

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. ⁴ C07C 177/00	(11) 공개번호 특 1986-0008132
	(43) 공개일자 1986년 11월 12일
(21) 출원번호	특 1986-0003086
(22) 출원일자	1986년 04월 22일
(30) 우선권주장	8510277 1985년 04월 23일 영국(GB)
(71) 출원인	글락소 그룹 리미티드 배리 안토니 뉴샘 영국, 런던 더블유 1와이 8디 에이취, 클래지스 스트리트 6-12, 클래지스 하우스
(72) 발명자	에릭 더블유 콜링톤 영국, 허트포드셔주, 네브워쓰, 와튼 로드 28 해리 핀치 영국, 허트포드셔주, 히친, 헨슬리콜로즈 19 던캔비. 주드 영국, 허트포드셔주, 웨어, 세인트 마가레츠, 세인트 마가레츠 로드 24
(74) 대리인	장수길, 이세진

심사청구 : 없음

(54) 시클로펜틸 에테르의 제조 방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

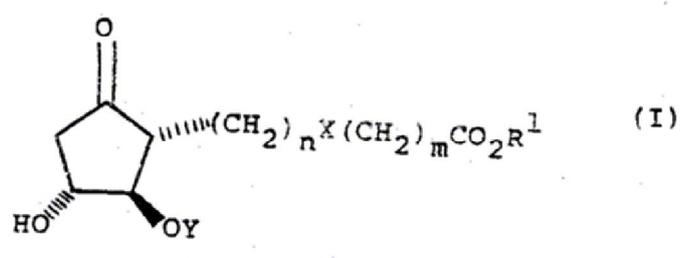
시클로펜틸 에테르의 제조 방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

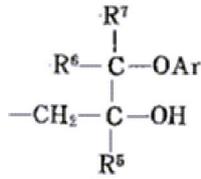
청구항 1

다른 일반식 (I)의 화합물 및 R²가 수소 원자인 화합물의 염을 제조함에 있어서, (a) 고리의 히드록시기와 Y종의 히드록시기 보호된 대응하는 화합물의 보호기를 제거하거나, (b) R¹가 수소 원자인 대응하는 화합물을 에스테르화 시키거나, (c) X가 -CH₂-CH₂-기인 화합물을 제조함에 있어서, X가 -CH=CH- 또는 아세틸렌기인 대응하는 화합물을 환원시키거나, (d) X가 -CH=CH-기인 화합물을 제조함에 있어서, X가 아세틸렌기인 대응하는 화합물을 선택적으로 환원시키거나, 또는 (e) X가 트란스 -CH=CH-기인 화합물을 제조함에 있어서, X가 시스 -CH=CH-기인 대응하는 화합물을 이성질화시킴을 특징으로 하는 방법.



위 식에서, n은 1 또는 2이고, m은 2-5이며, X는 시스 또는 트란스 -CH=CH- 또는 -CH₂-CH₂-기이거나, 또는 m은 1-4이고 X는 -CH=C-CH-기이고, R¹은 (a) 페닐기로서, 이 페닐기는 C₁₋₄알킬, C₁₋₄알콕시, C₁₋₄알카노일, 메틸티오, 메틸술피닐, 메틸술폰닐, 할로겐, -CO₂R²(여기서, R²는 수소원자 또는 C₁₋₄알킬 또는

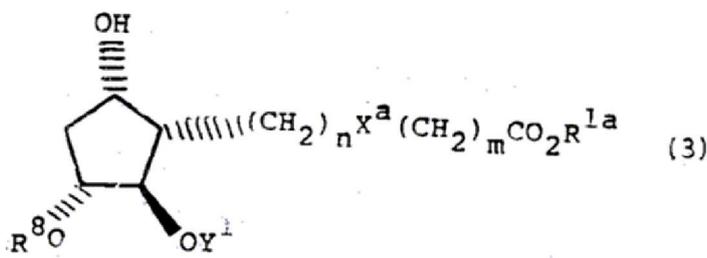
페닐기임), $-\text{NHCOR}^2$ (여기에서, R^2 는 위에서 정의한 바와 같거나, 또는 히드록실, $\text{CH}_3\text{CONH}-$ 또는 벤조질아미노기에 의해 임의로 치환된 페닐기임), CONR^3R^4 (여기서, R^3 및 R^4 는 서로 동일하거나 또는 상이한 것으로서, 각각 수소 원자 또는 C_{1-4} 알킬기임), $-\text{NHCONH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CONH}_2)\text{NHCOC}_3$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CONH})_2\text{NHCOC}_3$ 기에 의해 임의로 치환되거나, 또는 (b) 2-나프틸기이고,



Y는 기인데, 여기서 R^5, R^6 및 R^7 는 각각 수소 원자 또는 메틸기이고, 이 중의 적어도 하나는 수소 원자이고, Ar는 페닐기(이 페닐기는 1 또는 2개의 C_{1-4} 알킬, C_{1-4} 알콕시, C_{1-4} 알킬티오, C_{1-4} 알킬술폰, C_{1-4} 알킬술폰, 할로겐 또는 트리플루오로메틸기에 의해 임의로 치환됨)이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 다음 구조식(3)의 화합물을 산화시킨 후, 히드록실 보호기를 제거하고, (R^{1a} 가 소원자인 경우에) 생성물을 에스테르화시켜서 목적 R^1 기를 도입한 다음, (X^a 가 아세틸렌기인 경우에) 아세틸기를 환원시켜서 X가 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 기인 화합물을 얻은 다음, X가 시스 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 기인 생성물을 임의로 이성질화시켜서 X가 트랜스 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 기인 화합물을 얻거나, 또는 X가 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 기인 생성물을 환원시켜서 X가 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 기인 화합물을 얻는 것을 특징으로 하는 방법.



위 식에서,

R^8 은 히드록실 보호기이고, $\text{Y}1$ 은 제1항에서 정의한 Y기 중 히드록실기가 보호된 기이고, X^a 는 제1항에서 정의한 X가 또는 아세틸렌기이고, R^{1a} 는 제1항에서 정의한 R^1 또는 수소 원자이고, n 및 m는 제항에서 정의한 바와 같다.

청구항 3

제1항 또는 2항에 있어서, 생성물중 X가 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 또는 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 기이고, n가 1인 경우에 m은 3이고, n가 2인 경우에 m은 2 또는 4이거나, 또는 X가 $-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}$ 기이고 n가 1인 경우에, m은 2이고 n가 2인 경우에 m은 1 또는 3인 방법.

청구항 4

제1항 내지 3항 중 어느 하나의 항에 있어서, 생성물 중 $\text{R}1$ 이 C_{1-4} 알콕시, C_{1-4} 알카노일, 메틸티오, 메틸술폰, $-\text{CO}_2\text{R}^2$, $-\text{NHCOR}^2$, $-\text{CONR}^3\text{R}^4$, $-\text{NHCONH}_2$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CONH}_2)\text{NHCOC}_3$ 기에 의해 치환된 페닐기이거나 또는 2-나프틸기인 방법.

청구항 5

제1항 내지 4항 중 어느 하나의 항에 있어서, 생성물 중 $\text{R}1$ 이 메톡시, 아세틸, $-\text{CO}_2\text{CH}_2$, $-\text{NHCOC}_2$, 벤조일아미노, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CONH}_2)\text{NHCOC}_2$ 기에 의해 치환된 페닐기이거나, 또는 2-나프틸기인 방법.

청구항 6

제1항 내지 5항 중 어느 하나의 항에 있어서, 생성물 중 R^5, R^6 가 R^7 가 수소 원자이고, Ar가 페닐기 또는 플루오로 또는 클로로에 의해 치환된 페닐기인 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, 생성물 중 X가 $-\text{CH}=\text{CH}$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 기이고 n이 1이고 m이 3이거나, 또는 n이 2이고 m이 2 또는 4이거나, 또는 X가 $-\text{CH}=\text{C}=\text{CH}$ 기이고 n이 1이며 m이 2이거나, 또는 n이 2이고 m이 1 또는 3이고, R^1 가 메톡시, 아세틸, $-\text{CO}_2\text{CH}_2$, $-\text{NHCOC}_2$, 벤조일아미노, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ 또는 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CONH}_2)\text{NHCOC}_2$ 기에

의해 치환된 페닐기 또는 2-니프틸기이고, R⁵가 수소원자 또는 메틸기이고, R⁶ 및 R⁷이 수소 원자이고, Ar가 페닐기 또는 플루오로 또는 클로로에 의해 치환된 페닐기인 방법.

청구항 8

제1항 내지 7항 중 어느 하나의 항에 있어서, 생성물 중 $-(CH_2)_nX(CH_2)_mCO_2R^1$ 기를 갖는 탄소 원자가 R-배치인 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, 생성물이 [1R [1α(Z), 2β(R^{*}) 3α]]-(⁻)-4-(벤조일아미노)페닐 7-[3-히드록시-2-(2-히드록시-3-페녹시프로폭시)-5-옥소이클로펜틸]-5-헵테노에이트인 방법.

청구항 10

제1항에서 정의한 구조식(1)의 화합물을 1개 이상의 제약담체와 함께 제형시키는 것이 특징인 제약조성물의 제조 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.