

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ³ C07D 209/56	(11) 공개번호 특1984-0006623
	(43) 공개일자 1984년 12월 01일
(21) 출원번호 특1983-0005346	
(22) 출원일자 1983년 11월 11일	
(30) 우선권주장 P 3242151.6 1982년 11월 13일 독일(DE)	
(71) 출원인 핵스트 아크티엔게젤샤프트 하인리히 벡커, 베른하르트 벡	
(72) 발명자 독일연방공화국 데-6230 프랑크푸르트 암 마인 80 브뤼닝스트라세 45 한스 외르그 우르바하	
(74) 대리인 독일연방공화국 데-6242 크론베르크/타우너스 레 라반도우스트라세 41 이병호, 김성기	

심사청구 : 없음

(54) 트리사이클릭아미노산 유도체의 제조방법

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

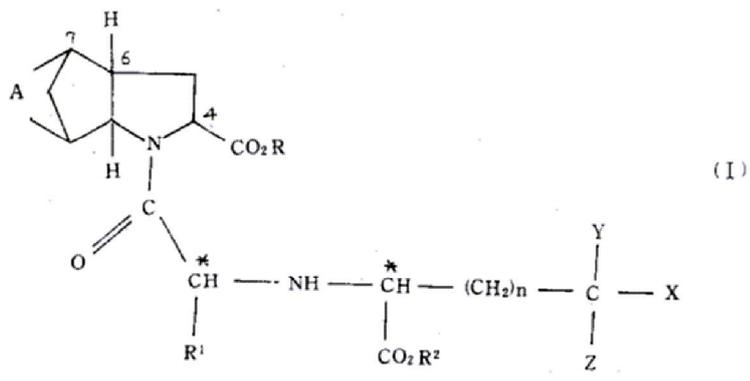
트리사이클릭 아미노산 유도체의 제조방법

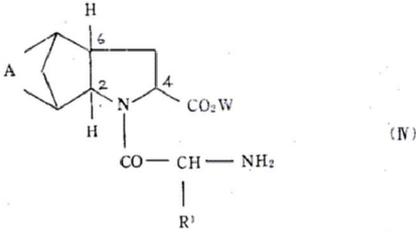
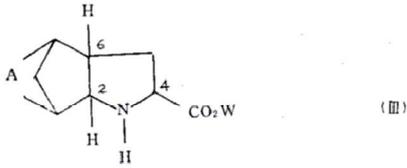
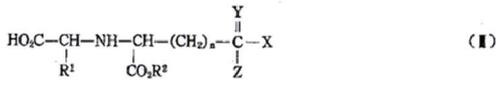
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

a) 하기 일반식(ii)의 화합물을 하기 일반식(iii)의 화합물과 반응시킨후, 필요에 따라 W 및/또는 R²를 제거하여 유리카복실 그룹을 형성하거나, b) Y 및 Z가 함께 산소인 일반식(i)의 화합물을 제조하기 위해, b₁) 하기 일반식(iv)의 화합물을 하기 일반식(v)의 화합물과 반응시킨후, 필요에 따라 W 및 /또는 R²를 제거하여 유리카복실 그룹을 형성하거나, b₂) 일반식(iv)의 화합물을 하기 일반식(vi)의 화합물 및 하기 일반식(vii)의 화합물과 반응시킨후 필요에 따라 W 및 / 또는 R²를 제거하여 유리카복실 그룹을 형성하거나, c) Y 및 Z가 각각 수소인 일반식(i)의 화합물을 제조하기 위해, 일반식(iv)의 화합물과 하기 일반식(vii)의 화합물을 반응시킨후, 생성된 시프 염기를 환원시킨 다음, 필요에 따라 W 및 / 또는 R²를 제거하여 유리 카복실 그룹을 형성하거나, d) Y가 히드록실이고 Z가 수소인 일반식(i)의 화합물을 제조하기 위해, Y 및 Z가 함께 산소인 일반식(i)의 화합물을 보라네이트 착화합물 또는 보란-아민 착화합물로 환원시키고, 필요한 경우에 상기 a) 내지 d)에 의해 수득된 R이 수소인 일반식(i)의 화합물을 R(C₁ 내지 C₆)알킬 또는 (C₇ 내지 C₉)-아르알킬인 일반식 (i)의 에스테르로 전환시킴을 특징으로 하여 하기 일반식(i)의 화합물 및 약리학적으로 허용 가능한 이들의 염을 제조하는 방법.



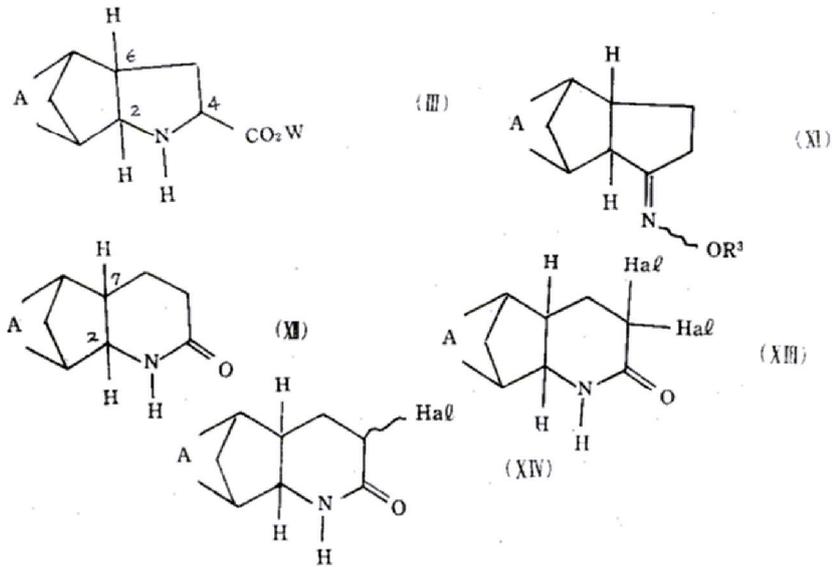


상기 일반식에서, n은 0 또는 1이고, A는 -CH=CH- 또는 -CH₂-CH₂-이며, R은 수소, (C₁ 내지 C₆)-알킬 또는 탄소수 7내지 9의 아르알킬이며, R¹은 수소; (C₁ 내지 C₆)-알킬 [이것은 아미노, (C₁ 내지 C₄)-아실아미노, 또는 벤조일아미노에 의해 임의로 치환될 수 있다]; 또는 (C₂ 내지 C₆)-알케닐, (C₅ 내지 C₉)-시클로알킬, (C₅ 내지 C₉)-시클로알케닐, (C₅ 내지 C₇)-시클로알킬-(C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₆ 내지 C₁₂)-아릴이나 부분적으로 수소화된(C₆ 내지 C₁₂)-아릴[이들 각각은 (C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₁ 또는 C₂)-알콕시 또는 할로겐에 의해 치환될 수도 있다]; 또는 C₆ 내지 C₁₂-아릴-(C₁ 내지 C₄)-알킬이나(C₇ 내지 C₁₃)-아로일-(C₁ 내지 C₄)-알킬(이들 둘다는 상기에서 정의한 바와같이 아릴라디칼이 치환될 수도 있다); 또는 5내지 7원환원자나 8내지 10원 환원자가 있는 모노사이클릭 또는 비사이클릭 헤테로사이클렌라디칼(여기서 1개 내지 2개의 환원자는 황이나 산소원자이고/이거나 1개 내지 4개의 환원자는 질소원자이다); 또는 보호될 수 있는 자연적으로 생성된 아미노산 측쇄이며, R²는 수소, (C₁ 내지 C₆)-알킬, (C₂ 내지 C₆)-알케닐 또는 (C₆ 내지 C₁₂)-아릴-(C₁ 내지 C₄)-알킬이고, Y는 수소 또는 히드록실이며 Z는 수소가거나 Y 및 Z가 함께 산소이며 X는 (C₁ 내지 C₆)-알킬, (C₂ 내지 C₆)-알케닐, (C₅ 내지 C₉)-시클로알킬, (C₆ 내지 C₁₂)-아릴[이들은 (C₁ 내지 C₄)-알킬, (C₁ 내지 C₄)-알콕시, 히드록실, 할로겐, 니트로, 아미노(C₁ 내지 C₄)-알킬아미노, 디-(C₁ 내지 C₄)-알킬아미노 및 /또는 메틸렌디옥시에 의해 단일-, 이-또는 삼 -치환 될 수도 있다] 또는 3-인돌릴이고, W는 수소 또는 산성, 염기성이나 가수소분해 조건하에서 제거될 수 있는 라디칼이다.

청구항 2

C-2 및 C-6상에 있는 H 원자가 서로에 대해 시스-배위로 이루어져 있으며, 사이클로펜탄 환이비사이클릭 환상계에 대해 엔도-또는 엑소-위치에 있는 하기 일반식(XI)의 화합물을 반응시켜 C-2 및 C-7상에 H 원자가 시스-배위를 이루고 있으며 락탐환이 비사이클릭 라디칼에 대해 엑소-또는 엔도-위치에 있는 하기 일반식(XII)의 화합물을 제조하고, 이 일반식(XII)의 화합물을 할로겐화시켜 입체화학적으로 일반식(XII)의 화합물에 상응하는 하기 일반식(XIII)의 화합물을 제조한 후, 이 일반식(XIII)의 화합물(이 화합물에서, A가 CH=CH라면, 이 이중결합을 사이클로펜타디에닐-철 디카보닐 착화합물로 순간적으로 보호시킨다)을 축매적으로 환원시켜 하기 일반식(XIV)의 화합물을 제조하고, 이 일반식(XIV)의 화합물을 염기의 존재하에서 반응시켜 W가 수소이며, C-2 및 C-6상에 있는 H 원자가 서로에 대해 시스-배위를 이루고 있으며, C-4상에 있는 CO₂W가 C-2상에 있는 H 원자에 대해 시스- 또는 트랜스 위치에 있으며, 피롤리딘 환이 비사이클릭 라디칼에 대해 엑소 또는 엔도-위치에 있는 하기 일반식(III)의 화합물을 제조하고, 필요한 경우에 이 화합물을 에스테르화시킴을 특징으로하여 하기 일반식(III)의 화합물을 제조하는

방법.



상기 일반식에서, A는 CH=CH 또는 CH₂-CH₂이고, W는 수소 또는 산성, 염기성 eh는 가수분해조건하에서 제거될 수 있는 라디칼이고, R³는 수소, 알킬, 아릴, 아르알킬, -SO₃H, 벤젠 술폰닐; 또는 p-톨루엔술폰닐이고, Hal은 할로겐워자이다.

※참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.