(19)대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) 。Int. Cl. 7
C07H 19/16

(11) 공개번호 특2003-0036189
(43) 공개일자 2003년05월09일

(21) 출원번호 10-2002-7015794
(22) 출원일자 2002년11월22일
번역문 제출일자 2002년11월22일
(86) 국제출원번호 PCT/US2001/16687
(87) 국제공개번호 WO 2001/92282
(86) 국제출원출원일자 2001년05월23일
(87) 국제공개일자 2001년12월06일

(81) 지정국 국내특허 : 아랍에미리트, 안티구아바부다, 알바니아, 아르메니아, 오스트리아, 오스트레일리아, 아제르바이잔, 보스니아-헤르체고비나, 바베이도스, 불가리아, 브라질, 벨라루스, 벨리즈, 캐나다, 스위스, 중국, 콜롬비아, 코스타리카, 쿠바, 체코, 독일, 덴마크, 도미니카연방, 알제리, 에스토니아, 스페인, 핀랜드, 영국, 그레나다, 그루지야, 가나, 감비아, 크로아티아, 헝가리, 인도네시아, 이스라엘, 인도, 아이슬란드, 일본, 케냐, 키르기즈, 북한, 대한민국, 카자흐스탄, 세인트루시아, 스리랑카, 라이베리아, 레소토, 리투아니아, 룩셈부르크, 라트비아, 모로코, 몰도바, 마다가스카르, 마케도니아, 몽고, 말라위, 멕시코, 모잠비크, 노르웨이, 뉴질랜드, 폴란드, 포르투칼, 루마니아, 러시아, 수단, 스웨덴, 싱가포르, 슬로베니아, 슬로바키아, 시에라리온, 타지키스탄, 투르크메니스탄, 터어키, 트리니다드토바고, 탄자니아, 우크라이나, 우간다, 미국, 우즈베키스탄, 베트남, 유고슬라비아, 남아프리카, 짐바브웨, 에쿠아도르,

AP ARIPO특허: 가나, 감비아, 케냐, 레소토, 말라위, 모잠비크, 수단, 시에라리온, 스와질랜드, 탄자니아, 우간다, 짐바브웨,

EA 유라시아특허: 아르메니아, 아제르바이잔, 벨라루스, 키르기즈, 카자흐스탄, 몰도바, 러시아, 타지키스탄, 투르크메니스탄,

EP 유럽특허: 오스트리아, 벨기에, 스위스, 사이프러스, 독일, 덴마크, 스페인, 핀랜드, 프랑스, 영국, 그리스, 아일랜드, 이탈리아, 룩셈부르크, 모나코, 네덜란드, 포르투칼, 스웨덴, 터어키,

OA OAPI특허: 부르키나파소, 베넹, 중앙아프리카, 콩고, 코트디브와르, 카메룬, 가봉, 기네, 기네비쏘, 말리, 모리타니, 니제르, 세네갈, 차드, 토고,

(30) 우선권주장 60/207,674 2000년05월26일 미국(US)
60/283,276 2001년04월11일 미국(US)

(71) 출원인 이데닉스(케이만)리미티드
케이만군도 그랜드 케이만 워커 하우스 워커 세크러테리즈

유니베르시타 데글리 스투디 디 카글리아리
이탈리아 아이-09042 몬세라토 케이엠. 4.500 시타델라 유니베르시타리아 에스에스 554 세지오네 디 마이크로바이올로지아 디아이피. 바이올로지아 스페리멘탈

(72) 발명자 솜마도시쟝-피에르
미합중국알라바마35242버밍엄그레이스톤웨이5075

라콜라파올로
이탈리아아이-09012카포테라포기오데이피니5스트라다엔오.11

(74) 대리인 최규팔
이은선

심사청구 : 없음

(54) 플라비바이러스 및 페스티바이러스의 치료방법 및 조성물

요약

유효한 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료량의 기재된 1',2' 또는 3'-변형된 뉴클레오사이드 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 투여하는 것을 포함하는 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주를 치료하기 위한 방법 및 조성물이 제공된다.

대표도

도 1

명세서

기술분야

본 발명은 약품화학 분야이며, 특히 플라비바이러스 및 페스티바이러스 치료를 위한 화합물, 방법 및 조성물이다. 본 출원은 2000년 5월 26일에 출원된 미합중국 가출원 제60/207,674호 및 2001년 4월 11일에 출원된 미합중국 가출원 제60/283,276호를 기초로 우선권을 주장한다.

배경기술

페스티바이러스와 플라비바이러스는 C형 간염 바이러스와 함께 플라비비리대(*Flaviviridae*) 훼밀리 바이러스에 속한다. 페스티바이러스 속은 소 바이러스성 설사 바이러스(BVDV), 전형적 돼지 열 바이러스(CSFV, 호그 콜레라 바이러스라고도 불림) 및 양의 가장자리 질병 바이러스(BDV)를 포함한다(Moennig, V. et al. Adv. Vir. Res. 1992, 41, 53-98). 가축(소, 돼지 및 양)의 페스티바이러스 감염은 전세계적으로 심각한 경제적 손실을 야기한다. BVDV는 소에서 점막 질환을 일으키며 가축 산업에서 경제적으로 대단히 중요하다(Meyers, G. and Thiel, H-J., Advances in Virus Research, 1996, 47, 53-118; Moennig V. et al, Adv. Vir. Res. 1992, 41, 53-98).

인간 페스티바이러스는 동물 바이러스만큼 심도있게 특성이 규명되어 있지 않았다. 그러나, 혈청학적 연구 결과 인간에서 상당한 페스티바이러스 노출이 있는 것으로 밝혀졌다. 인간에서 페스티바이러스 감염은 선천성 뇌 손상, 유아 위장염 및 인간 면역결핍 바이러스(HIV) 양성 환자의 만성 설사를 포함하여 몇몇 질환에 연루되어 있다. M. Giangaspero et al., Arch. Virol. Suppl., 1993, 7, 53-62; M. Giangaspero et al., Int. J. Std. Aids, 1993, 4(5): 300-302.

플라비바이러스 속은 혈청학적 연관성을 기초로 그룹들로 분리되는 68 초과의 구성원을 포함한다(Calisher et al., J. Gen. Virol, 1993, 70, 37-43). 임상적 증상은 변화하며 열, 뇌염 및 출혈열을 포함한다. Fields Virology, Editors: Fields, B. N. Knipe, D. M., and Howley, P. M., Lippincott-Raven Publishers, Philadelphia, PA, 1996, Chapter 31, 931-959. 인간 질병과 관련된 세계적 관심사인 플라비바이러스는 뎅그열 바이러스(DHF), 황색 열 바이러스, 쇼크 증후군 및 일본 뇌염 바이러스를 포함한다. Hlastead, S. B., Rev. Infect. Dis., 1984, 6, 251-264; Halstead, S.B., Science, 239: 476-481, 1988; Monath, T.P., New Eng. J. Med., 1988, 319, 641-643.

플라비바이러스 또는 페스티바이러스에 대해 활성적인 것으로 확인된 항바이러스제의 예는

(1) 인터페론 및 리바비린(Battaglia, A. M. et al., Ann. Pharmacother, 2000, 34: 487-494); Berenguer, M. et al. Antivir. Ther. 1998, 3(Suppl. 3): 125-136);

(2) 알파케토아미드 및 하이드라지노우레아를 포함하는 기질-기초 NS3 프로 테아제 저해제(Attwood et al., Antiviral peptide derivatives, PCT WO 98/22496, 1998; Attwood et al., Antiviral Chemistry and Chemotherapy 1999, 10, 259-273; Attwood et al., Preparation and use of amino acid derivatives as anti-viral agents, 독일특허

공개 DE 19914474; Tung et al. Inhibitor of serine proteases, particularly hepatitis C virus NS3 protease, PCT WO 98/17679), 및 보론산 또는 포스페이트와 같은 친전자체로 끝나는 저해제(Llinas-Brunet et al, Hepatitis C inhibitor peptide analogues, PCT WO 99/07734);

(3) 아미드상에서 14 개의 탄소 쇄로 치환된 RD3-4082 및 파라-페녹시페닐 그룹을 갖는 RD3-4078을 포함하는, 2,4,6-트리하이드록시-3-니트로-벤즈아미드 유도체(Sudo K. et al., Biochemical and Biophysical Research Communications, 1997, 238, 643-647; Sudo K. et al. Antiviral Chemistry and Chemotherapy, 1998, 9, 186)와 같은 비-기질-기초 저해제;

(4) NS3/4A 융합 단백질 및 NS5A/5B 기질을 사용하는 역상 HPLC 분석에서 관련된 저해성을 보이는 티아졸리딘 유도체(Sudo K. et al., Antiviral Research, 1996, 32, 9-18), 특히, 긴 알킬 쇄로 치환된 융합된 신나모일 부위를 갖는 화합물 RD-1-6250, RD4 6205 및 RD4 6193;

(5) Kakiuchi N. et al. J. EBS Letters 421, 217-220; Takeshita N. et al. Analytical Biochemistry, 1997, 247, 242-246에서 확인된 티아졸리딘 및 벤즈아닐리드;

(6) SDS PAGE 및 오토라디오그래피 분석에서 스트렙토마이세스 종(*Streptomyces sp.*), Sch 68631의 발효 배양액으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Tetrahedron Letters, 1996, 37, 7229-7232), 및 섬광 근접 분석에서 진균 페니실리움 그리스코풀럼(*Penicillium griscofuluum*), Sch 351633으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 9, 1949-1952)에 대하여 활성을 갖는 페난-트레네퀴논;

(7) 거머리로부터 분리된, 매크로분자 에글린 c(eglin c)에 기초한 선택적 NS3 저해제(Qasim M. A. et al., Biochemistry, 1997, 36, 1598-1607);

(8) 헬리카아제 저해제(Diana G. D. et al., Compounds, compositions and methods for treatment of hepatitis C, 미국특허 제5,633,358호; Diana G. D. et al., Piperidine derivatives, pharmaceutical compositions thereof and their use in the treatment of hepatitis C, PCT WO 97/36554);

(9) 뉴클레오타이드 유사체, 글리오톡신(Ferrari R. et al. Journal of Virology, 1999, 73, 1649-1654), 및 천연 세루레닌(Lohmann V. et al., Virology, 1998, 249, 108-118)과 같은 폴리머라아제 저해제;

(10) 바이러스의 5' 비-코딩 영역(NCR)에서 서열 스트레치에 상보적인 안티센스 포스포로티오에이트 올리고데옥시뉴클레오타이드(Alt M. et al., Hepatology, 1995, 22, 707-717), 또는 NCR의 3' 말단을 포함하는 뉴클레오타이드 326-348 또는 HCV RNA의 코어 코딩 영역에 위치하는 뉴클레오타이드 371-388(Alt M. et al., Archives of Virology, 1997, 142, 589-599; Galderisi U. et al., Journal of Cellular Physiology, 1999, 181, 251-257);

(11) IRES-의존 해독 저해제(Ikeda N et al., Agent for the prevention and treatment of hepatitis C, 일본특허 공개 JP-08268890; Kai Y. et al. Prevention and treatment of viral diseases, 일본특허 공개 JP-10101591);

(12) 뉴클레아제-내성 라이보자임(Maccjak D. J. et al., Hepatology, 1999, 30, 초록 995); 및

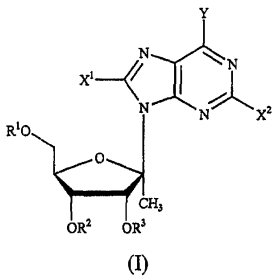
(13) 1-아미노-알킬사이클로헥산(미국특허 제6,034,134호, Gold et al.), 알킬 리피드(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 비타민 E 및 다른 항산화제(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 스쿠알렌, 아만타딘, 담즙산(미국특허 제5,846,964호, Ozeki et al), N-(포스포노아세틸)-L-아스파트산(미국특허 제5,830,905호, Diana et al.), 벤젠디카복스아미드(미국특허 제5,633,388호, Diana et al.), 폴리아데닐산 유도체(미국특허 제5,496,546호, Wang et al.), 2',3'-디데옥시이노신(미국특허 제5,026,687호, Yarchoan et al.), 및 벤즈이미다졸(미국특허 제5,891,874호, Colacino et al.)을 포함하는 여러 다른 화합물을 포함한다.

페스티바이러스와 플라비바이러스와 관련된 질병의 중증도 및 동물 및 인간에서 그들의 전파를 고려하여, 본 발명의 목적은 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료를 위한 화합물, 방법 및 조성물을 제공하는 것이다.

발명의 요약

유효 치료량의 화학식 (Ⅰ)-(XⅧ)의 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 포함하는, 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료를 위한 화합물, 방법 및 조성물을 기술한다.

제1 주요 예에서, 화학식 I 의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(I)

상기 식에서,

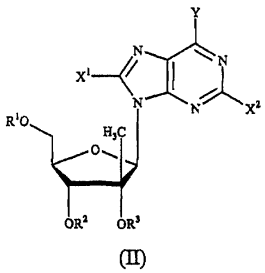
R 1 , R 2 및 R 3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R 1 , R 2 및 R 3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR 4 , NR 4 R 5 또는 SR 4 이며;

X 1 및 X 2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR 4 , NR 4 R 5 또는 SR 4 이고;

R 4 및 R 5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제2 주요 예에서, 화학식 II 의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(II)

상기 식에서,

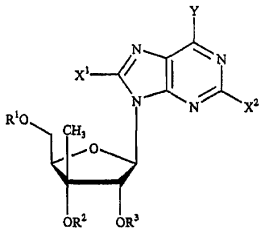
R 1 , R 2 및 R 3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R 1 , R 2 및 R 3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR 4 , NR 4 R 5 또는 SR 4 이며;

X 1 및 X 2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR 4 , NR 4 R 5 또는 SR 4 이고;

R 4 및 R 5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제3 주요 예에서, 화학식 III의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(III)

상기 식에서,

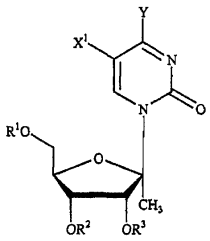
R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제4 주요 예에서, 화학식 IV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(IV)

상기 식에서,

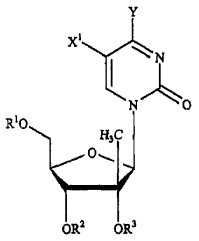
R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제5 주요 예에서, 화학식 V의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(V)

상기 식에서,

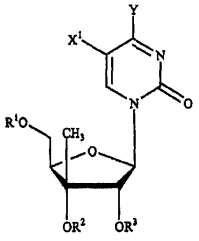
R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제6 주요 예에서, 화학식 VI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(VI)

상기 식에서,

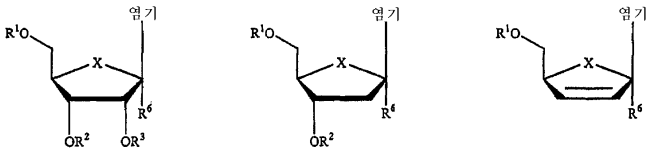
R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

제7 주요 예에서, 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

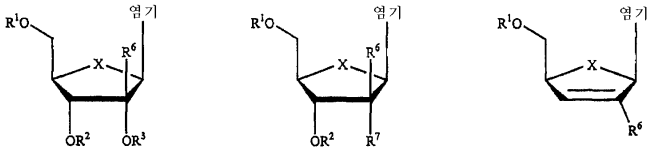
염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

제8 주요 예에서, 화학식 X, XI 및 XII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(X) (XI) (XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

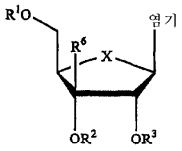
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

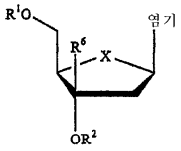
R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

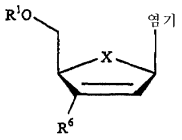
제9 주요 예에서, 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

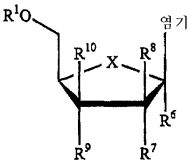
염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

제10 주요 예에서, 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

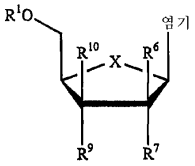
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

제11 주요 예에서, 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

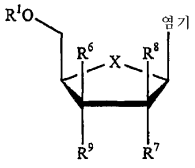
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

제12 주요 예에서, 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키 닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

본 발명의 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드는 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 폴리머라아제 활성을 저해할 수 있다. 이들 뉴클레오사이드는 표준 스크리닝 방법에 따라 시험관내에서 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 폴리머라아제 활성을 저해하는 능력에 대하여 평가될 수 있다.

일례에서 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스 화합물의 효능은 본 명세서에서 특히 상세하게 설명되는 방법에 따라, 시험관내에서 바이러스의 플라크 수를 50%로 감소시키기 위하여 요구되는 화합물의 농도(즉, 화합물의 EC_{50})에 따라 측정된다. 바람직한 일례에서, 화합물은 시험관내에서 15 미만, 바람직하게는 10 마이크로몰라 미만의 EC_{50} 를 나타낸다.

또다른 일례에서, 활성 화합물은 다른 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스 약제와 배합되거나 교대로 투여될 수 있다. 병용 요법에서는 유효량의 2 이상의 제제가 함께 투여되지만, 교대 요법에서는 유효량의 각각의 제제가 연속적으로 투여된다. 투여량은 약물의 흡수, 불활성화, 및 배설 속도 및 당업자에게 공지되 어 있는 다른 인자에 의존한다. 또한 투여량은 경감시키기 위한 상태의 중증도에 따라 달라질 수 있음에 주의하여야 한다. 또한 특정 대상에 대하여, 조성물을 투여하고 이를 감독하는 사람의 전문적 판단 및 개인의 요구에 따라 특정 투여 요법 및 스케줄이 시간에 따라 조정되어야 함을 이해하여야 한다.

HCV는 플라비비리대 훼밀리의 구성원이다; 그러나, 현재, HCV는 새로운 모노타입성 속, 헤파시바이러스로 분류된다. 따라서, 일례에서 플라비바이러스 또는 페스티바이러스는 HCV가 아니다.

본 명세서에 기술된 화합물과 배합하여 사용될 수 있는 항바이러스제의 비제한적인 예는

(1) 인터페론 및/또는 리바비린(Battaglia, A. M. et al., Ann. Pharmacother. 34: 487-494, 2000); Berenguer, M. et al. Antivir. Ther. 3(Suppl. 3): 125-136, 1998);

(2) 알파케토아미드 및 하이드라지노우레아를 포함하는 기질-기초 NS3 프로테아제 저해제(Attwood et al., Antiviral peptide derivatives, PCT WO 98/22496, 1998; Attwood et al., Antiviral Chemistry and Chemotherapy 10. 259-273, 1999; Attwood et al., Preparation and use of amino acid derivatives as anti-viral agents, 독일특허 공개 DE 19914474; Tung et al. Inhibitor of serine proteinases, particularly hepatitis C virus NS3 proteinase, PCT WO 98/17679), 및 보론산 또는 포스페이트와 같은 친전자체로 끝나는 저해제. Llinas-Brunet et al, Hepatitis C inhibitor peptide analogues, PCT WO 99/07734;

(3) 아미드상에서 14개의 탄소 쇄로 치환된 RD3-4082 및 파라-페녹시페닐 그룹을 갖는 RD3-4078을 포함하는, 2,4,6-트리하이드록시-3-니트로-벤즈아미드 유도체(Sudo K. et al., Biochemical and Biophysical Research Communications, 238: 643-647, 1997; Sudo K. et al. Antiviral Chemistry and Chemotherapy 9: 186, 1998)와 같은 비-기질-기초 저해제;

(4) NS3/4A 융합 단백질 및 NS5A/5B 기질을 사용하는 역상 HPLC 분석에서 관련된 저해성을 보이는 티아졸리딘 유도체(Sudo K. et al., Antiviral Research 32: 9-18, 1996), 특히, 긴 알킬 쇄로 치환된 융합된 신나모일 부위를 갖는 화합물 RD-1-6250, RD4 6205 및 RD4 6193;

(5) Kakiuchi N. et al. J. EBS Letters 421: 217-220; Takeshita N. et al. Analytical Biochemistry 247: 242-246, 1997에서 확인된 티아졸리딘 및 벤즈아닐리드;

(6) SDS PAGE 및 오토라디오그래피 분석에서 스트렙토마이세스 종(*Streptomyces sp.*), Sch 68631의 발효 배양액으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Tetrahedron Letters 37: 7229-7232, 1996), 및 섬광 근접 분석에서 진균 페니실리움 그리스코풀럼(*Penicillium griscofuluum*) Sch 351633으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 9: 1949-1952)에 대하여 활성을 갖는 페난-트레네퀴논;

(7) 거머리로부터 분리된, 매크로분자 에글린 c(eglin c)에 기초한 선택적 NS3 저해제(Qasim M. A. et al., Biochemistry 36: 1598-1607, 1997);

(8) 헬리카아제 저해제(Diana G. D. et al., Compounds, compositions and methods for treatment of hepatitis C, 미국특허 제5,633,358호; Diana G. D. et al., Piperidine derivatives, pharmaceutical compositions thereof and their use in the treatment of hepatitis C, PCT WO 97/36554);

(9) 뉴클레오타이드 유사체, 글리오톡신(Ferrari R. et al. Journal of Virology 73: 1649-1654,1999), 및 천연 세루레닌(Lohmann V. et al., Virology 249: 108-118,1998)과 같은 폴리머라아제 저해제;

(10) 바이러스의 5' 비-코딩 영역(NCR)에서 서열 스트레치에 상보적인 안티센스 포스포로티오에이트 올리고데옥시뉴클레오타이드(Alt M. et al., Hepatology 22: 707-717, 1995), 또는 NCR의 3' 말단을 포함하는 뉴클레오타이드 326-348 또는 HCV RNA의 코어 코딩 영역에 위치하는 뉴클레오타이드 371-388(Alt M. et al., Archives of Virology 142: 589-599, 1997; Galderisi U. et al., Journal of Cellular Physiology 181: 251-257, 1999);

(11) IRES-의존 해독 저해제(Ikeda N et al., Agent for the prevention and treatment of hepatitis C, 일본특허 공개 JP-08268890; Kai Y. et al. Prevention and treatment of viral diseases, 일본특허 공개 JP-10101591);

(12) 뉴클레아제-내성 라이보자임(Maccjak D. J. et al., Hepatology 30 초록 995, 1999); 및

(13) 1-아미노-알킬사이클로헥산(미국특허 제6,034,134호, Gold et al.), 알킬 리피드(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 비타민 E 및 다른 항산화제(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 스쿠알렌, 아만타딘, 담즙산(미국특허 제5,846,964호, Ozeki et al), N(포스포노아세틸)-L-아스파트산(미국특허 제5,830,905호, Diana et al.), 벤젠디카복스아미드(미국특허 제5,633,388호, Diana et al.), 폴리아데닐산 유도체(미국특허 제5,496,546호, Wang et al.), 2',3'-디데옥시이노신(U. S. Patent No. 5,026,687 to Yarchoan et al.), 및 벤즈이미다졸(미국특허 제5,891,874호, Colacino et al.)을 포함하는 여러 다른 화합물을 포함한다.

도면의 간단한 설명

도 1은 본 발명의 뉴클레오사이드의 다양한 비제한적 예, 및 본 명세서에서 비교예로 사용된 다른 공지된 뉴클레오사이드, FIAU 및 리바비린의 구조를 제공한다.

도 2는 투여 후 시간에 걸친 사이노몰거스 원숭이에게 투여한 β-D-2'-CH_3-리보G의 약물동력학(혈장 농도)의 선 그래프이다.

도 3a 및 3b는 투여 후 시간에 걸친 사이노몰거스 원숭이에게 정맥내(3a) 또는 경구(3b) 투여한 β-D-2'-CH_3-리보G의 약물동력학(혈장 농도)의 선 그래프이다.

도 4는 BVDV에 대한 β-D-2'-CH_3-리보G의 세포 보호 분석 결과의 선 그래프이다.

도 5는 BVDV에 대한 리바비린의 세포 보호 분석 결과의 선 그래프이다.

도 6은 β-D-2'-CH_3-리보G, β-D-2'-CH_3-리보C, β-D-2'-CH_3-리보U, β-D-2'-CH_3-리보A 및 리바비린의 세포 보호 분석의 선 그래프이다.

도 7은 β-D-2'-CH_3-리보U, β-D-2'-CH_3-리보C 및 β-D-2'-CH_3-리보G의 플라크 감소 분석 결과의 선 그래프이다.

도 8은 β-D-2'-CH_3-리보U의 농도 증가에 따른 플라크 감소를 나타낸다.

도 9는 9 μM에서 4 로그 감소를 나타내는, β-D-2'-CH_3-리보G의 수율 감소 분석 결과의 선 그래프이다.

도 10은 β-D-2'-CH_3-리보C의 농도 증가에 따른 수율 감소를 나타낸다.

발명의 상세한 설명

본 명세서에서 기술하는 본 발명은 임의로 약제학적으로 허용되는 담체중 본 명세서에서 기술된 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 유효한 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료량으로 투여하는 것을 포함하는 인간 또는 다른 숙주 동물에서 페스티바이러스 및 플라비바이러스를 치료하기 위한 화합물, 방법 및 조성물이다. 본 발명의 화합물은 항바이러스(즉, 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스) 활성을 갖거나, 상기 활성을 나타내는 화합물로 대사된다.

요약하면, 본 발명은 하기의 특성을 포함한다:

(a) 본 명세서에서 기술된 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭;

(b) 특히 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염을 갖거나 플라비바이러스 또는 페스티바이러스에 의해 감염될 위기에 있는 것으로 진단받은 개인에서 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방에 사용하기 위한, 본 명세서에서 기술된 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭;

(c) 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염 치료를 위한 약제의 제조에서 본 명세서에서 기술된 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭의 용도;

(d) 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 포함하는 약제학적 제제;

(e) 기술된 뉴클레오사이드의 에난티오머가 실질적으로 없거나, 실질적으로 다른 화학물질로부터 분리된 본 명세서에서 기술된 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭;

(f) 하기 상세히 기술되는 바와 같은 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드의 제조방법; 및

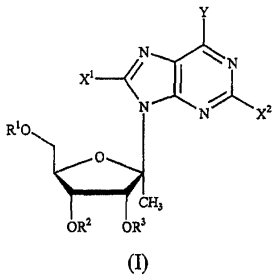
(g) 기술된 뉴클레오사이드의 에난티오머가 실질적으로 없거나, 실질적으로 다른 화학물질로부터 분리된 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드의 제조방법.

본 발명의 범위에 포함되는 플라비바이러스는 Fields Virology, Editors: Fields, B.N., Knipe, D.M., and Howley, P.M., Lippincott-Raven Publishers, Philadelphia, PA, Chapter 31, 1996에 일반적으로 논의되어 있다. 특정 플라비바이러스는 아브세타로브, 알푸이, 아포이, 아로아, 바가자, 반지, 보우보우이, 부수쿠아라, 카시파코어, 카레이 아일랜드, 타카르 뱃, 뎅그 1, 뎅그 2, 뎅그 3, 뎅그 4, 에지 힐, 엔테베 뱃, 가젯 걸리, 한잘로바, 하이프르, 일헤우스, 이스라엘 터키 메닌고엔세팔리티스, 일본 뇌염, 주그라, 주티아파, 카담, 카르쉬, 케도우고우, 코코베라, 코우탄고, 쿰린지, 쿤진, 카이아사누르 포레스트 질환, 란가트, 루핑 병, 메아반, 모독, 몬타나 마이오티스 류코엔세팔리티스, 머레이 밸리 엔세팔리티스, 나란잘, 네기쉬, 느타야, 옴스크 출혈열, 페놈-펜 뱃, 포와산, 리오 브라보, 로시오, 로얄 팜, 러시안 스프링-서머 엔세팔리티스, 사보야, 세인트 루이스 엔세팔리티스, 살 비에자, 산 펄리타, 사우마레즈 리프, 세피크, 소쿠룩, 스폰드웨니, 스트라트포드, 템부수, 타이우레니이, 우간다 S, 우수투, 웨셀스브론, 웨스트 닐, 야오운데, 황색 열 및 지카를 포함하지만, 이들로 제한되는 것은 아니다.

본 발명의 범위에 포함되는 페스티바이러스는 Fields Virology, Editors: Fields, B.N., Knipe, D.M., and Howley, P.M., Lippincott-Raven Publishers, Philadelphia, PA, Chapter 33, 1996에 일반적으로 논의되어 있다. 특정 페스티바이러스는 소 바이러스성 설사 바이러스('BVDV'), 전형적 돼지 열 바이러스('CSFV', 호그 콜레라 바이러스로도 불림) 및 가장자리 질환 바이러스('BDV')를 포함하지만, 이들로 제한되는 것은 아니다.

Ⅰ. 활성 화합물, 및 그의 생리학적으로 허용되는 염 및 프로드럭

제1 주요 예에서, 화학식 Ⅰ의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

바람직한 하위예에서,

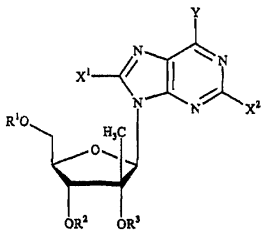
R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

X^1 는 H이며;

X^2 는 H 또는 NH_2 이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 I 의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다.

제2 주요 예에서, 화학식 II 의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(II)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

바람직한 하위예에서,

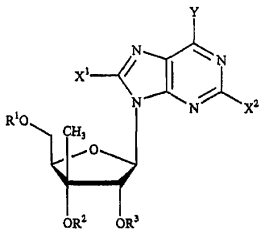
R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

X^1 는 H이며;

X^2 는 H 또는 NH_2 이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 II의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다.

제3 주요 예에서, 화학식 III의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(III)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

바람직한 하위예에서,

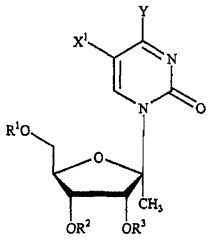
R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

X^1 는 H이며;

X^2 는 H 또는 NH_2 이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 III의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다.

제4 주요 예에서, 화학식 IV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(IV)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

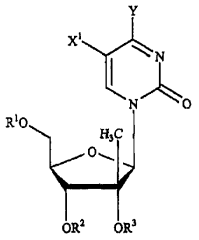
바람직한 하위예에서,

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

X^1 는 H 또는 CH_3 이며;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 IV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다.

제5 주요 예에서, 화학식 V의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(V)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알 킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

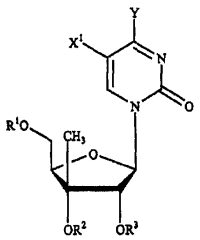
바람직한 하위예에서,

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

X^1 는 H 또는 CH_3 이며;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 V의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다.

제6 주요 예에서, 화학식 VI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

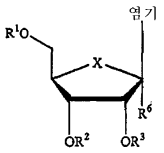
바람직한 하위예에서,

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트(바람직하게 H)이고;

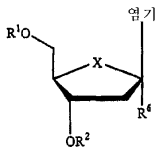
X^1 는 H 또는 CH_3 이며;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, NH_2 또는 OH인 화학식 VI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭이 제공된다:

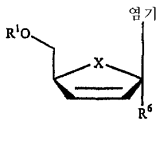
제7 주요 예에서, 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(VII)



(VIII)



(IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

바람직한 제1 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 수소이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서,

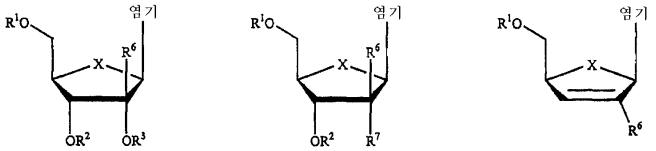
염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O인 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

제8 주요 예에서, 화학식 X, X I 및 X II의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(X) (XI) (XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

바람직한 제1 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 X, X I 및 X II의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 수소이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 X, X I 및 X II의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서,

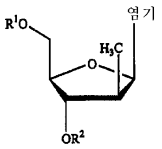
염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6는 알킬이고;

X는 O인 화학식 X, XI 및 XII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

더욱 바람직한 하위예에서, 화학식 XI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



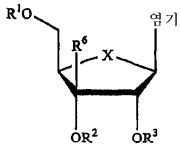
(XI)

상기 식에서,

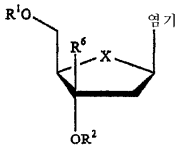
염기는 임의로 아민 또는 사이클로프로필로 치환된 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기(예: 2-아미노, 2,6-디아미노 또는 사이클로프로필 구아노신)이고;

R^1 및 R^2는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이다.

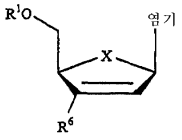
제9 주요 예에서, 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2이다.

바람직한 제1 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 수소이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서,

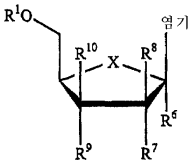
염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며;

R^6 는 알킬이고;

X는 O인 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

제10 주요 예에서, 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요 오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

바람직한 제1 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2, 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택 되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이고; 5) R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2, 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10} 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제4 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의 에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2, 알킬, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제5 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함 하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^1 이며; 5) R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제6 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10}은 H이 고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제7 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10}은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제8 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미 딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2이고; 5) R^8 및 R^{10}은 수소이며; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제9 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의 에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2이고; 5) R^8 및 R^{10}은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제10 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 및 R^{10}은 수소이고; 6) X는 O인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제11 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1는 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 4) R^7 및 R^9는

독립적으로 OR^{2} 이며; 5) R^{8} 및 R^{10} 은 수소이고; 6) X는 O, S, SO_{2}, 또는 CH_{2} 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제12 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미 딘 염기이고; 2) R^{1} 는 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^{6} 는 알킬이고; 4) R^{7} 및 R^{9} 는 독립적으로 OR^{2} 이며; 5) R^{8} 및 R^{10} 은 수소이고; 6) X는 O, S, SO_{2}, 또는 CH인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제13 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^{1} 는 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^{6} 는 알킬이고; 4) R^{7} 및 R^{9} 는 독립적으로 OR^{2} 이며; 5) R^{8} 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제14 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^{1} 는 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^{6} 는 알킬이고; 4) R^{7} 및 R^{9} 는 독립적으로 OR^{2}, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_{2}, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^{8} 및 R^{10} 은 수소이고; 6) X는 O인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

더욱 바람직한 하위예에서,

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소;(3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=구아닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=시토신; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=티민; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=0;

(1) 염기=우라실; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =포스페이트; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =에틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =프로필; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O ;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =부틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

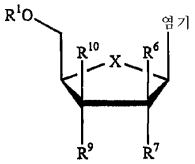
(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} =수소 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=S;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=S0 $_{2}$;

(1) 염기=아데닌; (2) R^{1} =수소; (3) R^{6} =메틸; (4) R^{7} 및 R^{9} =하이드록실; (5) R^{8} 및 R^{10} =수소; 및 (6) X=CH_{2} 인 화학식 XVI의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:

제11 주요 예에서, 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 pi 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

바람직한 제1 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^{10} 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이고; 5) R^{10} 은 H, 알킬(저급알킬 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환

체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^{10}은 H, 알킬(저급알킬 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제4 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2이며; 5) R^{10}은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제5 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2이며; 5) R^{10}은 H, 알킬(저급알킬 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다:

바람직한 제6 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^{10}은 H이고; 6) X는 O인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제7 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 OR^2이며; 5) R^{10}은 H이고; 6) X는 O인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제8 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^{10}은 H, 알킬(저급알킬 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제9 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미 딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^{10} 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제10 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^{10} 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

더욱 바람직한 하위예에서,

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=구아닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=시토신; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=티민; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=0;

(1) 염기=우라실; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =포스페이트; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =에틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =프로필; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

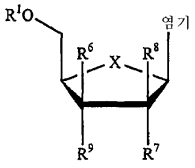
(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =부틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=S;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=SO_2;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^{10} =수소; 및 (6) X=CH_2 인 화학식 XVII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

제12 주요 예에서, 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭을 제공한다:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 pi 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

바람직한 제1 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미 딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제2 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의 에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제3 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제4 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으 로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제5 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제6 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고; 6) X는 O인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제7 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또 는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제8 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6 는 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 하이드록시, O-알킬, O-알케닐, 클로로, 브로모, 요오도, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노 또는 디(저급알킬)아미노이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제9 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

바람직한 제10 하위예에서, 1) 염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고; 2) R^1 은 독립적으로 H 또는 포스페이트이며; 3) R^6 는 알킬이고; 4) R^7 및 R^9 는 독립적으로 OR^2 이며; 5) R^8 은 H이고; 6) X는 O인 화학식 XVIII의 화합물, 또 는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

더욱 바람직한 하위예에서,

(1) 염기=아데닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^8 =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=구아닌; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^8 =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=시토신; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^8 =수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=티민; (2) R^1 =수소; (3) R^6 =메틸; (4) R^7 및 R^9 =하이드록실; (5) R^8 =수소; 및 (6) X=0;

(1) 염기=우라실; (2) R^1=수소; (3) R^6=메틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=포스페이트; (3) R^6=메틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=에틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=프로필; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=부틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=O;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=메틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) X=S;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=메틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) $X=SO_2$;

(1) 염기=아데닌; (2) R^1=수소; (3) R^6=메틸; (4) R^7 및 R^9=하이드록실; (5) R^8=수소; 및 (6) $X=CH_2$ 인 화학식 XVIII의 화합물, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭으로부터 선택되는 화합물을 제공한다.

본 발명의 β-D- 또는 β-L-뉴클레오사이드는 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 폴리머라아제 활성을 저해할 수 있는 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러 스 약제 클래스에 속한다. 뉴클레오사이드는 본 명세서에서 특히 상세하게 설명되는 스크리닝 방법에 따라 시험관내에서 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 폴리머라아제 활성을 저해하는 능력에 대하여 스크리닝될 수 있다. 본 명세서에서 기술되는 분석 또는 다른 확인 분석과 함께 화합물을 평가하여 활성 스펙트럼을 용이하게 결정할 수 있다.

일례에서 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스 화합물의 효능은 본 명세서에서 특히 상세하게 설명되는 방법에 따라, 시험관내에서 바이러스의 플라크 수를 50%로 감소시키기 위하여 요구되는 화합물의 농도(즉, 화합물의 EC_{50})에 따라 측정한다. 바람직한 일례에서 화합물은 15 또는 10 마이크로몰라 미만의 EC_{50} 를 나타낸다.

HCV는 플라비비리대 훼밀리의 구성원이다; 그러나, 현재, HCV는 새로운 모노타입 속, 헤파시바이러스로 분류된다. 따라서, 일례에서, 플라비바이러스 또는 페스티바이러스는 HCV가 아니다.

활성 화합물을 수혜자에게 투여할 때 본 발명의 화합물을 직접 또는 간접적으로 제공할 수 있거나, 그 자체로서 활성을 나타내는 염 또는 프로드럭으로서 투여할 수 있다. 비제한적인 예는 약제학적으로 허용되는 염(다르게는 '생리학적으로 허용되는 염'으로 언급함) 및 5'-위치 또는 퓨린 또는 피리미딘 염기상에서 알킬화되거나 아실화된 화합물('약제학적으로 허용되는 프로드럭' 형태)이다. 모 화합물에 대한 활성을 증가시키는 일부 경우에, 변형을 통해 모 화합물의 생물학적 활성은 영향을 받을 수 있다. 본 명세서에 기술된 방법, 또는 당업자에게 공지되어 있는 다른 방법에 따라 염 또는 프로드럭을 제조하고 그의 항바이러스 활성을 시험하여 용이하게 평가할 수 있다.

Ⅱ. 정의

본 명세서에서 사용되는, 용어 '알킬'은, 다르게 특정되지 않는 한, 포화된 직쇄, 분지쇄, 또는 사이클릭 일차, 이차, 또는 삼차 탄화수소를 말하고, 전형적으로 C_1 내지 C_{10} 이고, 특히 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, *t*-부틸, 펜틸, 사이클로펜틸, 이소펜틸, 네오펜틸, 헥실, 이소헥실, 사이클로헥실, 사이클로헥실메틸, 3-메틸펜틸, 2,2-디메틸부틸, 및 2,3-디메틸부틸을 포함한다. 용어는 치환 및 비치환된 알킬 그룹 모두를 포함한다. 알킬 그룹은 임의로 본 명세서에서 참고문헌으로 인용되는 Greene, *et al.* , 'Protective Groups in Organic Synthesis' John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지인 바와 같이, 보호되지 않거나 필요한 경우 보호되는, 하이드록실, 아미노, 알킬아미노, 아릴아미노, 알콕시, 아릴옥시, 니트로, 시아노, 설폰산, 설페이트, 포스폰산, 포스페이트, 또는 포스포네이트로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 부위로 치환될 수 있다.

본 명세서에서 사용되는, 용어 '저급 알킬'은, 다르게 특정되지 않는 한, 치환 및 비치환된 형태 모두를 포함하는, C_1 내지 C_4 의 포화된 직쇄 또는 분지, 또는 적절한 경우, 사이클릭(예를 들면, 사이클릭프로필) 알킬 그룹을 말한다. 본 명세 서에서 특별히 언급되지 않는 한 알킬이 적절한 부위인 경우 저급 알킬이 바람직하다. 유사하게, 알킬 또는 저급 알킬이 적절한 부위인 경우 비치환된 알킬 또는 저급 알킬이 바람직하다.

용어 알킬아미노 또는 아릴아미노는 각각 하나 또는 두 개의 알킬 또는 아릴 치환체를 갖는 아미노 그룹을 언급한다.

본 명세서에서 사용되는, 용어 '보호'는, 다르게 특정되지 않는 한, 추가의 반응을 방지하거나 다른 목적을 위해 산소, 질소, 또는 인 원자가 첨가된 그룹을 의미한다. 다양한 산소 및 질소 보호 그룹이 유기물 합성 분야의 당업자에게 공지되어 있다.

본 명세서에서 사용되는, 용어 '아릴'은, 다르게 특정되지 않는다면, 페닐, 비페닐 또는 나프틸, 및 바람직하게는 페닐을 말한다. 용어는 치환 및 비치환된 부위 모두를 포함한다. 아릴 그룹은 임의로 예를 들면, Greene, *et al.* , 'Protective Groups in Organic Synthesis' John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지인 바와 같이, 보호되지 않거나 필요한 경우 보호되는, 하이드록실, 아미노, 알킬아미노, 아릴아미노, 알콕시, 아릴옥시, 니트로, 시아노, 설폰산, 설페이트, 포스폰산, 포스페이트 또는 포스포네이트로 구성된 그룹으로부터 선택된 하나 이상의 부위로 치환될 수 있다.

용어 '알크아릴' 또는 '알킬아릴'은 아릴 치환체를 갖는 알킬 그룹을 말한다. 용어 '아르알킬' 또는 '아릴알킬'은 알킬 치환체를 갖는 아릴 그룹을 말한다.

본 명세서에서 사용되는, 용어 '할로'는 클로로, 브로모, 요오도 및 플루오 로를 포함한다.

용어 '퓨린 또는 피리미딘'은 아데닌, N^6-알킬퓨린, N^6-아실퓨린(여기서 아실은 C(O)(알킬, 아릴, 알킬아릴 또는 아릴알킬), N^6-벤질퓨린, N^6-할로퓨린, N^6-비닐퓨린, N^6-아세틸렌 퓨린, N^6-아실 퓨린, N^6-하이드록시알킬 퓨린, N^6-티오알킬 퓨린, N^2-알킬퓨린, N^2-알킬-6-티오퓨린, 티민, 시토신, 5-플루오로시토신, 5-메틸시토신, 6-아자시토신을 포함하는 6-아자피리미딘, 2-및/또는 4-머캅토피리미딘, 우라실, 5-플루오로우라실을 포함하는 5-할로우라실, C^5-알킬피리미딘, C^5-벤질피리미딘, C^5-할로피리미딘, C^5-비닐피리미딘, C^5-아세틸렌 피리미딘, C^5-아실 피리미딘, C^5-하이드록시알킬 퓨린, C^5-아미도피리미딘, C^5-시아노피리미딘, C^5-니트로피리미딘, C^5-아미노피리미딘, N^2-알킬퓨린, N^2-알킬-6-티오퓨린, 5-아자시티디닐, 5-아자우라실릴, 트리아조로피리디닐, 이미다졸로피리디닐, 피롤로피리미디닐, 및 피라졸로피리미디닐을 포함하지만, 여기에 제한되지는 않는다. 퓨린 염기는 구아닌, 아데닌, 하이포크산틴, 2,6-디아미노퓨린 및 6-클로로퓨린을 포함하지만, 여기에 제한되지 않는다. 염기상의 작용성 산소 및 질소 그룹은 필요하거나 원하는 경우 보호될 수 있다. 적절한 보호 그룹은 당업자에게 주지이고, 트리메틸실릴, 디메틸헥실실릴, t-부틸디메틸실릴 및 t-부틸디페닐실릴, 트리틸, 알킬 그룹, 아세틸 및 프로피오닐과 같은 아실 그룹, 메탄설포닐, 및 p-톨루엔설포닐을 포함한다. 다르게는, 퓨린 또는 피리미딘 염기는 생체내에서 절단될 수 있는 활성 프로드럭을 형성하도록 임의로 치환될 수 있다. 적절한 치환체의 예는 아시 부위, 아민 또는 사이클로프로필(예: 2-아미노, 2,6-디아미노 또는 사이클로프로필 구아노신)을 포함한다.

용어 '아실'은 카복실산 에스테르를 언급하고, 여기에서 에스테르 그룹의 비카보닐 부위는 직쇄, 분지쇄, 또는 사이클릭 알킬 또는 저급 알킬, 메톡시메틸을 포함하는 알콕시알킬, 벤질을 포함하는 아르알킬, 페녹시메틸과 같은 알킬옥시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도로 임의로 치환된 페닐을 포함하는 아릴, C_1 내지 C_4 알킬 또는 C_1 내지 C_4 알콕시, 설포네이트 에스테르, 예를 들어 메탄설포닐을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐, 모노, 디 또는 트리포스페이트 에스테르, 트리틸 또는 모노메톡시트리틸, 치환된 벤질, 트리알킬실릴(예: 디메틸-t-부틸실릴) 또는 디페닐메틸실릴로 구성된 그룹으로부터 선택된다. 에스테르에서 아릴 그룹은 임의로 페닐 그룹을 포함한다. 용어 '저급 아실'은 비카보닐 부위가 저급 알킬인 아실 그룹을 언급한다.

본 명세서에 사용되는, 용어 '실질적으로 없는' 또는 '실질적으로 부재하는'은 적어도 85% 또는 90중량%, 바람직하게 95% 내지 98중량%, 더욱 바람직하게는 99% 내지 100%의 상기 뉴클레오사이드의 지정된 에난티오머를 포함하는 뉴클레오사이드 조성물을 말한다. 바람직한 일례에서, 본 발명의 방법 및 화합물에서 화합물은 에난티오머들이 실질적으로 존재하지 않는다.

유사하게, 용어 '분리된'은 적어도 85% 또는 90중량%, 바람직하게 95% 내지 98중량%, 더욱 바람직하게는 99% 내지 100%의 상기 뉴클레오사이드를 포함하고, 나머지는 다른 화학물질 또는 에난티오머들을 포함하는 뉴클레오사이드 조성물을 언급한다.

본 명세서에서 용어 '독립적으로'는 독립적으로 적용되는 변수는 적용되는 경우마다 독립적으로 다양하게 적용된다는 것을 언급하기 위하여 사용된다. 따라서, R'XYR'과 같은 화합물에서 R'은 '독립적으로 탄소 또는 질소'이고, R' 두 개 모두는 탄소일 수 있고, R' 두 개 모두는 질소일 수 있거나, 하나의 R'은 탄소이고 다른 하나의 R'은 질소일 수 있다.

본 명세서에서 사용되는 용어 숙주는 세포주 및 동물, 바람직하게 인간을 포함하는, 바이러스가 복제할 수 있는 단세포 또는 다세포 유기체를 언급한다. 또한, 숙주는 C형 간염 바이러스 게놈의 일부를 운반할 수 있고 그의 복제 또는 작용은 본 발명의 화합물에 의해 변화될 수 있다. 용어 숙주는 특히 감염된 세포, 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 게놈 전체 또는 일부에 의해 형질감염된 세포 및 동물, 특히 영장류(침팬지 포함) 및 인간을 언급한다. 본 발며의 대부분의 동물 적용에 있어서, 숙주는 인간이다. 그러나, 특별한 지시가 있는 경우 본 발명에 의해 수의학적 적용(예: 침팬지)도 명확하게 기대된다.

본 명세서에서 용어 '약제학적으로 허용되는 염 또는 프로드럭'은 환자에게 투여되는 경우 뉴클레오사이드 화합물을 제공하는 뉴클레오사이드 화합물의 모든 약제학적으로 허용되는 형태(예를 들어, 에스테르, 포스페이트 에스테르, 에스테르 염 또는 관련된 그룹)를 기술하기 위하여 본 명세서에서 사용된다. 약제학적으로 허용되는 염은 약제학적으로

허용되는 무기 또는 유기 염기 및 산으로부터 유래된 것을 포함한다. 적절한 염은 약제학 분야에 공지된 다수의 다른 산중 알칼리 금속, 예를 들어 칼륨 및 나트륨, 알칼리토금속, 예를 들어 칼슘 및 마그네슘으로부터 유래된 것을 포함한다. 약제학적으로 허용되는 프로드럭은 대사, 예를 들면 본 발명의 화합물을 형성하기 위하여 숙주에서 가수분해되거나 산화되는 화합물을 언급한다. 프로드럭의 전형적인 예는 활성 화합물의 작용 부위상에 생물학적으로 변화하기 쉬운 보호 그룹을 갖는 화합물을 포함한다. 프로드럭은 산화, 환원, 아민화, 탈아민화, 하이드록시화, 탈하이드록시화, 가수분해, 탈가수분해, 알킬화, 탈알킬화, 아실화, 탈아실화, 인산화, 탈인산화되어 활성 화합물을 생성할 수 있는 화합물을 포함한다. 본 발명의 화합물은 플라비바이러스 또는 페스티바이러스에 대하여 항바이러스 활성을 갖고, 상기 활성을 나타내는 화합물로 대사된다.

III. 뉴클레오타이드 염 또는 프로드럭 제제

화합물이 안정한 비독성 산 또는 염기 염을 형성하기에 충분하게 염기성 또는 산성인 경우 약제학적으로 허용되는 염으로서 화합물의 투여가 적절할 수 있다. 약제학적으로 허용되는 염의 예는 산으로 형성된 유기산 부가염이며, 이는 생리학적으로 허용가능한 음이온을 형성하고, 예로서 토실레이트, 메탄설포네이트, 아세테이트, 시트레이트, 말로네이트, 타르트레이트, 숙시네이트, 벤조에이트, 아스코르베이트, α-케토글루타레이트, 및 α-글리세로포스페이트이다. 적절한 무기 염 또한 형성될 수 있고, 예로서 설페이트, 니트레이트, 바이카보네이트, 및 카보네이트 염을 포함한다.

약제학적으로 허용되는 염은 본 분야에서 잘 공지되어 있는 표준 방법을 사용하여 수득할 수 있고, 예를 들면, 아민과 같이 충분하게 염기성인 화합물을 적절한 산과 반응시켜 생리학적으로 허용가능한 음이온을 형성할 수 있다. 카복실산의 알칼리 금속(예: 나트륨, 칼륨 또는 리튬) 또는 알칼리토금속(예: 칼슘) 염 또한 제조될 수 있다.

본 명세서에 기술된 모든 뉴클레오사이드는 뉴클레오사이드의 활성, 생체이용률, 안정성을 증가시키거나 다르게는 성질을 변화시키기 위하여 뉴클레오타이드 프로드럭으로서 투여될 수 있다. 다수의 뉴클레오타이드 프로드럭 리간드가 공지되어 있다. 통상, 뉴클레오사이드의 모노, 디 또는 트리포스페이트의 알킬화, 아실화 또는 다른 친지성 변형에 의해 뉴클레오타이드의 안정성이 증가될 것이다. 포스페이트 부위상에서 하나 이상의 수소를 대체할 수 있는 치환체 그룹의 예는 알킬, 아릴, 스테로이드, 당을 포함하는 카보하이드레이트, 1,2-디아실글리세롤 및 알코올이다. 다수가 R. Jones and N. Bischofberger, Antiviral Research, 27(1995) 1-17에 기재되어 있다. 원하는 효과를 얻기 위하여 상기의 것중 어느 것을 기술된 뉴클레오사이드와 배합하여 사용할 수 있다.

본 명세서에서 참고로 인용되는 하기의 참고문헌에 기술된 바와 같은 활성 뉴클레오사이드는 또한 5'-포스포에테르 리피드 또는 5'-에테르 리피드로서 제공될 수 있다: Kucera, L. S., N. Iyer, E. Leake, A. Raben, Modest E. K., D. L. W., and C. Piantadosi, 'Novel membrane-interactive ether lipid analogs that inhibit infectious HIV-1 production and induce defective virus formation', AIDS Res. Hum. Retro viruses, 1990, 6, 491-501; Piantadosi, C., J. Marasco C. J., S. L. Morris-Natschke, K. L. Meyer, F. Gumus, J. R. Surles, K. S. Ishaq, L. S. Kucera, N. Iyer, C. A. Wallen, S. Piantadosi, and E. J. Modest. 'Synthesis and evaluation of novel ether lipid nucleoside conjugates for anti-HIV activity', J. Med. Chem., 1991, 34, 1408-1414; Hosteller, K. Y., D. D. Richman, D. A. Carson, L. M. Stuhmiller, G. M. T. van Wijk, and H. van den Bosch, 'Greatly enhanced inhibition of human immunodeficiency virus type 1 replication in CEM and HT4-6C cells by 3'-deoxythymidine diphosphate dimyristoylglycerol, a lipid prodrug of 3,-deoxythymidine', Antimicrob. Agents Chemother., 1992, 36, 2025-2029; Hosetler, K. Y., L. M. Stuhmiller, H. B. Lenting, H. van den Bosch, and D. D. Richman, 'Synthesis and antiretroviral activity of phospholipid analogs of azidothymidine and other antiviral nucleosides', J. Biol. Chem., 1990, 265, 61127.

뉴클레오사이드, 바람직하게는 뉴클레오사이드의 5'-OH 위치에 공유결합으로 도입될 수 있는 적절한 친지성 치환체 또는 친지성 제제를 기술한 미국특허의 비제한적인 예는 하기를 포함하고, 이들 모두 본 명세서에서 참고로 인용된다: 미국특허 제5,149,794호(1992. 9. 22, Yatvin et al.); 제5,194,654호(1993. 3. 16, Hostetler et al.; 제5,223,263호(1993. 6. 29, Hostetler et al.); 제5,256,641호(1993. 10. 26, Yatvin et aL); 제5,411,947호(1995. 5. 2, Hostetler et al.); 제5,463,092호(1995. 10. 31, Hostetler et al.); 제5,543,389 호(1996. 8. 6, Yatvin et al.); 제5,543,390호(1996. 8. 6, Yatvin et al.); 제5,543,391호(1996. 8. 6, Yatvin et al.); 및 제5,554,728호(1996. 9. 10, Basava et al.). 본 발명의 뉴클레오사이드에 결합할 수 있는 친지성 치환체 또는 친지성 제제를 기술하는 외국 특허출원은 WO 89/02733, WO 90/00555, WO 91/16920, WO 91/18914, WO 93/00910, WO 94/26273, WO 96/15132, EP 0 350 287, EP 93917054.4 및 WO 91/19721를 포함한다.

IV. 병용 및 교대 요법

장기간의 항바이러스제 치료 후 바이러스의 약물-내성 변이체가 출현할 수 있다고 인식되어 왔다. 약물 내성은 가장 전형적으로는 바이러스 복제에 사용되는 효소를 코딩하는 유전자의 돌연변이에 의해 발생한다. 주약에 의해 유발된

것과 상이한 돌연변이를 유도하는 제2, 가능하면 제3의 항바이러스성 화합물과 배합하거나 교대로 화합물을 투여하여 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염에 대한 약물의 효능을 연장, 증진 또는 수복시킬 수 있다. 또한, 약물의 약물동력학, 생체내분포, 또는 다른 파라미터는 상기의 병용 요법 또는 교대 요법에 의해 변형될 수 있다. 일반적으로, 병용 요법이 바이러스에서 다중의 스트레스를 동시에 유도하기 때문에 교대 요법보다 바람직하다.

본 명세서에서 기술된 화합물과 배합하여 사용할 수 있는 항바이러스제의 비제한적인 예는 하기와 같다:

(1) 인터페론 및/또는 리바비린(Battaglia, A. M. et al., Ann. Pharmacother. 34: 487-494, 2000); Berenguer, M. et al. Antivir. Ther. 3(Suppl. 3): 125-136, 1998);

(2) 알파케토아미드 및 하이드라지노우레아를 포함하는 기질-기초 NS3 프로테아제 저해제(Attwood et al., Antiviral peptide derivatives, PCT WO 98/22496, 1998; Attwood et al., Antiviral Chemistry and Chemotherapy 10, 259-273, 1999; Attwood et al., Preparation and use of amino acid derivatives as anti-viral agents, 독일특허 공개 DE 19914474; Tung et al. Inhibitors of serine proteases, particularly hepatitis C virus NS3 protease, PCT WO 98/17679), 및 보론산 또는 포스페이트와 같은 친전자체로 끝나는 저해제(Llinas-Brunet et al, Hepatitis C inhibitor peptide analogues, PCT WO 99/07734);

(3) 아미드상에서 14 개의 탄소 쇄로 치환된 RD3-4082 및 파라-페녹시페닐 그룹을 갖는 RD3-4078을 포함하는 비-기질-기초 저해제, 예를 들어 2,4,6-트리하이드록시-3-니트로-벤즈아미드 유도체(Sudo K. et al., Biochemical and Biophysical Research Communications, 238: 643-647, 1997; Sudo K. et al. Antiviral Chemistry and Chemotherapy 9: 186, 1998);

(4) NS3/4A 융합 단백질 및 NS5A/5B 기질을 사용하는 역상 HPLC 분석에서 관련된 저해성을 보이는 티아졸리딘 유도체(Sudo K. et al., Antiviral Research 32: 9-18, 1996), 특히, 긴 알킬 쇄로 치환된 융합된 신나모일 부위를 갖는 화합물 RD-1-6250, RD4 6205 및 RD4 6193;

(5) Kakiuchi N. et al. J. EBS Letters 421: 217-220; Takeshita N. et al. Analytical Biochemistry 247; 242-246,1997에서 확인된 티아졸리딘 및 벤즈아닐리 드;

(6) SDS PAGE 및 오토라디오그래피 분석에서 스트렙토마이세스 종(*Streptomyces sp.*), Sch 68631의 발효 배양액으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Tetrahedron Letters 37: 7229-7232, 1996), 및 섬광 근접 분석에서 진균 페니실륨 그리스코풀럼(*Penicillium griscofuluum*) Sch 351633으로부터 분리된 프로테아제(Chu M. et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 9: 1949-1952)에 대하여 활성을 갖는 페난-트레네퀴논;

(7) 거머리로부터 분리된, 매크로분자 에글린 c(eglin c)에 기초한 선택적인 저해제(Qasim M. A. et al., Biochemistry 36; 1598-1607, 1997);

(8) 헬리카아제 저해제(Diana G. D. et al., Compounds, compositions and methods for treatment of hepatitis C, 미국특허 제5,633,358gh; Diana G. D. et al., Piperidine derivatives, pharmaceutical compositions thereof and their use in the treatment of hepatitis C, PCT WO 97/36554);

(9) 폴리머라아제 저해제, 예를 들어 뉴클레오타이드 유사체, 글리오톡신(Ferrari R. et al. Journal of Virology 73: 1649-1654, 1999) 및 천연 세루레닌(Lohmann V. et al., Virology 249: 108-118, 1998);

(10) 바이러스의 5' 비-코딩 영역(NCR)에서 서열 스트레치에 상보적인 안티센스 포스포로티오에이트 올리고데옥시뉴클레오타이드(Alt M. et al., Hepatology 22: 707-717, 1995) 또는 NCR의 3' 말단을 포함하는 뉴클레오타이드 326-348 또는 HCV RNA의 코어 코딩 영역에 위치하는 뉴클레오타이드 371-388(Alt M. et al., Archives of Virology 142: 589-599, 1997; Galderisi U. et al., Journal of Cellular Physiology 181: 251-257, 1999);

(11) IRES-의존 해독 저해제(Ikeda N et al., Agent for the prevention and treatment of hepatitis C, 일본특허 공개 JP-08268890; Kai Y. et al. Prevention and treatment of viral diseases, 일본특허공개 JP-10101591);

(12) 뉴클레아제-내성 라이보자임(Maccjak D. J. et al., Hepatology 30 초록 995, 1999); 및

(13) 1-아미노-알킬사이클로헥산(미국특허 제6,034,134호, Gold et al.), 알킬 리피드(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 비타민 E 및 다른 항산화제(미국특허 제5,922,757호, Chojkier et al.), 스쿠알렌, 아만타딘, 담즙산(미국특허 제5,846,964호, Ozeki et al), N(포스포노아세틸)-L-아스파트산(미국특허 제5,830,905호, Diana et al.), 벤젠디카복스아미드(미국특허 제5,633,388호, Diana et al.), 폴리아데닐산 유도체(미국특허 제5,496,546호, Wang et

al.), 2',3'-디데옥시이노신(미국특허 제5,026,687호, Yarchoan et al.), 및 벤즈이미다졸(미국특허 제5,891,874호, Colacino et al.)을 포함하는 여러 다른 화합물.

Ⅴ. 약제학적 조성물

플라비바이러스 또는 페스티바이러스, 또는 그의 게놈 단편으로 감염된 인간을 포함하는 숙주는 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제의 존재하에 유효량의 활성 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 프로드럭 또는 염을 환자에게 투여 하여 치료될 수 있다. 활성 물질은 액체 또는 고체 형태로 적절한 경로, 예를 들면, 경구, 비경구, 정맥내, 경피, 피하 또는 국소로 투여될 수 있다.

플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염용 화합물의 바람직한 투여량은 1일당 수혜자의 체중에 대해 약 1 내지 50 ㎎/㎏, 바람직하게는 1 내지 20 ㎎/㎏, 더 일반적으로는 1 일당 수혜자 체중 1 ㎏당 0.1 내지 약 100 ㎎의 범위이다. 약제학적으로 허용되는 염 및 프로드럭의 유효한 투여량 범위는 투여하는 모 뉴클레오사이드의 중량을 기초로 하여 계산될 수 있다. 염 또는 프로드럭 그 자체로 활성을 나타내는 경우, 유효 투여량은 염 또는 프로드럭의 중량을 이용하여 상기한 바와 같이 추정되거나 당업자에게 공지된 다른 수단에 의해 추정된다.

본 화합물은 제한하는 것은 아니지만 단위 복용 형태당 7 내지 3000 ㎎, 바람직하게는 70 내지 1400 ㎎의 활성 성분을 포함하는 것을 포함하여 적절한 투여 단위 형태로 편리하게 투여된다. 50-1000 ㎎의 경구 투여량이 보통 편리하다.

이상적으로, 유효 성분은 약 0.2 내지 70 μM, 바람직하게는 약 1.0 내지 10 μM의 활성 성분의 피크 혈장 농도가 이루어지도록 투여되어야 한다. 이것은, 예를 들면 임의로 활성 성분의 0.1 내지 5% 식염수 용액을 정맥내 주사하여 이루어지거나 활성 성분의 볼루스로서 투여된다.

의약 조성물 내의 활성 성분의 농도는 약물의 흡수도, 불활성화 및 배설 속도 및 당업자에게 공지된 다른 인자에 따라 달라질 것이다. 또한 투여량은 경감시키기 위한 상태의 중증도에 따라 달라질 수 있음에 주의하여야 한다. 특정 대상자의 경우는 조성물을 투여하고 이를 감독하는 사람의 판단 및 개인의 요구에 따라 특정 투여 요법 및 스케줄이 시간에 따라 조정되어야 함을 이해하여야 하고, 본 명세서에서 기술된 농도 범위는 단지 일례이며 청구하는 조성물의 범위 또는 실시예를 제한하고자 하는 것은 아님을 이해하여야 한다. 활성 성분은 한 번에 투여되거나, 다양한 시간 간격으로 투여되는 다수의 더 작은 용량으로 나누어질 수 있다.

활성 화합물 투여의 바람직한 형태는 경구이다. 경구용 조성물은 통상 불활성 희석제 또는 식용 담체를 포함한다. 이들은 젤라틴 캡슐에 싸여 있거나 정제로 압착된다. 치료적 경구 투여 목적을 위해, 활성 화합물은 부형제와 혼입할 수 있고 정제, 트로키 또는 캡슐의 형태로 사용될 수 있다. 약제학적으로 적절한 결합제 및/또는 애쥬번트 물질이 본 조성물의 일부로서 포함될 수 있다.

정제, 환제, 캡슐제, 트로키 등은 하기 성분중 어느 것, 또는 유사한 성질의 화합물을 포함할 수 있다: 미세결정 셀룰로즈, 검 트라가칸트 또는 젤라틴과 같은 결합제; 전분 또는 락토스와 같은 부형제, 알긴산, 프리모겔(Primogel), 또는 옥수수 전분과 같은 붕해제; 마그네슘 스테아레이트 또는 스테로테스(Sterotes)와 같은 활택제; 콜로이드성 실리콘 옥사이드와 같은 윤활제; 수크로스 또는 사카린과 같은 감미제; 또는 페파민트, 메틸 살리실레이트, 또는 오렌지 향료와 같은 향료. 투여 단위 형태가 캡슐인 경우, 상기 유형의 물질외에, 지방성 오일과 같은 액상 담체를 포함할 수 있다. 또한, 투여 단위 형태는 투여 단위의 물리적 형태를 변화시키는 다양한 다른 물질, 예를 들면, 당 코팅, 셀락, 또는 다른 장용제를 함유할 수 있다.

본 화합물이 엘릭시르, 현탁제, 시럽, 웨이퍼, 츄잉검 등의 성분으로서 투여 될 수 있다. 시럽은 활성 성분에 부가적으로 감미제로서 수크로스 및 특정 보존제, 염료 및 착색제 및 향료를 포함할 수 있다.

본 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 프로드럭 또는 염은 또한 다른 뉴클레오사이드 화합물을 포함하여 소기의 작용에 손상을 주지 않는 다른 활성 물질, 또는 소기의 작용을 보충하는 물질, 예를 들면, 항생제, 항균제, 항염증제 또는 다른 항바이러스제와 혼합될 수 있다. 비경구, 경피, 피하 또는 국소 투여용으로 사용되는 액제 또는 현탁제는 하기의 성분을 포함할 수 있다: 주사용 물, 식염수 용액, 비휘발성 오일, 폴리에틸렌 글리콜, 글리세린, 프로필렌 글리콜 또는 다른 합성 용매과 같은 무균 희석제; 벤질 알콜 또는 메틸 파라벤과 같은 항박테리아제; 아스코르브산 또는 소듐 바이설파이트와 같은 항산화제; 에틸렌디아민테트라아세트산과 같은 킬레이트제; 아세테이트, 시트레이트 또는 포스페이트와 같은 완충액 및 염화나트륨 또는 덱스트로스와 같은 장력 조절용 시약. 비경구용 제제는 유리 또는 플라스틱으로 제조된 앰플, 일회용 주사기 또는 다용량 바이알내에 포함될 수 있다.

정맥내 투여되는 경우, 바람직한 담체는 생리학적 식염수 또는 포스페이트 완충된 식염수(PBS)이다.

바람직한 예에서, 활성 화합물은 임플란트 및 마이크로캡슐화된 전달계를 포함하는 방출 조절형 제제와 같이 본 화합물이 인체로부터 급속히 제거되는 것으로부터 보호하는 담체와 함께 제조될 수 있다. 에틸렌 비닐 아세테이트, 폴리안하이드라이드, 폴리글리콜산, 콜라겐, 폴리오르토에스테르 및 폴리아세트산과 같은 생 분해성, 생체적합성 중합체가 사용될 수 있다. 그러한 제제의 제조방법은 당업자에게 명백하다. 이러한 물질은 알자사(Alza Corporation)로부터 상업적으로 얻을 수도 있다.

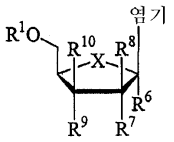
리포좀 현탁액(바이러스성 항원에 대한 모노클론 항체로 감염된 세포를 표적으로 하는 리포좀을 포함하는)이 약제학적으로 허용되는 담체로서 또한 바람직하다. 이들은 당업자에게 공지된 방법, 예를 들면 미국특허 제4,522,811호(전체가 본 명세서에 참고로서 인용됨)에 기술된 방법에 따라 제조될 수 있다. 예를 들면, 리포좀 제제는 적절한 액체(예를 들면 스테로일포스파티딜 에탄올아민, 스테로일 포스파티딜 콜린, 아라키도일 포스파티딜 콜린 및 콜레스테롤과 같은)를 이후에 증발되어 용기의 표면에 건조된 지방의 박막을 남기는 무기 용매내에 용해시켜 제조될 수 있다. 활성 화합물 또는 그 모노포스페이트, 디포스페이트, 및/또는 트리포스페이트 유도체의 수용액은 이후 용기에 도입된다. 용기는 이후 손으로 저어 지방 물질이 용기 측면으로부터 유리되어 지방 응집물로서 분산되고, 이에 의해 리포좀 현탁액을 형성하도록 한다.

VI. 활성 화합물의 제조방법

본 발명의 뉴클레오사이드는 본 분야에 공지된 방법에 따라 합성될 수 있다. 특히, 본 뉴클레오사이드의 합성은 적절하게 변형된 당을 알킬화한 후 글리코실화하거나 뉴클레오사이드를 글리코실화한 후 알킬화하여 수행할 수 있다. 하기의 비제한적인 예가 본 발명의 뉴클레오사이드을 수득하기 위한 일반적인 방법의 일부를 설명한다.

A. 일반적인 1'-C-분지형 뉴클레오사이드의 합성

하기 구조의 1'-C-분지형 뉴클레오사이드를 하기 일반적인 방법중 어느 하나에 의해 제조할 수 있다:



상기 식에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬 포함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬 포함), 염소, 브롬 또는 요오드이거나;

R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 은 알킬, 할로게노알킬(즉, CF_3), 알케닐 또는 알키닐(즉, 알릴)이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

1) 락톤으로부터의 변형

본 공정을 위해 중요한 출발물질은 적절하게 치환된 락톤이다. 락톤은 구입하거나 표준 에피머화, 치환 및 폐환화 기술을 포함하는 공지된 방법에 따라 제조할 수 있다. Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 락톤을 적절한 보호 그룹, 바람직하게 아실 또는 실릴 그룹으로 임의로 보호할 수 있다. 이어서 보호된 락톤을 적절한 온도에서 적절

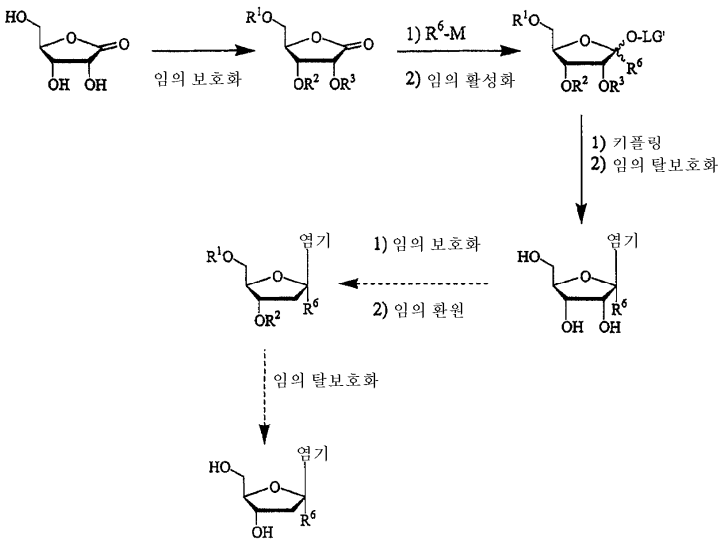
한 비-양성자성 용매중 적절한 커플링제, 예를 들면 유기금속성 탄소 친핵체(organometallic carbon nucleophile), 예를 들어 그리냐르 시약, 유기 리튬, 리튬 디알킬코퍼 또는 TBAF중 R^6-$SiMe_3$과 커플링하여 1'-알킬화된 당을 수득할 수 있다.

그 후 Townsend Chemistry of nucleosides and nucleotides, Plenum Press, 1994에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 임의로 활성화된 당을 염기와 커플링할 수 있다. 예를 들면, 적절한 온도에서 적절한 용매중 루이스산, 예를 들어 틴 테트라클로라이드, 티타늄 테트라클로라이드 또는 트리메틸실릴트리플레이트를 이용하여 아실화된 당을 실릴화된 염기에 커플링할 수 있다.

이어서 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 뉴클레오사이드를 탈보호할 수 있다.

특별한 예에서, 1'-C-분지형 뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 반응식 1에 나타내었다. 또한, 데옥시리보-뉴클레오사이드가 바람직하다. 이 뉴클레오사이드를 얻기 위하여, 형성된 리보뉴클레오사이드를 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 임의로 보호한 후, 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드록실을 활성화시켜 환원, 즉 Barton 환원을 촉진할 수 있다.

반응식 1



2) 1'-C-분지형 뉴클레오사이드의 다른 제조방법

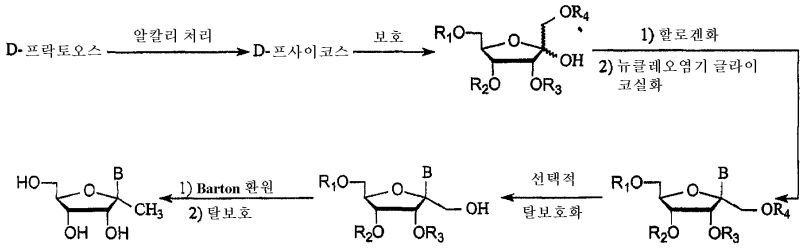
본 공정을 위해 중요한 출발 물질은 적절하게 치환된 헥소스이다. 헥소스를 구입하거나 표준 에피머화, 치환 및 폐환화 기술을 포함하는 공지된 방법에 따라 제조할 수 있다. Townsend Chemistry of nucleosides and nucleotides, Plenum Press, 1994에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 헥소스를 선택적으로 보호하여 적절한 헥사-퓨라노스를 수득할 수 있다.

1'-하이드록실은 각각 아실화 또는 할로겐화를 통해 아실 그룹 또는 할로겐과 같은 적절한 이탈 그룹으로 임의로 활성화할 수 있다. 그 후 임의로 활성화된 당을 Townsend Chemistry of nucleosides and nucleotides, Plenum Press, 1994에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 염기와 커플링할 수 있다. 예를 들면, 적절한 온도에서 적절한 용매중 루이스산, 예를 들어 틴 테트라클 로라이드, 티타늄 테트라클로라이드 또는 트리메틸실릴트리플레이트를 이용하여 실릴화된 염기를 아실화된 당과 커플링할 수 있다.

보호된 경우, 1'-CH_2-OH는 본 분야의 공지된 방법에 의해 선택적으로 탈보호할 수 있다. 생성된 1차 하이드록실을 작용화하여 다양한 C-분지형 뉴클레오사이드를 수득할 수 있다. 예를 들면, 적절한 환원제를 사용하여 1차 하이드록실을 환원시켜 메틸을 수득할 수 있다. 또한, 환원에 앞서 반응을 촉진시키기 위하여 Barton 환원에 의해 하이드록실을 활성화시킬 수 있다. 다른 예에서, 1차 하이드록실을 알데히드로 산화시킨 후 적절한 온도에서 적절한 비-양성자성 용매와 함께 탄소 친핵체, 예로서 그리냐르 시약, 유기 리튬, 리튬 디알킬코퍼 또는 TBAF중 R^6-$SiMe_3$과 커플링할 수 있다.

특별한 예에서, 1'-C-분지형 리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 반응식 2에 나타내었다. 또한, 데옥시리보-뉴클레오사이드가 바람직하다. 이들 뉴클레오사이드를 수득하기 위하여, Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 의해 형성된 리보뉴클레오사이드를 임의로 탈보호할 수 있고, 이어서 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드록실을 활성화하여 환원을 촉진할 수 있다; 즉, Barton 환원에 의해.

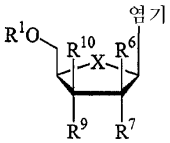
반응식 2



또한, 출발 물질로서 상응하는 L-당 또는 뉴클레오사이드 L-에난티오머로 시작하여 본 발명의 화합물에 상응하는 L-에난티오머를 동일한 일반적인 방법(1 또는 2)에 따라 제조할 수 있다.

B. 일반적인 2'-C-분지형 뉴클레오사이드의 합성

하기 구조의 2'-C-분지형 리보뉴클레오사이드를 하기 방법중 하나에 따라 제조할 수 있다:



상기 식에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬 포함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬 포함), 염소, 브롬 또는 요오드이거나;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 pi 결합을 형성할 수 있고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 은 알킬, 할로게노-알킬(즉, CF_3), 알케닐 또는 알키닐(즉, 알릴)이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

1. 적절하게 변형된 당을 이용한 뉴클레오염기의 글리코실화

이 공정을 위한 중요한 출발물질은 적절한 이탈 그룹(LG), 예를 들어 아실 그룹 또는 할로겐으로 적절하게 치환된 2'-OH 및 2'-H를 갖는 당이다. 당은 구입하거나 표준 에피머화, 치환, 산화 및 환원 기술에 의해 제조할 수 있다. 이어서 적절한 온도에서 적절한 용매중 적절한 산화제로 치환된 당을 산화시켜 2'-변형된 당을 수득할 수 있다. 가능한 산

화제는 존스 시약(크롬산 및 황산의 혼합물), 콜린스 시약(디피리딘 Cr(VI) 옥사이드), 코레이 시약(피리디늄 클로로크로메이트), 피리디늄 디크로메이트, 산 디크로메이트, 과망간산칼륨, MnO_2, 루테늄 테트록사이드, 크롬산 또는 폴리머상의 과망간산염과 같은 상 이동 촉매, Cl_2-피리딘, H_2O_2-암모늄 몰리브데이트, $NaBrO_2$-CAN, HOAc중 NaOCl, 코퍼 크로마이트, 코퍼 옥사이드, 레이니 니켈, 팔라듐 아세테이트, Meerwin-Pondorf-Verley 시약(또다른 케톤을 갖는 알루미늄 t-부톡사이드) 및 N-브로모숙신아미드를 포함한다.

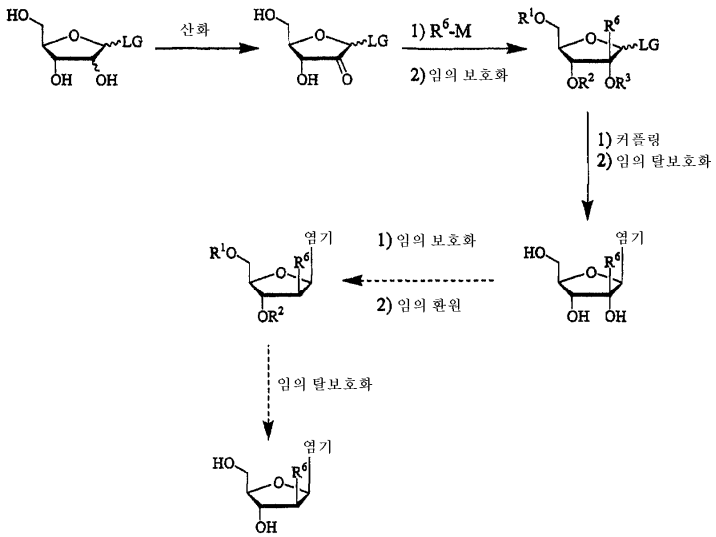
그 후 적절한 온도에서 적절한 비-양성자성 용매로 케톤과 유기 금속성 탄소 친핵체, 예를 들어 그리냐르 시약, 유기 리튬, 리튬 디알킬코퍼 또는 TBAF중 R^6-$SiMe_3$과 커플링화하여 2'-알킬화된 당을 수득할 수 있다. 알킬화된 당은 Greene et al Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 잘 알려져 있는 방법에 따라 적절한 보호 그룹, 바람직하게 아실 또는 실릴 그룹으로 임의로 보호될 수 있다.

이어서 임의로 보호되는 당은 Townsend Chemistry of nucleosides and nucleotide, Plenum Press, 1994에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 염기와 커플링될 수 있다. 예를 들면, 아실화된 당은 적절한 온도에서 적절한 용매중 루이스산, 예를 들어 테트라클로라이드, 티타늄 테트라클로라이드 또는 트리메틸실릴트리플레이트를 이용하여 실릴화된 염기와 커플링될 수 있다.

이어서, Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 뉴클레오사이드를 탈보호화할 수 있다.

특별한 예에서, 2'-C-분지형 리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 반응식 3에 나타내었다. 또한, 데옥시-리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 이들 뉴클레오사이드를 수득하기 위하여 형성된 리보뉴클레오사이드를 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 보호화할 수 있고, 이어서 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드록실은 Barton 환원에 의한 환원을 촉진시키기 위하여 활성화될 수 있다.

반응식 3



2. 예비-형성된 뉴클레오사이드의 변형

이 방법을 위한 중요한 출발물질은 2'-OH 및 2'-H를 갖는 적절하게 치환된 뉴클레오사이드이다. 뉴클레오사이드는 구입하거나 표준 커플링 기술을 포함하는 공지된 방법에 의해 제조할 수 있다. 뉴클레오사이드는 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 적절한 보호 그룹, 바람직하게 아실 또는 실릴 그룹으로 임의로 보호될 수 있다.

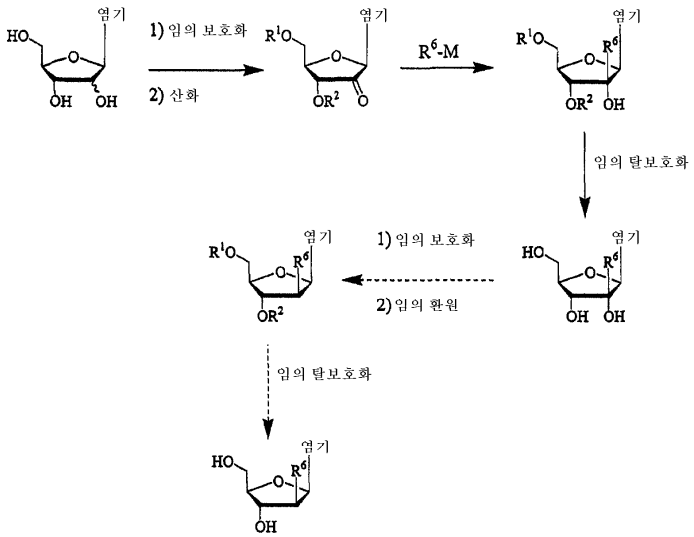
그 후 적절하게 보호된 뉴클레오사이드는 적절한 온도에서 적절한 용매중 적절한 산화제로 산화되어 2'-변형된 당을 수득할 수 있다. 가능한 산화제는 존스 시약(크롬산 및 황산의 혼합물), 콜린스 시약(디피리딘 Cr(VI) 옥사이드), 코레이 시약(피리디늄 클로로크로메이트), 피리디늄 디크로메이트, 산 디크로메이트, 과망간산칼륨, MnO_2, 루테늄 테트로옥사이드, 크롬산 또는 폴리머상의 과망간산염과 같은 상 이동 촉매, Cl_2-피리딘, H_2O_2-암모늄 모일브데이트

, NaBr0 $_2$ -CAN, HOAc중 NaOC, 코퍼 크로마이트, 코퍼 옥사이드, 레이니 니켈, 팔라듐 아세테이트, Meerwin-Ponndorf-Verley 시약(또다른 케톤을 갖는 알루미늄 t-부톡사이드) 및 N-브로모숙신아미드를 포함한다.

이어서, 뉴클레오사이드는 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 탈보호화될 수 있다.

특별한 예에서, 2'-C-분지형 리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 반응식 4에 나타내었다. 또한, 데옥시-리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 이들 뉴클레오사이드를 수득하기 위하여 예비-형성된 리보뉴클레오사이드를 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 보호화하고, 이어서 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드록실은 Barton 환원에 의한 환원을 촉진시키기 위하여 활성화될 수 있다.

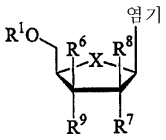
반응식 4



본 발명의 또다른 예에서, L-에난티오머가 바람직하다. 따라서, 본 발명의 화합물에 상응하는 L-에난티오머를 출발 물질로서 상응하는 L-당 또는 뉴클레오사이드 L-에난티오머로 시작하여 동일한 상기 일반적인 방법에 따라 제조할 수 있다.

C. 일반적인 3'-C-분지형 뉴클레오사이드의 합성

하기 구조의 3'-C-분지형 리보뉴클레오사이드를 하기 방법중 하나에 따라 제조할 수 있다:



상기 식에서,

염기는 본 명세서에서 정의된 바와 같은 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R ^{7} 및 R ^{9} 는 독립적으로 수소, OR ^{2} , 하이드록시, 알킬(저급 알킬 포함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO $_2$, NH $_2$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_2$, -N(아실) $_2$ 이며;

R ^{8} 은 H, 알킬(저급 알킬 포함), 염소, 브롬 또는 요오드이거나;

R ^{7} 및 R ^{9} , 또는 R ^{8} 및 R ^{9} , 또는 R ^{8} 및 R ^{10} 은 함께 pi 결합을 형성할 수 있고;

R^{1} 및 R^{2} 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노 산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^{1} 이 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^{6} 은 알킬, 할로게노-알킬(즉, CF_3), 알케닐 또는 알키닐(즉, 알릴)이고;

X는 O, S, SO_2 또는 CH_2 이다.

1. 적절하게 변형된 당을 이용한 뉴클레오염기의 글리코실화

이 공정을 위한 중요한 출발물질은 적절한 이탈 그룹(LG), 예를 들면, 아실 그룹 또는 할로겐으로 적절하게 치환된 3'-OH 및 3'-H를 갖는 당이다. 당은 구입하거나 표준 에피머화, 치환, 산화 및 환원 기술에 의해 제조할 수 있다. 그 후 적절한 온도에서 적절한 용매중 적절한 산화제로 치환된 당을 산화시켜 3'-변형된 당을 수득할 수 있다. 가능한 산화제는 존스 시약(크롬산 및 황산의 혼합물), 콜린스 시약(디피리딘 Cr(VI) 옥사이드), 코레이 시약(피리디늄 클로로크로메이트), 피리디늄 디크로메이트, 산 디크로메이트, 과망간산칼륨, MnO_2, 루테늄 테트로옥사이드, 크롬산 또는 폴리머상의 과망간산염과 같은 상 이동 촉매, Cl_2-피리딘, H_2O_2-암모늄 몰리브데이트, $NaBrO_2$-CAN, HOAc중 NaOC, 코퍼 크로마이트, 코퍼 옥사이드, 레이니 니켈, 팔라듐 아세테이트, Meerwin-Pondorf-Verley 시약(또다른 케톤을 갖는 알루미늄 t-부톡사이드) 및 N-브로모숙신아미드를 포함한다.

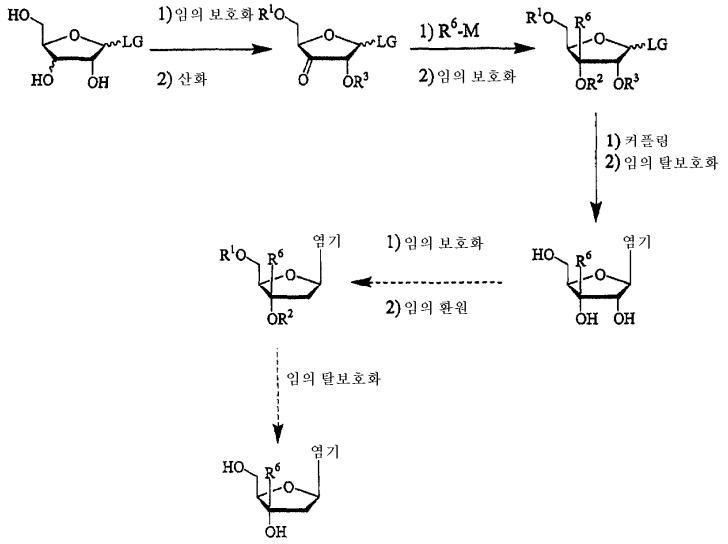
이어서, 적절한 온도에서 적절한 비-양성자성 용매로 케톤과 유기 금속성 탄 소 친핵체, 예를 들어 그리냐르 시약, 유기 리튬, 리튬 디알킬코퍼 또는 TBAF중 R^{6}-$SiMe_3$ 과 커플링화하여 3'-알킬화된 당을 수득할 수 있다. 알킬화된 당은 Greene et al Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 적절한 보호 그룹, 바람직하게 아실 또는 실릴 그룹으로 임의로 보호될 수 있다.

이어서 임의로 보호된 당은 Townsend Chemistry of nucleosides and nucleotides, Plenum Press, 1994에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 염기와 커플링될 수 있다. 예를 들면, 아실화된 당은 적절한 온도에서 적절한 용매중 루이스산, 예를 들어 테트라클로라이드, 티타늄 테트라클로라이드 또는 트리메틸실릴트리플레이트를 이용하여 실릴화된 염기와 커플링될 수 있다.

연속하여, Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 뉴클레오사이드를 탈보호할 수 있다.

특별한 예에서, 3'-C-분지형 리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 반응식 5에 나타내었다. 또한, 데옥시-리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 이들 뉴클레오사이드를 수득하기 위하여 형성된 리보뉴클레오사이드를 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 보호할 수 있고, 이어서, 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드 록실은 Barton 환원에 의한 환원을 촉진시키기 위하여 활성화될 수 있다.

반응식 5



2) 예비-형성된 뉴클레오사이드의 변형

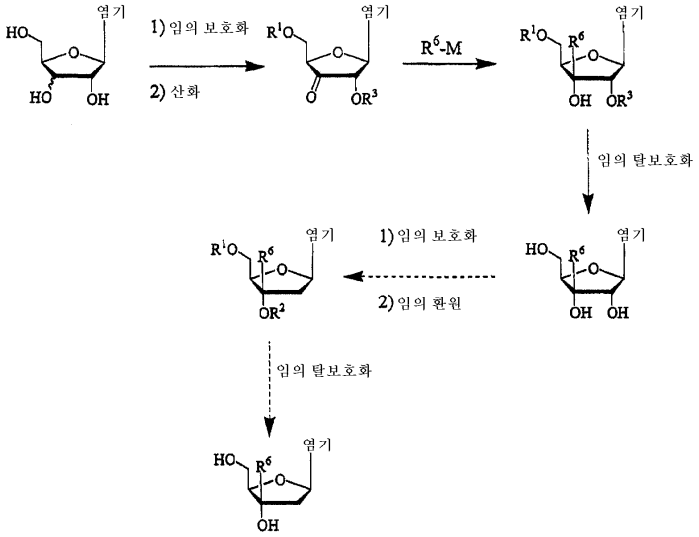
이 방법을 위한 중요한 출발물질은 3'-OH 및 3'-H를 갖는 적절하게 치환된 뉴클레오사이드이다. 뉴클레오사이드는 구입하거나 표준 커플링 기술을 포함하는 공지된 방법에 의해 제조될 수 있다. 뉴클레오사이드는 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 적절한 보호 그룹, 바람직하게 아실 또는 실릴 그룹으로 임의로 보호될 수 있다.

그 후 적절하게 보호된 뉴클레오사이드는 적절한 온도에서 적절한 용매중 적절한 산화제로 산화되어 2'-변형된 당을 수득할 수 있다. 가능한 산화제는 존스 시약(크롬산 및 황산의 혼합물), 콜린스 시약(디피리딘 Cr(VI) 옥사이드), 코레이 시약(피리디늄 클로로크로메이트), 피리디늄 디크로메이트, 산 디크로메이트, 과망간산칼륨, MnO_2, 루테늄 테트로옥사이드, 크롬산 또는 폴리머상의 과망간산염과 같은 상 이동 촉매, Cl_2-피리딘, H_2O_2-암모늄 모일브데이트, $NaBrO_2$-CAN, HOAc중 NaOC, 코퍼 크로마이트, 코퍼 옥사이드, 레이니 니켈, 팔라듐 아세테이트, Meerwin-Pondorf-Verley 시약(또다른 케톤을 갖는 알루미늄 t-부톡사이드) 및 N-브로모숙신아미드를 포함한다.

연속하여, 뉴클레오사이드는 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis John Wiley and Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 탈보호될 수 있다.

특별한 예에서, 3'-C-분지형 리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 리보뉴클레오사이드의 합성을 도식 6에 나타낸다. 또한, 데옥시-리보뉴클레오사이드가 바람직하다. 이들 뉴클레오사이드를 수득하기 위하여 앞서 형성된 리보뉴클레오사이드를 Greene et al. Protective Groups in Organic Synthesis, John Wiley 및 Sons, Second Edition, 1991에 교시된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 보호화하고, 이어서, 2'-OH를 적절한 환원제로 환원시킬 수 있다. 임의로, 2'-하이드록실은 Barton 환원에 의한 환원을 촉진시키기 위하여 활성화될 수 있다.

반응식 6



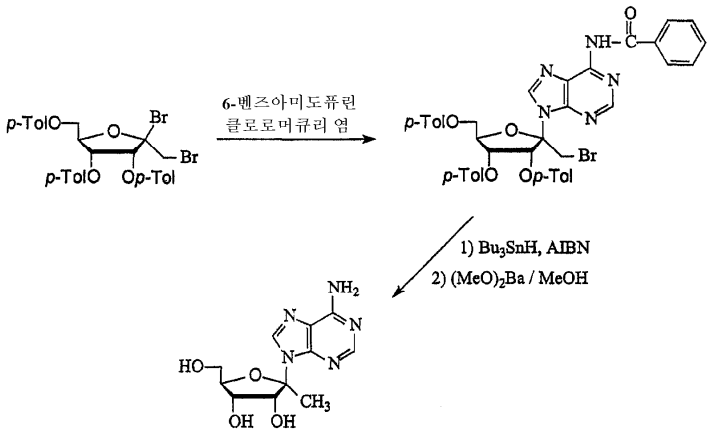
본 발명의 또다른 일례로, L-에난티오머가 바람직하다. 따라서, 본 발명의 화합물에 상응하는 L-에난티오머를 출발 물질로서 상응하는 L-당 또는 뉴클레오사이드 L-에난티오머로 시작하여 동일한 상기 일반적인 방법에 따라 제조할 수 있다.

실시예

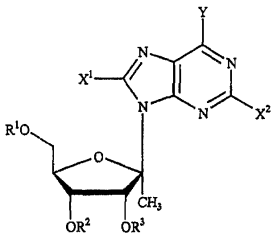
실시예 1: 6-아미노-9-(1-데옥시-β-D-프사이코퓨라노실)을 통한 1'-C-메틸리보아데닌의 제조

표제 화합물은 공개된 방법(J. Farkas, and F. Sorm, 'Nucleic acid components and their analogues. XCIV. Synthesis of 6-amino-9-(1-deoxy-β-D-psicofuranosyl)purine' Collect. Czech. Chem. Commun. 1967, 32. 2663-2667; J. Farkas', Collect. Czech. Chem. Commun. 1966, 31, 1535)(반응식 7)에 따라 제조될 수 있다.

반응식 7



유사한 방법이지만, 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 하기 화학식 I의 뉴클레오사이드를 제조한다.



(I)

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	H	H
H	H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	H	OH
H	H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	H	OEt
H	H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	H	O-아세틸
H	H	H	H	H	SH
H	H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	H	S-사이클로프로필
H	H	H	H	H	F
H	H	H	H	H	Cl
H	H	H	H	H	Br
H	H	H	H	H	I
모노포스페이트	H	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	F
모노포스페이트	H	H	H	H	Cl
모노포스페이트	H	H	H	H	Br
모노포스페이트	H	H	H	H	I
디포스페이트	H	H	H	H	NH_2
디포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	H	OEt
디포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	F
디포스페이트	H	H	H	H	Cl
디포스페이트	H	H	H	H	Br

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	H	I
트리포스페이트	H	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	SH
트리포스페이트	H	H	H	H	SMe
트리포스페이트	H	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	F
트리포스페이트	H	H	H	H	Cl
트리포스페이트	H	H	H	H	Br
트리포스페이트	H	H	H	H	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	OH
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	Cl
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	Cl
H	H	H	F	H	NH_2
H	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	H	OH
H	H	H	F	H	F
H	H	H	F	H	Cl
H	H	H	Cl	H	NH_2
H	H	H	Cl	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	H	OH
H	H	H	Cl	H	F
H	H	H	Cl	H	Cl
H	H	H	Br	H	NH_2
H	H	H	Br	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	H	OH
H	H	H	Br	H	F
H	H	H	Br	H	Cl
H	H	H	NH_2	H	NH_2
H	H	H	NH_2	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	H	OH
H	H	H	NH_2	H	F
H	H	H	NH_2	H	Cl
H	H	H	SH	H	NH_2
H	H	H	SH	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	H	OH
H	H	H	SH	H	F
H	H	H	SH	H	Cl
아세틸	H	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
아세틸	H	H	H	H	F
아세틸	H	H	H	H	Cl
아세틸	H	H	F	H	NH_2
아세틸	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	H	OH
아세틸	H	H	F	H	F
아세틸	H	H	F	H	Cl
H	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	H	OH
H	아세틸	아세틸	H	H	F
H	아세틸	아세틸	H	H	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	Cl
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
H	H	H	H	NH_2	H
H	H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	NH-메틸
H	H	H	H	NH_2	NH-에틸
H	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
H	H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	H	NH_2	OMe
H	H	H	H	NH_2	OEt
H	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	O-아세틸
H	H	H	H	NH_2	SH
H	H	H	H	NH_2	SMe
H	H	H	H	NH_2	SEt
H	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	F
H	H	H	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	NH_2	Br
H	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	F
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	I
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	F
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
디포스페이트	H	H	H	NH_2	I
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	F
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	OH
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	Cl
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	Cl
H	H	H	F	NH_2	NH_2
H	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	NH_2	OH
H	H	H	F	NH_2	F

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	F	NH_2	Cl
H	H	H	Cl	NH_2	NH_2
H	H	H	Cl	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	NH_2	OH
H	H	H	Cl	NH_2	F
H	H	H	Cl	NH_2	Cl
H	H	H	Br	NH_2	NH_2
H	H	H	Br	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	NH_2	OH
H	H	H	Br	NH_2	F
H	H	H	Br	NH_2	Cl
H	H	H	NH_2	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	NH_2	OH
H	H	H	NH_2	NH_2	F
H	H	H	NH_2	NH_2	Cl
H	H	H	SH	NH_2	NH_2
H	H	H	SH	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2	F
H	H	H	SH	NH_2	Cl
아세틸	H	H	H	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	NH_2	OH
아세틸	H	H	H	NH_2	F
아세틸	H	H	H	NH_2	Cl
아세틸	H	H	F	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	NH_2	OH
아세틸	H	H	F	NH_2	F
아세틸	H	H	F	NH_2	Cl

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	NH-메틸
H	H	H	H	Cl	NH-에틸

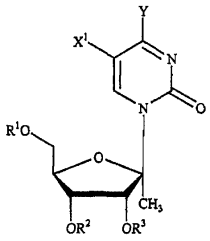
R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	Cl	NH-아세틸
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	OMe
H	H	H	H	Cl	OEt
H	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	O-아세틸
H	H	H	H	Cl	SH
H	H	H	H	Cl	SMe
H	H	H	H	Cl	SEt
H	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	OH
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	SH
디포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OH
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SH
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
트리포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	OH
H	H	H	F	Cl	NH_2

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	Cl	OH
H	H	H	Cl	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	Cl	OH
H	H	H	Br	Cl	NH_2
H	H	H	Br	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	Cl	OH
H	H	H	NH_2	Cl	NH_2
H	H	H	NH_2	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	Cl	OH
H	H	H	SH	Cl	NH_2
H	H	H	SH	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	Cl	OH
아세틸	H	H	H	Cl	NH_2
아세틸	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	Cl	OH
아세틸	H	H	F	Cl	NH_2
아세틸	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	Cl	OH
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Br	OH

다르게는, 하기 화학식 IV의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(IV)

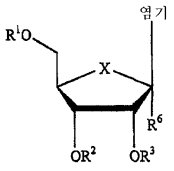
R^1	R^2	R^3	X^1	Y
H	H	H	H	H
H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	OEt
H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	O-아세틸
H	H	H	H	SH
H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	OEt

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
디포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	SH
트리포스페이트	H	H	H	SMe
드리포스페이드	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	OH
H	H	H	F	NH_2
H	H	H	F	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	OH
H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	OH
H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2
H	H	H	SH	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	OH
아세틸	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	OH
아세틸	H	H	F	NH_2
아세틸	H	H	F	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	OH
H	아세틸	아세틸	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH

다르게는, 하기 화학식 VII의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(VII)

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	H	H	CH_3	O	티민
H	H	H	CH_3	O	시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	우라실
H	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	S	티민
H	H	H	CH_3	S	시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	우라실
H	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
드리포스페이드	H	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
H	H	H	CH_3	O	구아닌
H	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	O	아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌

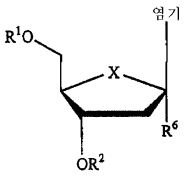
R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	S	구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-플루오로아데닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	아데닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	구아닌

다르게는, 하기 화학식 Ⅷ의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(VIII)

R^1	R^2	R^6	X	염기
H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	CH_3	O	하이포크산틴
H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	H	CH_3	O	티민
H	H	CH_3	O	시토신
H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	CH_3	O	우라실
H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	CH_3	S	하이포크산틴
H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	H	CH_3	S	티민
H	H	CH_3	S	시토신
H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	CH_3	S	우라실
H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	CH_3	O	시토신

R^1	R^2	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	CH_3	O	티민
디포스페이트	H	CH_3	O	시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	CH_3	S	시토신
디포스페이트	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	S	우라실
디포스페이트	H	CH_3	S	5-플루오로우라실

R^1	R^2	R^6	X	염기
트리포스페이트	H	CH_3	O	2,4-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	CH_3	O	티민
트리포스페이트	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	CH_3	S	티민
트리포스페이트	H	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	S	우라실
트리포스페이트	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	티민

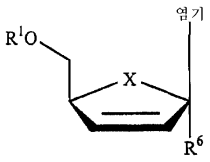
R^1	R^2	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
H	H	CH_3	O	구아닌
H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	CH_3	O	아데닌
H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
H	H	CH_3	S	구아닌
H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌

R^1	R^2	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	O	아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	구아닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	CH_3	S	아데닌
디포스페이트	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	CH_3	O	구아닌
디포스페이트	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	CH_3	O	아데닌
디포스페이트	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	CH_3	S	구아닌
디포스페이트	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌

R^1	R^2	R^6	X	염기
디포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	CH_3	S	아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	O	아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	구아닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌

R^1	R^2	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	아데닌
아세틸	아세틸	CF_3	O	구아닌
아세틸	아세틸	CF_3	S	구아닌
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	구아닌
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	구아닌

다르게는, 하기 화학식 IX의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(IX)

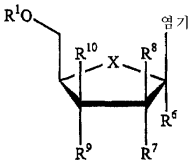
R^1	R^6	X	염기
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	CH_3	O	하이포크산틴
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	O	티민
H	CH_3	O	시토신

R^1	R^6	X	염기
H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	O	우라실
H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	CH_3	S	하이포크산틴
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	S	티민
H	CH_3	S	시토신
H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	S	우라실
H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	O	티민
모노포스페이트	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	S	티민
모노포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	CH_3	S	5-플루오로우라실

R^1	R^6	X	염기
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	O	티민
디포스페이트	CH_3	O	시토신
디포스페이트	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	우라실
디포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이드	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	S	티민
디포스페이트	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	CH_3	O	티민
트리포스페이트	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	CH_3	S	티민
트리포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민

R^1	R^6	X	염기
모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

다르게는, 하기 화학식 XVI의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XVI)

R^1	R^6	R^7	R^8	X	염기	R^{10}	R^9
H	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	하이포크산틴	OH	Me

R^1	R^6	R^7	R^8	X	염기	R^{10}	R^9
H	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	티민	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	우라실	OH	Me
H	CH_3	H	H	O	5-플루오로우라실	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	하이포크산틴	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	티민	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	우라실	OH	Me
H	CH_3	H	H	S	5-플루오로우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	하이포크산틴	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	티민	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	시토신	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	O	5-플루오로우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	하이포크산틴	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	티민	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	시토신	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me

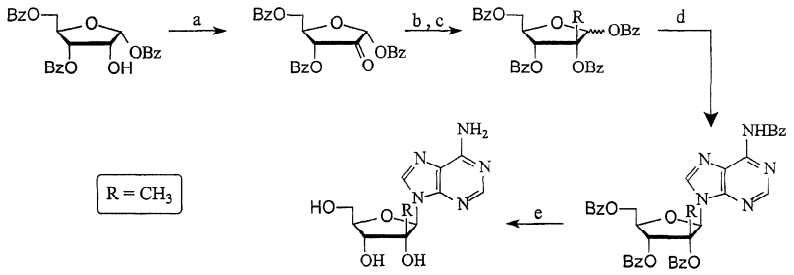
R^1	R^6	R^7	R^8	X	염기	R^{10}	R^9
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	우라실	OH	Me
모노포스페이트	CH_3	H	H	S	5-플루오로우라실	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	하이포크산틴	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	티민	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	시토신	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	우라실	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	O	5-플루오로우라실	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	S	하이포크산틴	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	S	티민	OH	Me
디포스페이트	CH_3	H	H	S	시토신	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	하이포크산틴	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	티민	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	시토신	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	우라실	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	O	5-플루오로우라실	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	S	하이포크산틴	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	S	티민	OH	Me
트리포스페이트	CH_3	H	H	S	시토신	OH	Me

R^1	R^6	R^7	R^8	X	염기	R^{10}	R^9
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	하이포크산틴	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	티민	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	우라실	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	O	5-플루오로우라실	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	하이포크산틴	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	2,4-O-디아세틸티민	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	티민	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	4-(N-모노-아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	우라실	OH	Me
모노포스페이트	CF_3	H	H	S	5-플루오로우라실	OH	Me
아세틸	CH_3	H	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	H	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	OH	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	OH	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br

실시예 2: 2'-C-메틸리보아데닌의 제조

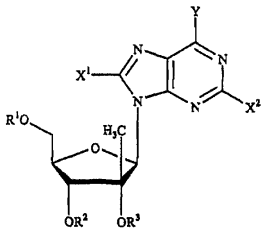
표제 화합물을 공개된 방법(R.E. Harry-O'kuru, J.M. Smith, and M.S. Wolfe, 'A short, flexible route toward 2'-C-branched ribonucleosides', J. Org. Chem. 1997, 62, 1754-1759)(반응식 8)에 따라 제조할 수 있다.

반응식 8



(a) 데스-마틴 페리오디난; (b) MeMgBr/$TiCl_4$; (c) BzCl, DMAP, Et_3N; (d) 비스(트리메틸실릴)아세트아미드, N^6-벤조일 아데닌, TMSOTf; (e) NH_3/MeOH

유사한 방법이지만, 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 하기 화학식 II의 뉴클레오사이드를 제조한다.



(II)

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	H	H
H	H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	H	OH
H	H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	H	OEt

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	H	O-이세틸
H	H	H	H	H	SH
H	H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	H	S-사이클로프로필
H	H	H	H	H	F
H	H	H	H	H	Cl
H	H	H	H	H	Br
H	H	H	H	H	I
모노포스페이트	H	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	F
모노포스페이트	H	H	H	H	Cl
모노포스페이트	H	H	H	H	Br
모노포스페이트	H	H	H	H	I
디포스페이트	H	H	H	H	NH_2
디포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	H	OEt
디포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	F
디포스페이트	H	H	H	H	Cl
디포스페이트	H	H	H	H	Br
디포스페이트	H	H	H	H	I
트리포스페이트	H	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	SH
트리포스페이트	H	H	H	H	SMe
트리포스페이트	H	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	F
트리포스페이트	H	H	H	H	Cl

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	H	Br
트리포스페이트	H	H	H	H	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	OH
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	Cl
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	Cl
H	H	H	F	H	NH_2
H	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	H	OH
H	H	H	F	H	F
H	H	H	F	H	Cl
H	H	H	Cl	H	NH_2
H	H	H	Cl	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	H	OH
H	H	H	Cl	H	F
H	H	H	Cl	H	Cl
H	H	H	Br	H	NH_2
H	H	H	Br	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	H	OH
H	H	H	Br	H	F

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	Br	H	Cl
H	H	H	NH_2	H	NH_2
H	H	H	NH_2	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	H	OH
H	H	H	NH_2	H	F
H	H	H	NH_2	H	Cl
H	H	H	SH	H	NH_2
H	H	H	SH	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	H	OH
H	H	H	SH	H	F
H	H	H	SH	H	Cl
아세틸	H	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	H	OH
아세틸	H	H	H	H	F
아세틸	H	H	H	H	Cl
아세틸	H	H	F	H	NH_2
아세틸	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	H	OH
아세틸	H	H	F	H	F
아세틸	H	H	F	H	Cl
H	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	H	OH
H	아세틸	아세틸	H	H	F
H	아세틸	아세틸	H	H	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	Cl

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
디포스페이드	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
H	H	H	H	NH_2	H
H	H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	NH-메틸
H	H	H	H	NH_2	NH-에틸
H	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
H	H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	H	NH_2	OMe
H	H	H	H	NH_2	OEt
H	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	O-아세틸
H	H	H	H	NH_2	SH
H	H	H	H	NH_2	SMe
H	H	H	H	NH_2	SEt
H	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	F

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	NH_2	Br
H	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	F
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	I
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
디포스페이드	H	H	H	NH_2	SMe
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	F
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
디포스페이트	H	H	H	NH_2	I
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
드리포스페이드	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
드리포스페이드	H	H	H	NH_2	SMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	F
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	OH
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	Cl

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이드	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	Cl
H	H	H	F	NH_2	NH_2
H	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	NH_2	OH
H	H	H	F	NH_2	F
H	H	H	F	NH_2	Cl
H	H	H	Cl	NH_2	NH_2
H	H	H	Cl	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	NH_2	OH
H	H	H	Cl	NH_2	F
H	H	H	Cl	NH_2	Cl
H	H	H	Br	NH_2	NH_2
H	H	H	Br	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	NH_2	OH
H	H	H	Br	NH_2	F
H	H	H	Br	NH_2	Cl
H	H	H	NH_2	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	NH_2	OH
H	H	H	NH_2	NH_2	F
H	H	H	NH_2	NH_2	Cl
H	H	H	SH	NH_2	NH_2

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	SH	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2	F
H	H	H	SH	NH_2	Cl
아세틸	H	H	H	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	NH_2	OH
아세틸	H	H	H	NH_2	F
아세틸	H	H	H	NH_2	Cl
아세틸	H	H	F	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	NH_2	OH
아세틸	H	H	F	NH_2	F
아세틸	H	H	F	NH_2	Cl
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필

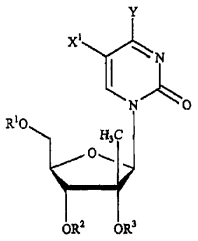
R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	NH-메틸
H	H	H	H	Cl	NH-에틸
H	H	H	H	Cl	NH-아세틸
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	OMe
H	H	H	H	Cl	OEt
H	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	O-아세틸
H	H	H	H	Cl	SH
H	H	H	H	Cl	SMe
H	H	H	H	Cl	SEt
H	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	OH
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	SH
디포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OH
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SH
드리포스페이드	H	H	H	Cl	SMc
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
트리포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이드	H	Cl	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH-
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	OH
H	H	H	F	Cl	NH_2
H	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	Cl	OH
H	H	H	Cl	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	Cl	OH
H	H	H	Br	Cl	NH_2
H	H	H	Br	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	Cl	OH
H	H	H	NH_2	Cl	NH_2
H	H	H	NH_2	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	Cl	OH
H	H	H	SH	Cl	NH_2
H	H	H	SH	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	Cl	OH
아세틸	H	H	H	Cl	NH_2
아세틸	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	Cl	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
아세틸	H	H	F	Cl	NH_2
아세틸	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	Cl	OH
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Br	OH

다르게는, 하기 화학식 V의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(V)

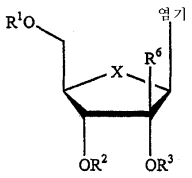
R^1	R^2	R^3	X^1	Y
H	H	H	H	H
H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	OH
H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	OEt
H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	O-아세틸
H	H	H	H	SH
H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
모노포스페이트	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	OEt
디포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
트리포스페이트	H	H	H	SH
트리포스페이트	H	H	H	SMe
트리포스페이트	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	OH
H	H	H	F	NH_2
H	H	H	F	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	OH
H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	OH
H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	OH
H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2
H	H	H	SH	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	OH
아세틸	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
아세틸	H	H	F	NH_2
아세틸	H	H	F	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	OH
H	이세틸	이세틸	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH

다르게는, 하기 화학식 X의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(X)

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸우라실

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸티민
H	H	H	CH_3	O	티민
H	H	H	CH_3	O	시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N-모노- 아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N,N- 디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	우라실
H	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	H	CH_3	S	2,4-O- 디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	S	2,4-O- 디아세틸티민
H	H	H	CH_3	S	티민
H	H	H	CH_3	S	시도신
H	H	H	CH_3	S	4-(N-모노- 아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N,N- 디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	우라실
H	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노- 이세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N- 디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O- 디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O- 디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N-모노- 아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N,N- 디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O- 디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노- 아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N- 디아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸디민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
H	H	H	CH_3	O	구아닌
H	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	O	아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
H	H	H	CH_3	S	구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌

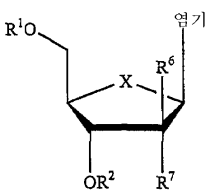
R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이드	H	H	CH_3	S	아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이드	모노포스페이드	CF_3	O	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,8-디플루오로 아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,8-디플루오로 아데닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	아데닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	구아닌

다르게는, 하기 화학식 XI의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XI)

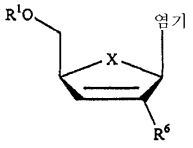
R^1	R^2	R^7	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	H	H	CH_3	O	티민
H	H	H	CH_3	O	시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	우라실
H	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	S	하이포크산틴

R^1	R^2	R^7	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	H	H	CH_3	S	티민
H	H	H	CH_3	S	시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	우라실
H	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
			CH_3		
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민

R^1	R^2	R^7	R^6	X	염기
디포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
디포스페이드	H	H	CH_3	O	시도신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N- 모노 - 아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
드리포스페이드	H	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N- 모노 - 아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우리실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
드리포스페이드	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	티민

R^1	R^2	R^7	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	시토신
모노포스페이드	모노포스페이트	Br	CF_3	O	4-(N- 모노 - 아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이드	Br	CF_3	S	4-(N- 모노 - 아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	Br	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	NO2	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	NO2	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸) 시토신
아세틸	아세틸	NO2	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	NO2	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

다르게는, 하기 화학식 XII의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



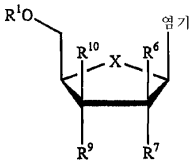
(XII)

R^1	R^6	X	염기
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	CH_3	O	하이포크산틴
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	O	티민
H	CH_3	O	시토신
H	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	O	우라실
H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	CH_3	S	하이포크산틴
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	S	티민
H	CH_3	S	시토신
H	CH_3	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	S	우라실
H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	O	티민
모노포스페이트	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	S	티민

R^1	R^6	X	염기
모노포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	O	티민
디포스페이트	CH_3	O	시토신
디포스페이트	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	우라실
디포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	S	티민
디포스페이트	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	CH_3	O	티민
트리포스페이트	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민

R^1	R^6	X	염기
트리포스페이트	CH_3	S	티민
트리포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

다르게는, 하기 화학식 XVII의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XVII)

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^9	R^{10}
H	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
H	CH_3	H	O	히이포크산틴	NH2	Me
H	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸티민	NHAc	Me
H	CH_3	H	O	티민	NH2	Me
H	CH_3	H	O	시토신	NH2	Me
H	CH_3	H	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAc	Me
H	CH_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시도신	NHAc	Me
H	CH_3	H	O	우라실	NH2	Me
H	CH_3	H	O	5-플루오로우라실	NH2	Me
H	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
H	CH_3	H	S	하이포크산틴	NH2	Me
H	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸디민	NHAc	Me
H	CH_3	H	S	티민	NH2	Me
H	CH_3	H	S	시토신	NH2	Me
H	CH_3	H	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAc	Me
H	CH_3	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	NHAc	Me
H	CH_3	H	S	우라실	NH2	Me
H	CH_3	H	S	5-플루오로우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	하이포크산틴	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸티민	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	티민	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAC	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	O	5-플루오로우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	하이포크산틴	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸티민	NHAc	Me

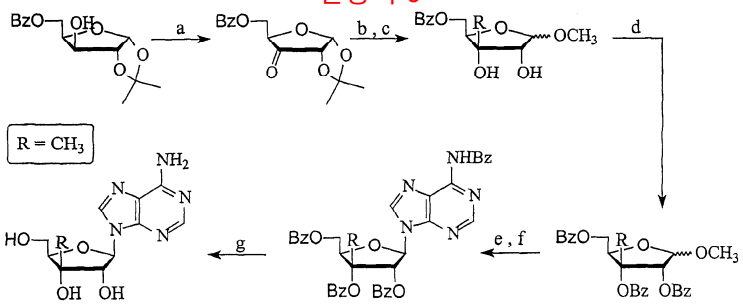
R^1	R^6	R^7	X	염기	R^9	R^{10}
모노포스페이트	CH_3	H	S	티민	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	NHAc	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CH_3	H	S	5-플루오로우라실	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	하이포크산틴	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸티민	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	티민	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	시토신	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAc	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	NHAc	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	우라실	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	O	5-플루오로우라실	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	S	하이포크산틴	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸티민	NHAc	Me
디포스페이트	CH_3	H	S	티민	NH2	Me
디포스페이트	CH_3	H	S	시토신	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	NHAc	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	하이포크산틴	NHAc	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	2,4-O-디아세틸티민	NHAc	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	티민	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	시토신	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	NHAc	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	우라실	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	O	5-플루오로우라실	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	S	하이포크산틴	NH2	Me

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^9	R^{10}
트리포스페이트	CH_3	H	S	2,4-O-디아세틸티민	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	S	티민	NH2	Me
트리포스페이트	CH_3	H	S	시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	2,4-O-디아세틸우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	하이포크산틴	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	2,4-O-디아세틸티민	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	티민	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	4-(N-모노-아세틸)시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	O	5-플루오로우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	2,4-O-디아세틸우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	하이포크산틴	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	2,4-O-디아세틸티민	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	티민	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	4-(N-모노-아세틸)시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	우라실	NH2	Me
모노포스페이트	CF_3	H	S	5-플루오로우라실	NH2	Me
아세틸	CH_3	H	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	H	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	OH	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br

실시예 3: 3'-C-메틸리보아데닌의 제조

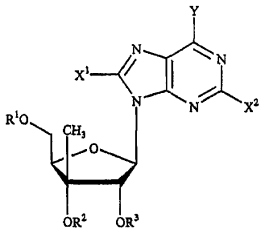
표제 화합물을 공개된 방법(R.F. Nutt, M.J. Dickinson, F.W. Holly, and E. Walton, 'Branched-chain sugar nucleosides. III. 3'-C-methyladenine', J. Org. Chem. 1968, 33, 1789-1795)(반응식 9)에 따라 제조할 수 있다.

반응식 9



(a) $RuO_2/NaIO_4$; (b) $MeMgI/TiCl_4$; (c) $HCl/MeOH/H_2O$; (d) BzCl/피리딘; (e) AcBr, HBr/AcOH; (f) 염화수은-6-벤즈아미도퓨린; (g) NH_3/MeOH

유사한 방법이지만, 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 하기 화학식 III의 뉴클레오사이드를 제조한다.



(III)

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	H	H
H	H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	H	OEt
H	H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	H	O-아세틸
H	H	H	H	H	SH
H	H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	H	S-사이클로프로필
H	H	H	H	H	F
H	H	H	H	H	Cl
H	H	H	H	H	Br
H	H	H	H	H	I
모노포스페이트	H	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	H	F
모노포스페이트	H	H	H	H	Cl
모노포스페이트	H	H	H	H	Br
모노포스페이트	H	H	H	H	I
디포스페이트	H	H	H	H	NH_2

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	H	OEt
디포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	H	F
디포스페이트	H	H	H	H	Cl
디포스페이트	H	H	H	H	Br
디포스페이트	H	H	H	H	I
트리포스페이트	H	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	H	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	H	SH
드리포스페이트	H	H	H	H	SMe
트리포스페이트	H	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	H	S-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	H	F
트리포스페이트	H	H	H	H	Cl
트리포스페이트	H	H	H	H	Br
트리포스페이트	H	H	H	H	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	OH
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	H	Cl
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	H	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	H	Cl
H	H	H	F	H	NH_2
H	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	H	OH
H	H	H	F	H	F
H	H	H	F	H	Cl
H	H	H	Cl	H	NH_2
H	H	H	Cl	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	H	OH
H	H	H	Cl	H	F
H	H	H	Cl	H	Cl
H	H	H	Br	H	NH_2
H	H	H	Br	H	NH-사이클로프로필

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	Br	H	OH
H	H	H	Br	H	F
H	H	H	Br	H	Cl
H	H	H	NH_2	H	NH_2
H	H	H	NH_2	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	H	OH
H	H	H	NH_2	H	F
H	H	H	NH_2	H	Cl
H	H	H	SH	H	NH_2
H	H	H	SH	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	H	OH
H	H	H	SH	H	F
H	H	H	SH	H	Cl
아세틸	H	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	H	OH
아세틸	H	H	H	H	F
아세틸	H	H	H	H	Cl
아세틸	H	H	F	H	NH_2
아세틸	H	H	F	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	H	OH
아세틸	H	H	F	H	F
아세틸	H	H	F	H	Cl
H	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	H	OH
H	아세틸	아세틸	H	H	F
H	아세틸	아세틸	H	H	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	H	Cl
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
디포스페이드	아세틸	아세틸	H	H	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	F
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	H	Cl
H	H	H	H	NH_2	H
H	H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	NH-메틸
H	H	H	H	NH_2	NH-에틸
H	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
H	H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	H	NH_2	OMe
H	H	H	H	NH_2	OEt
H	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	O-아세틸
H	H	H	H	NH_2	SH
H	H	H	H	NH_2	SMe
H	H	H	H	NH_2	SEt

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
H	H	H	H	NH_2	F
H	H	H	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	NH_2	Br
H	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	F
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
모노포스페이트	H	H	H	NH_2	I
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
디포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
디포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2	F
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
디포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
디포스페이트	H	H	H	NH_2	I
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OH
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	OEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SH
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SMe
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	SEt
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	F
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	Br
트리포스페이트	H	H	H	NH_2	I
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2	F
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이드	H	NH_2	Cl
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	F
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	F
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2	Cl
H	H	H	F	NH_2	NH_2
H	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	NH_2	OH
H	H	H	F	NH_2	F
H	H	H	F	NH_2	Cl
H	H	H	Cl	NH_2	NH_2
H	H	H	Cl	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	NH_2	OH
H	H	H	Cl	NH_2	F
H	H	H	Cl	NH_2	Cl
H	H	H	Br	NH_2	NH_2
H	H	H	Br	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	NH_2	OH
H	H	H	Br	NH_2	F
H	H	H	Br	NH_2	Cl
H	H	H	NH_2	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	NH_2	OH
H	H	H	NH_2	NH_2	F

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
H	H	H	NH_2	NH_2	Cl
H	H	H	SH	NH_2	NH_2
H	H	H	SH	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2	F
H	H	H	SH	NH_2	Cl
아세틸	H	H	H	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	NH_2	OH
아세틸	H	H	H	NH_2	F
아세틸	H	H	H	NH_2	Cl
아세틸	H	H	F	NH_2	NH_2
아세틸	H	H	F	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	NH_2	OH
아세틸	H	H	F	NH_2	F
아세틸	H	H	F	NH_2	Cl
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
H	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl

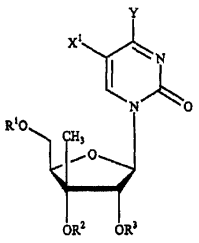
R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	F
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2	Cl
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	H
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	NH-메틸
H	H	H	H	Cl	NH-에틸
H	H	H	H	Cl	NH-아세틸
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	OMe
H	H	H	H	Cl	OEt
H	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	O-아세틸
H	H	H	H	Cl	SH
H	H	H	H	Cl	SMe
H	H	H	H	Cl	SEt
H	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
모노포스페이드	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SH
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
모노포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
모노포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	OH
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
디포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	OEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	Cl	SH
디포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
디포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
디포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OH
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OMe
트리포스페이트	H	H	H	Cl	OEt

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	Cl	O-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SH
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SMe
트리포스페이트	H	H	H	Cl	SEt
트리포스페이트	H	H	H	Cl	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	Cl	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	Cl	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	Cl	OH
H	H	H	F	Cl	NH_2
H	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	Cl	OH
H	H	H	Cl	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	Cl	OH
H	H	H	Br	Cl	NH_2
H	H	H	Br	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	Cl	OH
H	H	H	NH_2	Cl	NH_2
H	H	H	NH_2	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	Cl	OH
H	H	H	SH	Cl	NH_2
H	H	H	SH	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	Cl	OH
아세틸	H	H	H	Cl	NH_2

R^1	R^2	R^3	X^1	X^2	Y
아세틸	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	Cl	OH
아세틸	H	H	F	Cl	NH_2
아세틸	H	H	F	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	Cl	OH
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	Cl	NH-사이클로프로필
드리포스페이드	아세틸	아세틸	H	Cl	OH
H	H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Cl	OH
H	H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	Br	OH

다르게는, 하기 화학식 VI의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(VI)

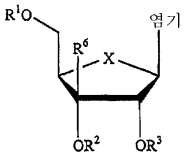
R^1	R^2	R^3	X^1	Y
H	H	H	H	H
H	H	H	H	NH_2
H	H	H	H	NH-사이클로프로필
H	H	H	H	NH-메틸
H	H	H	H	NH-에틸
H	H	H	H	NH-아세틸
H	H	H	H	OH
H	H	H	H	OMe
H	H	H	H	OEt
H	H	H	H	O-사이클로프로필
H	H	H	H	O-아세틸
H	H	H	H	SH
H	H	H	H	SMe
H	H	H	H	SEt
H	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH_2
모노포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	NH-메틸
모노포스페이트	H	H	H	NH-에틸
모노포스페이트	H	H	H	OH
모노포스페이트	H	H	H	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
모노포스페이트	H	H	H	OMe
모노포스페이트	H	H	H	OEt
모노포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
모노포스페이트	H	H	H	SH
모노포스페이트	H	H	H	SMe
모노포스페이트	H	H	H	SEt
모노포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH_2
디포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
디포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	NH-메틸
디포스페이트	H	H	H	NH-에틸
디포스페이트	H	H	H	OH
디포스페이트	H	H	H	O-아세틸
디포스페이드	H	H	H	OMe
디포스페이트	H	H	H	OEt
디포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
디포스페이트	H	H	H	SH
디포스페이트	H	H	H	SMe
디포스페이트	H	H	H	SEt
디포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	NH_2
트리포스페이트	H	H	H	NH-아세틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-사이클로프로필
드리포스페이드	H	H	H	NH-메틸
트리포스페이트	H	H	H	NH-에틸
트리포스페이트	H	H	H	OH
트리포스페이트	H	H	H	OMe
트리포스페이트	H	H	H	OEt
트리포스페이트	H	H	H	O-사이클로프로필
트리포스페이트	H	H	H	O-아세틸

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
트리포스페이트	H	H	H	SH
트리포스페이트	H	H	H	SMe
트리포스페이트	H	H	H	SEt
트리포스페이트	H	H	H	S-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH_2
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	H	OH
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH_2
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	디포스페이트	디포스페이트	H	OH
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH_2
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	트리포스페이트	트리포스페이트	H	OH
H	H	H	F	NH_2
H	H	H	F	NH-사이클로프로필
H	H	H	F	OH
H	H	H	Cl	NH_2
H	H	H	Cl	NH-사이클로프로필
H	H	H	Cl	OH
H	H	H	Br	NH_2
H	H	H	Br	NH-사이클로프로필
H	H	H	Br	OH
H	H	H	NH_2	NH_2
H	H	H	NH_2	NH-사이클로프로필
H	H	H	NH_2	OH
H	H	H	SH	NH_2
H	H	H	SH	NH-사이클로프로필
H	H	H	SH	OH
아세틸	H	H	H	NH_2
아세틸	H	H	H	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	H	OH

R^1	R^2	R^3	X^1	Y
아세틸	H	H	F	NH_2
아세틸	H	H	F	NH-사이클로프로필
아세틸	H	H	F	OH
H	아세틸	아세틸	H	NH_2
H	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
H	아세틸	아세틸	H	OH
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH_2
아세틸	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
아세틸	아세틸	아세틸	H	OH
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
모노포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
디포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH_2
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	NH-사이클로프로필
트리포스페이트	아세틸	아세틸	H	OH

다르게는, 하기 화학식 XIII의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XIII)

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	O	하이포크산틴

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	H	H	CH_3	O	티민
H	H	H	CH_3	O	시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	우라실
H	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
H	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	H	H	CH_3	S	티민
H	H	H	CH_3	S	시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	S	우라실
H	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시도신
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이드	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시도신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
니포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
디포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	티민
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	시토신

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이드	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이드	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸구아닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
H	H	H	CH_3	O	구아닌
H	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	O	아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
H	H	H	CH_3	S	구아닌
H	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
H	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
H	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
H	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌

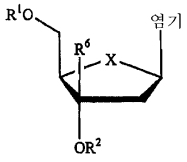
R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	O	아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
디포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	8-플루오로아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-O-아세틸 구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	구아닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	2-플루오로아데닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	8-플루오로아데닌
드리포스페이드	H	H	CH_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
트리포스페이트	H	H	CH_3	S	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-(N,N-디아세틸)-구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-O-아세틸 구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	구아닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	6-(N,N-디아세틸)-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	8-플루오로아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,8-디플루오로-아데닌
모노포스페이트	모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	아데닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	CF_3	S	구아닌

R^1	R^2	R^3	R^6	X	염기
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	구아닌
아세틸	아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	구아닌

다르게는, 하기 화학식 XIV의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XIV)

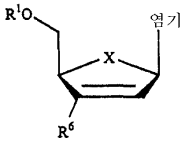
R^1	R^2	R^6	X	염기
H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	CH_3	O	하이포크산틴
H	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	H	CH_3	O	티민
H	H	CH_3	O	시토신
H	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	H	CH_3	O	우라실
H	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
H	H	CH_3	S	하이포크산틴
H	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	H	CH_3	S	티민
H	H	CH_3	S	시토신
H	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

R^1	R^2	R^6	X	염기
H	H	CH_3	S	우라실
H	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	CH_3	O	티민
모노포스페이트	H	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	H	CH_3	S	티민
모노포스페이트	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	H	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	H	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	CH_3	O	티민
디포스페이트	H	CH_3	O	시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	H	CH_3	O	우라실
디포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴

R^1	R^2	R^6	X	염기
디포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	H	CH_3	S	티민
디포스페이트	H	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	CH_3	O	티민
트리포스페이트	H	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	H	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	H	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	H	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	H	CH_3	S	티민
트리포스페이트	H	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	시토신

R^1	R^2	R^6	X	염기
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

다르게는, 하기 화학식 XV의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XV)

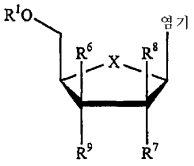
R^1	R^6	X	염기
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
H	CH_3	O	하이포크산틴
H	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	O	티민
H	CH_3	O	시토신
H	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	O	우라실
H	CH_3	O	5-플루오로우라실
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실

R^1	R^6	X	염기
H	CH_3	S	하이포크산틴
H	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
H	CH_3	S	티민
H	CH_3	S	시토신
H	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
H	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
H	CH_3	S	우라실
H	CH_3	S	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	O	티민
모노포스페이트	CH_3	O	시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	O	우라실
모노포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CH_3	S	티민
모노포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N-모노-아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CH_3	S	우라실
모노포스페이트	CH_3	S	5-플루오로우라실
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
디포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	O	티민
디포스페이트	CH_3	O	시토신

R^1	R^6	X	염기
디포스페이트	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
디포스페이트	CH_3	O	우라실
디포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
디포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
디포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
디포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
디포스페이트	CH_3	S	티민
디포스페이트	CH_3	S	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	O	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	O	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	CH_3	O	티민
트리포스페이트	CH_3	O	시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
트리포스페이트	CH_3	O	우라실
트리포스페이트	CH_3	O	5-플루오로우라실
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
트리포스페이트	CH_3	S	하이포크산틴
트리포스페이트	CH_3	S	2,4-O-디아세틸티민
트리포스페이트	CH_3	S	티민
트리포스페이트	CH_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	O	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	O	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CF_3	O	티민
모노포스페이트	CF_3	O	시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	O	우라실

R^1	R^6	X	염기
모노포스페이트	CF_3	O	5-플루오로우라실
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸우라실
모노포스페이트	CF_3	S	하이포크산틴
모노포스페이트	CF_3	S	2,4-O-디아세틸티민
모노포스페이트	CF_3	S	티민
모노포스페이트	CF_3	S	시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
모노포스페이트	CF_3	S	우라실
모노포스페이트	CF_3	S	5-플루오로우라실
아세틸	CF_3	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	CF_3	S	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	O	4-(N,N-디아세틸)시토신
아세틸	2-브로모-비닐	S	4-(N,N-디아세틸)시토신

다르게는, 하기 화학식 XVIII의 뉴클레오사이드를 적절한 당과 피리미딘 또는 퓨린 염기를 사용하여 제조한다.



(XVIII)

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^8	R^9
H	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
H	CH_3	OH	O	하이포크산틴	H	Me
H	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
H	CH_3	OH	O	티민	H	Me
H	CH_3	OH	O	시토신	H	Me

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^8	R^9
H	CH_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
H	CH_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
H	CH_3	OH	O	우라실	H	Me
H	CH_3	OH	O	5-플루오로우라실	H	Me
H	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
H	CH_3	OH	S	하이포크산틴	H	Me
H	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
H	CH_3	OH	S	티민	H	Me
H	CH_3	OH	S	시토신	H	Me
H	CH_3	OH	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
H	CH_3	OH	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
H	CH_3	OH	S	우라실	H	Me
H	CH_3	OH	S	5-플루오로우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	하이포크산틴	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	티민	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	O	5-플루오로우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	하이포크산틴	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	티민	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	우라실	H	Me
모노포스페이트	CH_3	OH	S	5-플루오로우라실	H	Me

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^8	R^9
디포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	하이포크산틴	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	티민	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	시토신	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
디포스페이드	CH_3	OH	O	우라실	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	O	5-플루오로우라실	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	S	하이포크산틴	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	S	티민	H	Me
디포스페이트	CH_3	OH	S	시토신	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	하이포크산틴	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	티민	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	시토신	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	우라실	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	O	5-플루오로우라실	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	S	하이포크산틴	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	S	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	S	티민	H	Me
트리포스페이트	CH_3	OH	S	시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	하이포크산틴	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	2,4-O-디아세틸티민	H	Me

R^1	R^6	R^7	X	염기	R^8	R^9
모노포스페이트	CF_3	OH	O	티민	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	우라실	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	O	5-플루오로우라실	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	2,4-O-디아세틸우라실	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	하이포크산틴	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	2,4-O-디아세틸티민	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	티민	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	우라실	H	Me
모노포스페이트	CF_3	OH	S	5-플루오로우라실	H	Me
아세틸	CH_3	OH	O	4-(N- 모노 -아세틸)시토신	H	Br
아세틸	CH_3	OH	S	4-(N,N-디아세틸)시토신	H	Br

VII. 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스 활성

화합물은 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 폴리머라제를 저해하거나, 복제 사이클에 필요한 다른 효소를 저해하거나, 다른 경로에 의해 항-플라비바이러스 또는 페스티바이러스 활성을 나타낼 수 있다.

실시예

시험 화합물을 초기 농도 200 μM로 DMSO에 용해시킨 후 배양 배지에서 계열 희석하였다.

다르게 언급하지 않는 한, 새끼 햄스터 신장(BHK-21)(ATCC CCL-10) 및 Bos Taurus(BT)(ATCC CRL 1390) 세포를 37 ℃에서 습윤 CO_2 (5%) 대기에서 증식시켰다. BHK-21 세포를 2 mM L-글루타민, 10% 소태아 혈청(FBS, Gibco) 및 Earle's BSS를 함유하고 1.5 g/ℓ 탄산나트륨 및 0.1 mM 비필수 아미노산을 함유하도록 조정된 이글 MEM에서 계대하였다. BT 세포를 4 mM L-글루타민 및 10% 말 혈청(HS, Gibco)를 함유하고 1.5 g/ℓ 탄산나트륨, 4.5 g/ℓ의 글루코스 및 1.0 mM 피루브산 나트륨을 함유하도록 조정된 둘베코즈 변형 이글 배지에서 계대하였다. 백신 균주 17D(YFV-17D)(Stamaril , Pasteur Merieux) 및 소 바이러스성 설사 바이러스(BVDV)(ATCC VR-534)를 사용하여 75 ㎠ 병에서 BHK 및 BT 세포를 각각 감염시켰다. 37 ℃에서 3 일간의 인큐베이션 기간후, 심각한 세포변성 효과가 관찰되었다. 배양물을 3 회 동결-해동시키고, 세포 찌꺼기를 원심분리에 의해 제거하여 상등액을 분주하고 -70 ℃에서 저장하였다. YFV-17D와 BVDV를 각각 24-웰 플레이트에서 컨플루언시로 증식한 BHK-21 및 BT 세포에서 역가를 측정하였다.

실시예 4: 활성 트리포스페이트에 대한 뉴클레오사이드의 인산화 분석

화합물의 세포 대사를 측정하기 위하여, HepG2 세포를 아메리칸 타입 걸쳐 컬렉션(록크빌, MD)으로부터 입수하고, 225 ㎠ 조직 배양 플라스크내 비필수 아미노산 및 1% 페니실린-스트렙토마이신 함유 최소 필수 배지에서 증식시켰다. 배지를 3 일마다 교체하고 세포를 매주 1 회 하위배양하였다. 30 ㎖의 트립신-EDTA에 10 분간 노출시키고 배지로 3 회 연속 세척하여 접착성 단일층을 탈리시킨 후, 컨플루언트 HepG2 세포를 6-웰 플레이트에 웰당 2.5×10^{6} 세포 밀도로 씨딩하고, 정해 진 시간 동안 10 μM의 [^{3}H]표지된 활성 화합물(500 dpm/pmol)에 노출시켰다. 세포를 37 ℃에서 5% CO_2 대기하에 유지시켰다. 선택된 시점에, 세포를 빙냉 인산-완충 식염수(PBS)로 3 회 세척하였다. 세포 침전물을 밤새 -20 ℃에서 60% 메탄올과 함께 인큐베이션한 후 추가로 20 ㎕의 냉 메탄올로 1 시간동안 빙욕에서 추출함으로써 세포내 활성 화합물과 그 각각의 대사산물을 추출하였다. 그 후 추출물을 합하고 온화하게 여과된 기류하에 건조시킨 후 HPLC 분석까지 -20 ℃에 저장하였다. HPLC 분석의 일차적 결과를 표 1에 나타내었다.

[표 1]

시간(h)	β-D-2'-CH_3-리보A-TP	β-D-2'-CH_3-리보U-TP	β-D-2'-CH_3-리보C-TP	β-D-2'-CH_3-리보G-TP
2	33.1	0.40	2.24	ND
4	67.7	1.21	3.99	ND
8	147	1.57	9.76	2.85
24	427	6.39	34.9	0.91
30	456	7.18	36.2	3.22
48	288	9.42	56.4	6.26

실시예 5: 사이노몰거스 원숭이에서의 생체이용률 분석

연구 시작전 1 주일내에, 사이노몰거스 원숭이에게 채혈을 용이하게 하기 위하여 지속성 정맥 카데테르와 피하 정맥 액세스 포트(VAP)를 외과적으로 이식하고 혈액학 및 혈청화학적 평가를 포함한 물리적 검사를 수행하고 체중을 기록하였다. 각각의 원숭이(총 6 마리)에게 각각의 용량의 활성 화합물과 함께, 즉 β-D-2'-CH_3-리보G를 5 ㎎/㎖의 투여 농도에서 10 ㎎/㎏의 투여 수준으로 정맥내 볼루스(3 마 리, IV) 또는 경구 가바즈(3 마리, PO)를 통해, 약 250 μCi의 ^{3}H 활성을 투여하였다. 각각의 투여 주사기의 중량을 투여전에 측정하여 투여된 제제의 양을 중량측정적으로 측정하였다. 뇨 샘플을 팬 캐치를 통해 정해진 간격(투여전 약 18-0 시간, 투여후 0-4, 4-8 및 8-12 시간)으로 수집하고 가공하였다. 혈액 샘플도 지속성 정맥 카데테르와 VAP를 통하거나 지속성 정맥 카데테르 과정이 불가능한 경우

말초 혈관으로부터 수집하였다(투여전, 투여후 0.25, 0.5, 1, 2, 3, 6, 8, 12 및 24 시간). 혈액 및 뇨 샘플을 최대 농도(C_{max}), 최대 농도에 도달하는 시간(T_{max}), 곡선하 면적(AUC), 투여 농도의 반감기($T_{1/2}$), 정화값(CL), 정상상태 부피 및 분포(V_{ss}) 및 생체이용률(F)에 대해 분석하고 각각 표 2 및 표 3에 나타내고 도 2 및 도 3에 그래프로 나타내었다.

[표 2]

	용량 (mg)	AUC (ng/mℓ×h)	Norm AUC (ng/mℓ×h/mg)	평균 Norm AUC (ng/mℓ×h/mg)	F(%)
IV 원숭이 1	46.44	13614	293.2		
IV 원숭이 2	24.53	6581	268.3		
IV 원숭이 3	20.72	6079	293.4	284.9	
PO 원숭이 1	29.04	758	26.1		
PO 원숭이 2	30.93	898	29.0		
PO 원숭이 3	30.04	1842	61.3	38.8	13.6

[표 3]

	IV	PO
용량/경로(mg/kg)	10	10
C_{max} (ng/mℓ)	6945.6±1886.0	217.7±132.1
T_{max} (hr)	0.25±0.00	2.00±1.00
AUC(ng/mℓ×hr)	8758.0±4212.9	1166.0±589.6
$T_{1/2}$ (hr)	7.9±5.4	10.3±4.1
CL(ℓ /hr/kg)	1.28±0.48	
V_{ss} (ℓ /kg)	2.09±0.54	
F(%)	13.8	

실시예 6: 골수 독성 분석

인간 골수 세포를 정상적인 건강한 자원자로부터 수집하고 단핵 집단을 Sommadossi J-P, Carlisle R. 'Toxicity of 3'-azido-3'-deoxythymidine and 9-(1,3-dihydroxy-2-propoxymethyl)guanine for normal human hematopoietic progenitor cells *in vitro* ' Antimicrobial Agents and Chemotherapy 1987; 31: 452-454; and Sommadossi J-P, Schinazi RF, Chu CK, Xie M-Y. 'Comparison of cytotoxicity of the (-)- and (+)-enantiomer of 2',3'-dideoxy-3'-thiacytidine in normal human bone marrow progenitor cells' Biochemical Pharmacology 1992; 44: 1921-1925에 의해 이미 기재된 바와 같은 피콜-하이팩 구배에 의해 분리하였다. CFU-GM 및 BFU-E에 대한 배양 분석을 이중층 소프트 아가 또는 메틸셀룰로스 방법을 이용하여 수행하였다. 약물을 조직 배양 배지에서 희석시키고 여과하였다. 14 내지 18 일후 37 ℃, 공기중 5% CO_2 의 습윤 대기에서 50 세포보다 큰 콜로니를 역상 현미경을 이용하여 계수하였다. 표 4의 결과를 용매 대조 배양과 비교한 약물 존재시 콜로니 형성의 퍼센트 저해로서 제시하였다.

[표 4]

처리	IC_{50} (μM)	
	CFU-GM	BFU-E

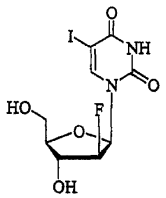
리바비린	5	1
β-D-2'-CH_3-리보A	>100	>100
β-D-2'-CH_3-리보U	>100	>100
β-D-2'-CH_3-리보C	>10	>10
β-D-2'-CH_3-리보G	>10	>100

실시예 7: 미토콘드리아 독성 분석

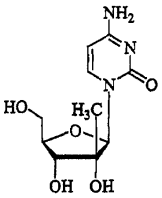
HepG2 세포를 상기한 바와 같이 12-웰 플레이트에서 배양하고 Pan-Zhou X-R, Cui L, Zhou X-J, Sommadossi J-P, Darley-Usmer VM. 'Differential effects of antiretroviral nucleoside analogs on mitochondrial function in HepG2 cells' Antimicrob Agents Chemother 2000; 44: 496-503에 교시된 바와 같이 다양한 농도의 약물에 노출시켰다. 약물 노출 4 일후 배양 배지에서 락트산 농도를 베링거 락트산 분석 키트를 사용하여 측정하였다. 락트산 농도를 헤모사이토미터 계수에 의해 측정된 세포수에 의해 정규화하였다. 이 분석의 일차적 결과를 표 5에 나타내었다.

[표 5]

	농도(μM)	락테이트(mg/10^6 세포)	대조의 %
대조		2.18	
FIAU	10	3.73	170.4
β-D-2'-CH_3-리보C	1	2.52	115.3
	10	2.36	107.9
	50	2.26	103.4
	100	2.21	101.2



FIAU



β-D-2'-CH_3-리보C

실시예 8: 세포독성 분석

세포를 96-웰 플레이트내의 증식 배지에 37 ℃, 습윤 CO_2 (5%) 대기에서 5×10^3 내지 5×10^4 /웰의 비율로 씨딩하였다. 그 후 계열 희석된 약물을 함유하는 새로운 증식 배지를 첨가하였다. 4 일간 인큐베이션한 후, 배양물을 50% TCA에서 고정하고 설포로다민 B로 염색하였다. 광학 밀도를 550 ㎚에서 판독하였다. 세포독성 농도를 세포수를 50 %로 감소시키는데 필요한 농도(CC_{50})로서 표현하였다. 그 결과를 표 6에 나타내었다.

[표 6]

화합물	CC_{50}, μM		
	MDBK	Huh7	HepG2
β-D-2'-CH_3-리보A	20	40	50-60
β-D-2'-CH_3-리보U	>250	>250	>250
β-D-2'-CH_3-리보C	100	>250	150

β-D-2'-CH $_3$ -리보G	100	>250	>250
리바비린	5	25	150

실시예 9: 세포 보호 분석(CPA)

분석을 필수적으로 Baginski, S.G.; Pevear, D.C.; Seipel, M.; Sun, S. C. C.; Benetatos, C. A.; Chunduru, S. K.; Rice, C. M. and M. S. Collett 'Mechanism of action of a pestivirus antiviral compound' PNAS USA 2000, 97(14), 7981-7986에 기재된 바와 같이 수행하였다. MDBK 세포(ATCC)를 사용 24 시간전 96-웰 배양 플레이트로 씨딩하였다(웰당 4,000 세포). BVDV(NADL주, ATCC)를 세포당 0.02 플라크 형성 단위(PFU)의 감염 다중도(MOI)로 감염시킨 후, 계열 희석된 시험 화합물을 증식 배지에 0.5% DMSO의 최종 농도로 감염 및 비감염 세포에 가하였다. 각각의 희석물을 4배수로 시험하였다. 실험에 걸쳐 연속적인 세포 증식을 보장하고 감염 4 일후 무처리 대조군에서 90% 초과의 바이러스-유도된 세포 파괴를 달성하도록 세포 밀도 및 바이러스 접종물을 조정하였다. 4 일후, 플레이트를 50% TCA로 고정하고 설포로다민 B로 염색하였다. 웰의 광학 밀도를 마이크로플레이트 리더로 550 ㎚에서 판독하였다. 50% 유효 농도(EC $_{50}$) 값을 바이러스의 세 포변성 효과를 50% 감소시키는 화합물의 농도로 정의하였다. 그 결과를 표 7에 나타내었다. 도 4 및 5는 β-D-2'-CH $_3$ -리보G 및 리바비린의 50% 유효농도(EC $_{50}$)에 도달하는데 사용한 방법을 그래프로 보여주는 것이다. 도 6은 β-D-2'-CH $_3$ -리보G, β-D-2'-CH $_3$ -리보C, β-D-2'-CH $_3$ -리보U, β-D-2'-CH $_3$ -리보A 및 리바비린의 CPA 결과를 비교한 것이다.

[표 7]

	EC $_{50}$ (μM)	CC $_{50}$ (μM)
β-D-2'-CH $_3$ -리보A	2	20
β-D-2'-CH $_3$ -리보U	20	>250
β-D-2'-CH $_3$ -리보C	2	100
β-D-2'-CH $_3$ -리보G	4	100
리바비린	>3	5

실시예 10: 플라크 감소 분석

각각의 화합물에 대하여 유효 농도를 이중 24-웰 플레이트에서 플라크 감소 분석에 의해 측정하였다. 세포 단일층을 100 PFU/웰의 바이러스로 감염시켰다. 그 후, 2% 불활성화 혈청 및 0.75% 메틸 셀룰로스 함유 MEM에서 계열 희석된 시험 화합물을 단일층에 가하였다. 배양물을 37 ℃에서 3 일간 더 인큐베이션한 후, 50% 에탄올 및 0.8% 크리스탈 바이올렛으로 고정하고 세척 및 공기-건조시켰다. 그 후 플라크를 계수하여 90% 바이러스 억제를 얻는 농도를 측정하고 표 8에 나타내었다. 도 7은 플라크 감소 분석의 결과를 그래프로 나타낸 것이다. 도 8은 증 가하는 농도의 β-D-2'-CH $_3$ -리보U 존재하에 BVDV 플라크 형성의 영상이다.

[표 8]

	EC $_{90}$ (μM)
β-D-2'-CH3-리보A	<3
β-D-2'-CH3-리보U	<81
β-D-2'-CH3-리보C	<9
β-D-2'-CH3-리보G	<9

실시예 11: 수율 감소 분석

각각의 화합물에 대하여 바이러스 로드를 6-로그 감소시키는 농도를 수율 감소 분석에 의해 이중 24-웰 플레이트에서 측정하였다. 분석을 Baginski, S.G.; Pevear, D.C.; Seipel, M.; Sun, S. C. C.; Benetatos, C. A.; Chunduru, S. K.; Rice, C. M. and M. S. Collett 'Mechanism of action of a pestivirus antiviral compound' PNAS USA 2000, 97(14), 7981-7986에 기재된 바와 같이 약간 변형하여 수행하였다. 간략하게는, MDBK 세포(ATCC)를 세포당 0.1 PFU의 감염 다중도(MOI)로 BVDV(NADL주)를 감염시키기 24 시간전 24-웰 플레이트로 접종하였다(웰당 2×10^{5} 세포). 계열 희석된 시험 화합물을 증식 배지에 0.5% DMSO의 최종 농도로 감염 및 비감염 세포에 가하였다. 각각의 희석물을 3배수로 시험하였다. 3 일후 세포 배양물(세포 단일층 및 상등액)을 3 회의 동결-해동 사이클에 의해 용균시키고, 바이러스 수율을 플라크 분석에 의해 정량하였다. 간략하게는, MDBK 세포를 사용 24 시간전에 6-웰 플레이트(웰당 5×10^{5} 세포)로 씨딩하였다. 세포를 1 시간동안 0.2 ㎖의 시험 용균물로 접종하고 증식 배지에 0.5% 아가로스로 중층하였다. 3 일후, 세포 단일층을 3.5% 포름알데히드로 고정하고 1% 크리스탈 바이올렛(50% 에탄올에서의 w/v)으로 염색하여 플라크를 가시화하였다. 표 9에 나타낸 바와 같이 플라크를 계수하여 바이러스 로드가 6-로그 감소하는 농도를 측정하였다. 도 9는 수율 감소 분석의 결과를 그래프로 나타낸 것이다. 도 8은 증가하는 농도의 β-D-2'-CH_3-리보C 존재하에 BVDV 수율 감소의 영상이다.

[표 9]

	6-로그 감소의 농도(μM)
β-D-2'-CH_3-리보U	120
β-D-2'-CH_3-리보G	120
β-D-2'-CH_3-리보C	20
β-D-2'-CH_3-리보U	9

실시예 12: 비교 세포독성

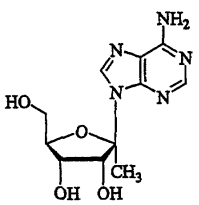
표 10은 다양한 세포 시스템에서 본 발명의 두 화합물, β-D-1'-CH_3-리보A 및 β-D-2'-CH_3-리보A의 세포독성을 RBV('리바비린')과 비교하여 요약한 것이다.

[표 10]

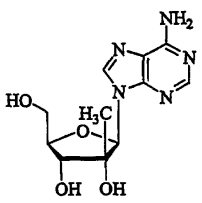
	BD	BHK	VERO	MT-4
β-D-1'-CH_3-리보A	>100	200	>100	18
β-D-2'-CH_3-리보A	75	22	22	6.6
RBV	ND	50	11	ND

* 세포 생존도를 50% 감소시키는데 필요한 화합물 농도(μM)

β-D-1'-CH_3-리보A와 β-D-2'-CH_3-리보A의 화학구조는 아래와 같다:



β-D-1'-CH_3-리보A



β-D-2'-CH_3-리보A

표 11은 플라비바이러스와 페스티바이러스 속에 속하는 몇몇 바이러스에 대한 β-D-1'-CH_3-리보A와 β-D-2'-CH_3-리보A의 항바이러스 활성을 요약한 것이다.

[표 11]

	BVDV	YFV	PICO	VSV	HIV-1
β-D-1'-CH_3-리보A	10	7.0	51	>100	>18
β-D-2'-CH_3-리보A	0.1	0.2	5.0	>100	>6.6
RBV	ND	30	>30	ND	ND

* 플라크 수를 50% 감소시키는데 필요한 화합물 농도(μM). 아래 바이러스-세포 시스템을 사용하였다: BVDC-BT, YFV-BHK, PICO(콕사키 B1 및 폴리오 사빈)/VSV-Vero.

표 12는 플라비바이러스와 페스티바이러스 속에 속하는 한쌍의 바이러스에 대한 β-D-2'-메틸-리보G, β-D-2'-메틸-리보C 및 β-D-2'-메틸-리보U의 항바이러스 활성 및 독성을 요약한 것이다.

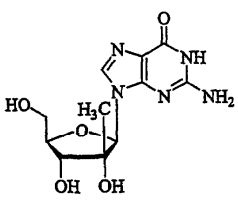
[표 12]

	BVDV		YFV	
	EC_{50} *	CC_{50} **	EC_{50} *	CC_{50} **
β-D-2'-CH_3-리보G	2	>100	1.2	20
β-D-2'-CH_3-리보C	3.7	>100	70	>100
β-D-2'-CH_3-리보U	20	>100	33	>100

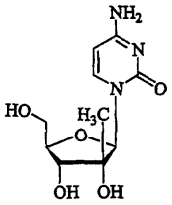
* 플라크 수를 50% 감소시키는데 필요한 화합물 농도(μM). 아래 바이러스-세포 시스템을 사용하였다: BVDC-BT 및 YFV-BHK.

** 세포 생존도를 50% 감소시키는데 필요한 화합물 농도(μM).

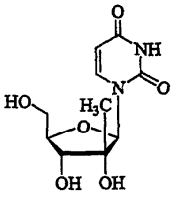
β-D-2'-CH_3-리보G, β-D-2'-CH_3-리보C 및 β-D-2'-CH_3-리보U의 화학구조는 아래와 같다:



β-D-2'-CH_3-리보G



β-D-2'-CH_3-리보C



β-D-2'-CH_3-리보U

표 13은 3 가지 상이한 분석에서 BVDV에 대한 본 발명의 몇몇 화합물의 항바이러스 활성을 요약한 것이다.

[표 13]

화합물	세포 보호 (EC_{50}, μM)	플라크 감소 (EC_{90}, μM)	수율 감소		세포독성 Huh7 세포 (EC_{50}, μM)
			EC_{90}, μM	6$\log_{10}$ 감소(μM)	
β-D-2'-CH_3-리보A	2	<3	<2	9	50
β-D-2'-CH_3-리보T	>250	ND	ND	ND	>250

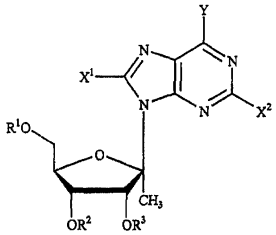
β-D-2'-CH_3-리보U	20	<81	24	120	>250
β-D-2'-CH_3-리보C	2	<9	<4	20	>250
β-D-2'-CH_3-리보G	4	<9	3	20	>250
β-D-2'-CH_3-리보I	45	ND	ND	ND	>250
리바비린	>3	>200	>20	독성	20

본 발명을 그의 바람직한 예를 들어 기재하였다. 본 발명의 변화 및 변형은 상기 본 발명의 상세한 설명으로부터 당업자에게 자명할 것이다.

(57) 청구의 범위

청구항 1.

화학식 I의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

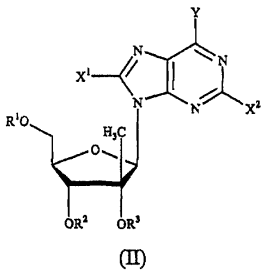
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이며;

X^1 및 X^2는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 2.

화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(II)

상기 식에서,

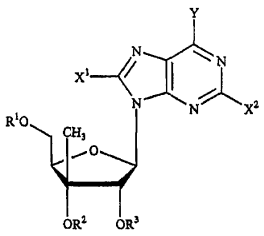
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 3.
화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(III)

상기 식에서,

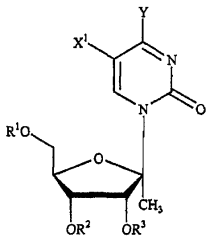
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 4.
화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(IV)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

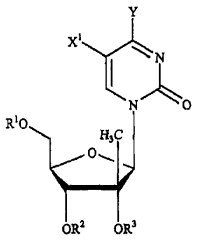
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 5.

화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(V)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

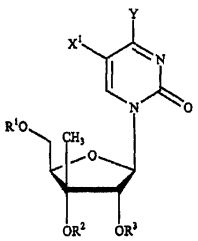
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 6.

화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

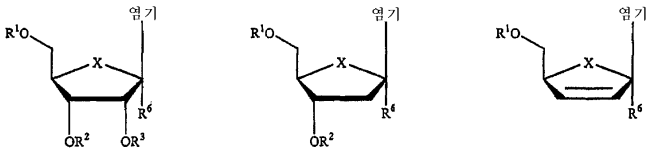
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 7.

화학식 VII, VIII 및 IX로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

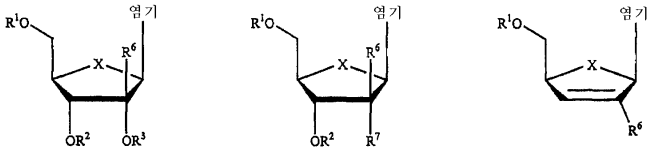
R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 8.

화학식 X, X I 및 X II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(X) (XI) (XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진

아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

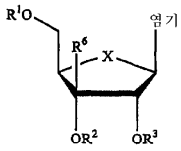
R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

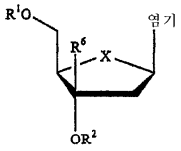
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 9.

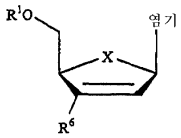
화학식 XIII, XIV 및 XV로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

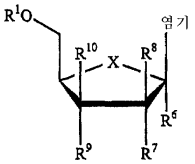
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 10.

화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴

의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

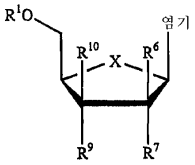
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 11.
화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

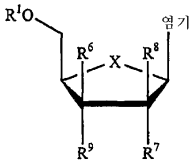
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 12.
화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케 닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

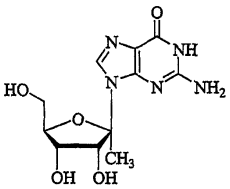
R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

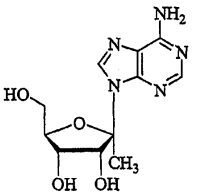
청구항 13.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



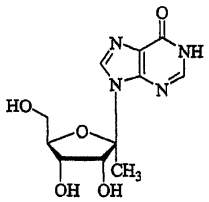
청구항 14.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:

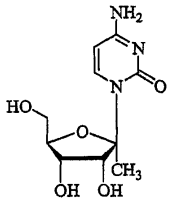


청구항 15.

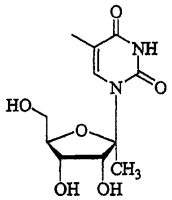
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



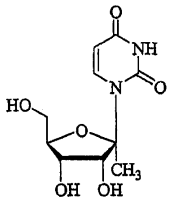
청구항 16.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



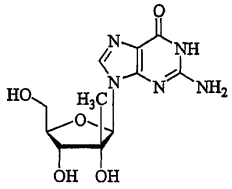
청구항 17.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



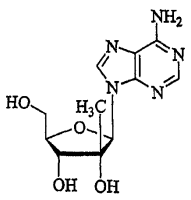
청구항 18.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



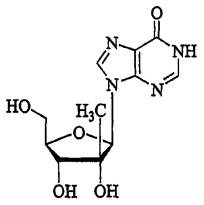
청구항 19.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



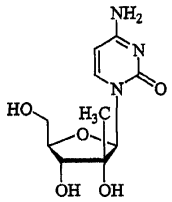
청구항 20.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



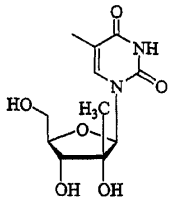
청구항 21.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



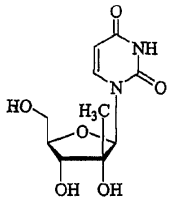
청구항 22.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



청구항 23.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:



청구항 24.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염:

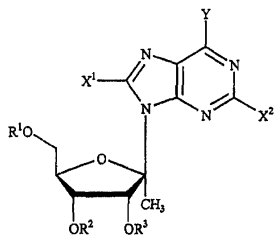


청구항 25.
제1항 내지 제24항중 어느 한 항에 있어서, 복용 단위 형태인 화합물.

청구항 26.
제25항에 있어서, 복용 단위가 10 내지 1500 ㎎의 화합물을 함유하는 화합물.

청구항 27.
제25항 또는 제26항에 있어서, 복용 단위가 정제나 캅셀제인 화합물.

청구항 28.
유효량의 화학식 Ⅰ의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학 적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

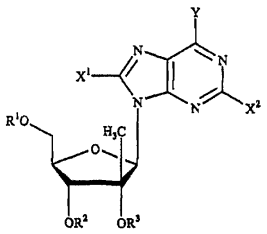
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 29.

유효량의 화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(II)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

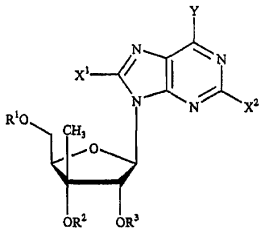
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 30.

유효량의 화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(III)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

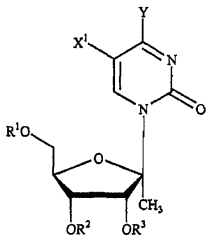
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 31.

유효량의 화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(IV)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

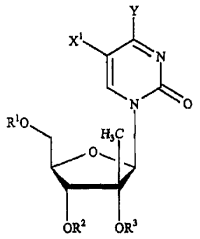
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 32.

유효량의 화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(V)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

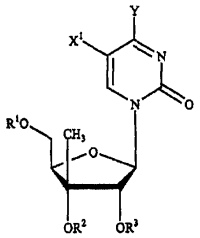
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 33.

유효량의 화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이며;

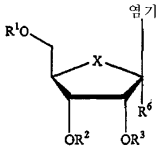
X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함

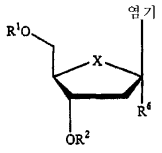
하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 34.

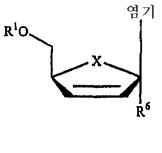
유효량의 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(VII)



(VIII)



(IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

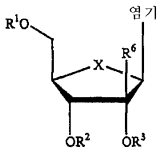
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

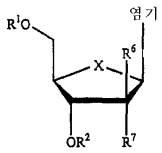
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 35.

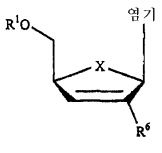
유효량의 화학식 X, XI 및 XII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(X)



(XI)



(XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

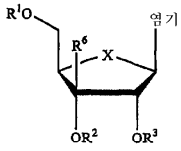
R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알 케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2,

NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

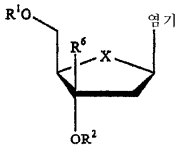
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 36.

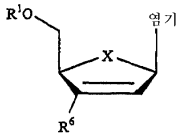
유효량의 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

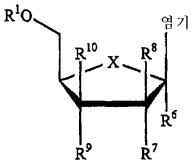
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함 하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 37.

유효량의 화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포 스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R ^{7} 및 R ^{9} 는 독립적으로 수소, OR ^{2} , 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이며;

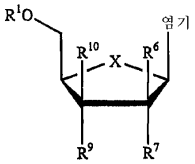
R ^{8} 및 R ^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R ^{7} 및 R ^{9} , R ^{7} 및 R ^{10} , R ^{8} 및 R ^{9} , 또는 R ^{8} 및 R ^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO $_{2}$, 또는 CH $_{2}$ 이다.

청구항 38.

유효량의 화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R ^{1} 및 R ^{2} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} 및 R ^{2} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R ^{6} 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이고;

R ^{7} 및 R ^{9} 는 독립적으로 수소, OR ^{2} , 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이며;

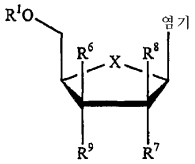
R ^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R ^{7} 및 R ^{9} , 또는 R ^{7} 및 R ^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO $_{2}$, 또는 CH $_{2}$ 이다.

청구항 39.

유효량의 화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R ^{1} 및 R ^{2} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} 및 R ^{2} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R ^{6} 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이고;

R ^{7} 및 R ^{9} 는 독립적으로 수소, OR ^{2} , 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키 닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO $_{2}$, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

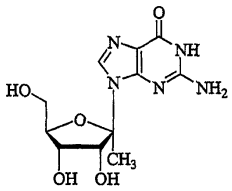
R ^{8} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R ^{7} 및 R ^{9} , 또는 R ^{8} 및 R ^{9} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO $_{2}$, 또는 CH $_{2}$ 이다.

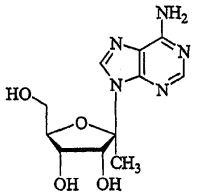
청구항 40.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



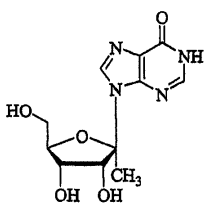
청구항 41.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



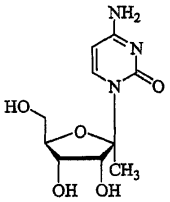
청구항 42.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



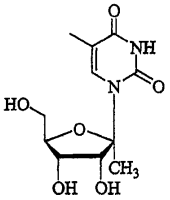
청구항 43.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



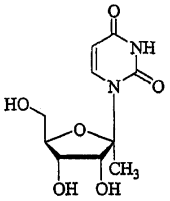
청구항 44.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학 적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



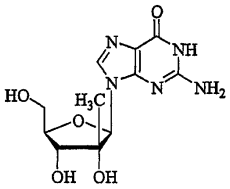
청구항 45.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



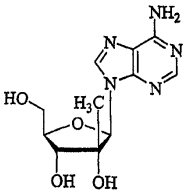
청구항 46.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



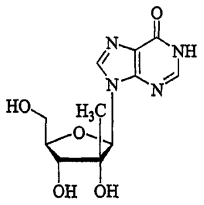
청구항 47.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



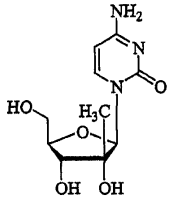
청구항 48.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



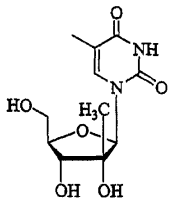
청구항 49.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



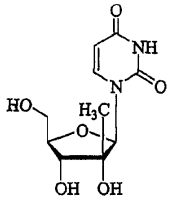
청구항 50.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



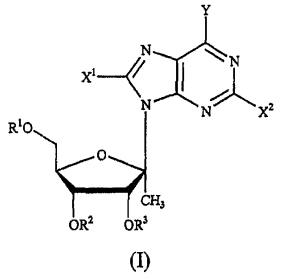
청구항 51.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



청구항 52.

유효량의 화학식 I 의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는

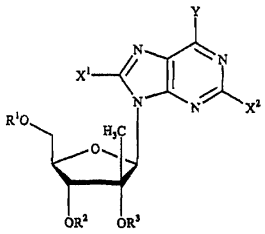
설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 53.
유효량의 화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(II)

상기 식에서,

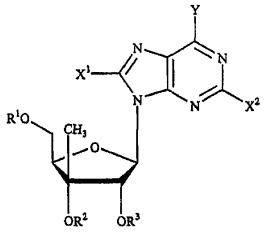
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 54.
유효량의 화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(III)

상기 식에서,

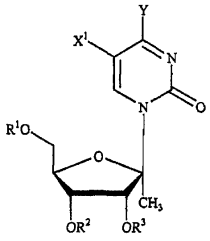
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 55.
유효량의 화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(IV)

상기 식에서,

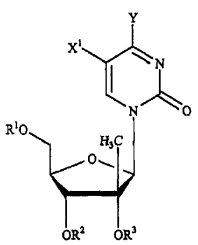
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 56.
유효량의 화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(V)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

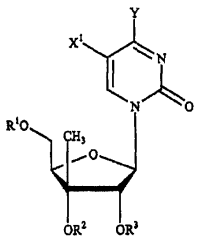
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 57.

유효량의 화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

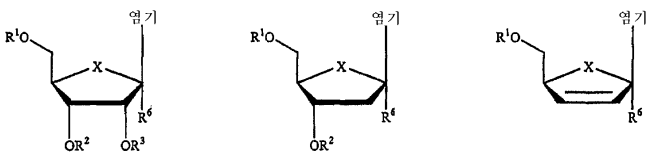
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 58.

유효량의 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

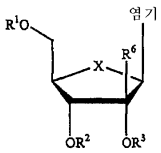
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

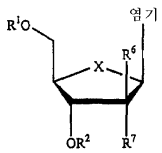
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 59.

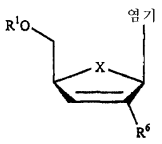
유효량의 화학식 X, XI 및 XII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(X)



(XI)



(XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

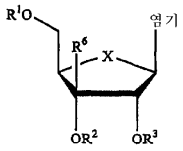
R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알 케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

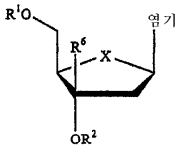
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 60.

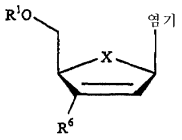
유효량의 화학식 XIII, XIV 및 XV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

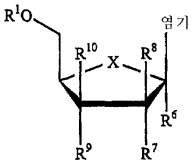
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함 하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 61.

유효량의 화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포 스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

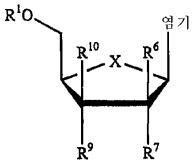
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 62.
유효량의 화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

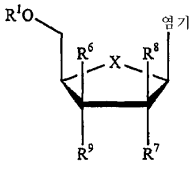
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 63.
유효량의 화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으

로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$이고;

R^7 및 R^9는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키 닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

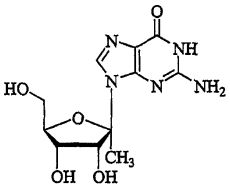
R^8은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2이다.

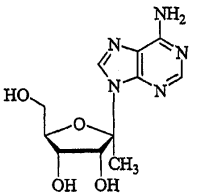
청구항 64.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



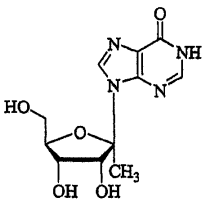
청구항 65.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



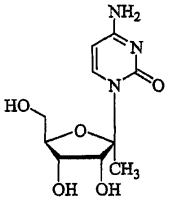
청구항 66.

유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:

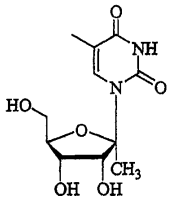


청구항 67.

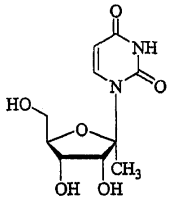
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



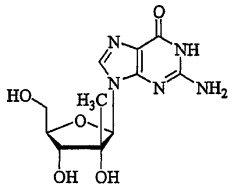
청구항 68.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



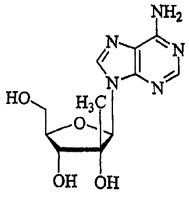
청구항 69.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



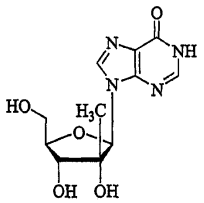
청구항 70.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



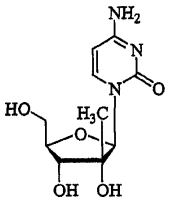
청구항 71.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



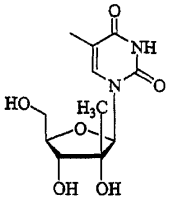
청구항 72.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



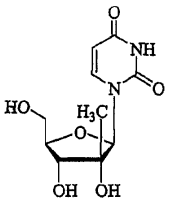
청구항 73.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



청구항 74.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:



청구항 75.
유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 치료 또는 예방용 약제학적 조성물:

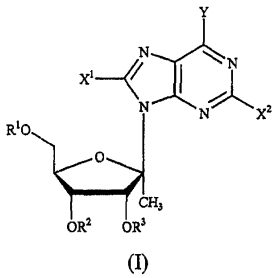


청구항 76.
제28항 내지 제75항중 어느 한 항에 있어서, 복용 단위 형태인 약제학적 조 성물.

청구항 77.
제76항에 있어서, 복용 단위가 10 내지 1500 ㎎의 화합물을 함유하는 약제학적 조성물.

청구항 78.
제75항 또는 제76항에 있어서, 복용 단위가 정제나 캅셀제인 약제학적 조성물.

청구항 79.
항바이러스 유효량의 화학식 I 의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용

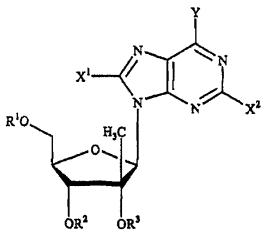
되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 80.
항바이러스 유효량의 화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(II)

상기 식에서,

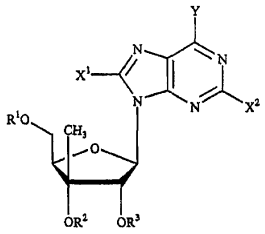
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 81.
항바이러스 유효량의 화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(III)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬

설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

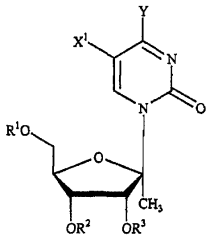
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 82.

항바이러스 유효량의 화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(IV)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴 알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

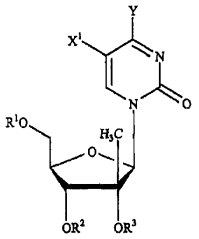
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 83.

항바이러스 유효량의 화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(V)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

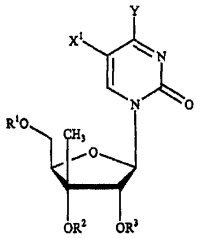
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 84.

항바이러스 유효량의 화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

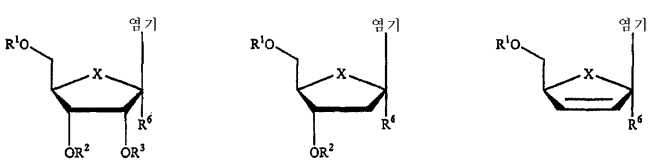
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 85.

항바이러스 유효량의 화학식 VII, VIII 및 IX의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

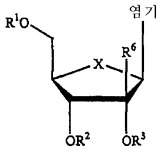
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

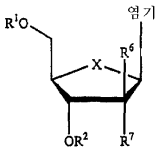
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 86.

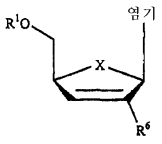
항바이러스 유효량의 화학식 X, XI 및 XII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(X)



(XI)



(XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

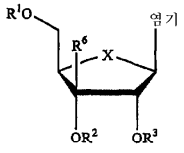
R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

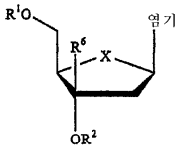
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 87.

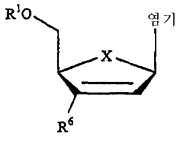
항바이러스 유효량의 화학식 XIII, XIV 및 XV로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

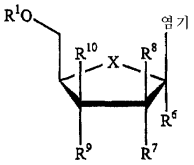
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 88.

항바이러스 유효량의 화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케 닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

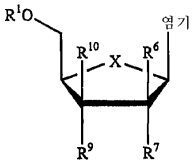
R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 89.

항바이러스 유효량의 화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R 1 및 R 2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R 1 및 R 2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R 6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO 2 , NH 2 , -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) 2 , -N(아실) 2 이고;

R 7 및 R 9 는 독립적으로 수소, OR 2 , 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO 2 , NH 2 , -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) 2 , -N(아실) 2 이며;

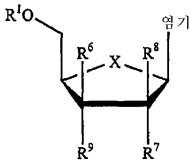
R 10 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R 7 및 R 9 , 또는 R 7 및 R 10 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO 2 , 또는 CH 2 이다.

청구항 90.

항바이러스 유효량의 화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R 1 및 R 2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R 1 및 R 2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R 6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO 2 , NH 2 , -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) 2 , -N(아실) 2 이고;

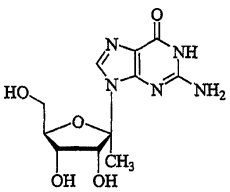
R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

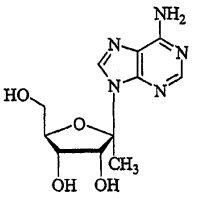
다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

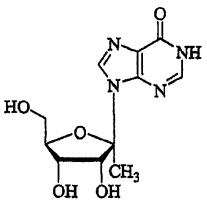
청구항 91.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



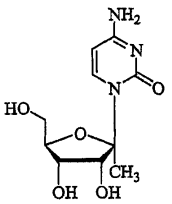
청구항 92.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



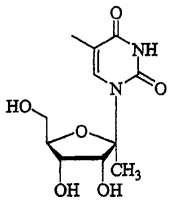
청구항 93.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



청구항 94.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:

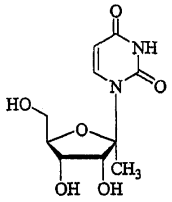


청구항 95.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



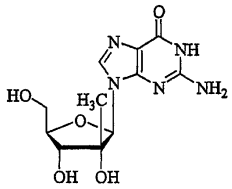
청구항 96.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



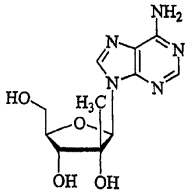
청구항 97.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



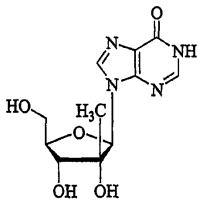
청구항 98.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



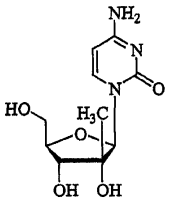
청구항 99.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



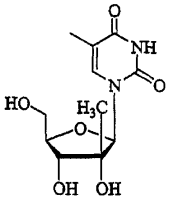
청구항 100.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



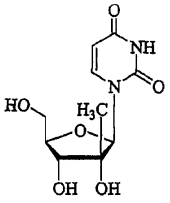
청구항 101.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



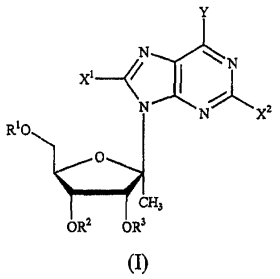
청구항 102.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



청구항 103.

항바이러스 유효량의 화학식 I 의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(I)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저 급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

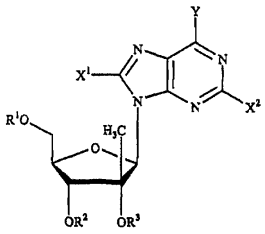
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 104.

항바이러스 유효량의 화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(II)

상기 식에서,

R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

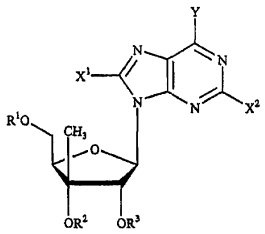
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 105.

항바이러스 유효량의 화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(III)

상기 식에서,

R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

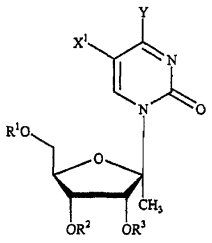
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 106.

항바이러스 유효량의 화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(IV)

상기 식에서,

R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

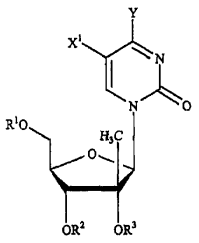
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4} , NR ^{4} R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 107.

항바이러스 유효량의 화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(V)

상기 식에서,

R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜

레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

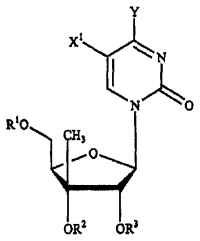
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 108.

항바이러스 유효량의 화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(VI)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

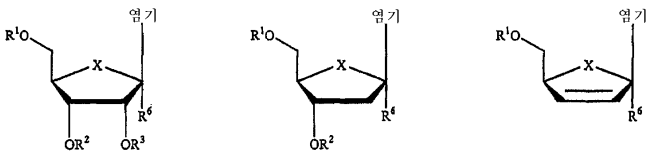
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 109.

항바이러스 유효량의 화학식 VII, VIII 및 IX로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

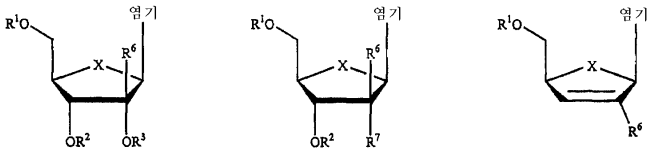
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의 에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 110.

항바이러스 유효량의 화학식 X, XI 및 XII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(X) (XI) (XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

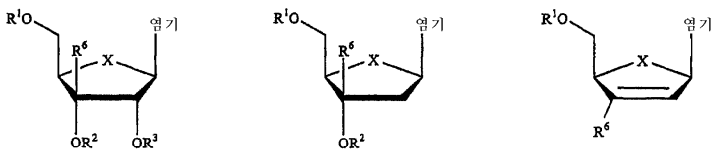
R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저 급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 111.

항바이러스 유효량의 화학식 XIII, XIV 및 XV로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XIII) (XIV) (XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

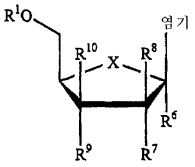
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 112.

항바이러스 유효량의 화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포 스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

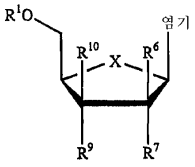
R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 113.

항바이러스 유효량의 화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R ^{1} 및 R ^{2} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하 는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} 및 R ^{2} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R ^{6} 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이고;

R ^{7} 및 R ^{9} 는 독립적으로 수소, OR ^{2} , 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이며;

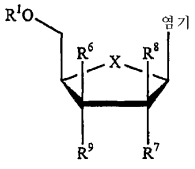
R ^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R ^{7} 및 R ^{9} , 또는 R ^{7} 및 R ^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO $_{2}$, 또는 CH $_{2}$ 이다.

청구항 114.

항바이러스 유효량의 화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것 을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R ^{1} 및 R ^{2} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1} 및 R ^{2} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R ^{6} 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO $_{2}$, NH $_{2}$, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬) $_{2}$, -N(아실) $_{2}$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

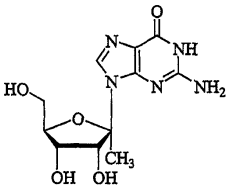
R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

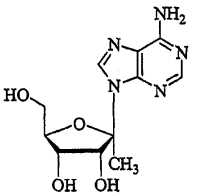
청구항 115.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



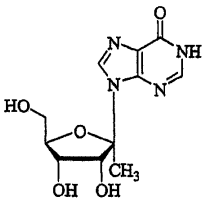
청구항 116.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



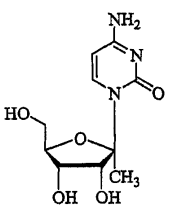
청구항 117.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



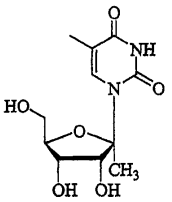
청구항 118.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



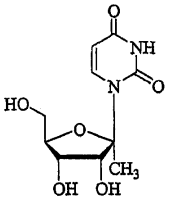
청구항 119.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



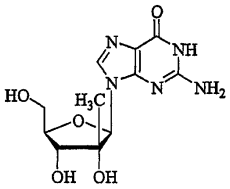
청구항 120.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



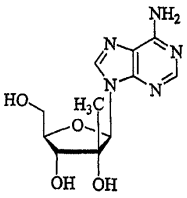
청구항 121.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



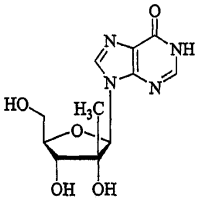
청구항 122.

항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:

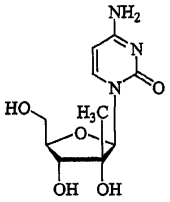


청구항 123.

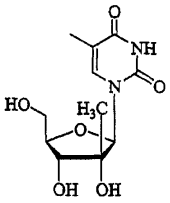
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방 법:



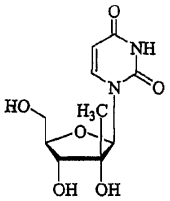
청구항 124.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



청구항 125.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:



청구항 126.
항바이러스 유효량의 하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 하나 이상의 다른 항바이러스 활성 약제와 함께 또는 교대로 투여하는 것을 포함하는, 숙주의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스 감염의 치료 또는 예방방법:

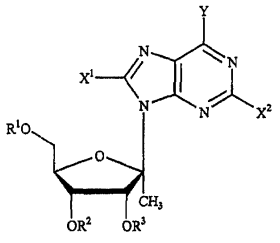


청구항 127.
제79항 내지 제126항중 어느 한 항에 있어서, 화합물이 복용 단위 형태인 치료방법.

청구항 128.
제127항에 있어서, 복용 단위가 10 내지 1500 ㎎의 화합물을 함유하는 치료방법.

청구항 129.
제127항 또는 제128항에 있어서, 복용 단위가 정제나 캅셀제인 치료방법.

청구항 130.
화학식 Ⅰ의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(I)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

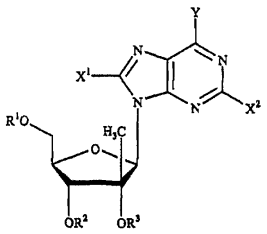
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아 릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 131.

화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(II)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

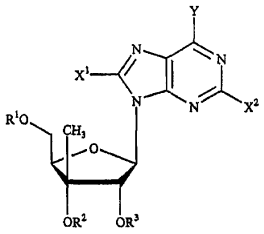
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 132.

화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(III)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

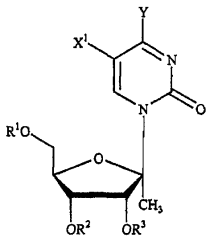
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 및 X ^{2} 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 133.

화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(IV)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

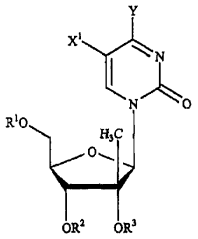
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 134.

화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(V)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

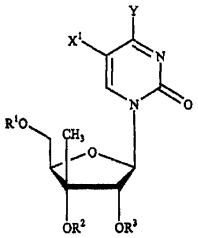
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 135.

화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(VI)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

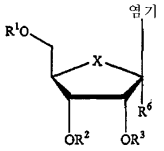
X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함

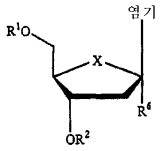
하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 136.

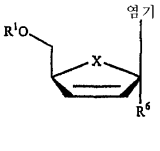
유효량의 화학식 VII, VIII 및 IX로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(VII)



(VIII)



(IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

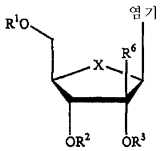
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함 하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

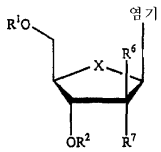
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 137.

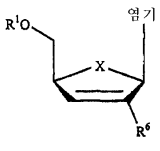
유효량의 화학식 X, XI 및 XII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(X)



(XI)



(XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

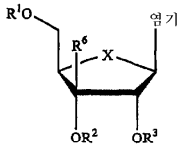
R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2,

NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

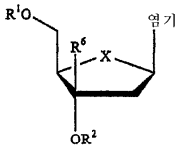
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 138.

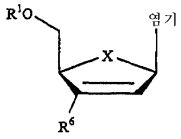
화학식 XIII, XIV 및 XV로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

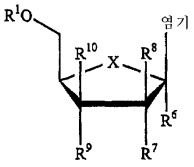
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 139.

화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

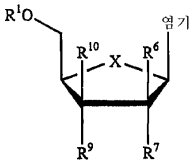
R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 140.

화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

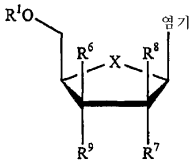
R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 141.

화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알 킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

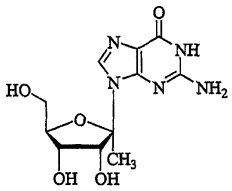
R^8 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

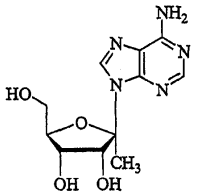
청구항 142.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



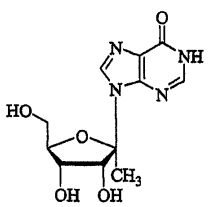
청구항 143.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



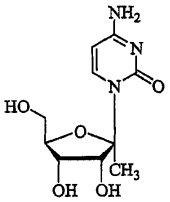
청구항 144.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



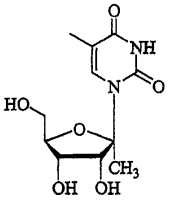
청구항 145.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



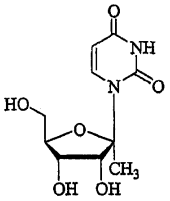
청구항 146.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



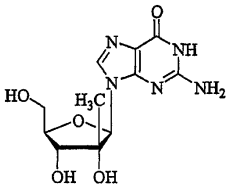
청구항 147.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



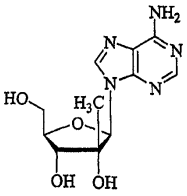
청구항 148.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



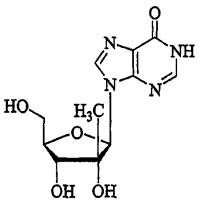
청구항 149.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



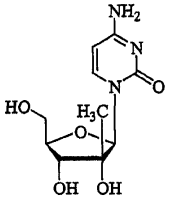
청구항 150.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



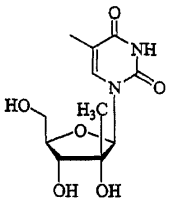
청구항 151.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



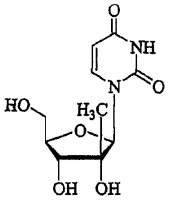
청구항 152.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



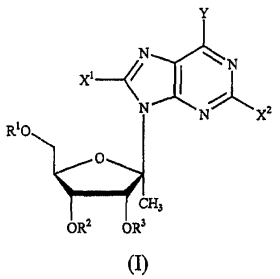
청구항 153.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방을 위한 용도:



청구항 154.

화학식 I 의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(I)

상기 식에서,

R ^{1} , R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H, 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는

설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

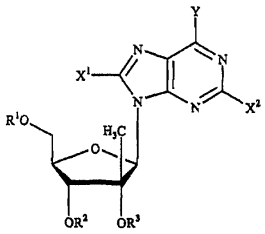
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 155.

화학식 II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(II)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

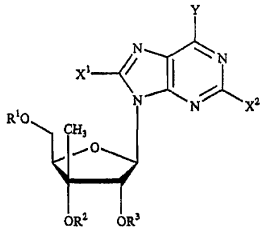
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 156.

화학식 III의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(III)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여 시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

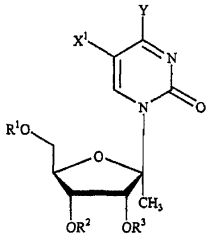
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 및 X^2 는 독립적으로 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 157.

화학식 IV의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(IV)

상기 식에서,

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노-, 디- 또는 트리포스페이트 및 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저 급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

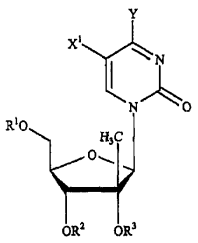
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이며;

X^1 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR^4, NR^4R^5 또는 SR^4 이고;

R^4 및 R^5 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 158.

화학식 V의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(V)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

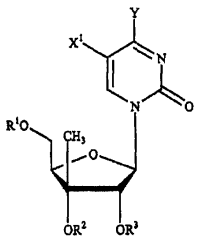
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에 틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 159.

화학식 VI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(VI)

상기 식에서,

R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R ^{1}, R ^{2} 및 R ^{3} 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이고;

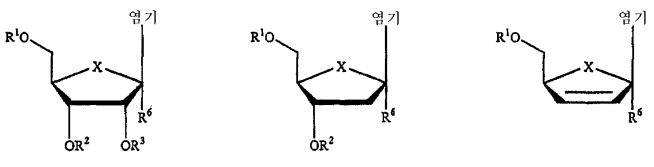
Y는 수소, 브로모, 클로로, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이며;

X ^{1} 은 H, 직쇄, 분지쇄 또는 사이클릭 알킬, CO-알킬, CO-아릴, CO-알콕시알킬, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, OR ^{4}, NR ^{4}R ^{5} 또는 SR ^{4} 이고;

R ^{4} 및 R ^{5} 는 독립적으로 수소, 아실(저급 아실을 포함함), 또는 알킬(메틸, 에틸, 프로필 및 사이클로프로필을 포함하지만 이들로 제한되지는 않음)이다.

청구항 160.

화학식 VII, VIII 및 IX로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(VII) (VIII) (IX)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

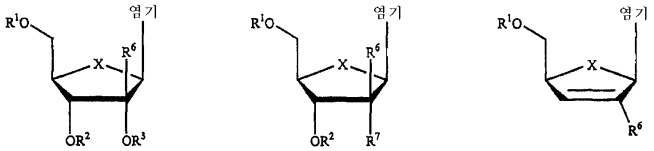
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함 하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, 2-Br-에틸, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), CF_3, 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 161.

화학식 X, X I 및 X II의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(X) (XI) (XII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트 리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

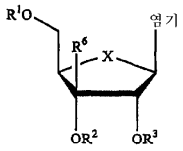
R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 은 수소, OR^3, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

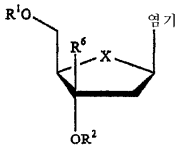
X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 162.

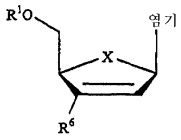
화학식 X III, X IV 및 X V로부터 선택되는 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(XIII)



(XIV)



(XV)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

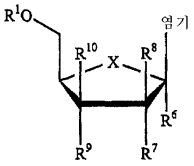
R^1, R^2 및 R^3 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1, R^2 및 R^3 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 163.

화학식 XVI의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(XVI)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학 적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

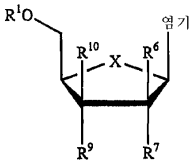
R^8 및 R^{10} 은 독립적으로 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, R^7 및 R^{10}, R^8 및 R^9, 또는 R^8 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 164.

화학식 XVII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용 도:



(XVII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6 는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이고;

R^7 및 R^9 는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 염소, 브롬, 요오드, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$ 이며;

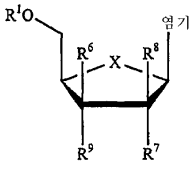
R^{10} 은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^7 및 R^{10} 은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2 이다.

청구항 165.

화학식 XVIII의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



(XVIII)

상기 식에서,

염기는 본 명세서에 정의된 퓨린 또는 피리미딘 염기이고;

R^1 및 R^2 는 독립적으로 H; 포스페이트(모노포스페이트, 디포스페이트, 트리포 스페이트, 또는 안정화된 포스페이트 프로드럭을 포함함); 아실(저급 아실을 포함함); 알킬(저급 알킬을 포함함); 페닐 그룹은 본 명세서에 주어진 아릴의 정의에 기재된 하나 이상의 치환체로 임의로 치환되는, 메탄설포닐 및 벤질을 포함하는 알킬 또는 아릴알킬 설포닐을 포함하는 설포네이트 에스테르; 포스포리피드를 포함하는 리피드; 아미노산; 카보하이드레이트; 펩티드; 콜레스테롤; 또는 생체내 투여시 R^1 및 R^2 가 독립적으로 H 또는 포스페이트인 화합물을 제공할 수 있는 다른 약제학적으

로 허용되는 이탈 그룹이며;

R^6는 수소, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 아지도, 시아노, 알케닐, 알키닐, Br-비닐, -C(O)O(알킬), -C(O)O(저급 알킬), -O(아실), -O(저급 아실), -O(알킬), -O(저급 알킬), -O(알케닐), 클로로, 브로모, 플루오로, 요오도, NO_2, NH_2, -NH(저급 알킬), -NH(아실), -N(저급 알킬)$_2$, -N(아실)$_2$이고;

R^7 및 R^9는 독립적으로 수소, OR^2, 하이드록시, 알킬(저급 알킬을 포함함), 알케닐, 알키닐, Br-비닐, O-알케닐, 염소, 브롬, 요오드, NO_2, 아미노, 저급알킬아미노, 또는 디(저급알킬)아미노이며;

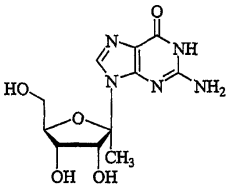
R^8은 H, 알킬(저급 알킬을 포함함), 염소, 브롬, 또는 요오드이고;

다르게는, R^7 및 R^9, 또는 R^8 및 R^9은 함께 결합을 형성할 수 있으며;

X는 O, S, SO_2, 또는 CH_2이다.

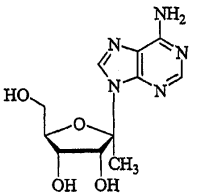
청구항 166.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



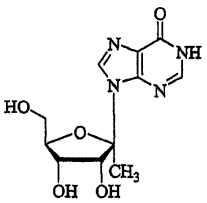
청구항 167.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



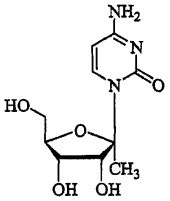
청구항 168.

하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:

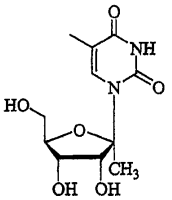


청구항 169.

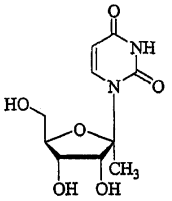
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



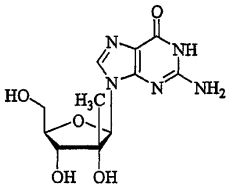
청구항 170.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



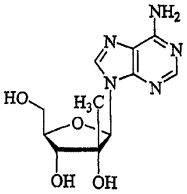
청구항 171.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



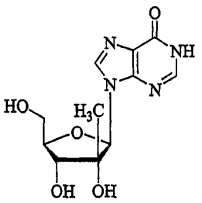
청구항 172.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



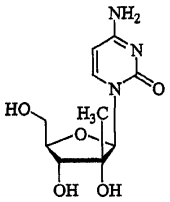
청구항 173.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



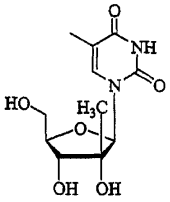
청구항 174.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



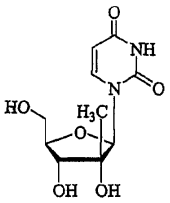
청구항 175.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



청구항 176.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



청구항 177.
하기 구조의 화합물 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염의 플라비바이러스 또는 페스티바이러스로 감염된 숙주의 치료 또는 예방용 약제의 제조를 위한 용도:



청구항 178.
제130항 내지 제177항중 어느 한 항에 있어서, 화합물이 복용 단위 형태인 화합물의 용도.

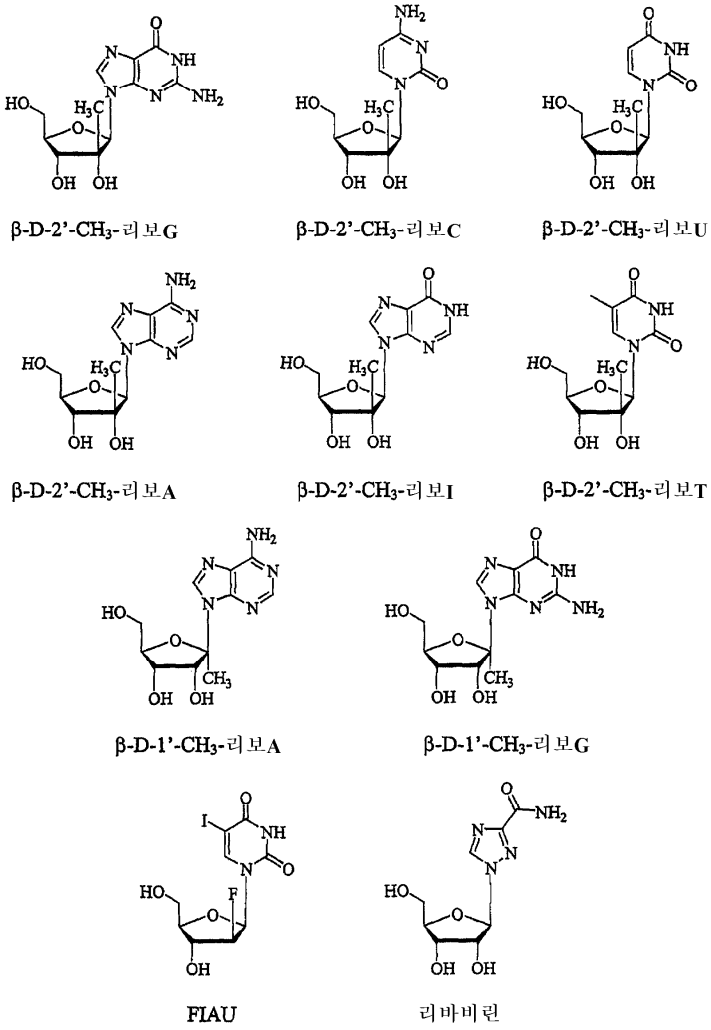
청구항 179.
제178항에 있어서, 복용 단위가 10 내지 1500 ㎎의 화합물을 함유하는 화합물의 용도.

청구항 180.
제178항 또는 제179항에 있어서, 복용 단위가 정제나 캅셀제인 화합물의 용도.

도면

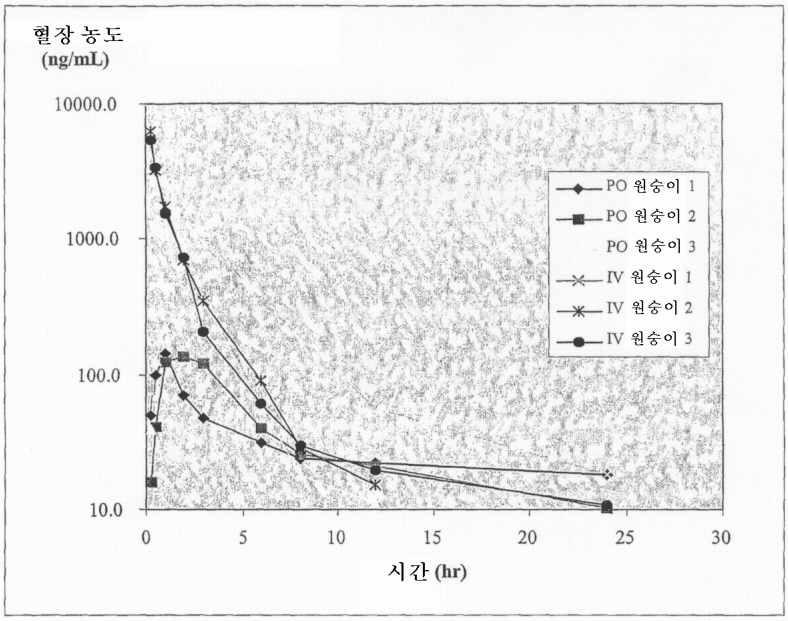
도면1

예시 뉴클레오사이드의 화학구조



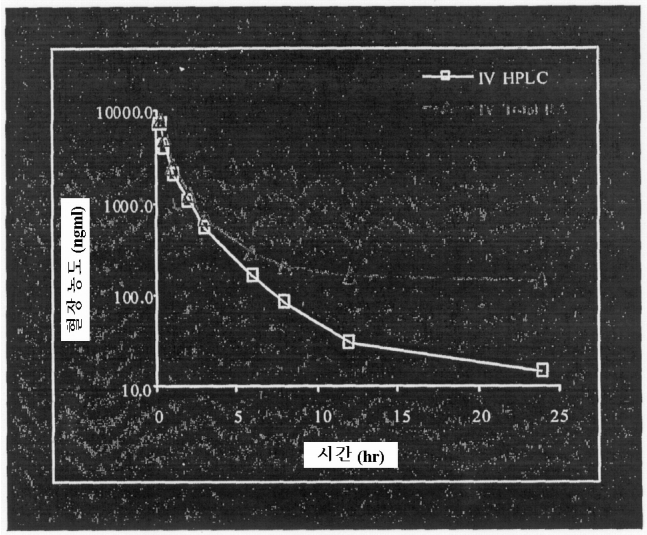
도면2

사이노몰거스 원숭이에서 β -D-2'-CH3 -리보G의 약물동력학의 스크리닝

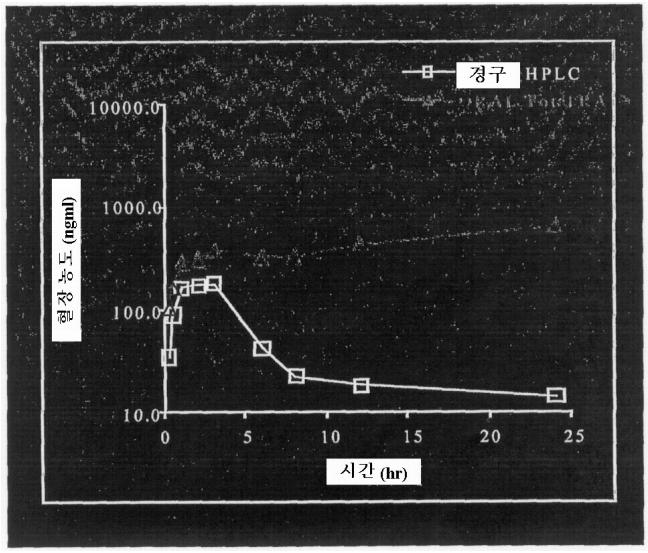


도면3a

사이노몰거스 원숭이에서 β -D-2'-CH_3 -리보G의 약물동력학

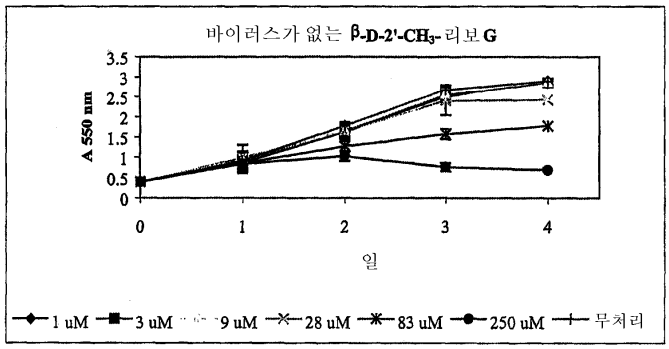


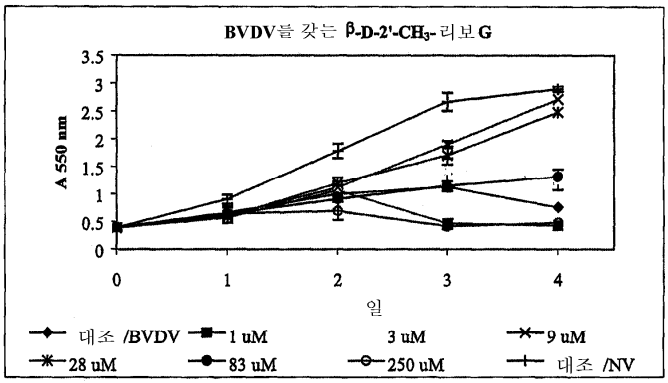
도면3b



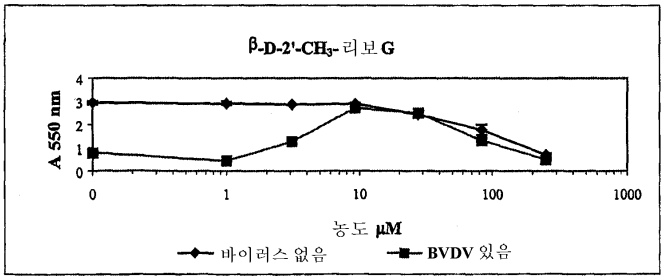
도면4

β -D-2'-CH_3 -리보G의 세포 보호 에세이 (CPA)



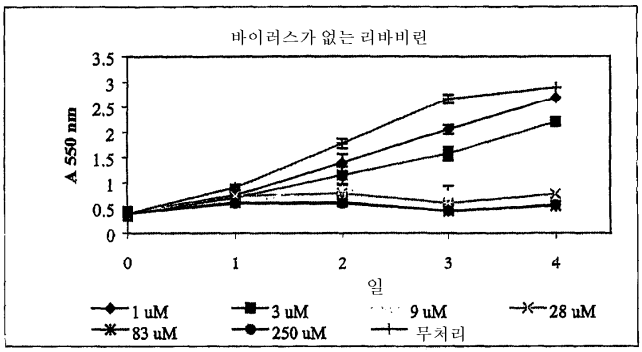


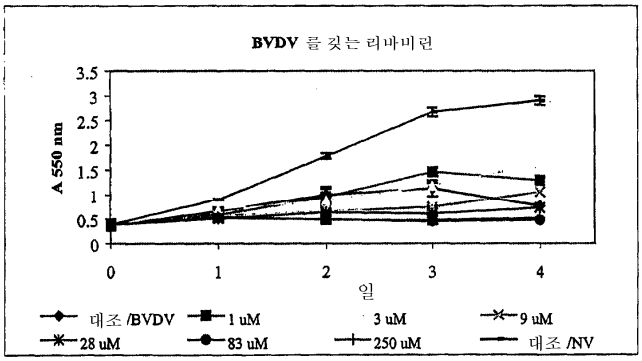
세포 보호 에세이



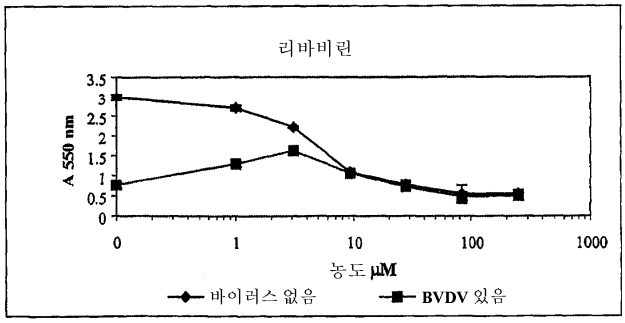
도면5

리바비린의 BVDV 세포 보호 에세이 (CPA)



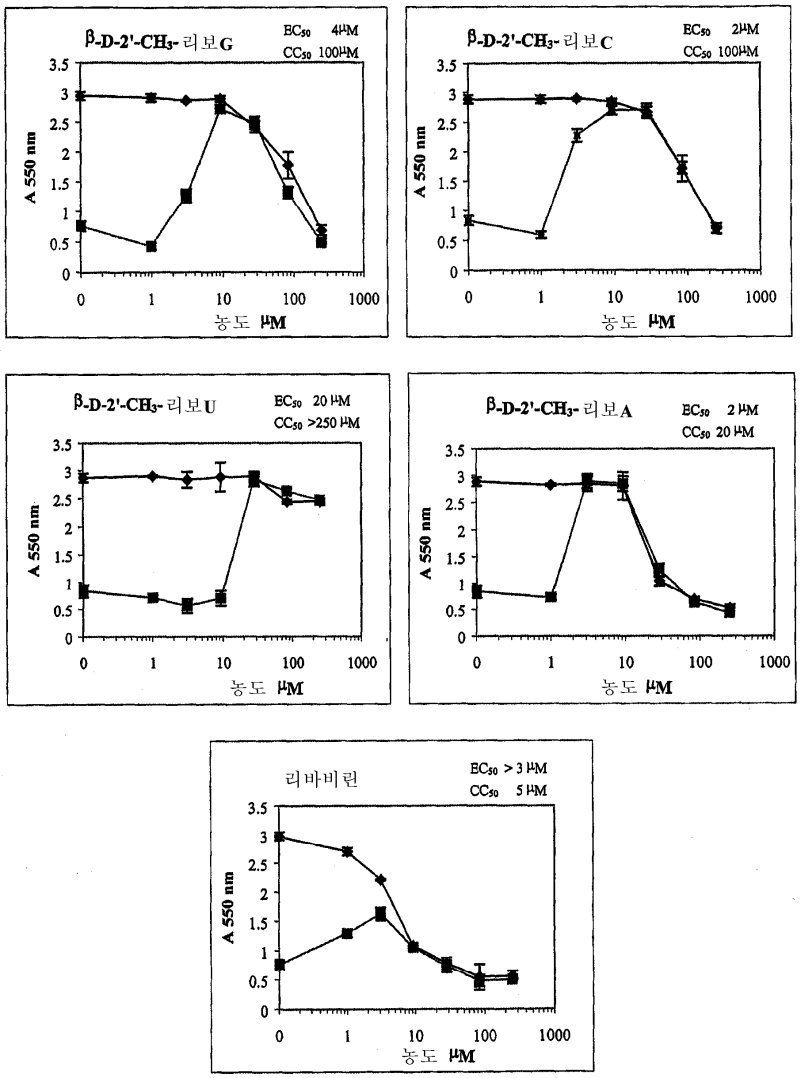


세포 보호 에세이



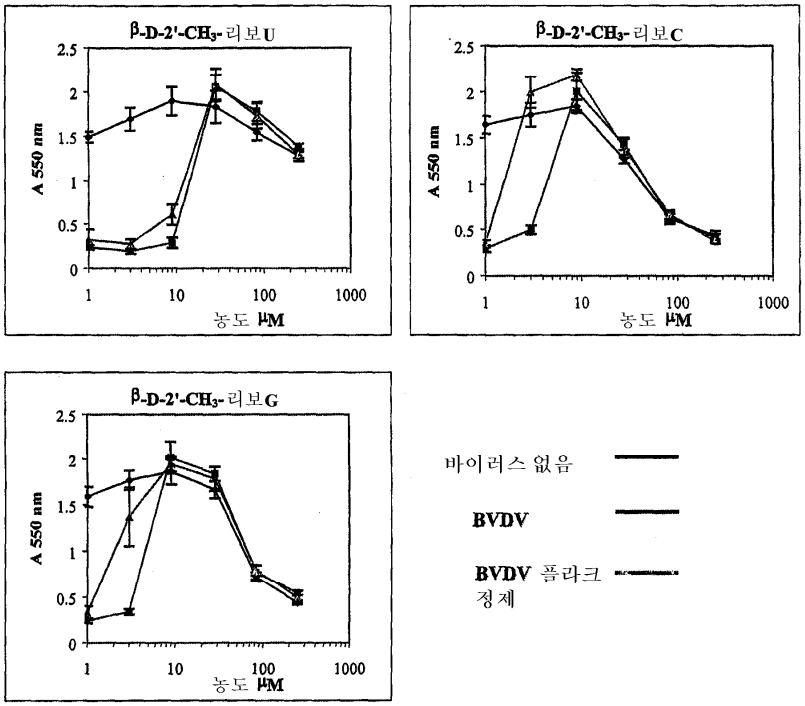
도면6

BVDV 세포 보호 에세이



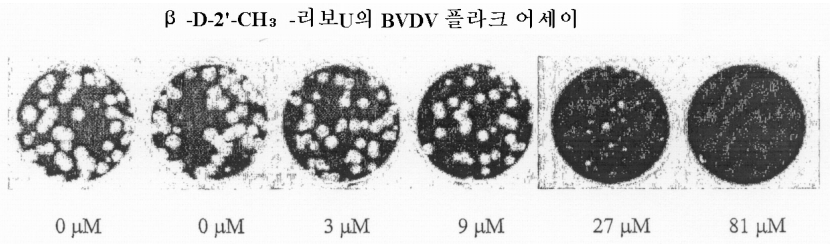
도면7

플라크 정제된 **BVDV**



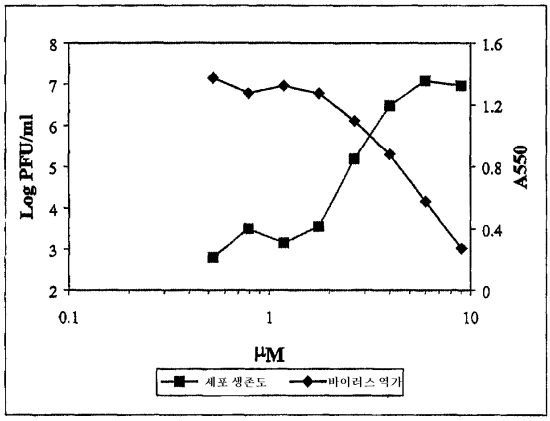
도면8

β -D-2'-CH₃ -리보U의 BVDV 플라크 어세이



도면9

β -D-2'-CH₃ -리보G의 수율 감소 어세이



9 μM 에서의 4-로그 바이러스 감소

도면10

β -D-2'-CH_3 -리보C의 BVDV 수율 감소 어세이

