

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.³
C07D 499/32

(11) 공개번호 특1983-0009112
(43) 공개일자 1983년 12월 17일

(21) 출원번호	특1982-0001222
(22) 출원일자	1982년 03월 22일
(30) 우선권주장	246453 1981년 03월 23일 미국(US)
(71) 출원인	화이자 인코포레이티드 윌리엄 데이비스 헌
	미합중국 뉴욕주 뉴욕시 이스트 42번 스트리트 235
(72) 발명자	토마스 찰스 크라우포드
	미합중국 콘네티컷주 레디아드 필립레인 23
	비타우타스 존 재시스
	미합중국 콘네티컷주 뉴런던 리치몬드 스트리트 15
(74) 대리인	김영무, 장수길

심사청구 : 있음

(54) 페니실란산 1,1-디옥사이드의 할로메틸 에스테르(및 관련 에스테르)의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

페니실란산 1,1-디옥사이드의 할로메틸 에스테르(및 관련 에스테르)의 제조방법

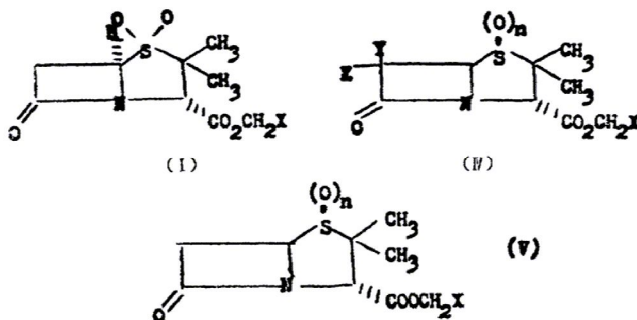
[도면의 간단한 설명]

' 본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음 '

(57) 청구의 범위

청구항 1

하기 일반식(VI)의 화합물을 (a) 트리아릴틴히드리드, 디(C₁-C₆알킬)틴 디히드리드 또는 트리(C₁-C₆알킬)틴 히드리드(여기서 '아릴기'는 페닐기 또는 C₁-C₃알킬, C₁-C₃알콕시기, 수산기 또는 니트로기로 치환된 페닐임) 및 (b) 수소 및 귀금속 촉매에서 선택된 환원제로써 환원시켜서 하기 일반식(V)의 화합물을 제조한 다음, n가 0 또는 1인 화합물(V)을 진이금속 촉매, 과초산 및 m-클로로벤조산의 존재하에 과망간산 나트륨, 과망간산 칼슘, 과망간산칼륨과 산화수소에서 선택된 산화제로써 산화시킴을 특징으로 하는 하기 일반식(I)로 표시되는 페니실란산 1,1-디옥사이드 유도체의 제조방법.

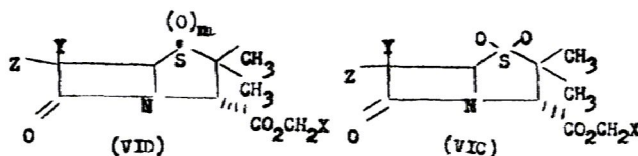


상기 일반식에서, X는 Cl, Br, I 또는 OSO₂RR¹이며, 여기서 R¹은 C₁-C₃알킬기 또는 C₆H₄R²기이고, R²는 H, Cl, Br, I, NO₂, C₁-C₃알킬기 또는 C₁-C₃알콕시기이며, n는 0, 1 또는 2이고, Y 및 Z는 각각 Cl, Br 또는 I 이거나, Y는 HO이고 Y는 Cl, Br, I, C N-(이소시아노) 및 SCN-(이소티오시아나토기)이며, 또는 T는 SeC₆H₄R²(여기서 R²는 일반식(I)에서 정의한 것과 같음)이고, Z는 Cl 또는 Br이며, Y 및 Z가 각각 Cl, Br 또는 I이거나 Y가 HO이고 Z는 Cl, Br 또는 I일 때 전기 환원제는 (a) 또는 (b)이고, Y가 HO이고 Z가 C N-

또는 SCN-이거나 Y가 $\text{SeC}_6\text{H}_4\text{R}^2$ 이고 Z가 Cl 또는 Br일 때 전기 환원제는 (a)이다.

청구항 2

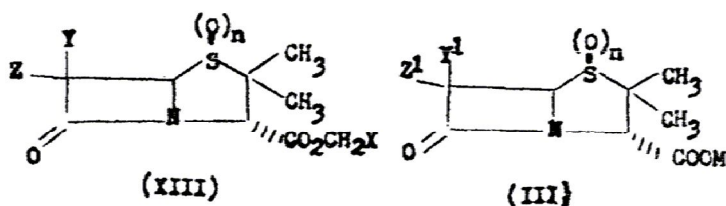
하기 일반식(VID)의 황화물 또는 술폰시드를 진이금속 촉매, 과초산 및 m-클로로벤조산의 존재하에 과망간산칼륨, 과망간산나트륨, 과망간산칼슘, 과산화수소에서 선택된 산화제로써 산화시키는 것을 특징으로 하는 하기 일반식(VIC)로 표시되는 페니실린산 1,1-디옥소 유도체의 제조방법.



상기 일반식에서, X, Y 및 Z는 청구의 범위 제1항의 일반식(VI)에 대한 정의한 것과 같으며, m은 0 또는 1이다.

청구항 3

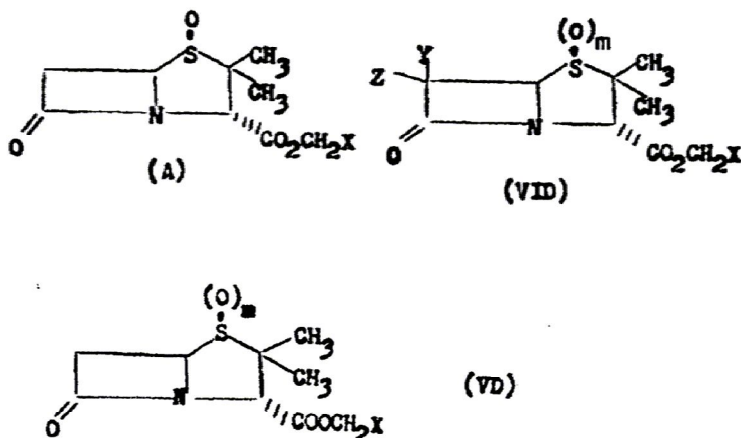
하기 일반식(III)의 카복실산염을 용매의 존재하에 $0^\circ - 60^\circ\text{C}$ 의 온도범위에서 일반식 XCH_2X^2 의 화합물과 접촉시키는 것을 특징으로 하는 하기 일반식(XIII)로 표시되는 화합물의 제조방법.



상기 일반식에서, n는 0.1 또는 2이고, X는 청구범위 제1항에서 Y^1 는 H이고 Z^1 는 $\text{C}\equiv\text{N}$ - 또는 SCN-이거나 Y^1 는 $\text{SeC}_6\text{H}_4\text{R}^2$ 이며 정의한 것과 같으며, Z^1 는 Cl 또는 Br이고 R^2 는 H, Cl, Br, I, NO_2 , C_1 - C_3 알킬기 또는 C_1 - C_3 알콕시기이며, M은 양이온이고 X^2 는 X 또는 X보다 더 좋은 이탈기이다.

청구항 4

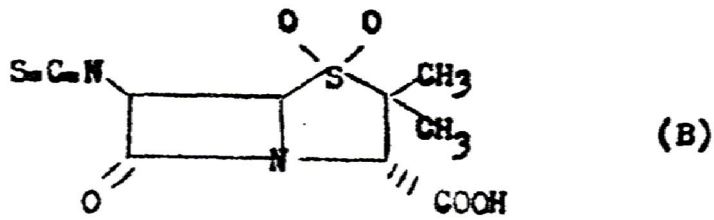
하기 일반식(VID)의 화합물을 (a) 트리아릴틴수화물, 디(C_1 - C_3 알킬)틴 디하이드리드 또는 트리(C_1 - C_3 알킬)틴 수화물(여기서 '아릴기'는 페닐 또는 C_1 - C_3 알킬, C_1 - C_3 알콕시, 수산기 또는 니트로기로 치환된 페닐기로 치환된 페닐기임) 및 (b) 수소 및 귀금속 촉매에서 선택된 환원제로써 환원시켜서 하기 일반식(VD)의 화합물을 제조한 다음 m가 0인 화합물(VD)를 진이금속 촉매, 과초산 및 m-클로로벤조산의 존재하에 과망간산나트륨, 과망간산칼슘, 과망간산칼륨, 과산화수소에서 선택된 산화제의 일당량과 산화시키는 것을 특징으로 하는 하기 일반식(A)로 표시되는 페니실린산 1-옥시드 유도체의 제조방법.



상기 일반식에서 X는 Cl, Br, I 또는 OSO_2R^1 이고 R^1 은 C_1 - C_6 알킬기 또는 $\text{C}_6\text{H}_4\text{R}^2$ 이며, R^2 는 H, Cl, Br, I, NO_2 , C_1 - C_3 알킬기 또는 C_1 - C_3 알콕시기이며, m은 0 또는 1이고, Y 및 Z는 각각 Cl, Br 또는 I이거나, Y는 H이고 Z는 Cl, Br, I, $\text{C}\equiv\text{N}$ -(이소시아노) 및 SCN-(이소티오시아나토)이고, 또는 Y는 $\text{SeC}_6\text{H}_4\text{R}^2$ 이며 여기서 R^2 는 일반식(I)에서 정의한 것과 같고, Z는 Cl 또는 Br이며, Y 및 Z가 각 Cl, Br 또는 I이거나 Y가 H이고, Z가 Cl, Br 또는 I일 때 전기 환원제는 (a) 또는 (b)이며, Y가 H, Z가 $\text{C}\equiv\text{N}$ -또는 SCN-이거나, Y가 $\text{SeC}_6\text{H}_4\text{R}^2$ 이고 Z가 Cl 또는 Br일 때 전기 환원제는 (a)이다.

청구항 5

6-아미노페니실란산 1,1-디옥시드를 반응 불활성 용매 존재하에 -10° ~ 30°C 의 온도 범위에서 이황화탄소 및 디시클로헥실 카르보디이미드와 접촉시키는 것이 특징인 하기 일반식(B)로 표시되는 이소티오시아나토 화합물의 제조방법.



청구항 6

특허청구의 범위 제 1,2 또는 4항 기재에 있어서, X가 Cl, Br 또는 I이고 Y 및 Z가 각 Cl 또는 Br이거나 Y가 H이고 Z가 Cl, Br 또는 CN-인 것이 특징인 제조방법.

청구항 7

특허청구의 범위 제1항 또는 3항에서 n가 0 또는 2인 것이 특징인 방법.

청구항 8

특허청구의 범위 제1항 또는 4항에서 환원제가 트리-n-부틸티나화물 또는 수소 및 팔라듐 촉매인 것이 특징인 방법.

청구항 9

특허청구의 범위 제1 또는 4항에서 산화제가 과망간산 칼륨 또는 m-클로로과벤조산인 것이 특징인 방법.

청구항 10

특허청구의 범위 제3항에서 n가 0 또는 2이고 X는 Cl, Br 또는 I이고 M는 Na,K 또는 테트라부틸 암모늄이며, Y¹는 H이고 Z¹은 C≡N- 또는 SCN-인 것이 특징인 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.