

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. 5  
C08B 37/18

(11) 공개번호 특 1994-0005675  
(43) 공개일자 1994년03월22일

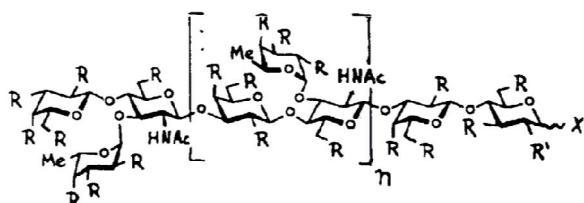
(30) 우선권주장	P42 21 444.0 1992년06월30일 독일(DE)
(71) 출원인	메르크 파텐트 게젤샤프트 미트베쉬랭크터 하프통 위르겐 호이만, 라인하르트 슈톨러
(72) 발명자	독일연방공화국 데-6100 다틈스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 리카르트 슈미트 독일연방공화국 데-6100 다틈스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 알렉산더 토에프퍼 독일연방공화국 데-6100 다틈스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 빌리 킨지 독일연방공화국 데-6100 다틈스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 위르겐 헴베르거 독일연방공화국 데-6100 다틈스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내
(74) 대리인	김창세, 잠성구

### 심사청구 : 없음

(54) 중합체 루이스 엑스(x) 사카라이드 및 그의 제조방법

요약

본 발명은 하기 일반식(1)의 중합체 루이스 X사카라이드의 제조방법, 상용하는 중간 생성물의 제조방법 및 신규중합체 루이스 X사카라이드, 특히 사람체 내지 팔량체 루이스 X항원에 관한 것이다:



상기식에서, X는  $\text{OC}(\text{=NH})\text{CCl}_3$ (TCA1), Z또는 S이고, Z는  $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{NHCOC}_6\text{H}_{2\text{u+1}})\text{CH}(\text{OH})\text{CH}=\text{CHC}_6\text{H}_{2\text{v+1}}$ 이고, S는  $(\text{CH}_2)_q\text{COOR}'$ 이고, R은 OH또는  $\text{R}_A^5$ 이고,  $\text{R}_A^5$ 는  $\text{OAc}$ ,  $\text{OBn}$ 또는  $\text{OB}_2$ 이고,  $\text{R}'$ 는 OH,  $\text{OAc}$ 또는  $\text{OPiv}$ 이고,  $\text{R}''$ 는  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -알킬이고, Ac는 아세틸이고,  $\text{Bn}$ 은 벤질이고,  $\text{B}_2$ 는 벤조일이고,  $\text{Piv}$ 는 피발로일이고, n은 0내지 7의 정수이고, q는 4내지 12의 정수이고, u는 13내지 23의 정수이고, v는 11내지 17의 정수이다.

중합체 사카라이드는 고수율로 입체선택적으로 합성할 수 있다.

대표도

卷1

## 경제사

[총정리 풀이]

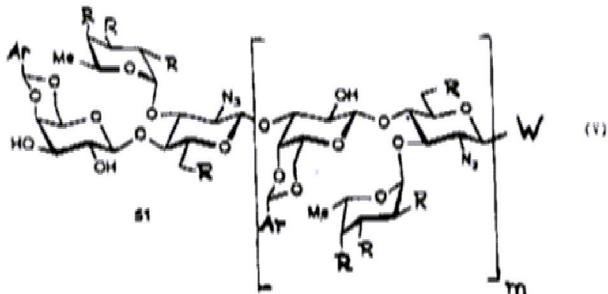
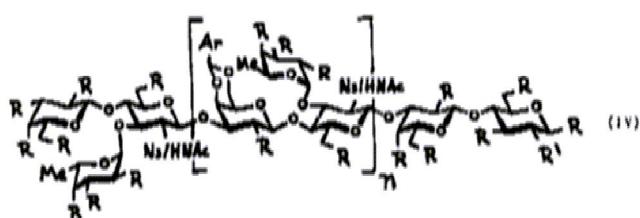
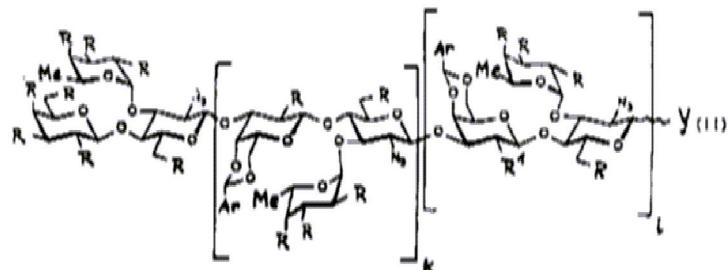
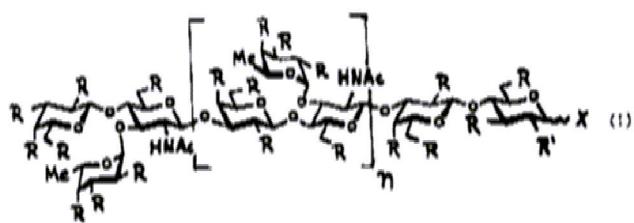
제1도(1.1내지 1.5)는 본 발명에 따른 방법의 가장 중요한 화합물을 나타낸다.

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

**(57) 청구의 범위**

**청구항 1**

(a)하기 일반식(II)화합물중의 하나로부터 선택된, 1-0-위치상에서 활성화된 공여체 사카라이드 단위(II[TCA1/(X)])를 하기 일반식(v)의 수용체 사카라이드 단위(v[(y)])로 글리코사이드화시켜 보다 긴 쇄의 하기 일반식(II)의 사카라이드(II[W(x+y)]), 여기에서, x는 6,9,12,15,18또는 21이고, y는 3,6,9,12,15또는 18이며 폴리사카라이드의 모노사카라이드 요소의 갯수를 나타내고, x+y는 24를 초과하지 않는다)를 생성시키고; (b)유리 애그룹(들)을 상응하는 보호 그룹으로 치환하고 W라디칼을 TCA1라디칼로 치환함으로써 보다 긴 쇄의 하기 일반식(II)의 상응하는 공여체 사카라이드(II[ACAI/(x+y)])로 전환시키고; (c)1-0-위치상에서 활성화된 상기 (b)로부터의 공여체 사카라이드를 수용체로서 작용하는 하기 일반식(III)의 디사카라이드로 글리코사이드화시켜 하기 일반식(IV)[(x+y+2)]의 사카라이드를 제조하고; (d)아지도 그룹을 화합물(IV)의 아세트아미도 그룹으로 환원시키고, 아릴리덴 및 벤질 라디칼을 분리하고, 라디칼 R 및 R'를 과아세틸화하고, 글리코사이드 아세틸 그룹을 OH로 치환하고 반응시켜 일반식(I)의 상응하는 트리클로로아세트이미테이트(X=TCA1)를 생성시키고, 경우에 따라 라디칼X를 Z또는 S로 변형시키고 보호 그룹(R,R'=OH)을 제거함을 특징으로 하는 헥사사카라이드 단위로부터 시작하여 하기 일반식(I)의 중합체 루이스X사카라이드를 제조하는 방법.



상기식들에서, X는  $OC(=NH)CC_1_3(TCAL)$ , Z 또는 S이고, Z는  $0CH_2CH(NHCOC_0H_{2u+1})CH(OH)CH=CHC_0H_{2v+1}$ 이고, S는  $(CH_2)_qCOOR''$ 이고, R은 OH또는  $R_A^5$ 이고,  $R_A^5$ 는 OAc, OBn또는 OBZ이고, R'는 OH, OAc또는 OPiv이고, R''는  $C_1-C_{14}$ -알킬이고, Ac는 아세틸이고, Bn은 벤질이고, Bz는 벤조일이고, Piv는 피발로일이고, n은 0내지 7의 정수이고, q는 4내지 12의 정수이고, u는 13내지 23의 정수이고, v는 11내지 17의 정수이고, y는  $OC(=NH)CC_1_3(TCAI)$  또는 W이고, W는 0-3급-부틸디메틸실릴(OTBS), 0-텍실디메틸실릴(OTDS) 또는 0-3급-부틸디페닐실릴(OTDPS)이고, R'은 R이고, Ar은 아릴이고, Me는 메틸이고, k 및 1은 0내지 6의 정수이고, y가 TCAI인 경우, R'은 OAc, OBz이고, Y가 W인 경우, R'은 OH이고, m은 0내지 5의 정수이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서, 말단 갈락토피라노스 환이 아세틸화된 일반식(II)의 화합물이 사용됨을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 일반식(II)의 피발로일화된 화합물( $R'=OPiv$ )이 사용됨을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 4

제1항 내지 제3항중 어느 한 항에 있어서, 글리코사이드화를 용매로서의 니트릴중에서 수행함을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한 항에 있어서, 화합물(13) (제1도(1.1))이 헥사사카라이드 단위로 사용됨을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한 항에 있어서, W가 0-3급-부틸디메틸실릴(OTBS)이고, Ar이 폐닐이며, u가 15이고, v가 13인 상응하는 화합물이 사용됨을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 7

제1항에 주어진 의미를 갖지만, n은 22내지 7의 정수이고, 단 n이 2인 경우 X는 Z가 아니고, R 및 R'는 OH가 아닌 일반식(I)의 중합체 루이스X사카라이드.

## 청구항 8

일반식(I)의 사랑체 루이스X항원( $n=3$ ) ; 일반식(I)의 육량체 루이스 X항원( $n=5$ ) ; 및 일반식(I)의 필링체 루이스 X 항원( $n=7$ ) 사카라이드.

## 청구항 9

제1항에 주어진 의미를 갖지만, k가 10이고 10이 1내지 5의 정수인 일반식(III)의 중합체 루이스 X사카라이드.

## 청구항 10

제1항에 주어진 의미를 갖지만, n이 2내지 7의 정수인 일반식(IV)의 중합체 루이스 X사카라이드.

## 청구항 11

제1항에 주어진 의미를 갖지만, m이 1내지 5의 정수인 일반식(v)의 중합체 루이스 X사카라이드.

## 청구항 12

입체적으로 별기한 실릴 보호 그룹을 갖는 2-아지도-아릴리덴-글루코피라노사이드를 상응하는 모노사 카라이드의 트리클로로아세트이미데이트와 반응시켜 일반식(II)의 트리사카라이드(II [W/(x)], k=0, 1=0, x=3)를 제조하고, 이로부터 일반식(II)의 공여체 트리사카라이드(II [TCAI/(x), x=3] 및 일반식(v)의 수용체 트리사카라이드(v [(y)], m=0 y=3)를 제조하고, 이들을 서로 반응시켜 상응하는 헥사사카라이드를 제조함을 특징으로 하는, 일반식(II)의 육량체 루이스 X사카라이드(II [TCAI/W/(x)], k=0 1=1, x=6)의 제조방법.

## 청구항 13

제12항에 있어서, 3급-부틸디메틸실릴 2-아지도-4,6,0-벤질리덴-글루코피라노사이드가 사용됨을 특징으로 하는 방법.

## 청구항 14

일반식(II)의 공여체 사카라이드(II [TCAI/(x)])를 제1항의 단계(c)에 따라 반응시킴을 특징으로 하는 일반식(IV)의 루이스 X사카라이드의 제조방법.

## 청구항 15

일반식 (II)의 화합물 (II) [W/(x), k=0, 1=0]의 말단 갈락토피라노스 환의 보호 그룹을 분리하고, 4 및 6위치에서 아릴리덴화, 바람직하게는 벤질리덴화를 수행함을 특징으로 하는 일반식 (V)의 루이스 X사카라이드의 제조방법.

청구항 16

제1항 내지 제6항, 제14항 및 제15항 중 어느 한 항에 있어서, 제12항에 따른 방법에 의해 제조된 일반식 (II)의 헥사사카라이드가 사용됨을 특징으로 하는 일반식 (I), (IV), (V)의 루이스 X사카라이드의 제조방법.

청구항 17

종양 치료 및 종양 진단용 항원 제조를 위한 제7항 내지 제11항에 따른 일반식(I),(II),(IV) 및 (V)의 화합물의 용도.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도연

## 도면 1

