

(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁵
C08B 37/18

(11) 공개번호 특1994-0005675
(43) 공개일자 1994년03월22일

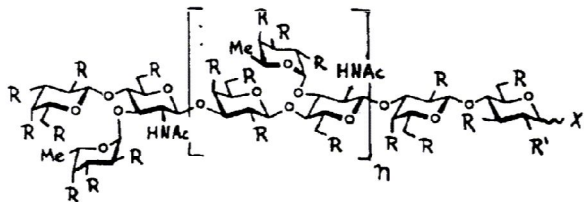
(21) 출원번호	특1993-0011958
(22) 출원일자	1993년06월29일
(30) 우선권주장	P42 21 444.0 1992년06월30일 독일(DE)
(71) 출원인	메르크 파텐트 게젤샤프트 미트베쉬랭크터 하프통 위르겐 호이만, 라인 하르트 슈틀러
(72) 발명자	독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 리카르트 슈미트 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 알렉산더 토에프퍼 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 빌리 킨지 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내 위르겐 햄베르거 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 에.메르크 구내
(74) 대리인	김창세, 장성구

심사청구 : 없음

(54) 중합체 루이스 엑스(X) 사카라이드 및 그의 제조방법

요약

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



상기식에서, X는 $OC(=NH)CC1_3$ (TCA1), Z또는 S이고, Z는 $OCH_2CH(NHCOC_vH_{2u+1})CH(OH)CH=CHC_vH_{2v+1}$ 이고, S는 $(CH_2)_qCOOR''$ 이고, R은 OH또는 R_A^5 이고, R_A^5 는 OAc, OBn또는 OB_z 이고, R'는 OH, OAc또는 OPiv이고, R''는 C₁-C₄-알킬이고, Ac는 아세틸이고, Bn은 벤질이고, B_z는 벤조일이고, Piv는 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

도 1

명세서

[발명의 명칭]

중합체 루이스 엑스(X) 사카라이드 및 그의 제조방법

[도면의 간단한 설명]

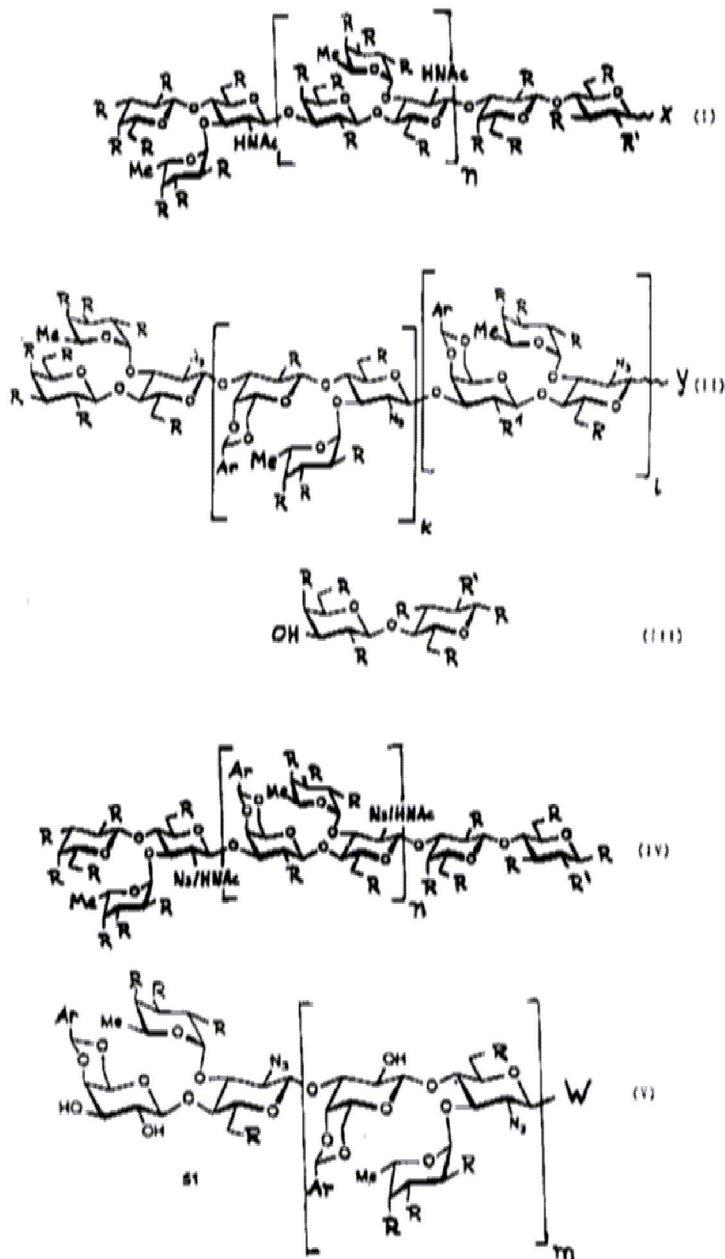
제1도(1.1내지 1.5)는 본 발명에 따른 방법의 가장 중요한 화합물을 나타낸다.

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 긴쇄의 하기 일반식(II)의 사카라이드(II [W(x+y)]),여기에서, x는 6,9,12,15,18또는 21이고, y는 3,6,9,12,15또는 18이며 폴리사카라이드중의 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 쇠의 하기 일반식(II)의 상응하는 공여체 사카라이드(II [ACA1/(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 애로 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 $OC(=NH)CC1_3(TCAL)$, Z 또는 S이고, Z는 $OCH_2CH(NHCOC_6H_{20+1})CH(OH)CH=CHC_6H_{20+1}$ 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 C₁-C₁₄-알킬이고, Ac는 아세틸이고, Bn은 벤질이고, Bz는 벤조일이고, Piv는 피발로일이고, n은 0내지 7의 정수이고, q는 4내지 12의 정수이고, 는 13내지 23의 정수이고, v는 11내지 17의 정수이고, y는 $OC(=NH)CC1_3(TCAI)$ 또는 W이고, W는 0-3급-부틸디메틸실릴(OTBS), 0-텍실디메틸실릴(OTDS)또는 0-3급-부틸디페닐실릴(OTDPS)이고, R'은 R이고, Ar은 아릴이고, Me는 메틸이고, k및 1은 0내지 6의 정수이고, y가 TCAI인 경우, R'은 OAc, OB₂이고, Y가 W인 경우, R'¹은 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 페닐이며, 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, R및 R'은 아가 아닌 일반식(I)의 중합체 루이스X사카라이드.

청구항 8

일반식(I)의 사량체 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 1이고 1이 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 벌키한 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 제15항중 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.

도면

도면1

