

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>3</sup> C07D 209/52	(11) 공개번호 특1984-0006965
	(43) 공개일자 1984년 12월 04일
(21) 출원번호 특1983-0005920	
(22) 출원일자 1983년 12월 14일	
(30) 우선권주장 P3246503.3 1982년 12월 16일 독일(DE)	
(71) 출원인 핵스트 아크디엔 게젤샤프트 하인리히 벡커, 베른 하르트 벡크 독일연방공화국 데 6230 프랑크푸르트 암마인 80 브뤼닝 스트라세 45	
(72) 발명자 한스에르그 우르바흐 독일연방공화국 데 6242 크론베르그/타우누스, 레라반도우 스트라세 41	
(74) 대리인 이병호, 김성기	

심사청구 : 없음

(54) 시스, 엔도-2-아자비사이클로[5.3.0] 데칸-3-카복실산 유도체의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

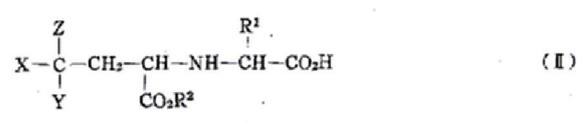
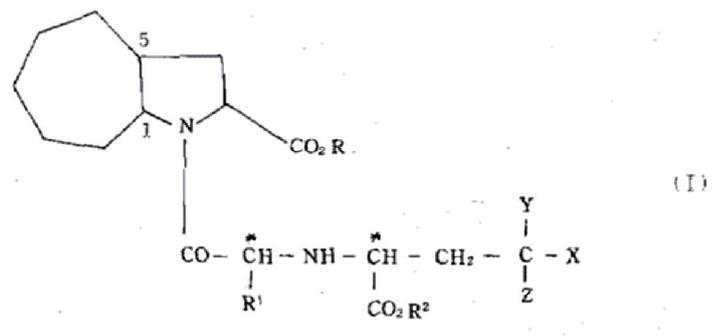
시스, 엔도-2-아자비사이클로 [5, 3, 0] 데칸-3-카복실산 유도체의 제조방법

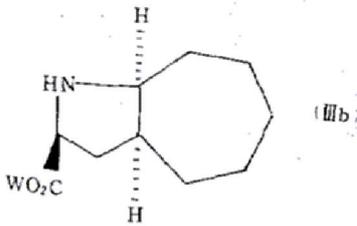
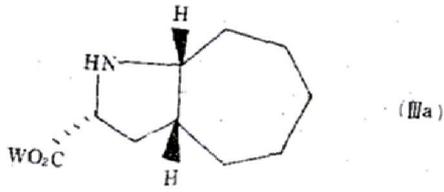
본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(II) 화합물을 일반식(IIIa) 또는 (IIIb) 화합물 또는 화합물 또는 라세미체와 반응시키고, 임의로는 수득된 일반식(I) 화합물을 산 및/또는 염기로 처리하는 수소화반응에 의해 R 및/또는 R<sup>2</sup>가 H인 일반식(I) 화합물로 전환시키고, 임의로는 이렇게 수득된 화합물을 에스테르화시키고/시키거나 임의로는 그의 생리학적으로 무독한 염으로 전환시킴을 특징으로 하여 일반식(I) 화합물 및 그의 생리학적으로 무독한 염을 제조하는 방법.





상기식에서, 가교 결합된 1 및 5위치의 탄소원자상 수소원자는 서로 시스 배위를 가지며, 3위치의 탄소 원자상 카복실 그룹은 비사이클 환구조에 대해 엔도로 배양되고, R은 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-알케닐 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬을 나타내며, R<sup>1</sup>은 수소, 알릴, 비닐 또는 임의로 보호된 천연 α-아미노산 R<sup>1</sup>-CH(NH<sub>2</sub>)-COOH의 측쇄를 나타내고, R<sup>2</sup>는 수소, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-알케닐 또는 (C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-아릴-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬을 나타내며(단, 일반식(II)에서는 수소를 제외한다), Y는 수소 또는 하이드록실을 나타내고, Z는 수소를 나타내거나, Y 및 Z가 함께 산소를 나타내고, X는 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-알킬, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-알케닐, (C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-사이클로알킬, (C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>)-아릴, 바람직하게는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알콕시, 하이드록실, 할로겐, 니트로, 아미노, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬아미노, 디-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-알킬아미노 및/또는 메틸렌 디옥시에 의해 일, 이 또한 심치환될 수 있는 페닐을 나타내거나 인돌-3-일을 나타내며, W는 카복실 에스테르화그룹을 나타낸다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sup>1</sup> 수소를 나타내고, R<sup>1</sup>이 메틸, 임의로 아실화된 리신 측쇄 또는 O-알킬화된 티로신 측쇄를 나타내며, R<sup>2</sup>가 수소, 메틸, 에틸, 벤질 또는 4급 부틸을 나타내고, X가 페닐 또는 불소 및/또는 염소로 일 또는 이치환된 페닐을 나타내며, Y가 수소 또는 하이드록실을 나타내고, Z가 수소를 나타내거나 Y 및 Z가 함께 산소를 나타내는 일반식(I) 화합물을 제조하는 방법.

**청구항 3**

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-S-알라닐-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

**청구항 4**

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐프로필)-S-알라닐-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

**청구항 5**

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-S-리실-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

**청구항 6**

제1항에 있어서, N-(1-S-카복시-3-페닐프로필)-S-리실-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

**청구항 7**

제1항에 있어서, N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-O-에틸-S-티로실-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

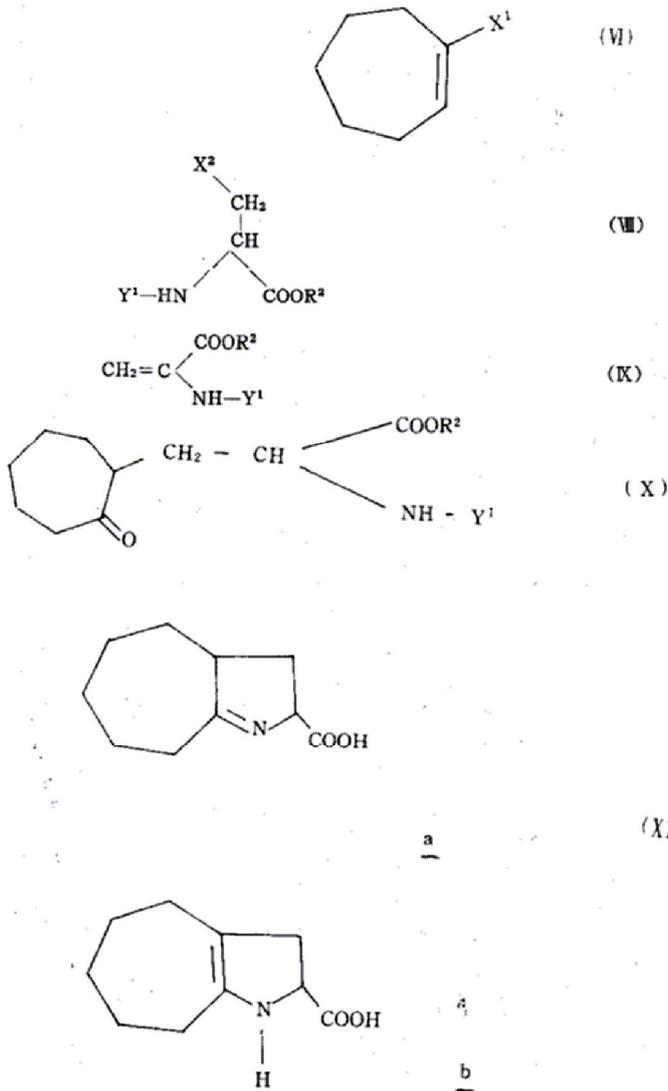
**청구항 8**

N-(1-S-카보에톡시-3-페닐프로필)-O-메틸-S-티로실-시스, 엔도-2-아자비사이클로[5, 3, 0] 데칸-3-S-카복실산을 제조하는 방법.

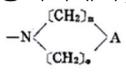
**청구항 9**

일반식(VI)의 엔아민을 일반식(VIII)의 N-아실화된 β-할로게노-α-아미노카복실릭 에스테르 또는 일반식(IX)의 아크릴릭에스테르와 반응시켜 일반식(X) 화합물을 수득하고, 이를 강산을 사용하여 폐환시키면, 아실아미드 및 에스테르가 분해되어 일반식(XI<sub>a</sub>) 또는 (XI<sub>b</sub>)의 화합물이 얻어지고, 이를 천연금속

촉매적 수소화시키거나, 저급알코올중 보란-이민 착물 또는 보로하이드라이드 착물로 환원시켜 W가 수소를 나타내는 일반식(III<sub>a</sub>) 및 (III<sub>b</sub>)화합물로 전환시키고, 임의로는 에스테르화시켜 W가 탄소수 1 내지 6의 알킬 또는 탄소수 7 내지 8의 아르킬을 나타내는 일반식(III<sub>a</sub>) 및 (III<sub>b</sub>)화합물을 수득함을 특징으로 하여 언급된 일반식(III<sub>a</sub>) 및/또는 (III<sub>b</sub>)화합물 및 그의 산 및 염기(W가 수소인 경우)와의 염을 제조하는 방법.



상기식에서, X<sup>1</sup>은 탄소수 2 내지 10의 알디킬아미노를 나타내거나, 일반식(VII)



의 라디칼(여기에서 m 및 o는 1 내지 3의 정수를 나타내고, (m+o) ≧ 3이며 A는 CH<sub>2</sub>, NH, O 또는 S를 나타낸다)을 나타내고, X<sup>2</sup>는 이핵성그룹(nucleofugic group)을 나타내며, Y<sup>1</sup>은 탄소수 1 내지 5의 알카노일, 탄소수 7 내지 9의 아로일 또는 산으로 분해될 수 있고 펩타이드 화학에서 통상적인 다른 보호그룹을 나타내고, R<sup>2</sup>가 탄소수 1 내지 5의 알킬 또는 탄소수 7 내지 9의 아르킬을 나타낸다.

**청구항 10**

제9항에 있어서, W가 수소, 3급-부틸, 벤질 또는 니트로벤질을 나타내는 일반식(III<sub>a</sub>) 및 (III<sub>b</sub>)화합물을 제조하는 방법.

※참고사항:최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.