를 나타내며, R은 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알킬 또는 탄소수 7 내지 9의 아르알킬을 나타내고, R<sup>1</sup>은 수소 또는 아미노, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-아실아미노, 또는 벤조일아미노로 임의 치환될 수 있는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알킬; 각각 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub> 또는 C<sub>2</sub>)-알콕시 또는 할로겐으로 치환될 수 있는 (C<sub>2</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알케닐, (C<sub>5</sub> 내지 C<sub>9</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>5</sub> 내지 C<sub>9</sub>)-사이클로알케닐, (C<sub>5</sub> 내지 C<sub>7</sub>)-사이클로알킬-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>6</sub> 내지 C<sub>12</sub>)-아릴 또는 부분적으로 수소화된(C<sub>6</sub> 내지 C<sub>12</sub>)-아릴, (C<sub>6</sub> 내지 C<sub>12</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬 또는 (C<sub>7</sub> 내지 C<sub>13</sub>)-아로일-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>2</sub>)-알킬(양자는 모두 상기에 기술된 바와 같이 아릴 라디칼에서 치환될 수 있다); 각 5 내지 7개 또는 내지 10개의 환원자를 지니며 이중 1 내지 2개의 환원자는 황 또는 산소원자이고/이거나 1 내지 4개의 환원자는 질소원자인 모노사이클릭 또는 비사이클릭 헤테로 사이클릭 라디칼; 또는 임의로 보호된 천연 α-아미노산의 측쇄를 나타내며; R<sup>2</sup>은 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알킬(C<sub>2</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알케닐 또는 (C<sub>6</sub> 내지 C<sub>12</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬을 나타내고; Y는 수소 또는 하이드록실을 나타내며, Z는 수소를 나타내고, Y 및 Z가 함께 산소를 나타내며, X는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>2</sub> 내지 C<sub>6</sub>)-알케닐, (C<sub>5</sub> 내지 C<sub>9</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>6</sub> 내지 C<sub>12</sub>)-아릴[

이때 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알콕시, 하이드록시, 할로겐, 니트로, 아미노, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬-아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬아미노 및/또는 메틸렌-디옥시로 일치환, 이치환 또는 삼치환될 수 있다] 또는 3-인돌릴을 나타내고, W는 수소 또는 산 또는 가수소분해로 분해될 수 있는 라디칼을 나타낸다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, \*표시의 각 탄소원자가 S배위를 갖는 일반식(I) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 3**

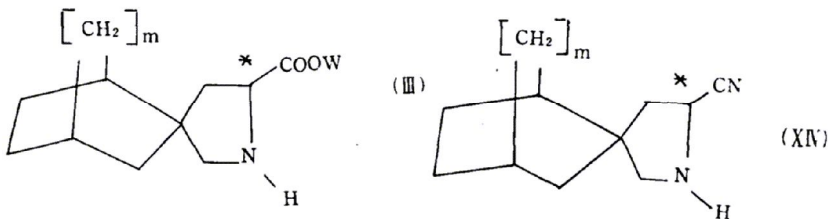
제1 및 2항중 어느 하나에 있어서, m이 1 또는 2를 나타내고, n이 1을 나타내며, R<sup>1</sup>이 수소 또는 (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬을 나타내고, R<sup>1</sup>이 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>3</sub>)-알킬, (C<sub>2</sub> 또는 C<sub>3</sub>)-알케닐, 벤질, 4-메톡시벤질, 4-에톡시벤질, 펜에틸, 4-아미노부틸 또는 벤조일 메틸을 나타내며, R<sub>2</sub>가 수소, (C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬 또는 벤질을 나타내고, X가 사이클로헥실 또는 (C<sub>1</sub> 또는 C<sub>2</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub> 또는 C<sub>2</sub>)-알콕시, 하이드록실, 불소, 염소, 브롬, 아미노, (C<sub>1</sub> 또는 내지 C<sub>4</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub> 내지 C<sub>4</sub>)-알킬아미노, 니트로 및/또는 메틸렌디옥시로 일치환된 또는 메톡시의 경우에는 삼치환된 페닐을 나타내는 일반식(I) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 4**

제1항에 있어서, m이 1 또는 2를 나타내고, n이 1을 나타내며, R<sup>1</sup>이 수소를 나타내고, R<sup>1</sup>이 메틸, 4-메톡시벤질 또는 4-에톡시벤질을 나타내며, R<sup>2</sup>가 수소 또는 에틸을 나타내고, \*로 표시된 키랄 탄소원자가 S-배위를 갖는 일반식(I) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 5**

일반식(XIV) 화합물을 무기산 또는 강염기로 가수분해시키고, 적절하게는 생성된 아미노산(II/W=수소)을 에스테르화시킴을 특징으로 하여 일반식(III) 화합물을 제조하는 방법.



상기식에서 m은 1 또는 2를 나타내고, W는 수소 또는 산 또는 가수소분해로 분해될 수 있는 라디칼을 나타낸다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.