(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[5]
C07D 513/18

(11) 공개번호 특1992-0014819
(43) 공개일자 1992년08월25일

(21) 출원번호 특1992-0001122
(22) 출원일자 1992년01월27일
(30) 우선권주장 91101037.9 1991년01월28일 유럽(EP)
(71) 출원인 그루포 레페티트 에스. 피. 에이. 레나토 스가르비
이탈리아공화국 20159 밀라노 비아 무라트 23
(72) 발명자 지안배티스타 판조네
이탈리아공화국 20010 코르나레도(미) 비아 반자고 23
아나클레토 지안안토니오
이탈리아공화국 20146 밀라노 비아 바르질라이 1
(74) 대리인 김성택, 주성민

심사청구 : 없음

(54) 2'-(디에틸아미노)리파마이신 P(P/DEA)의 제조 방법

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

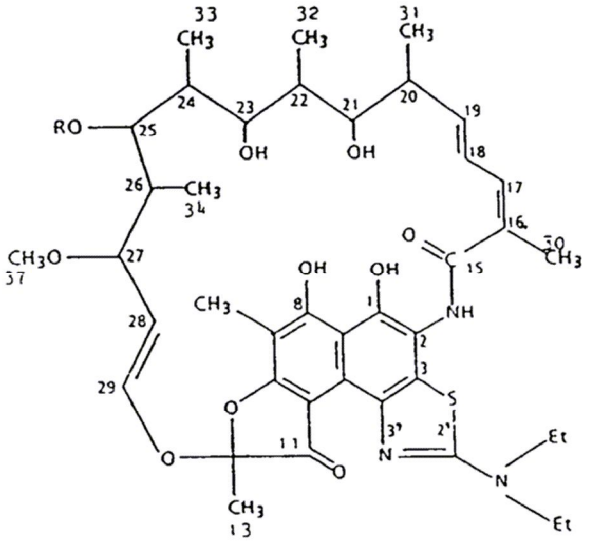
2'-(디에틸아미노)리파마이신P (P/DEA)의 제조방법

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

3-브로모리파마이신 S를 브롬화수소산 수용체 존재하에 디메틸 포름아미드 중에서 1,1-디에틸티오우레아와 반응시켜 하기 일반식(III)의 녹색 1,2-퀴논이민 중간체를 얻고, 이화합물을 단리하지 않고 온화한 환원제에 의해 환원시키는 것으로 이루어진, 하기 일반식(Ⅰ)의 2'-(디에틸아미노)리파마이신P (P/DEA)또는 그의 25-데스아세틸 유도체의 제조방법.



(I)

상기 식 중에서, R은 아세틸 또는 수소이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 1,1-디에틸티오우레아를 3-브로모리파마이신 S 1몰에 대해 1.03 내지 1.10의 몰비율로 사용하는 것이 바람직함을 특징으로 하는 방법.

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 브롬화수소산 수용체가 3급 아민, 바람직하게는 트리알킬아민, 탄소 부분이 1 또는 2(C_1-C_4)알킬기에 의해 치환될 수 있는 피리딘, 퀴놀린, N-메틸피롤리딘, N-메틸 피페리딘, 가장 바람직하게는 (C_1-C_4) 트리알킬아민, 예를 들면 트리메틸아민, 메틸디에틸아민, 트리에닐아민, 메틸디부틸아민에서 선택되는 것이 바람직함을 특징으로 하는 방법.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중 어느 한항에 있어서, 반응 온도가 0℃ 내지 50℃, 바람직하게는 18℃ 내지 25℃의 범위내에 있는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한항에 있어서, 온화한 환원제가 아스코르브산, 중아황산나트륨 또는 메타중아황산나트륨임을 특징으로 하는 방법.

청구항 6

제1항 내지 제5항 중 어느 한항에 있어서, 온화한 환원제가 아스코르브산임을 특징으로 하는 방법.

청구항 7

제1항 내지 제6항 중 어느 한항에 있어서, 온화한 환원제, 바람직하게는 아스코르브산을 출발 3-브로모리파마이신 S의 양과 대략 동일한 몰량의 1,2-퀴논이민 중간체(III)를 함유한, 바람직하게는 디메틸포름아미드와 물의 혼합물에 용해시킨 디메틸포름아미드 반응 용액에 가하는 것을 특징으로 하느 방법.

청구항 8

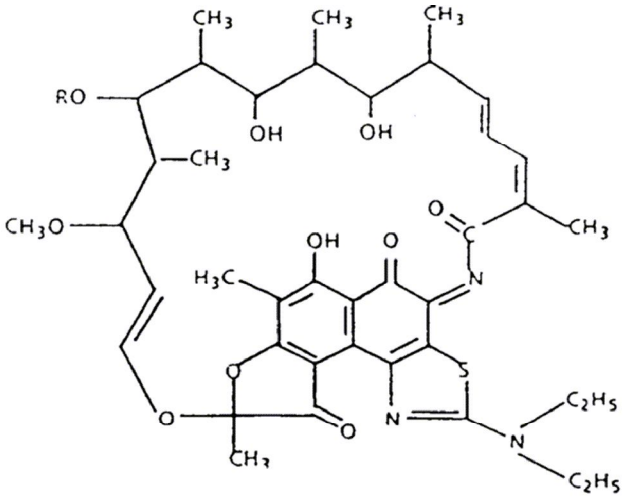
제1항 내지 제7항중 어느 한항에 있어서, 1,2-퀴논이민 중간체(III) 및 환원제, 바람직하게는 아스코르브산을 함유한 최종 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 방치함으로써 1,2-키논이민 중간체(III)의 환원을 완결시킴을 특징으로 하는 방법.

청구항 9

제1항 내지 제8항 중 어느 한항에 있어서, 조P/DEA를 함유한 반응 혼합물을 물에 붓고, 여과에 의해 회수하고 에틸 아세테이트로 부터 결정화시킴을 특징으로 하는 방법.

청구항 10

하기 일반식(III)의 1,2-퀴논이민 중간체.



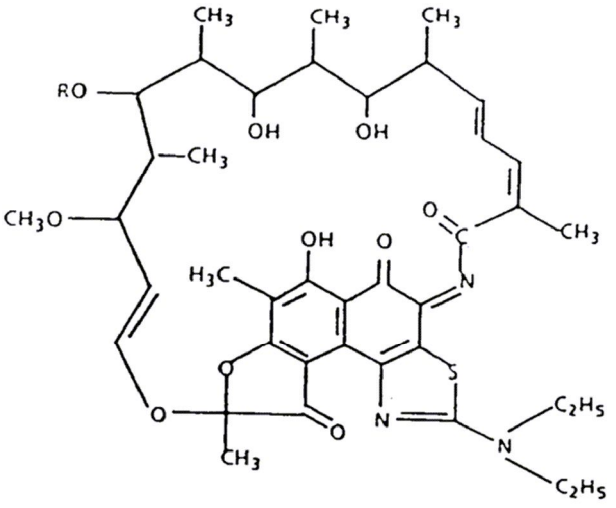
(III)

상기 식 중에서, R은 아세틸이다.

청구항 11

3-브로모리파마이신 S를 브롬화수소산 수용체 존재하에 디메틸 포름아미드 중에서 반응시키는 것으로 이

루어진 하기 일반식(Ⅲ)의 1,2-퀴논이민 중간체의 제조 방법.



(III)

상기 식 중에서, R은 아세틸이다.

청구항 12

본 발명에 따라 제조된 2-(디에틸아미노)리파마이신 P (P.DEA)를 질소 분위기하 실온에서 중탄산나트륨, 수성 수산화나트륨, 유기 염기와 같은 온화한 알칼리성 시약에 의해 알코올성 용매 중에서 가수분해시키는 것으로 이루어진, 25-데스아세틸 P/DEA의 제조 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.