

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07H 17/08	(11) 공개번호 (43) 공개일자	특 1987-0007196 1987년 08월 17일
(21) 출원번호	특 1986-0001742	
(22) 출원일자	1985년 03월 11일	
(30) 우선권주장	8506381 1985년 03월 12일 영국(GB) 8507626 1985년 03월 23일 영국(GB) 8600553 1986년 01월 10일 영국(GB)	
(71) 출원인	비이참 그루우프 피이엘시이 로널드 스미자아 영국 미들섹크스주 티이다블류 8 9비이디이(TW8 9BD) 부렌트호오드시 그레 이트 웨스트 로오드 비이참 하우스	
(72) 발명자	존 시드니 데이비스 영국 서리주 아아르 에이치 29 디이큐우 (RH2 9DQ) 라이거트시 보우포트 로 오드 17	
(74) 대리인	차윤근, 차순영	

심사청구 : 없음

(54) 화학적 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]
화학적 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

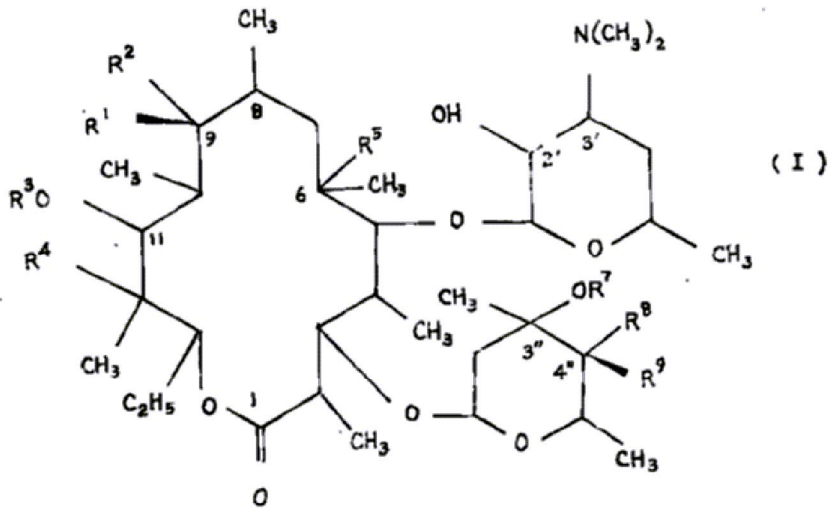
(57) 청구의 범위

청구항 1

어떤 반응기(11-히드록시기 이외의 것)가 임의로 보호된 하기 일반구조식(VII)의 화합물을 하기 일반구조식(VIII)의 알킬화제와 반응시켜 R¹ 및 R²가 함께 옥소기 또는 치환된 옥소기를 나타내는 일반구조식(I)의 화합물을 얻고 이후에, 필요하거나 요구되면, 어떠한 적당한 순서로

- (a) 에리트로마이신 구조상의 치환체를 관례적 방법으로 다른 그러한 치환체로 전환시킨다;
 - (b) 어떤 보호기를 제거한다; 및
 - (c) 제약학적으로 수용 가능한 에스테르 또는 산부가염을 형성한다의
- 단계 하나 또는 그 이상을 수행하는 것으로 구성되는 하기 일반구조식(I)의 화합물 또는 그 제약학적으

로 수용 가능한 에스테르 또는 산부가염의 제조방법.



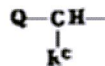
상기 식에서,

R^1 및 R^2 중 하나는 수소이고, R^1 및 R^2 중 다른 하나는 아미노기 또는 치환된 아미노기이거나 R^1 및 R^2 는 함께 옥소기, 옥심기, 치환된 옥심기 또는 이미노기이고,

R^5 는 히드록시기 또는 알콕시기이거나;

R^1 및 R^2 중 하나는 히드록시기 또는 아미노기이고 R^1 및 R^2 중 다른 하나는 R^5 와 함께 에테르 산소원자, -O-, 이고,

R^3 는 하기 구조식(II)의 기이고:



이 식에서

Q는 다음의 기들 중 하나이다.



R^{A} 는 비치환 또는 치환 탄화수소기이고,

R^{B} 는 수소원자 또는 비치환 또는 치환 탄화수소 또는 탄화수소-옥시기이고,

R^{C} 및 R^{D} 는 같거나 다를 수 있고 각각 수소원자 또는 비치환 또는 치환 탄화수소기이거나

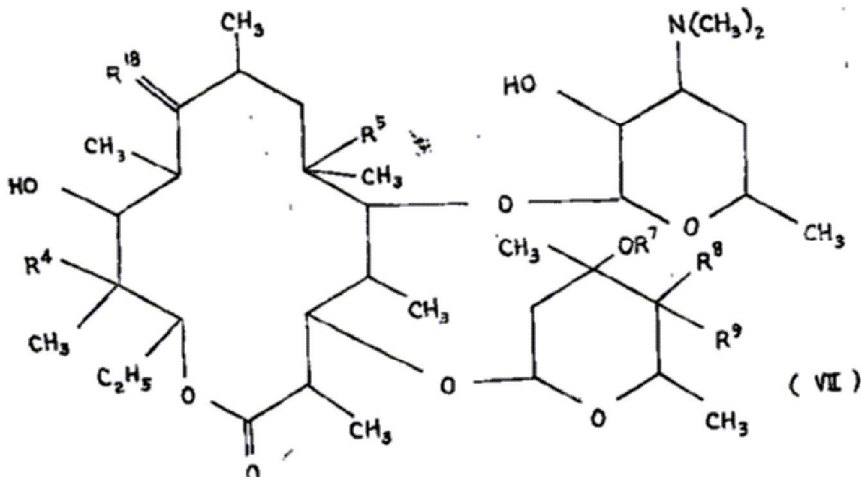
R^{A} , R^{B} , R^{C} 및 R^{D} 중 어떤 2개는 함께 분자의 개입원자와 함께 4-7각의 헤테로시클릭고리를 형성하는 2개의, 비치환 또는 치환 유기기이다.

R^4 는 수소 또는 히드록시이고;

R^7 은 수소 또는 메틸이고;

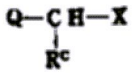
R^8 및 R^9 중 하나는 수소, 히드록시, 알콕시, 알카노일옥시, 아미노, 치환된 아미노, 또는 구조식 $R^{12}-\text{SO}_2-$ O-의 기이고 R^8 및 R^9 중 다른 하나는 수소가거나 R^8 및 R^9 는 함께 옥소기, 옥심기 또는 치환된 옥심기이고;

R¹²는 유기기이다.



상기 식에서,

R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ 및 R⁹는 상기 정의한 바와 같고 R¹⁸은 옥소기, 옥심기 또는 치환된 옥심기이다.



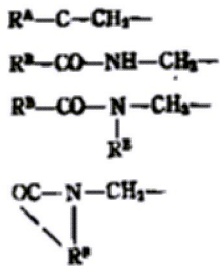
상기 식에서,

Q 및 R^c는 상기 정의한 바와 같고,

X는 이탈기이다.

청구항 2

제1항에 있어서, R³가 다음 구조식들 중 하나의 기인 방법.



상기 식에서,

R^a 및 R^b는 제1항에 정의된 것과 같고,

R^b는 비치환 또는 치환 탄화수소기이고,

R^f는 4-7각의 고리를 형성하는 비치환 또는 치환, 2가의 탄화수소기이다.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, R^a가 2-치환-에틸 또는 3-치환 프로필기인 방법.

청구항 4

제3항에 있어서, R^a가, 치환체가 아미노, N-알킬아미노, N,N-디알킬아미노, 할로겐, 하이드록시, 알콕시, 벤조일옥시, 알칸설포닐옥시, 트리실릴옥시, 알콕시카르보닐, 알카노일옥시, 펜옥시 및 헤테로시클릴기로부터 선택된, 2-치환-에틸 또는 3-치환-프로필기인 방법.

청구항 5

제1항 내지 제4항 중 어느 하나에 있어서, R¹ 및 R²가 함께 하기 구조식(IV)의 기인 방법

=N-O-R¹³ (IV)

이 식에서 R¹³은 수소 또는 비치환 또는 치환 탄화수소기 또는 아실기이다.

청구항 6

제5항에 있어서, R¹³이 수소원자 또는 메틸기인 방법.

청구항 7

제1항 내지 제6항 중 어느 하나에 있어서, R⁴가 히드록시기인 방법.

청구항 8

제1항 내지 제7항 중 어느 하나에 있어서, R⁵가 히드록시기인 방법.

청구항 9

제1항 내지 제8항 중 어느 하나에 있어서, R⁷이 메틸기인 방법.

청구항 10

제1항 내지 제9항 중 어느 하나에 있어서, R⁸이 수소원자이고 R⁹가 히드록시기인 방법.

청구항 11

제1항에 있어서, 실시예 1-64에서 특히 지정된 일반구조식(I)의 혼합물의 제조방법.

청구항 12

제1항에 있어서, 일반구조식(VII)의 화합물과 일반구조식(VIII)의 알킬화제와의 반응에 이어서, 하기 단계 하나 또는 그 이상을 어떤 적당한 순서로 수행하는 방법.

- (a) R¹ 및 R²로 함께 표시된 옥소기를 옥심기 또는 치환된 옥심기로 전환시킨다.
- (b) R¹ 및 R²로 함께 표시된 치환된 옥심기를 옥소기(또는 관련 토우토머), 다른 치환된 옥심기 또는 옥심기로 전환시킨다.
- (c) R¹ 및 R²로 함께 표시된 결과 생성된 옥심기를 옥소기(또는 관련 토우토머), 치환된 옥심기 또는 이미노기(또는 관련 토우토머)로 전환시킨다 ;
- (d) R¹ 및 R²로 함께 표시된 결과 생성된 이미노기를 R¹ 또는 R²로 표시된 아미노기로 전환시킨다 ;
- (e) R¹ 및 R²로 표시된 결과 생성된 아미노기를 치환된 아미노기로 전환시킨다 ;
- (f) R³, R⁵, R⁸ 및 R⁹로 표시된 하나 또는 그 이상의 기를 다른 그러한 기로 전환시킨다 ;
- (g) 존재하는 어떤 보호기를 제거한다 ; 및
- (h) 제약학적으로 수용 가능한 에스테르 또는 산부가염을 형성한다.

청구항 13

제12항에 있어서, R^A가 아지도 또는 할로겐 치환체를 함유하고, 단계(f)에서 그러한 치환체가 아미노 또는 치환된 아미노 치환체로 전환되거나 대치되는 방법.

청구항 14

일반구조식(I)의 화합물을 제약학적으로 수용 가능한 담체 또는 부형제와 결합시키거나 혼합물로 만드는 것으로 구성된 제약학적 조성물의 제조방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.