

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. 3
C07D 501/46

(11) 공개번호 특 1983-0009119
(43) 공개일자 1983년 12월 17일

(21) 출원번호 특 1982-0001027
(22) 출원일자 1982년 03월 10일

(30) 우선권주장 242792 1981년03월11일 미국(US)
(71) 출원인 일라이 릴리 앤드 캄파니 아더 알. 웨일
(72) 발명자 미합중국 인디애나 인디애나폴리스 이스트 맥카티 스트리트 307
 월리암 헨리 워커伦
 미합중국 인디애나 46240 인디애나폴리스 웨스트 80번 스트리트 1141
 존 케빈 쇼들
(74) 대리인 미합중국 인디애나 46220 인디애나폴리스 크릭클우드 드라이브 6628
 이별호

심사청구 : 있음

(54) 세팔로스포린계 항생물질의 제조방법

요약

내용 없음

명세서

〔발명의 명칭〕

세팔로스포린계 항생물질의 제조방법

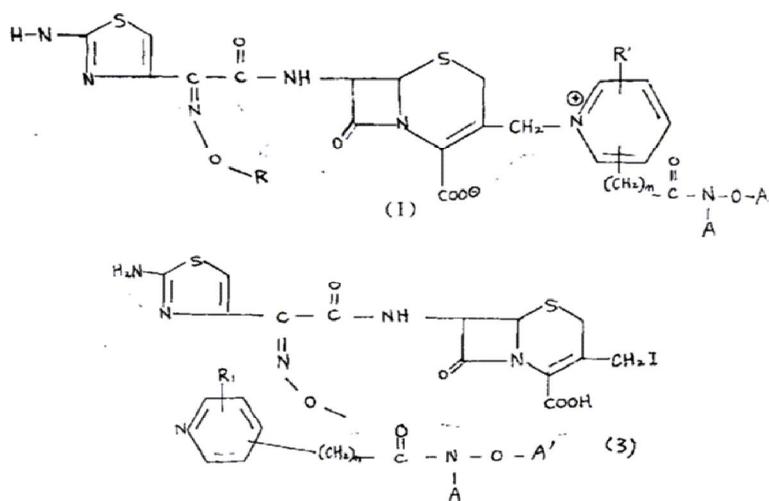
[도면의 간단한 설명]

‘본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음’

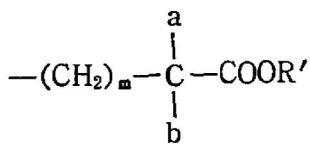
(57) 청구의 범위

청구항 1

무수조건하, 아프로틱 용매중에서 일반식(2)의 3-요도메틸 세팔로스포린을 일반식(3)의 피리딘하이드를 삼산 또는 그 유도체와 반응시킴을 특징으로 하여 일반식(1)의 세팔로스포린계 항생물질 및 그 약제학적으로 가능한 염을 제조하는 방법.



상기식에서, R은 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 다음 일반식의 그룹



(여기서, m은 0.1 또는 2이고, a와 b는 각각 수소 또는 탄소수 1 내지 3의 알킬이거나, 또는 a와 b는 함께 3 내지 6원소의 사보사이클 환을 형성하고; R'는 수소 또는 카복시 보호그룹이다)이고; R_i은 수소 또는 탄소수 1 내지 4의 알킬이고; n은 0 또는 1 내지 3의 정수이고; A와 A'는 각각 수소, 알킬, 탄소수 1 내지 4의 알킬이고, 상기식(2)에서 C₄ 카복실그룹, 옥시미노 관능기의 카복실산 그룹(존재할때), 티아졸 환의 2-위치에 존재하는 아야아그룹은 보호그룹으로 보호된다.

청구항 2

7-위치의 옥시미노 관능기가 출발물질인 3-요도메틸 세팔로스포린과 반응생성물중에서 anti형태로 존재하는 상기 1에 따른 방법.

청구항 3

A'이 수소이고 피리딘-하이드록산의 카복실 그룹은 반응시키기에 앞서 보호시키는 상기 1 또는 2에 따른 방법.

청구항 4

보호그룹이 실릴그룹인 상기 1,2 또는 3에 따른 방법.

청구항 5

실릴그룹이 트레메틸 실릴그룹인 상기 1 내지 4중의 하나에 따른 방법.

청구항 6

반응이 끝나면 보호그룹을 제거시키는 상기 1 내지 5 중의 하나에 따른 방법.

청구항 7

반응혼합물 중에 요드화수소 제거제를 포함하는 상기 1 내지 6중의 하나에 따른 방법.

청구항 8

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노 아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-4-피리딘 카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노 티아졸-4-일)-2-메톡시아미노-아세트아미도]-3-[(4-(N-하이드록시카바모일) 피리디니움]메틸]-3-세펜-4-카복실메이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 9

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노 아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시 3-피리딘아세트 아미드를 반응시켜 7-[2-(2-아미노 티아졸-4-일)-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[(N-하이드록시-3-피리디니움 아세트아미도)-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 10

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도-메틸-3-세펜-4-카복실산과 N-하이드록시-2-피리딘아세트 아미드를 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[(N-하이드록시-2-피리디니움 아세트아미도) 메틸]-3-세펜-4-카복실케이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 11

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-3-피리딘 카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[(3'-(N-하이드록시카바모일)피리디니움)-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 12

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-4-피리딘-아세트아미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[(N-하이드록시-4-피리디니움 아세트아미드)-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 13

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시 2-파리딘 카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아세트티아졸-4-일)-2-메톡시아미노-아세트아미도]-3-[2-(N-하이드록시 카바모일)피리디니움]-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 14

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노-아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-N-메틸 4-파리딘카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[4-(N-하이드록시-N-메틸카바모일)피리디니움]-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 15

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-N-메틸-3-피리딘카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노-아세트아미도]-3-[3-(N-하이드록시-N-메틸카바모일)피리디니움]-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 16

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-하이드록시-N-메틸-2-파리딘카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노-아세트아미도]-3-[2-(N-하이드록시-N-메틸카바모일)피리디니움]-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 17

7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-메톡시아미노아세트아미도]-3-요도메틸-3-세펜-4-카복실산을 N-메톡시-4-피리딘카복사미드와 반응시켜 7-[2-(2-아미노티아졸-4-일)-2-2-메톡시-아미노아세트아미도]-3-[4-(N-메톡시카바모일)-1-피리디니움]-메틸]-3-세펜-4-카복실레이트를 제조하는 상기 1 내지 7중의 하나에 따른 방법.

청구항 18

반응 생성물을 선택된 산과 반응시켜 약제학적으로 가능한 산을 제조하는 상기 청구범위 중의 하나에 따른 방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.