

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07D 207/520	(11) 공개번호 특 1985-0001167
	(43) 공개일자 1985년 03월 16일
(21) 출원번호 특 1984-0003851	
(22) 출원일자 1984년 07월 05일	
(30) 우선권주장 P 3324263.1 1983년 07월 06일 독일(DE)	
(71) 출원인 핵스트 아크티엔 게젤샤프트 하인리히 벡커 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 45 아크티엔 게젤샤프트 베른하르트 벡 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 45	
(72) 발명자 한스외르그 우르바흐	
(74) 대리인 독일연방공화국 데-6242 크론베르크/타우누스 레 라반도우 스트라세 41 이병호	

심사청구 : 없음

(54) 2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-3-카복실산 유도체의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-3-카복실산 유도체의 제조방법

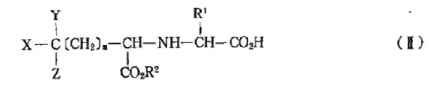
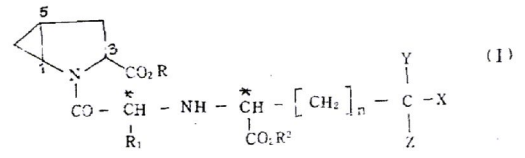
[도면의 간단한 설명]

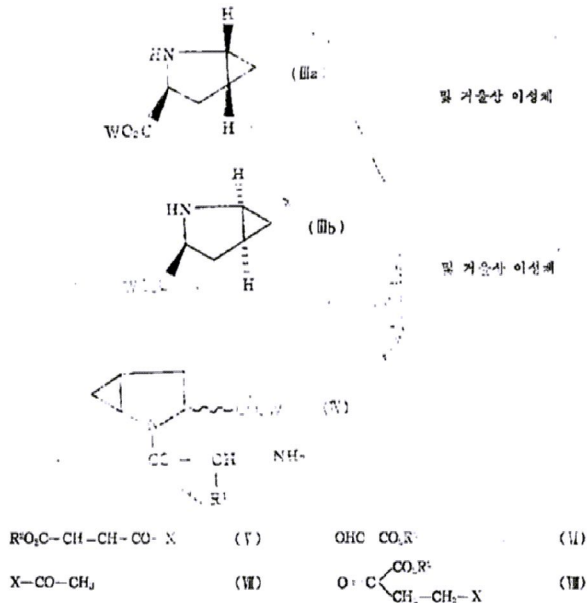
본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

a) 일반식(II)의 화합물을 일반식(IIIa) 또는 (IIIb)의 화합물 또는 이의 입체성이성체 혼합물과 반응시킨 다음, 그 생성물을 수소화시키거나 산 또는 염기로 처리하거나, b) Y와 Z가 함께 산소인 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해, b₁) 일반식(IV)의 화합물을 일반식(V)의 화합물과 반응시키고, 경우에 따라서, 유리 카복실기를 생성시키면서 W 및/또는 R²를 분리시키거나, b₂) 일반식(IV)의 화합물을 일반식(VI)의 화합물 및 일반식(VII)의 화합물과 반응시키고, 경우에 따라서, 유리카복실기를 생성시키면서 W 및/또는 R²를 분리시키거나, c) Y 및 Z가 각각 수소인 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해서, 일반식(IV)의 화합물을 일반식(VIII)의 화합물과 반응시키고, 생성된 슈프(Schiff's) 염기를 환원시킨 후, 경우에 따라서, 유리카복실기를 생성시키면서 W 및/또는 R²를 분리시키거나, d) Y는 히드록실이고 Z가 수소인 일반식(I)의 화합물을 제조하기 위해, Y와 Z가 함께 산소인 일반식(I)의 화합물을 복합 보로네이트 또는 보란-아민 복합물으로써 환원시키고; 경우에 따라서, 상기 a) 내지 d)에 따라서 수득한 ROI 수소인 일반식(I)의 화합물을 ROI(C₁ 내지 C₆)-알킬 또는 (C₇ 내지 C₉)-아르알킬인 일반식(I)의 에스테르로 전환시키고, 경우에 따라서, 일반식(I)의 화합물을 생리학적으로 허용되는 이의 염으로 전환시킴을 특징으로하여, 일반식(I)의 화합물 및 생리학적으로 허용되는 이의 염을 제조하는 방법.





상기 식에서, n은 0 또는 1이고, R은 수소, (C₁ 내지 C₆)-알킬, (C₂ 내지 C₆)-알케닐 또는 (C₆ 내지 C₁₂)-아릴-(C₁ 내지 C₄)-알킬이고, R¹은 수소; 아미노(C₁ 내지 C₆)-아실아미노 또는 벤조일아미노에 의해 임의로 치환될 수 있는(C₁ 내지 C₆)-알킬; (C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₁ 내지 C₂)-알콕시 또는 할로겐에 의해 각각 치환될 수 있는 (C₂ 내지 C₆)-알케닐; (C₅ 내지 C₉)-시클로알킬, (C₅ 내지 C₉)-시클로알케닐, (C₅ 내지 C₇)-시클로알킬-(C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₆ 내지 C₁₂)-아릴 또는 부분적으로 수소화된(C₆ 내지 C₁₂)-아릴; 상기 정의한 바와 같이 알릴라디칼부위에 치환될 수 있는(C₆ 내지 C₁₂)-아릴-(C₁ 내지 C₄)-알킬 또는 (C₇ 내지 C₁₃)-아로일-(C₁ 내지 C₂)-알킬; 각각 5 내지 7 또는 8 내지 10개의 고리원자(이중 1 또는 2개의 고리원자는 황 또는 산소이고/이거나 1 내지 4개의 고리원자는 질소원자이다)를 가지는 일환식 또는 이환식 헤테로사이클릭라디칼; 또는 천연 α-아미노산 R¹-CH(NH₂)-COOH의 임의 보호된 축쇄이고, R²는 수소, (C₁ 내지 C₆)-알킬, (C₂ 내지 C₆)-알케닐 또는 (C₆ 내지 C₁₂)-아릴-(C₁ 내지 C₄)-알킬이고, 단, 일반식(II)에서 R²는 수소는 아니며, Y는 수소 또는 히드록실이고, Z는 수소이거나, Y와 Z는 함께 산소이며, X는 (C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₁ 내지 C₄)-알콕시, 히드록실, 할로겐, 니트로, 아미노, 아실아미노, (C₁ 내지 C₄)-알킬아미노, 디-(C₁ 내지 C₄)-알킬아미노 및/또는 메틸렌 디옥시에 의해 각각 일치환, 이치환 또는 삼치환 될 수 있는 (C₁ 내지 C₆)-알킬, (C₂ 내지 C₆)-알케닐, (C₅ 내지 C₉)-시클로알킬, (C₆ 내지 C₁₂)-아릴; 또는 3-인돌일이고, W는 카복실을 에스테르화시키는 기이다.

청구항 2

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐 프로필)-S-알라닐-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 3

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐 프로필)-S-알라닐-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-S-리실-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 5

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐프로필)-S-리실-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 6

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐 프로필)-0-에틸-S-티로실-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐 프로필)-0-메틸-S-티로실-시스-2-아자비시클로[3.1.0] 헥산-엔도-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 8

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐 프로필)-S-알라닐-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐 프로필)-S-알라닐-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 10

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-S-리실-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 11

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐프로필)-S-리실-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 12

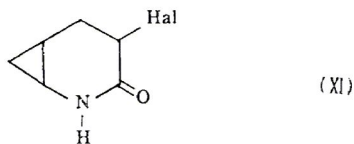
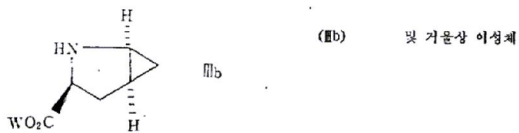
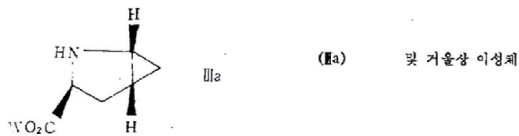
제1항에 있어서, N-(1-S-카복시에톡시-3-페닐프로필)-0-에틸-S-티로실-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 13

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-0-메틸-S-티로실-시스-2-아자비시클로 [3.1.0] 헥산-엑소-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

청구항 14

일반식(XI)의 화합물을 염기의 존재하에서 전위 반응시키고, 경우에 따라서 생성된 W가 수소인 일반식(IIIa) 또는 (IIIb)의 화합물을 에스테르화시킴을 특징으로 하여, 일반식(IIIa) 또는 (IIIb)의 화합물 및 이의 입체이성체 혼합물을 제조하는 방법.



상기식에서, W는 수소 또는 카복실을 에스테르화시키는 기이고, Hal은 할로겐이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.