

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>  
C07D 487/04

(11) 공개번호 특1991-0006293  
(43) 공개일자 1991년04월29일

(21) 출원번호	특1990-0014464
(22) 출원일자	1990년09월10일
(30) 우선권주장	89205348 1989년09월11일 영국(GB)
(71) 출원인	더 웰컴 파운데이션 리미티드 엠. 피. 잭슨 영국, 런던 엔더블유 1 2 비피, 유스톤 로오드 160, 유니콘하우스 실비아 마가렛 티스데일
(72) 발명자	영국, 켄트 비알3 3비 에스, 베켄햄, 랭글리커트 조엘 반 터틀 미합중국, 노우스 캐롤라이나 27705, 더햄, 레드넘 스트리트 2306-지 마틴 존 슬래터 영국, 켄트 비알3 3비에스, 베켄햄, 랭글리 커트 수잔 마리 달러지 미합중국, 노우스캐롤라이나 27514, 채펄 힐, 아잘리아 드라이브 297 웨인 하워드 밀러 미합중국, 노우스 캐롤라이나 27502, 아펙스, 구드윈 로오드 1208 토마스 안토니 크레니츠키 미합중국, 노우스 캐롤라이나 27514, 채펄힐, 라우렐 힐 로오드 106 조오지 월터 코스잘카 미합중국, 노우스 캐롤라이나 27514, 채펄힐, 워터포드 플레이스 100 나영환, 도두형
(74) 대리인	

심사청구 : 없음

(54) 항비루스성 화합물, 이의 제법 및 이를 함유하는 약학적 조성물

요약

내용 없음

명세서

[발명의 명칭]

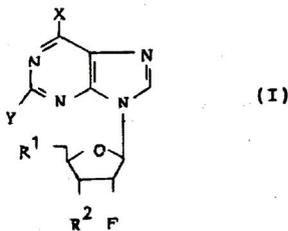
항비루스성 화합물, 이의 제법 및 이를 함유하는 약학적 조성물.

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

일반식(I)의 화합물 또는 그 약학적 허용염.



상기식에서 (1) Y는 H 또는 NH<sub>2</sub>; (2) X는 ①R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>가 서로 다른 NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>기로서 각각은 수소, C<sub>1-6</sub>알킬, C<sub>2-6</sub>알케닐, C<sub>3-7</sub>시클로알킬을 나타내며 개개의 기들은 하나 이상의 할로겐에 의해 임의 치환되었으며; 또는 ②Z-R<sup>5</sup>기로서 Z는 산소 또는 황이며, R<sup>5</sup>는 R<sup>3</sup>과 동일한 의미를 지니며; 또는 ③할로겐 또는 수소이며; (3) R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>는 서로 같거나 서로 다르며 각각은 ①히드록시기; 또는 ②-OCOR<sup>6</sup>H기 (R<sup>6</sup>는 직쇄이거나 측쇄의 C<sub>1-6</sub>알킬렌, C<sub>2-6</sub>알케닐렌 또는 C<sub>3-7</sub>시클로알킬렌인 이가기이며, 개개의 기들은 하나 이상의 히드록시기에 의해 임의 치환되었다); ③-OCOR<sup>7</sup>H기 (R<sup>7</sup>은 공유 결합이거나 R<sup>6</sup>와 같은 의미를 지니다); ④-OCOR<sup>6</sup>-COOR<sup>8</sup>기 (R<sup>6</sup>은 상기 정의한 것과 같고 R<sup>8</sup>는 수소, 직쇄 또는 측쇄의 C<sub>1-6</sub>알킬 또는 C<sub>1-6</sub>알케닐이며, 각각은 하나 이상의 히드록시기에 의해 임의 치환되었다); 또는 ⑤-OCOR<sup>7</sup>-Z-Ar (R<sup>7</sup>은 상기 정의한 것과 같고, Z는 공유 결합이거나 산소이며, Ar은 방향족 환으로서 하나 이상의 할로겐, C<sub>1-6</sub>알킬 또는 C<sub>1-6</sub>알콕시에 의해 치환 또는 비치환되었다); 또는 ⑥-OR<sup>6</sup>H기 (R<sup>6</sup>는 상기 정의한 것과 같다); 또는 ⑦-OR<sup>6</sup>-Z-Ar (R<sup>6</sup>, Z 및 Ar은 상기 정의한 것과 같다); 또는 ⑧-OCOCHR<sup>9</sup>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>기 (R<sup>10</sup> 및 R<sup>11</sup>은 R<sup>8</sup>에서 정의한 것과 같고; R<sup>9</sup>은 수소이거나 하나 이상의 히드록시, 메르캅토; C<sub>1-3</sub>알콕시 또는 C<sub>1-3</sub>알킬티오기에 의해 임의 치환된 직쇄 또는 측쇄의 C<sub>1-4</sub>알킬; -R<sup>12</sup>-A기 (R<sup>12</sup>는 하나 이상의 히드록시기에 의해 임의 치환된 C<sub>1-4</sub>알킬렌기이며 A는 -COOH, -CONH<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub> 또는 -NH-C(NH)NH<sub>2</sub> 또는 A는 4-11 원소의 방향족 또는 비방향족의 사이클릭한 또는 3-10탄소원자와 0, 1, 2 또는 3환 질소원자를 지닌 복소환 시스템이며 환 탄소원자 및/또는 질소원자는 하나 이상의 히드록시기에 의해 임의 치환되었다); 또는 ⑨-OCO-R<sup>13</sup>기 (R<sup>13</sup>은 3-6탄소원자 및, 0, 1 또는 2 질소원자 함유의 4-7 원소 복소환이며 환의 탄소원자 및/또는 질소원자는 하나 이상의 히드록시기에 의해 임의 치환되었다); 또는 ⑩-모노-, 디- 또는 트리- 포스페이트 에스테르기이며; 단 일반식(1)의 화합물중에서, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>가 각각 히드록시이거나 R<sup>1</sup>이 모노-, 디- 또는 트리포스페이트 5' -에스테르이고 R<sup>2</sup>가 히드록시이며 (a)X=OH이고 Y=NH<sub>2</sub>이거나 (b)X=NH<sub>2</sub>이고 Y=H인 것은 제외한다.

**청구항 2**

제1항에 있어서, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>가 둘다 OH이거나, R<sup>1</sup>은 모노포스페이트, R<sup>2</sup>는 OH, Y는 H 또는 NH<sub>2</sub>이고 X는 -NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>기 (R<sup>3</sup> 및 R<sup>4</sup>는 같거나 상이하하며 각각 H 또는 C<sub>1-6</sub>알킬이다); 또는 X는 Z-R<sup>5</sup>기 (Z는 O이거나 S이고 R<sup>5</sup>는 C<sub>1-6</sub>알킬이다); 또는 X는 할로겐 또는 수소인 화합물 또는 그 약학적 허용염.

**청구항 3**

제1항 또는 제2항에 있어서, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup> 모두 OH, Y는 NH<sub>2</sub>, 그리고 X는 H, OH, NH<sub>2</sub>, 또는 Z-R<sup>5</sup> (Z는 O이고, R<sup>5</sup>는 C<sub>1-6</sub>알킬이다)인 화합물 또는 그 약학적 허용 염.

**청구항 4**

2,6-디아미노-9-(2-데옥시-2-플루오로-β-D-리보푸라노실)-9H-푸린 및 그 약학적 허용염.

**청구항 5**

2-아미노-9-(2-데옥시-2-플루오로-β-D-리보푸라노실)-9H-푸린 및 그 약학적 허용염.

**청구항 6**

2-아미노-9-(2-데옥시-2-플루오로-β-D-리보푸라노실)-6-메톡시-9H-푸린 및 그 약학적 허용염.

**청구항 7**

의약요법에 사용하기 위한 제1항 또는 제2항 내지 제6항중 어느 한 항에 의한 일반식(1)의 화합물 또는 그들의 약학적 허용 염.

**청구항 8**

감염의 치료 또는 예방을 위한 약물제조에 있어서 제2항 내지 제6항중 어느 한 항의 화합물의 사용방법.

**청구항 9**

제8항에 있어서, 상기 감염이 바이러스성 감염일 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 10**

제8항에 있어서, 상기 감염이 원생동물에 의한 감염일 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 11**

제8항에 있어서, 바이러스성 감염이 인플루엔자 바이러스성 감염인 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 12**

제8항에 있어서, 바이러스성 감염이 호흡기 합포체 바이러스 감염인 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 13**

제8항에 있어서, 원생동물 감염이 트리코모나스 바기날리스 감염인 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 14**

제8항에 있어서, 원생동물 감염이 기아디아 람블리아 감염인 경우의 화합물의 사용방법.

**청구항 15**

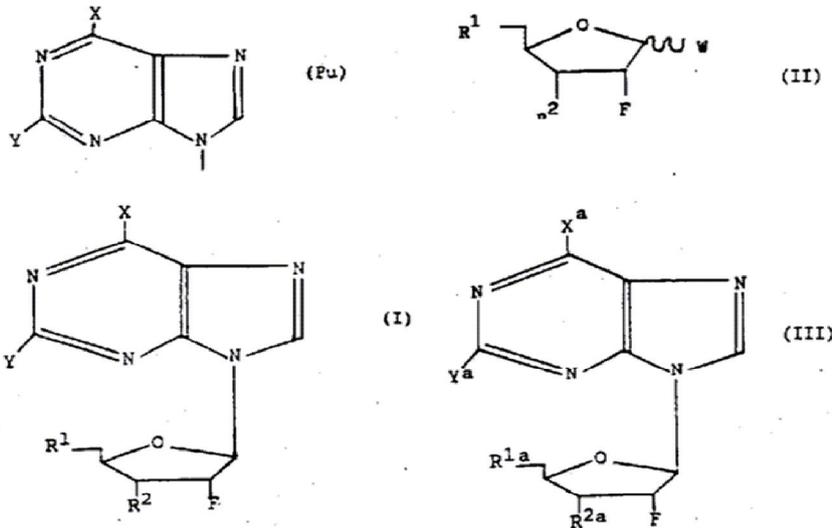
제2항 내지 제7항중 어느 한 항의 화합물과 그 약학적 허용 담체를 포함하는 약학적 제제.

**청구항 16**

제15항에 있어서, 경구 또는 비강 투여용 약학적 제제.

**청구항 17**

제1항 내지 제6항의 일반식 (I)의 화합물 또는 그 약학적 허용염을 제조하는 방법에 있어서, (A) 일반식 Pu의 퓨린염기(PuH는 퓨린잔기이다) 또는 그 염을 일반식(II)의 화합물과 반응시켜서 일반식(I)의 화합물을 생성하는 방법; 및 (B) 일반식(III)의 화합물을 반응제와 반응시켜서 상기 전구체 형태의 기를 다음의 목적하는 기로 전환시키는 방법으로서, (i) R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>중 적어도 하나가 히드록시기인 식(I) 화합물을 적당한 반응제와 반응시켜 상기 히드록시기를 상기에서 정의한 R<sup>1</sup> 및/또는 R<sup>2</sup>의 다른 기로 전환시키는 방법 (ii) R<sup>1</sup> 및/또는 R<sup>2</sup>가 히드록시가 아닌 식(I) 화합물을 반응제와 반응시켜 R<sup>1</sup> 및/또는 R<sup>2</sup>를 히드록시기로 전환시키는 방법.



상기식에서, X, Y, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>는 상기 정의와 같다; W는 포스페이트 에스테르 또는 그 염이나 퓨린 또는 피리미딘 부분(Pu 제외)이다; X<sup>a</sup>, Y<sup>a</sup>, R<sup>1a</sup> 및 R<sup>2a</sup>는 각각 상기 정의된 X, Y, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>를 나타내거나 전구체인데 예컨데 최소한 X, Y, R<sup>1</sup> 및 R<sup>2</sup>중 하나가 전구체 형태라면 그런기의 보호된 형태이다.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.