

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>5</sup> C07F 9/09	(11) 공개번호 (43) 공개일자	특 1990-0016235 1990년 11월 13일
(21) 출원번호	특 1990-0004897	
(22) 출원일자	1990년 04월 10일	
(30) 우선권주장	01-087961 1989년 04월 10일 일본(JP) 01-296232 1989년 11월 16일 일본(JP) 01-297443 1989년 11월 17일 일본(JP)	
(71) 출원인	닛뽕 가야구 가부시기가이샤 다게다 가즈히꼬 일본국 도오교오도 지요다구 후지미 1쵸오메 11-2	
(72) 발명자	사시또오 세이이찌 일본국 지바켄 가시와시 마쓰바쯔 4쵸오메 7-2-407 하세가와 시게루 일본국 사이다마켄 요노시 가미오찌아이 1039 기다가와 마사유키 일본국 사이다마켄 요노시 가미오찌아이 1039 시마다 노부요시 일본국 도오교오도 기다구 시모 2쵸오메 9-10 다가하시 가쓰도시 일본국 도오교오도 기다구 가미야 3쵸오메 10-8-512 세끼 준이찌 일본국 군마켄 다가사끼시이와하나마찌 239 호시노 히로오 일본국 군마켄 마에바시시 헤이와마찌 1쵸오메 14-5 니시야마 유키히로 일본국 아이찌켄 아이찌군 도고쵸 시라도리 2쵸오메 8-25 마쓰바라 겐이찌 일본국 오오사가후 스이다시 야마다히가시 3쵸오메 18-1-804 나가하다 다께미쓰 일본국 오오사가후 도요나까시 가미신덴 2쵸오메 6-25 센리사까노기 하이쓰 208	
(74) 대리인	최재철, 김기종	

심사청구 : 없음

(54) 옥세타노신의 인산에스테르 유도체와 그 제조방법 및 용도

요약

내용 없음.

명세서

[발명의 명칭]

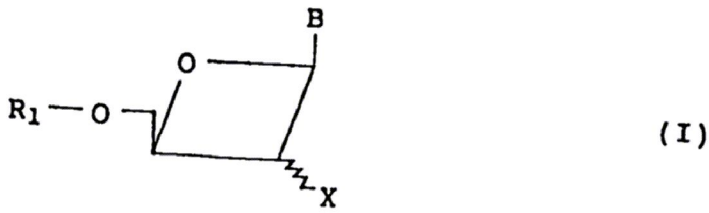
옥세타노신의 인산에스테르 유도체와 그 제조방법 및 용도

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

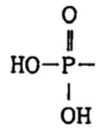
청구항 1

일반식 (I)의 옥세타노신 인산에스테르 및 그 산부가염.



위의 일반식에서, R<sub>1</sub>은 인산에스테르 잔기이고, B는 퓨린염기 잔기이고, X는 수소, 히드록시 또는 히드록시메틸이다.

청구항 2



제1항에 있어서, 일반식 (I)의 R<sub>1</sub>이  $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{HO}-\text{P}- \\ | \\ \text{OH} \end{array}$ 인 옥세타노신 인산에스테르 및 그 산부 가염.

청구항 3

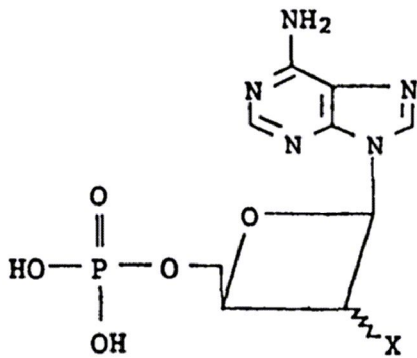
제1항에 있어서, 일반식 (I)의 B가 아데닌잔기 또는 구아닌 잔기인 옥세타노신 인산에스테르 및 그 산부 가염.

청구항 4

제1항에 있어서, 일반식 (I)의 X가 수소 또는  $\begin{array}{c} | \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$ 인 옥세타노신 인산에스테르 및 그 산부가염.

청구항 5

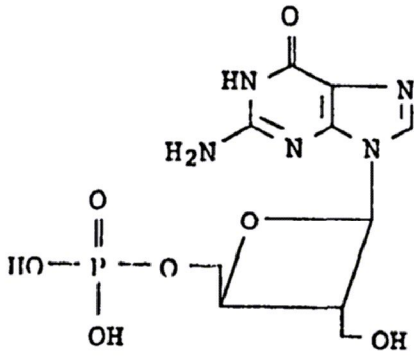
아래식의 옥세타노신 A의 인산에스테르 및 2'-디히드로메틸 옥세타노신 A 그리고 그 산부가염.



위의 식에서, X는 수소 또는 히드록시메틸이다.

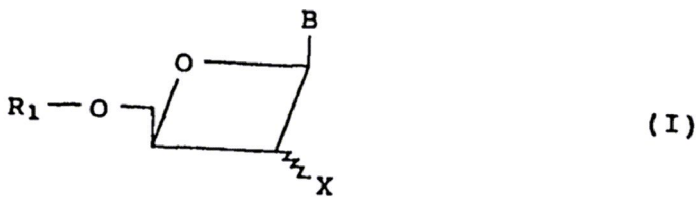
청구항 6

아래구조식의 OXT-G 인산에스테르.



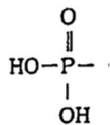
**청구항 7**

일반식 (I)의 옥세타노신 인산에스테르 또는 그 산부가염을 유효성부로 효과량 함유하고 담체로 조성된 항 바이러스 약제 조성물.



위의 일반식에서, R<sub>1</sub>은 인산에스테르 잔기이고, B는 퓨린염기잔기이고, X는 수소, 히드록시 또는 히드록시메틸이다.

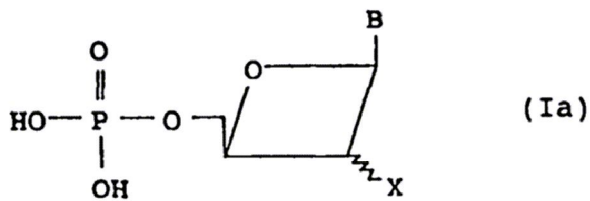
**청구항 8**



제7항에 있어서, 일반식 (I)의 R<sub>1</sub>이 이고, X가 수소 또는 히드록시메틸이고, B가 아데닌잔기 또는 구아닌잔기인 항바이러스약제 조성물.

**청구항 9**

일반식 (I a)의 옥세타노신 인산에스테르 또는 그 산부가염을 바이러스 감염 온혈동물에 효과량 투여하여 바이러스성장을 억제하는 방법.



위의 일반식에서 B는 퓨린염기잔기이고, X는 수소, 히드록시 또는 히드록시메틸이다.

**청구항 10**

제9항에 있어서, 일반식 (I a)의 B가 아데닌잔기인 방법.

**청구항 11**

제9항에 있어서, 바이러스가 HIV(사람 면역결핍성 바이러스), 비-A(non-A), 비-B(non-B) 간염 바이러스, 헤르페스 심플렉스 바이러스 I 및 II, 시토크갈로바이러스, B형 간염 바이러스 또는 바리셀라-조스테르(Varicellazoster) 헤르페스 바이러스인 방법.

**청구항 12**

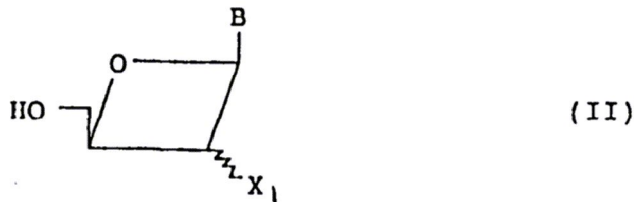
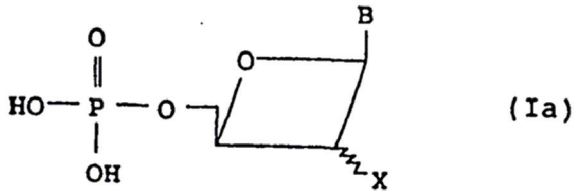
제9항에 있어서, 일반식 (I a)의 B가 구아닌 잔기이고, 바이러스가 DNA 바이러스인 방법.

청구항 13

제12항에 있어서, DNA 바이러스가 헤르페스 심플렉스 바이러스 I 및 II, 시토메갈로바이러스, B형 간염 바이러스 또는 바리셀라-조스테르 헤르페스 바이러스인 방법.

청구항 14

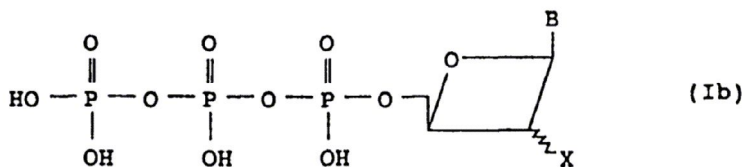
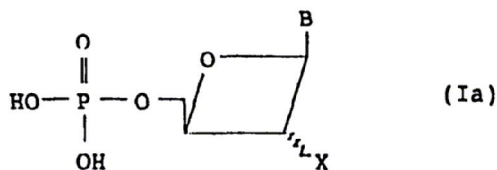
일반식(II)의 옥세타노신을 일반식(P)의 저급알킬 인산염 존재하에 옥시염화인산(phosphorus oxychloride)와 반응시키고, X' 가 -O-P<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>-O-P<sub>3</sub>인 경우는 보호화합물로부터 보호기를 제거하여 일반식(Ia)의 옥세타노신 1 인산 에스테르를 제조하는 방법.



위의 일반식에서, X는 H, OH 또는 CH<sub>2</sub>OH 이고, B는 퓨린 염기잔기이고, X' 는 H, OH<sub>1</sub>-O-P<sub>3</sub> 또는 -CH<sub>2</sub>-O-P<sub>3</sub>(P<sub>3</sub>은 보호기)이고, R<sub>a</sub>, R<sub>b</sub> 및 R<sub>c</sub>는 각각 수소 또는 저급알킬이다.

청구항 15

일반식(Ia)의 옥세타노신/인산 에스테르를 트리알킬 아민 존재하에 카르보닐디이미다졸 및 트리알킬암 모니움 파이로포스페이트와 반응시켜 일반식(Ib)의 옥세타노신 3 인산에스테르를 제조하는 방법.



위의 일반식에서 B는 퓨린염기잔기이고, X는 수소, 히드록시 또는 히드록시메틸이다.

※참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.