

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
C07D 501/36

(11) 공개번호 특1995-0008519
(43) 공개일자 1995년04월17일

(21) 출원번호 특1993-0018319
(22) 출원일자 1993년09월11일

(71) 출원인 주식회사 럭 키 최근선
서울특별시 영등포구 여의도동 20번지
(72) 발명자 여재홍
대전직할시 유성구 신성동 럭키하나아파트 107-1505
방찬식
대전직할시 유성구 도룡동 386-4 럭키사원아파트 B-208
임종찬
대전직할시 유성구 신성동 럭키하나아파트 103-203
우영민
대전직할시 유성구 신성동 럭키하나아파트 103-1307
양덕호
대전직할시 유성구 도룡동 386-4 럭키사원아파트 A-405
김세호
서울특별시 구로구 독산본동 973-31
전재훈
서울특별시 은평구 응암1동 103-6
서미경
서울특별시 송파구 방이동 159-12호
김삼식
대전직할시 유성구 도룡동 386-4 럭키사원아파트 A-101
이태희
대전직할시 유성구 도룡동 럭키기숙사 416호
김용주
대전직할시 유성구 신성동 럭키하나아파트 102-401
오현승
대전직할시 유성구 신성동 하나아파트 102-103
(74) 대리인 최규팔

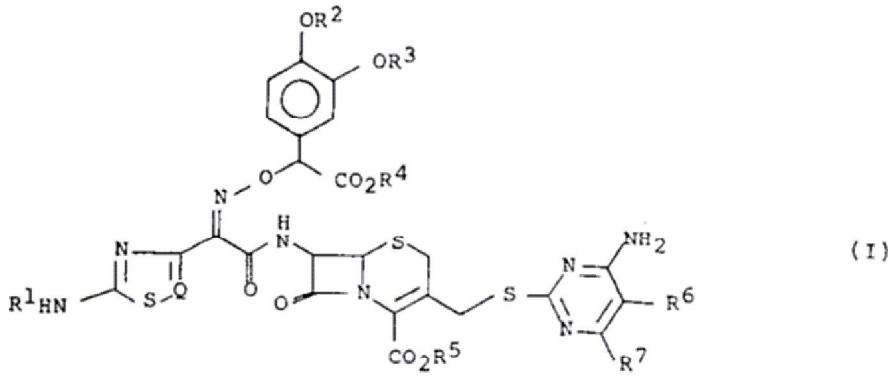
심사청구 : 없음

(54) 신규 세팔로스포린계 항생제 및 이의 제조방법

요약

본 발명은 항생제로서 유용한 하기 일반식(1)로 표시되는 신규의 세팔로스포린화합물, 약제학적 허용 가

능한 그의 무독성염, 생리학적으로 가수분해 가능한 에스테르, 수화물 및 용매화물과 이들의 이성질체.



상기식에서, R¹은 수소 또는 아미노 보호기를 나타내고; R² 및 R³는 각각 동일 또는 상이할 수 있으며, 각각 수소 또는 히드록시기 보호기를 나타내거나, R² 및 R³가 함께 고리형 디올 보호기를 형성할 수 있고; R⁴ 및 R⁵는 각각 수소 또는 카르복실 보호기이고, R⁶ 및 R⁷은 각각 독립적으로 수소, 아미노기 또는 치환된 아미노기, 히드록시기 또는 알콕시기, C₁₋₄알킬기, 카르복실기 또는 알콕시카르복실기를 나타내거나, R⁶ 및 R⁷은 그들이 부착되어 있는 탄소원자와 함께 C₃₋₇의 고리를 형성할 수 있으며, Q는 =CH-또는 =N-이다.

명세서

[발명의 명칭]

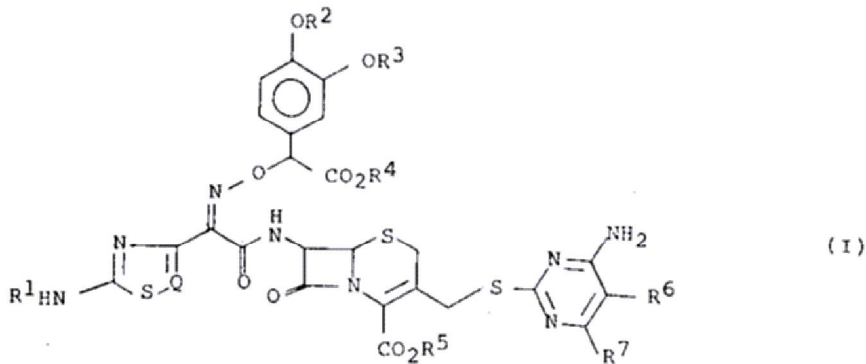
신규 세팔로스포린계 항생제 및 그의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(1)로 표시되는 신규의 세팔로스포린화합물, 약제학적 허용 가능한 그의 무독성염, 생리학적으로 가수분해 가능한 에스테르, 수화물 및 용매화물과 이들의 이성질체.



상기식에서, R¹은 수소 또는 아미노 보호기를 나타내고; R² 및 R³는 각각 동일 또는 상이할 수 있으며, 각각 수소 또는 히드록시기 보호기를 나타내거나, R² 및 R³가 함께 고리형 디올 보호기를 형성할 수 있고; R⁴ 및 R⁵는 각각 수소 또는 카르복실 보호기이고, R⁶ 및 R⁷은 각각 독립적으로 수소, 아미노기 또는 치환된 아미노기, 히드록시기 또는 알콕시기, C₁₋₄알킬기, 카르복실기 또는 알콕시카르복실기를 나타내거나, R⁶ 및 R⁷은 그들이 부착되어 있는 탄소원자와 함께 C₃₋₇의 고리를 형성할 수 있으며, Q는 =CH-또는 =N-이다.

청구항 2

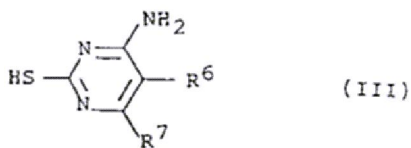
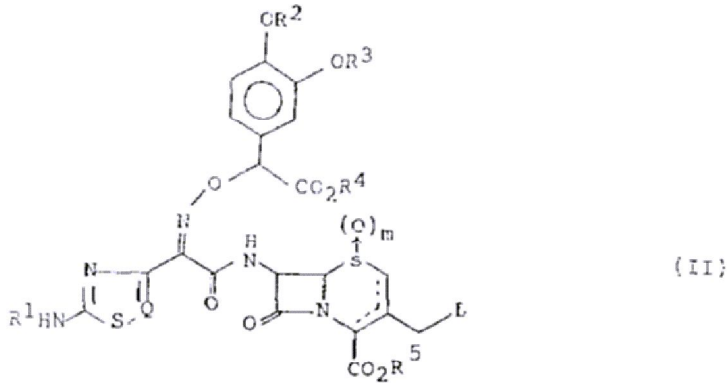
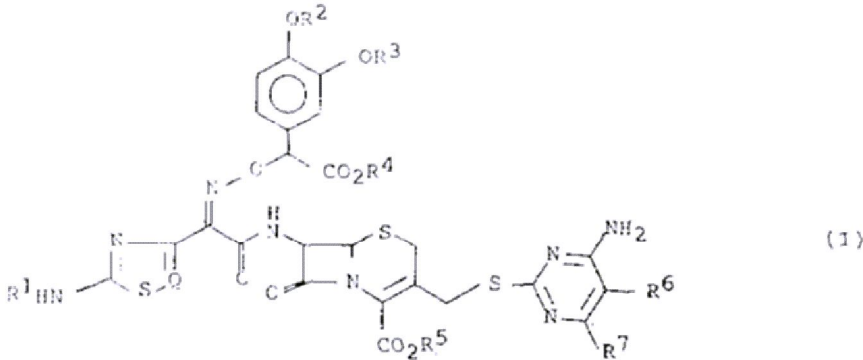
제1항에 있어서, R¹, R⁴ 및 R⁷가 각각 동시에 수소원자이고; R² 및 R³는 각각 같거나 상이하며 수소 또는 아세틸기이며, R⁶가 수소 또는 메틸기이고, R⁷이 수소 또는 아미노기이거나, R⁶ 및 R⁷은 그들이 부착되어 있는 탄소원자와 함께 C₅₋₆의 고리를 형성함을 특징으로 하는 일반식(1)화합물.

청구항 3

제1항에 있어서, 하기 화합물로 구성된 군에서 선택된 일반식(I)의 화합물 7-[(Z)-2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-(α -카르복시-3,4-디하이드록시벤질옥시이미노)아세트아미도]-3-(4,6-디아미노피리미딘-2-일)티오메틸-3-세템-4-카르복실산; 7-[(Z)-2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-(α -카르복시-3,4-디하이드록시벤질옥시이미노)아세트아미도]-3-(4,6-디아미도-5-메틸피리미딘-2-일)티오메틸-3-세템-4-카르복실산; 7-[(Z)-2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-(α -카르복시-3,4-디하이드록시벤질옥시이미노)아세트아미도]-3-(4-아미노피리미딘-2-일)티오메틸-3-세템-4-카르복실산; 7-[(Z)-2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-(α -카르복시-3,4-디하이드록시벤질옥시이미노)아세트아미도]-3-(4-아미노-5,6-시클로펜타피리미딘-2-일)티오메틸-3-세템-4-카르복실산; 7-[(Z)-2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-(α -카르복시-3,4-디하이드록시벤질옥시이미노)아세트아미도]-3-(4,5,6-트리아미노피리미딘-2-일)티오메틸-3-세템-4-카르복실산.

청구항 4

하기 일반식 (II)의 화합물을 용매 존재하에 하기 일반식(III)의 화합물과 반응시키고, 필요에 따라 반응 전이나 후에 아미노보호기 또는 산보호기를 제거시키거나 S-옥사이드[S→(O)m]를 환원시킴을 특징으로 하여 하기 일반식(I)의 화합물, 약제학적 허용가능한 그의 무독성염, 생리학적 가수분해 가능한 그의 에스테르, 수화물 또는 용매화물과 이들의 이성질체의 제조방법.



상기식에서, R¹은 수소 또는 아미노 보호기이고; R² 및 R³는 각각 같거나 상이할 수 있으며, 수소 또는 히드록시기 보호기를 나타내거나, R² 및 R³가 함께 고리형 디 보호기를 형성할 수 있으며; R⁴ 및 R⁵는 수소 또는 카르복실 보호기이고, R⁶ 및 R⁷은 각각이 수소, 아미노기 또는 치환된 아미노기, 히드록시기 또는 알콕시, C₁₋₄알킬기, 카르복실기 또는 알콕시카르보닐기를 나타내거나, R⁶ 및 R⁷은 그들이 부착되어 있는 탄소와 함께 C₃₋₇의 고리를 형성할 수 있고, Q는 -CH- 또는 =N-이며, L은 이탈기이고, m은 0 또는 1이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.