

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>5</sup> A61K 31/70	(11) 공개번호 특 1991-0007533
	(43) 공개일자 1991년 05월 30일
(21) 출원번호	특 1990-0015951
(22) 출원일자	1990년 10월 05일
(30) 우선권주장	417989 1989년 10월 06일 미국(US)
(71) 출원인	더 웰컴 파운데이션 리미티드 엠 피 잭슨 영국, 런던 엔더블유 2비피, 유스톤 로우드 160, 유니온 하우스
(72) 발명자	조지 월터 코스잘카 미합중국, 노오쓰 캐롤리나 27514, 차펠 힐, 프리스틀리 크리크 드라이브 117 찰렌 루이즈 번즈 미합중국, 노오쓰 캐롤리나 27701, 던햄, 노오쓰 듀크 스트리트 1418 토마스 안토니 크레니트스키 미합중국, 노오쓰 캐롤리나 27514, 차펠 힐, 라우렐 힐 로우드 106 자넷 리츠스터 라이드 아웃 미합중국, 노오쓰 캐롤리나 27607, 펠라이, 모닝사이드 드라이브 3101
(74) 대리인	나영환, 도두형

심사청구 : 없음

(54) 치료용 뉴클레오시드

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

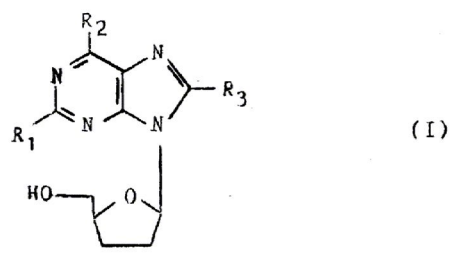
치료용 뉴클레오시드

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

헤파티티스 B바이러스 감염질환 치료 또는 예방용 약학적 조성물 제조에 사용되는 하기식(I)의 뉴클레오시드류 화합물 및 이의 약학적 허용 유도체의 용도.



[상기식에서, R<sub>1</sub>은 수소 또는 아미노 및 R<sub>2</sub>는 할로겐, C<sub>3-6</sub> 시클로알킬로 임의 치환된 C<sub>1-6</sub> 알콕시(예로, 시클로프로필메톡시 시클로알킬옥시(예로, 시클로부틸옥시 또는 시클로펜틸옥시); 아릴옥시; 아르알킬 또는 아르알킬 옥시인데, 상기 아릴은 임의적으로 저급 알킬, 히드록실 또는 할로겐으로 치환된 것이며, C<sub>3-6</sub> 시클로알킬티오 : C<sub>1-6</sub> 알킬티오 : 아릴티오 또는 아르알킬티오인데 상기 아릴은 임의적으로 저급알킬, 히드록시 또는 할로겐으로 치환된 것이며, 또는 R<sub>2</sub>는 링에 선택적인 이중결합으로 산소원자 또는 하나 또는 두개의 질소원자 및 3-7탄소원자를 함유하는 헤테로시클릭기로서 선택적으로 황 및/또는 산소이종원자를 함유하고 선택적으로 링에서 하나 또는 그 이상의 저급 알킬, 히드록실 또는 할로겐기로 치환

될 수 있고, 또한 R<sub>2</sub>는 C<sub>3-6</sub>시클로알킬티오, 아르알킬티오인데, 상기 아릴은 저급알킬, 히드록시 또는 할로겐으로 치환될 수 있으며; 또는 R<sub>2</sub>는 이미다졸릴티오기인데, 이미다졸릴 부분은 저급알킬로 치환되거나 및/또는 C-니트로치환된 것이며, 또는 R<sub>2</sub>는 아미노기인데, C<sub>1-6</sub>알킬, C<sub>1-6</sub>알콕시, 및/또는 C<sub>3-6</sub> 시클로알킬로 하나 또는 두개 치환된 것이며, 아릴, 아르알킬인데, 아릴은 임의적으로 저급알킬, 히드록시 또는 할로겐으로 치환된 것이고, 알킬은 임의적으로 모노 또는 디-알킬이나 알콕시기로 치환된 것이며, 및 R<sub>3</sub>는 수소 또는 아미노이다. 단, 상기식에서 R<sub>1</sub> 및 R<sub>3</sub>가 수소, R<sub>2</sub>가 메톡시 또는 메틸티오기인 화합물은 제외한다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sub>1</sub>이 아미노, R<sub>3</sub>가 수소인 식(1)화합물 또는 이의 약학적으로 허용유도체의 용도.

**청구항 3**

제1항 또는 제2항에 있어서, R<sub>2</sub>가 모노-또는 디-치환된 아미노기인 식(1)화합물 또는 이의 약학적 허용유도체의 용도.

**청구항 4**

제3항에 있어서, 아미노기가 C<sub>1-6</sub> 알킬 및/또는 C<sub>3-6</sub>시클로알킬에 의해 모노- 또는 디-치환된 식(1) 화합물 또는 이의 약학적 허용 유도체의 용도.

**청구항 5**

제1항 또는 제2항에 있어서, R<sub>2</sub>가 C<sub>1-6</sub> 알콕시기인 식(1) 화합물 또는 이의 약학적 허용 유도체의 용도.

**청구항 6**

제1항에 있어서, 상기 화합물은 2-아미노-6-n-프로폭시퓨린-9-β-D-2',3'-디데옥시리보푸라노시드 및 2-아미노-6-시클로프로필 아미노퓨린-9-β-D-2',3'-디데옥시라보푸라노시드로부터 선택된 식(1)화합물 이의 약학적 허용 유도체의 용도.

**청구항 7**

2-아미노-6-(시클로프로필 메틸 아미노)퓨린-9-β-D-2',3'-디데옥시라보푸라노시드 및 이의 약학적 허용 유도체.

**청구항 8**

제7항에 있어서, 의학치료용 화합물.

**청구항 9**

제8항에 있어서, 인간의 레트로바이러스 감염질환을 치료 또는 예방하는데 사용되는 화합물.

**청구항 10**

제9항에 있어서, 인간 면역결핍 바이러스(HIV)감염질환의 치료 또는 예방에 사용되는 화합물.

**청구항 11**

제8항에 있어서, 헤파티티스 B바이러스(HIV)감염질환의 치료 또는 예방에 사용되는 화합물.

**청구항 12**

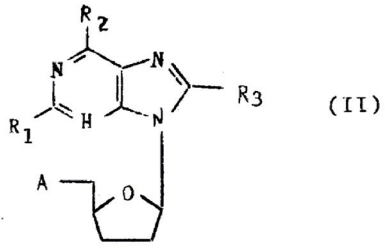
제7항에서 정의한 적어도 하나의 화합물과 적어도 하나의 이의 약학적 허용유도체를 함유하는 약학적 조성물.

**청구항 13**

하기의 (a)단계 또는 (b)단계로 2-아미노-6-(시클로프로필 아미노)퓨린-9-β-D-리보푸라노시드 및 이의 약학적 허용 유도체를 제조하는 방법.

(a)식(II)의 화합물과 반응제를 반응시키거나 또는 전구체가 바람직한 기로 전환될 수 있는 조건하에 반응시키는 단계, (b)바람직한 디데옥시리보푸라노실링을 하기식(III)의 퓨린 염기의 9-위치에 유입되도록 돕는 화합물과 하기식(III)의 퓨린 염기를 반응시키는 단계, 이후에 또는 동시에 하기의 전환반응을 하나이상 수행하는 방법.

(i) 바람직한 모화합물이 형성될때 이를 이의 약학적 허용유도체로 전환하는 단계, (ii) 바람직한 모화합물의 약학적 허용유도체가 형성될때 이 유도체를 모화합물 또는 이의 다른 유도체로 전환하는 단계.



B - H (III)

상기식에서, R<sub>1</sub>은 아미노, R<sub>2</sub>는 시클로프로필메틸아미노, R<sub>3</sub>는 수소, A는 하이드록시기의 전구체, B는 R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> 및 R<sub>3</sub>가 상기 정의한 것과 같거나 이의 기능적 등가물인 퓨린 염기이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.