

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.⁶

C07H 19/01

(11) 공개번호 특1995-0000727

(43) 공개일자 1995년01월03일

(21) 출원번호 특 1994-0012618

(22) 출원일자 1994년06월04일

(30) 우선권주장	9311682.0	1993년06월05일	영국(GB)
------------	-----------	-------------	--------

(71) **출원인** 시바-가이키 에이지 베르너 발데그

(72) 발명자 안토니 데이비드 박스터

스위스연방 4002 바슬 클리벡슈트라세 141

영국 체서 노쓰위치 레프트위치 그린 라임 애브뉴 52

에릭 케이쓰 베일리스

영국 체서 스톡포트 애비 그로브 18

스티븐 폴 콜링우드

영국 볼튼 웨스트하우톤 더 호스커스 로즈우드 39

로저 존 테일러

영국 맨체스터 스트레트포드 스텔어트 로오드 14

존 위트만

영국 맨체스터 플릭스톤 스노우덴 애브뉴 58

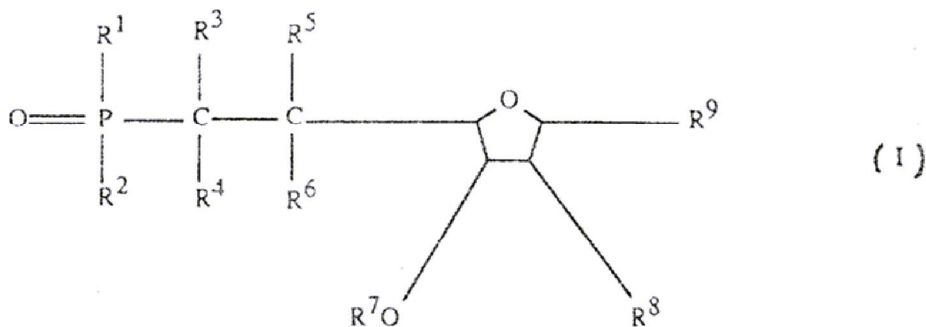
(74) 대리인 이병호, 최달용

심사청구 : 없음

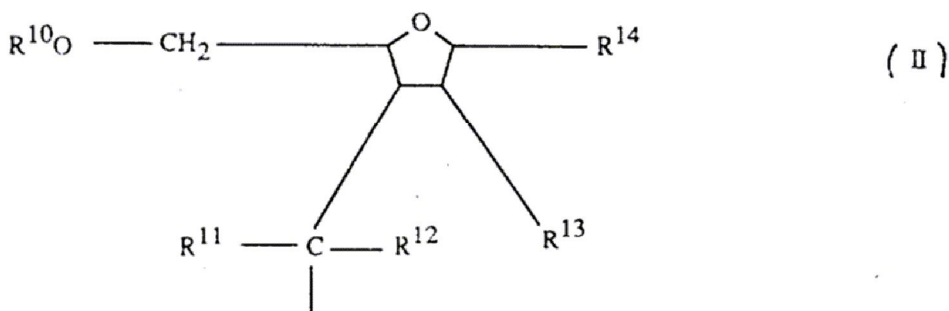
(54) 디뉴클레오타이드 동족체, 이를 위한 중간 화합물 및 이로부터 유도된 올리고뉴클레오타이드

요약

본 발명은 다음 일반식(1)의 화합물에 관한 것이다.



상기식에서, R_1 은 수소 또는 R_a^1 이거나, 일반식



의 그룹이고, R^1_a 는 R^1_b 또는 보호 그룹 Q이며, R^1_b 는 C_1 - C_{20} 알킬, C_2 - C_{20} 알케닐, C_3 - C_{10} 사이클로알킬, C_6 - C_{15} 아릴 또는 C_7 - C_{16} 아르알킬이거나, 헤테로사이클릭 그룹 중의 탄소원자가 지시된 인 원자에 결합된 5원 또는 6원 헤테로사이클릭 그룹이고, R^2 는 치환되지 않거나 치환된 C_1 - C_{20} 알킬 또는 C_2 - C_{20} 알케닐 그

룹, 치환되지 않거나 치환된 C₃-C₁₀ 사이클로알킬 그룹, 치환되지 않거나 치환된 C₆-C₁₅ 아릴 그룹, 치환되지 않거나 치환된 C₆-C₁₆ 아르알킬 그룹이거나, 헤테로사이클릭 그룹 중의 탄소원자가 지시된 인 원자에 결합된 5원 또는 6원 헤테로사이클릭 그룹이며, R³은 수소, 할로겐, 하이드록시, R¹⁵, -OR¹⁶ 또는 -OSO₂R¹⁵이고, R⁴는 R_a이거나 R⁶과 함께 원자가 결합을 형성하며, R_a는 수소, 할로겐 또는 R¹⁶이고, R⁵는 수소, 할로겐 하이드록시, R¹⁷, -OR¹⁷, -OCOR¹⁷ 또는 -OSO₂R¹⁷이며, R⁶는 수소, 할로겐 또는 R¹⁸이거나, R⁴와 함께 원자가 결합을 형성하고, R⁷은 수소, 알킬 -N,N-디알킬포스포르아미달 또는 R_a이거나, R⁷O-가 R_a와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R_a는 R¹⁹, -COR¹⁹, -SO₂R¹⁹ 또는 트리(C₁-C₁₅ 하이드로카빌) 실릴이고, R⁸은 R_a 또는 Z이며, R_a는 수소, 할로겐, 하이드록시, R²⁰, -OR²⁰, -OCOR²⁰, -OSO₂R²⁰ 또는 트리(C¹-C¹⁵ 하이드로카빌)실릴옥시이거나, R⁷O-와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하거나, R⁹와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하고, R⁹는 할로겐, 하이드록시, -OR²¹, -OCOR²¹, -OSO₂R¹¹ 또는 B₂이거나, R_a와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R¹⁰은 수소 또는 R_a¹⁰이고, R_a¹⁰는 R²², -COR²², -SO₂R²² 또는 트리(C₁-C₁₅ 하이드로카빌)실릴이며, R¹¹은 수소, 할로겐, 하이드록시, R²³, -OR²³, -OCOR²³, -OSO₂R²³ 또는 Z이고, R¹은 수소, 할로겐 또는 R²⁴이며, R¹³은 R_a¹³ 또는 Z이고, R_a¹³은 수소, 할로겐 하이드록시, R²⁵, -OR²⁵, -OCOR²⁵, -OSO₂R²⁵ 또는 트리(C₁-C₁₅ 하이드로카빌)실릴옥시이거나, R¹⁴와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R¹⁴는 할로겐, 하이드록시, -OR²⁶, -OCOR²⁶, -OSO₂R²⁶ 또는 B₁이거나, R_a¹³와 함께 C₁-C₁₅ 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하고, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵ 및 R²⁶은 독립적으로 C₁-C₁₀ 지방족 그룹, C₃-C₁₀ 지환족 그룹, C₆-C₁₅ 방향족 그룹 또는 C₇-C₃₀ 아르지방족 그룹이며, B₁ 및 B₂는 각각 독립적으로 1가 뉴클레오시드 염기 라디칼이고, Z는 치환되거나 치환되지 않은 C₆-C₁₀ 아릴옥시티오카보닐옥시이며, 단, 여기서 R¹, R³, R⁴ 및 R⁶이 수소인 동시에 R²가 이소프로필이며 R⁵가 메톡시이고 R⁷이 메틸이며 R⁸ 및 R⁹가 각각 하이드록시 또는 각각 아세톡시이거나, R⁶ 및 R⁹가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물 ; R¹, R³, R⁴ 및 R⁶이 수소인 동시에 R²가 R²가 부틸이고 R⁵가 메톡시이며 R⁷이 벤질이고 R⁸ 및 R⁹가 각각 하이드록시 또는 각각 아세톡시이거나, R⁸ 및 R⁹가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물 ; 및 R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶ 및 R⁷이 수소인 동시에 R²가 페닐이고 R⁸ 및 R⁹가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물은 제외된다.

명세서

[발명의 명칭]

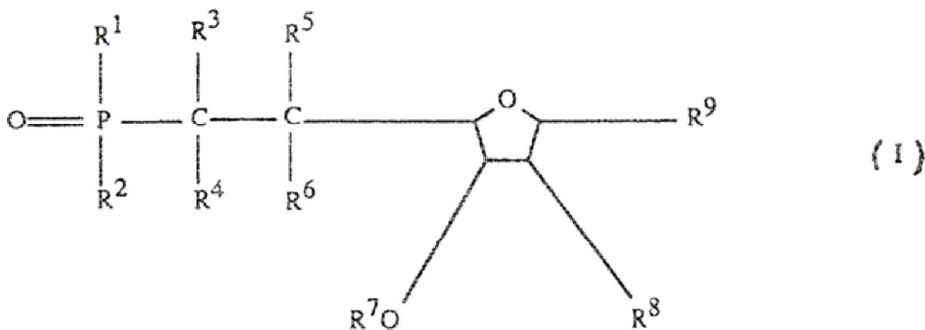
디뉴클레오타이드 동족체, 이를 위한 중간 화합물 및 이로부터 유도된 올리고 뉴클레오타이드

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

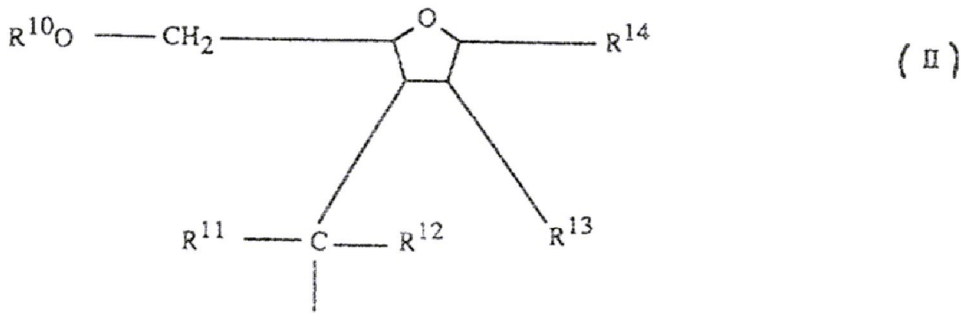
(57) 청구의 범위

청구항 1

다음 일반식(I)의 화합물.



상기식에서, R^1 은 수소 또는 R^1_a 이거나, 일반식



의 그룹이고, R^1_a 는 R^1_b 또는 보호 그룹 Q이며, R^1_b 는 C_1-C_{20} 알킬, C_2-C_{20} 알케닐, C_3-C_{10} 사이클로알킬, C_6-C_{15} 아릴 또는 C_7-C_{16} 아르알킬이거나, 헤테로사이클릭 그룹 중의 탄소원자가 지시된 인 원자에 결합된 5원 또는 6원 헤테로사이클릭 그룹이고, R^2 는 치환되지 않거나 치환된 C_1-C_{20} 알킬 또는 C_2-C_{20} 알케닐 그룹, 치환되지 않거나 치환된 C_3-C_{10} 사이클로알킬 그룹, 치환되지 않거나 치환된 C_6-C_{15} 아릴 그룹, 치환되지 않거나 치환된 C_6-C_{16} 아르알킬 그룹이거나, 헤테로사이클릭 그룹 중의 탄소원자가 인 원자에 결합된 5원 또는 6원 헤테로사이클릭 그룹이며, R^3 은 수소, 할로겐, 하이드록시, R^{15} , $-OR^{15}$ 또는 $-OSO_2R^{15}$ 이고, R^4 는 R^4_a 이거나 R^6 과 함께 원자가 결합을 형성하며, R^4_a 는 수소, 할로겐 또는 R^{16} 이고, R^5 는 수소, 할로겐 하이드록시, R^{17} , $-OR^{17}$, $-OCOR^{17}$ 또는 $-OSO_2R^{17}$ 이며, R^6 는 수소, 할로겐 또는 R^{16} 이고, R^5 는 수소, 할로겐, 하이드록시, R^{17} , $-OR^{17}$, $-OCOR^{17}$ 또는 $-OSO_2R^{17}$ 이며, R^6 는 수소, 할로겐 또는 R^{18} 이거나, R^4 와 함께 원자가 결합을 형성하고, R^7 은 수소, 알킬 -N,N-디알킬포스포르아미딜 또는 R^7_a 이거나, R^7O -가 R^8_a 와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R^7_a 는 R^{19} , $-COR^{19}$, $-SO_2R^{19}$ 또는 트리(C_1-C_{15} 하이드로카빌) 실릴이고, R^8 은 R^8_a 또는 Z이며, R^8_a 는 수소, 할로겐, 하이드록시, R^{20} , $-OR^{20}$, $-OCOR^{20}$, $-OSO_2R^{20}$ 또는 트리(C_1-C_{15} 하이드로카빌)실릴옥시이거나, R^7O -와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하거나, R^9 와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하고, R^9 는 할로겐 하이드록시, $-OR^{21}$, $-OCOR^{21}$, $-SO_2R^{21}$ 또는 B^1 이거나, R^8_a 와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R^{10} 은 수소 또는 R^{10}_a 이고, R^{10}_a 는 R^{22} , $-COR^{22}$, $-SO_2R^{22}$ 또는 트리(C_1-C_{15} 하이드로카빌)실릴이며, R^{11} 은 수소, 할로겐, 하이드록시, R^{23} , $-OR^{23}$, $-OCOR^{23}$, $-OSO_2R^{23}$ 또는 Z이고, R^{11} 은 수소, 할로겐 또는 R^{24} 이며, R^{13} 은 R^{13}_a 또는 Z이고, R^{12} 는 수소, 할로겐, 하이드록시, R^{25} , $-OR^{25}$, $-OCOR^{25}$, $-OSO_2R^{25}$ 또는 트리(C_1-C_{15} 하이드로카빌)실릴옥시이거나, R^{14} 와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하며, R^{14} 는 할로겐, 하이드록시, $-OR^{26}$, $-OCOR^{26}$, $-OSO_2R^{26}$ 또는 B^1 이거나, R^{13}_a 와 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디옥시 그룹을 형성하고, R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} , R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} 및 R^{26} 은 독립적으로 C_1-C_{10} 지방족 그룹, C_3-C_{10} 지환족 그룹, C_6-C_{15} 방향족 그룹 또는 C_7-C_{30} 아르지방족 그룹이며, B^1 및 B^2 는 각각 독립적으로 1가 뉴클레오시드 염기 라디칼이고, Z는 치환되거나 치환되지 않은 C_6-C_{10} 아릴옥시티오카보닐옥시이며, 단, 여기서 R^1 , R^3 , R^4 및 R^6 이 수소인 동시에 R^2 가 이소프로필이며 R^5 가 메톡시이고 R^7 이 메틸이며 R^8 및 R^9 가 각각 하이드록시 또는 각각 아세톡시이거나, R^6 및 R^9 가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물 ; R^1 , R^3 , R^4 및 R^6 이 수소인 동시에 R^2 가 R^2 가 부틸이고 R^5 가 메톡시이며 R^7 이 벤질이고 R^8 및 R^9 가 각각 하이드록시 또는 각각 아세톡시이거나, R^8 및 R^9 가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물 ; 및 R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 및 R^7 이 수소인 동시에 R^2 가 페닐이고 R^8 및 R^9 가 함께 이소프로필리덴디옥시를 형성하는 화합물은 제외된다.

청구항 2

제1항에 있어서, 지방족 그룹이 독립적으로 치환되거나 치환되지 않은 알킬 또는 알케닐 그룹이며, 지환족 그룹이 치환되거나 치환되지 않은 사이클로알킬 그룹이고, 방향족 그룹이 치환되거나 치환되지 않은 아릴 그룹이며, 아르지방족 그룹이 치환되거나 치환되지 않은 아르알킬 그룹인 화합물.

청구항 3

제2항에 있어서, 알킬 그룹이 C_1-C_4 알킬 그룹이고, 알케닐 그룹이 C_2-C_4 알케닐 그룹이며, 사이클로알킬 그룹이 C_5-C_6 사이클로알킬 그룹이고, 아릴 그룹이 C_6-C_{10} 아릴그룹이며, C_7-C_{16} 아르알킬 그룹이 C_7-C_9 아르알킬 그룹이고, C_7-C_{30} 아르알킬 그룹이 C_7-C_{20} 아르알킬 그룹이며, 이들 각 그룹이 치환되거나 치환되지

않은 화합물.

청구항 4

제1항 내지 제3항 중의 어느 한 항에 있어서, 보호 그룹 Q가, 지시된 인 원자에 결합된 탄소원자가 하나 이상의 하이드록시 또는 C₁-C₁₀ 알콕시 그룹에 의해 치환된 C₁-C₂₀ 하이드로카빌 그룹인 화합물.

청구항 5

제4항에 있어서, 보호 그룹 Q가 다음 일반식(III)의 그룹인 화합물.



상기식에서, R²⁷은 수소, C₁-C₁₀ 알킬, C₃-C₈ 사이클로알킬, C₆-C₁₀ 아릴 또는 C₇-C₁₁ 아르알킬이고, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 독립적으로 C₁-C₁₀ 알킬이다.

청구항 6

제1항 내지 제5항 중의 어느 한 항에 있어서, R¹이 수소, 보호 그룹 Q 또는 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식(II)의 그룹이고 ; R²가 C₁-C₄ 알킬, C₂-C₄ 알케닐, C₅-C₈ 사이클로알킬, C₆-C₁₀ 아릴 또는 C₇-C₉ 아르알킬이며 ; R³이 수소, 할로겐, 하이드록시, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시 또는 C₇-C₉ 아르알킬옥시이거나, -OCOR¹⁵ 또는 -OSO₂R²⁵ (여기서, R¹⁵는 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이다)이고 ; R⁴는 수소, 할로겐 또는 C₁-C₄ 알킬이며 ; R⁵가 수소, 할로겐, 하이드록시, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 알콕시 또는 C₇-C₉ 아르알킬옥시이거나, -OCOR¹⁷ 또는 -OSO₂R¹⁷ (여기서, R¹⁷는 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이다)이고 ; R⁶이 수소, 할로겐 또는 C₁-C₄ 알킬이며 ; R⁷이 수소, 시아노-C₁-C₄ 알킬-N,N-디(C₁-C₄ 알킬)포스포르아미딜, C₁-C₄ 알킬 또는 C₇-C₉ 아르알킬이거나, -COR¹⁹ 또는 -SO₂R²⁹ (여기서, R¹⁹는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이다)이고 ; R⁸이 수소 또는 하이드록시이거나, -OR²⁰, -OCOR²⁰ 또는 -OSO₂R²⁰ (여기서, R²⁰는 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, R⁹와 함께 C₁-C₅ 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다)이며 ; R⁹가 1가 뉴클레오시드 염기 라디칼 B² 또는 하이드록시이거나, -OR²¹, -OCOR²¹ 또는 -OSO₂ (여기서, R²¹는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, R⁸과 함께 C₁-C₅ 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다)이고 ; R¹⁰이 수소, 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₇-C₂₀ 아르알킬이거나, -COR²² 또는 -SO₂R²² (여기서, R²²는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, C₁-C₆ 알킬 디(C₆-C₈ 아릴)실릴이다)이며 ; R¹¹이 수소, 할로겐 또는 하이드록시이거나, -OCOR²³ 또는 -OSO₂R²³ (여기서, R²³는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, C₁-C₁₄ 알킬-또는 할로겐-치환된 페닐옥시 티오카보닐옥시이다)이고 ; R¹²는 수소 또는 할로겐이며 ; R¹³은 수소 또는 하이드록시이거나, -OR²⁵, -OCOR²⁵ 또는 -OSO₂R²⁵ (여기서, R²⁵는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, R¹⁴와 함께 C₁-C₅ 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다)이고 ; R¹⁴가 1가 염기 라디칼 B¹ 또는 하이드록시이거나, -OR²⁶ 또는 -OCOR²⁶ (여기서, R²⁶는 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₆-C₁₀ 아릴이거나, R¹³과 함께 C₁-C₅ 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다)인 화합물.

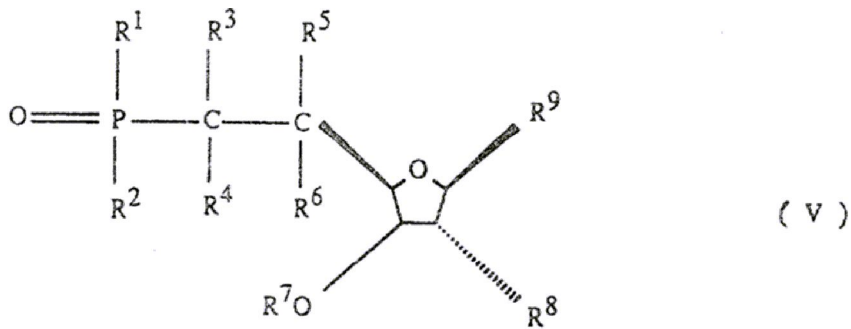
청구항 7

제6항에 있어서, R¹이 수소, 제5항에서 정의한 바와 같은 일반식(III)의 보호 그룹 또는 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식(II)의 그룹이고 ; R²가 메틸 사이클로헥실 또는 페닐이며 ; R³, R⁴, R⁵ 및 R⁶이 각각 수소이고 ; R⁷이 수소, 2-시아노에틸-N,N-디이소프로필포스포르아미딜, 아세틸, 벤질 또는 벤조일이며 ; R⁸이 수소, 하이드록시, 메톡시, 또는 아세톡시이거나, R⁹와 함께 이소프로필리덴디옥시 그룹을 형성하고 ; B⁹가 B¹ (이는 티미닐 또는 N-벤질옥시메틸티미닐이다)이거나, 하이드록시, 메톡시 또는 아세톡시이거나, R⁸과 함께 이소프로필리덴디옥시 그룹을 형성하며 ; R¹⁰이 수소, 벤조일, 3급-부틸디페닐실릴 또는 디메톡시트리페닐메틸이고 ; R¹¹은 수소, 하이드록시 또는 p-톨릴옥시티오카보닐옥시이며 ; R¹²는 수소이고 ; R¹³은 수소, 하이드록시, 메톡시 또는 아세톡시이거나, R¹⁴와 함께 이소프로필리덴디옥시 그룹을 형성하며 ; R¹⁴가 B² (이는, 티미닐 또는 N-벤질옥시메틸티미닐이다)이거나, 하이드록시, 메톡시 또는 아세톡시이거나

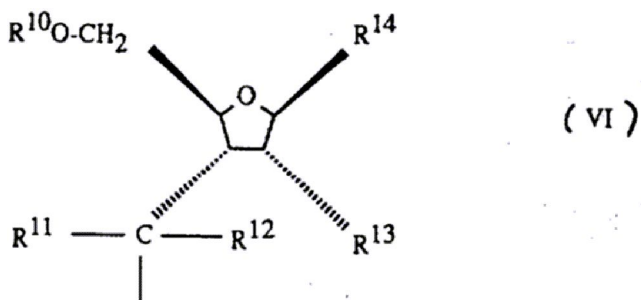
나, R¹³ 과 함께 이소프로필리덴디옥시 그룹을 형성하는 화합물.

청구항 8

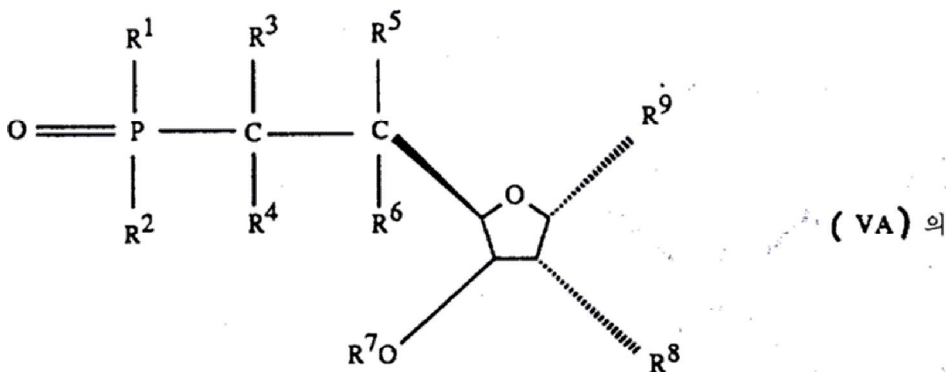
제1항 내지 제7항 중의 어느 한 항에 있어서, 다음 일반식(V)의 화합물.



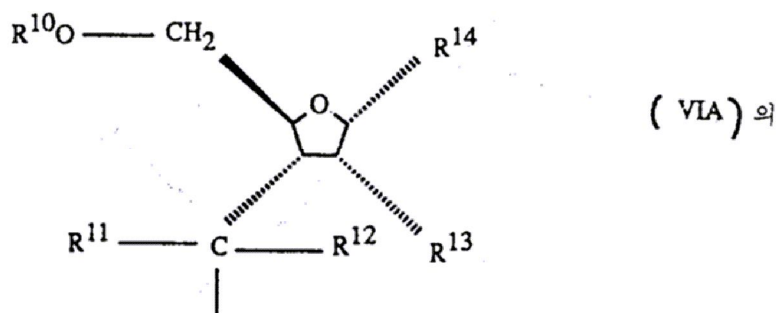
상기식에서, R² 내지 R⁷은 제1항 내지 제3항, 제6항 및 제7항 중의 어느 한 항에서 정의한 바와 같고, R¹은 수소이며, R_a는 제1항, 제4항 또는 제5항에서 정의한 바와 같거나, 일반식



의 그룹이고, R¹⁰ 내지 R¹²는 제1항 내지 제3항, 제6항 및 제7항 중의 어느 한 항에서 정의한 바와 같으며, R⁸은 수소, 할로겐, 하이드록시, R²⁰, -OR²⁰, -OCOR²⁰, -OSO₂R²⁰, 트리(C₁-C₁₅ 하이드로카빌)실릴옥시 또는 Z이고, R⁹는 B², 할로겐, 하이드록시, -OR²¹, -OCOR²¹ 또는 -OSO₂R²¹이며, R¹³은 수소, 할로겐, 하이드록시, R²⁵, -OR²⁵, -OCOR²⁵, -OSO₂R²⁵, 트리(C₁-C₁₅ 하이드로카빌)실릴옥시 또는 Z이고, R¹⁴는 B¹, 할로겐 하이드록시, -OR²⁶, -OCOR²⁶ 또는 -OSO₂R²⁶이며, Z는 제1항에서 정의한 바와 같거나, 일반식



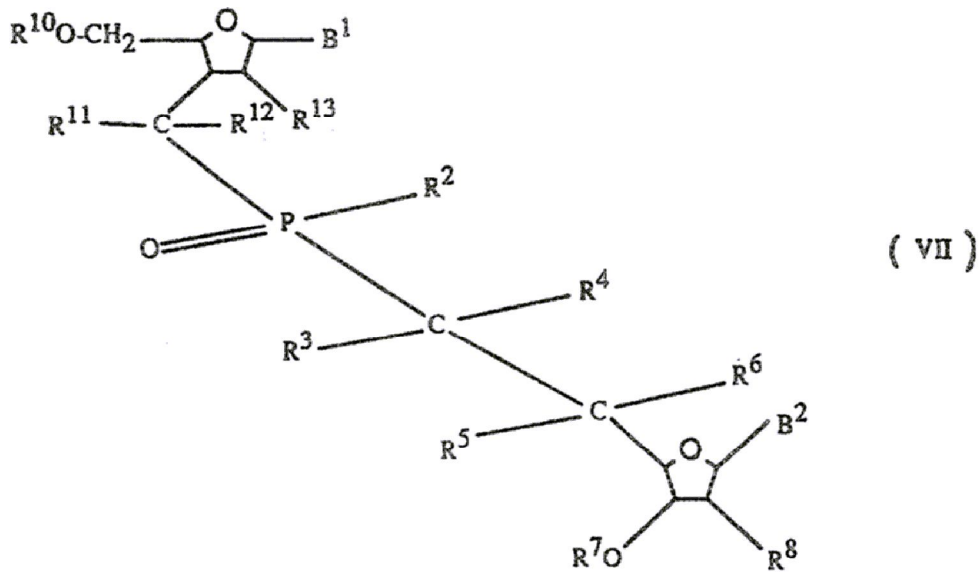
화합물[여기서, R² 내지 R⁸은 제1항 내지 제3항, 제6항 및 제7항 중의 어느 한 항에서 정의한 바와 같고, R¹은 수소, 제1항, 제4항 또는 제5항에서 정의한 바와 같은 R_a이거나, 일반식



그룹(여기서, R^{10} 내지 R^{13} 은 제1항 내지 제3항, 제6항 및 제7항 중의 어느 한항에서 정의한 바와 같고, R^{14} 는 할로겐, 하이드록시, $-OR^{26}$, $-OCOR^{26}$ 또는 $-OSO_2R^{26}$ 이거나, R^{13} 과 함께 C_1-C_{15} 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다)이며, R^9 는 할로겐, 하이드록시, $-OR^{21}$, $-OCOR^{21}$ 또는 $-OSO_2R^{21}$ 이거나, R^8 과 함께 C_1-C_{15} 알킬리덴디옥시 그룹을 형성한다]이다.

청구항 9

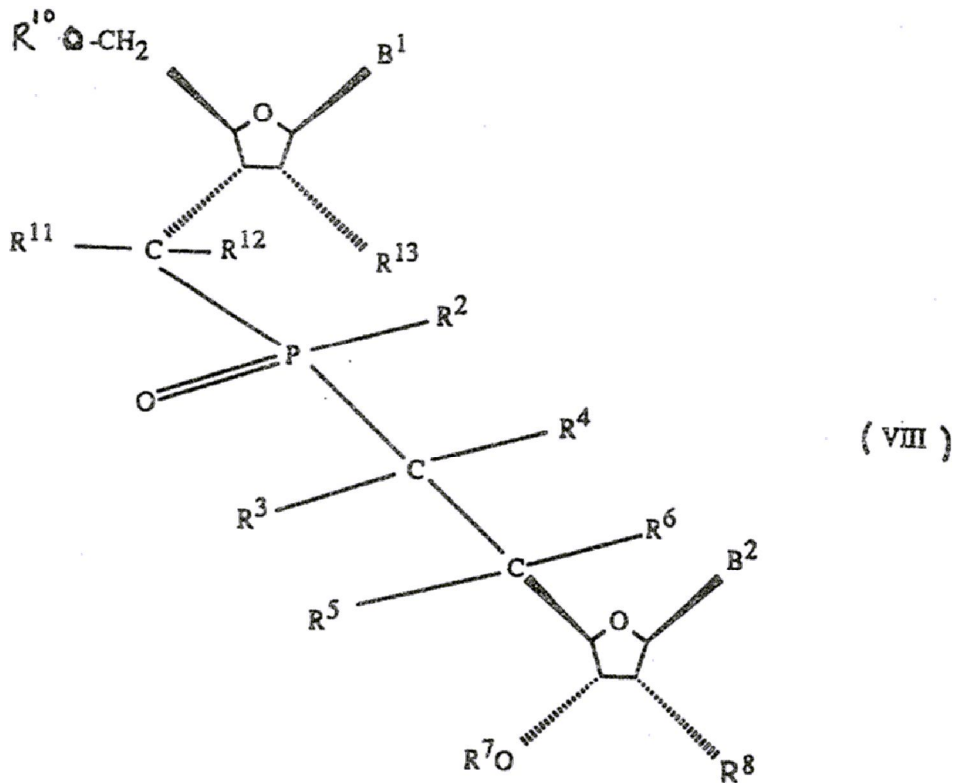
제1항에 있어서, 다음 일반식(VII)의 디뉴클레오타이드 동족체인 화합물.



상기식에서, B^1 및 B^2 는 제1항 또는 제7항에서 정의한 바와 같고, R^2 내지 R^8 및 R^{10} 내지 R^{13} 은 제1항, 제3항 제6항 및 제7항 중의 어느 한 항에서 정의한 바와 같다.

청구항 10

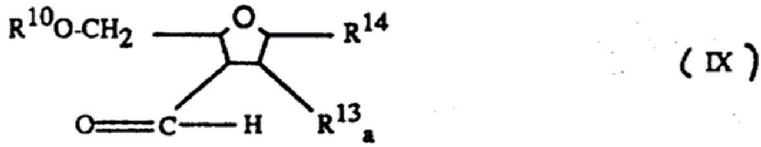
제9항에 있어서, 다음 일반식(VIII)의 화합물.



상기식에서, B^1 , B^2 , R^2 내지 R^8 및 R^{10} 내지 R^{13} 은 제9항에서 정의한 바와 같다.

청구항 11

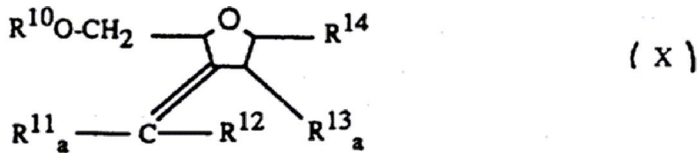
(A) R^1 이 수소인 일반식(I)의 화합물을 염기의 존재하에 일반식(IX)의 알데히드와 반응시키거나, (B) R^1 이 수소인 일반식(I)의 화합물을 실리화제와 반응시켜 P(III) 실릴 화합물을 수득한 다음, P(III)실릴 화합물을 일반식(IX)의 알데히드와 반응시킴을 포함하는, R^1 이 일반식(II)의 그룹(여기서, R^{11} 이 하이드록시이고, R^{12} 가 수소이다)인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.



상기식에서, R^{10} , R^{13} 및 R^{14} 는 제1항에서 정의한 바와 같다.

청구항 12

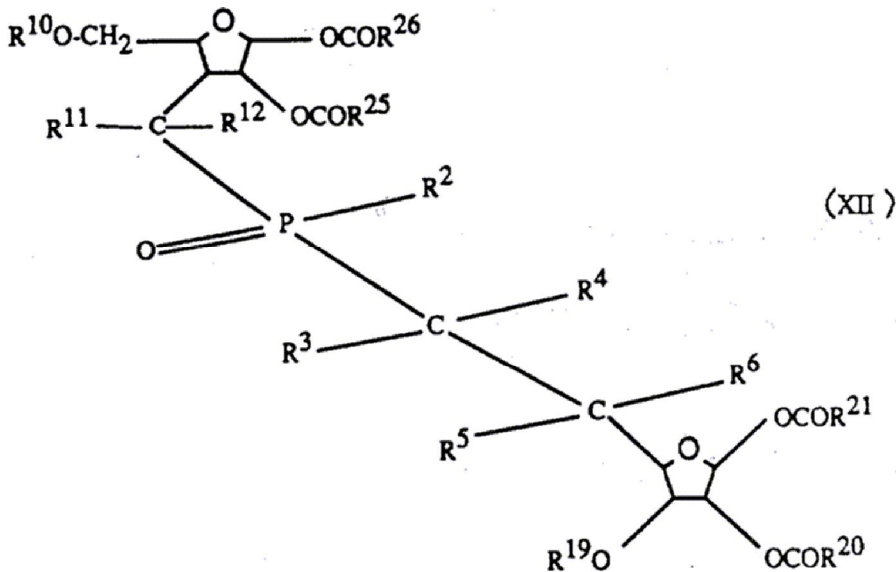
R^1 이 수소인 일반식(I)의 화합물을 자유 라디칼 개시제의 존재하에 일반식(X)의 화합물과 반응시킴을 포함하는, R^1 이 일반식(II)의 그룹인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.



상기식에서, R^{10} , R^{12} , R^{13} 및 R^{14} 는 제1항에서 정의한 바와 같고, R^{11} 은 수소 또는 할로겐이거나 제1항에서 정의한 R^{23} 이다.

청구항 13

일반식(XII)의 화합물을 B^1 이 제1항에서 정의한 바와 같은 일반식 B^1H 의 염기로 글리코실화시킴을 포함하는, B^1 및 B^2 가 동일한 제9항에 따른 디뉴클레오타이드 동족체인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.

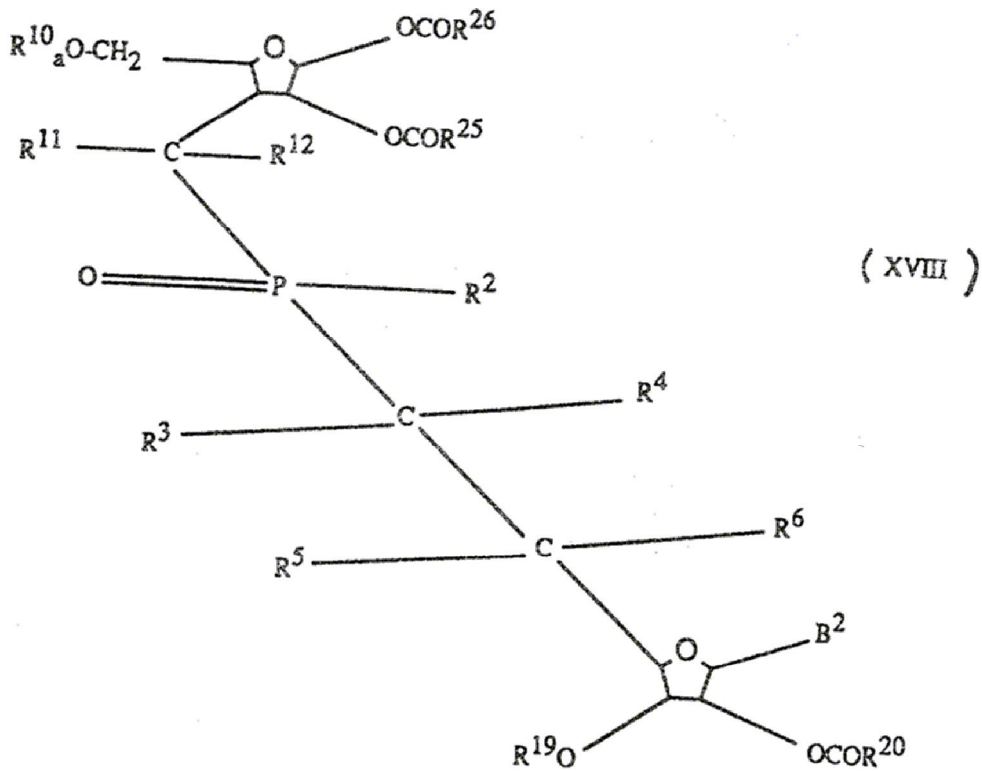


상기식에서, R^2 내지 R^6 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{19} , R^{20} , R^{21} , R^{25} 및 R^{26} 은 제1항에서 정의한 바와 같다.

청구항 14

일반식(XVIII)의 화합물을 일반식 B^1H 의 염기(여기서, B^1 은 제1항에서 정의한 바와 같다)로 글리코실화시킴을 포함하는, B^1 및 B^2 가 동일하거나 상이한 제9항에 따른 디뉴클레오타이드 동족체인 제1항에 따른 화합물

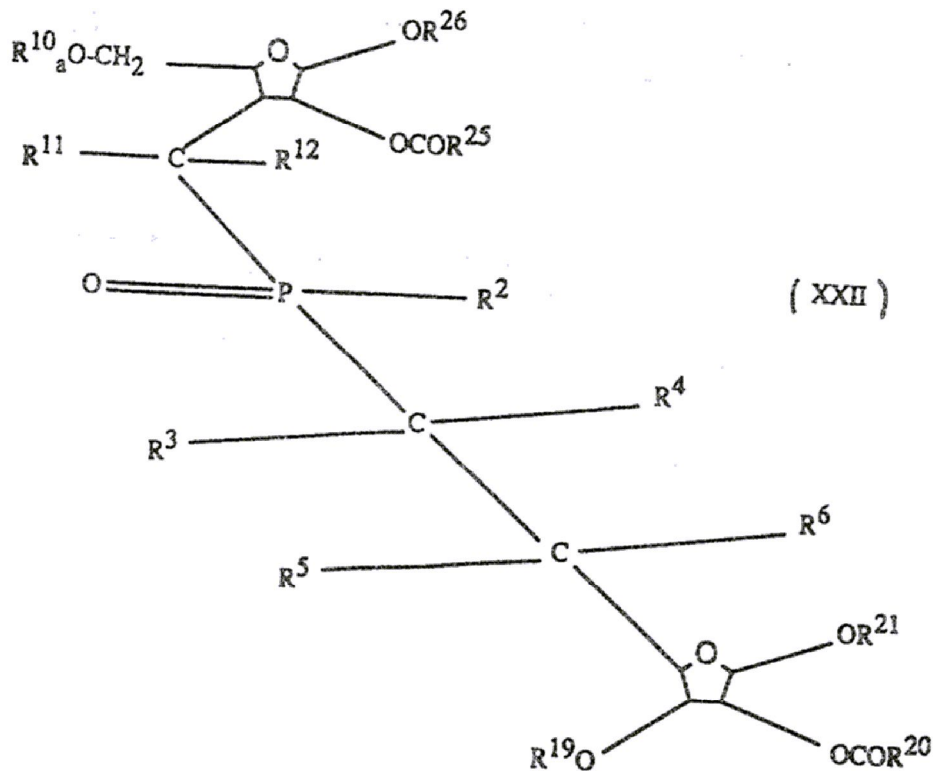
의 제조방법.



상기식에서, B^2 , R^2 내지 R^6 , R_a^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{19} , R^{20} , R^{25} 및 R^{26} 은 제1항에서 정의한 바와 같다.

청구항 15

일반식(XXII)의 화합물을 일반식 B^1H 의 염기(여기서, B^1 은 제1항에서 정의된 바와 같다)로 글리코실화시킴을 포함하는, B^1 및 B^2 가 동일한 제9항에 따른 디뉴클레오타이드인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.



상기식에서, R^2 내지 R^6 , R_a^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{19} , R^{20} , R^{21} , R^{25} 및 R^{26} 은 제1항에서 정의한 바와 같다.

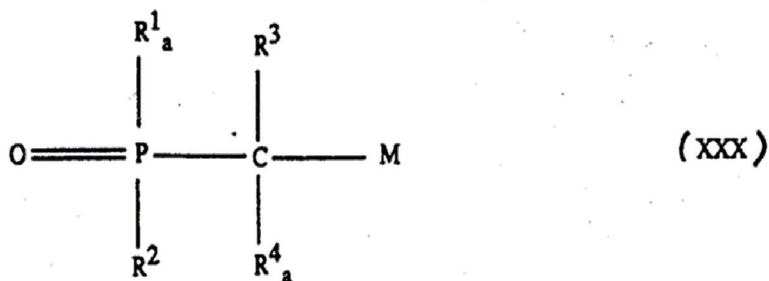
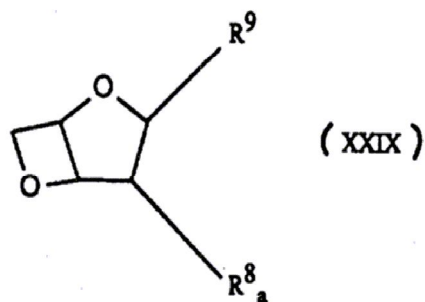
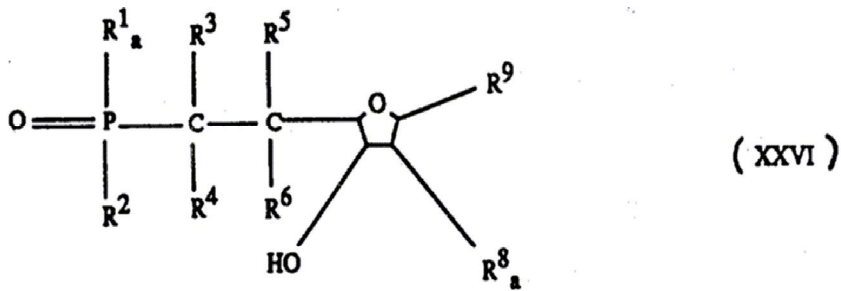
청구항 16

R^1 이 일반식(II)의 그룹(여기서, R^{11} 이 하이드록시이고, R^{12} 가 수소이다)인 제1항에 따른 화합물을 탈산소

화시킴을 포함하는, R^1 이 일반식(II)의 그룹(여기서, R^{11} 및 R^{12} 가 각각 수소이다)인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.

청구항 17

일반식(XXX)의 옥세탄을 루이스 산의 존재하에 일반식(XXX)의 유기 금속 화합물과 반응시킴을 포함하는, 일반식(XXVI)의 화합물인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.

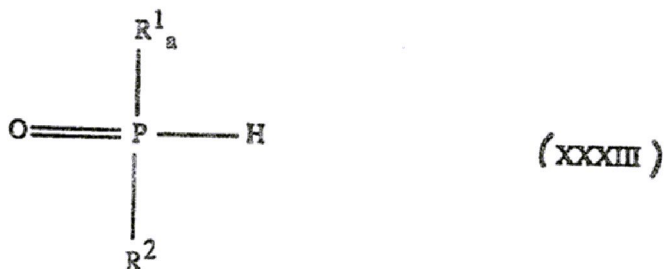
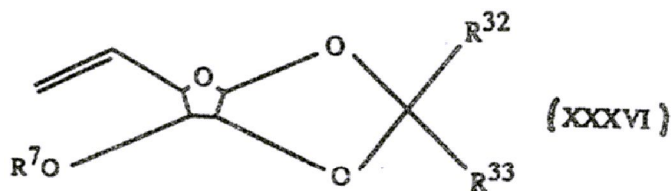


상기식에서, R_a^1 , R^2 내지 R^6 , R_a^4 , R_a^8 및 R^9 는 제1항에서 정의한 바와 같고, M은 리튬 또는 마그네슘이다.

청구항 18

일반식(XXXVI)의 올레핀을 자유 라디칼 개시제의 존재하에 일반식(XXXIII)의 포스핀 옥사이드와 반응시킴을 포함하는, R^1 이 R_a^1 이고 R^3 , R^4 , R^5 및 R^6 이 각각 수소이며 R^8 및 R^9 가 함께 C_1-C_{15} 하이드로카빌리덴디

옥시 그룹인 제1항에 따른 화합물의 제조방법.



상기식에서, R^7 은 수소이거나 제1항에서 정의한 바와 같은 R_a^7 이고, R^{32} 및 R^{33} 은 독립적으로 수소, C_1-C_{10} 알킬, C_3-C_8 사이클로 알킬 또는 C_6-C_{10} 아릴이며, Q 및 R^2 는 제1항에서 정의한 바와 같다.

청구항 19

R^1 이 R_a^1 이고 R^7 이 R_a^7 이며 R^8 이 $-OCOR^{20}$ 이고 R^9 가 $-OR^{21}$ 또는 $-OCOR^{21}$ 인 제1항에 따른 화합물을 일반식 B¹H의 염기로 글리코실화시킴을 포함하는, R^1 이 R_a^1 이고 R^7 이 R_a^7 이며 R^9 가 B¹인 일반식(1)의 화합물의 제조방법.

청구항 20

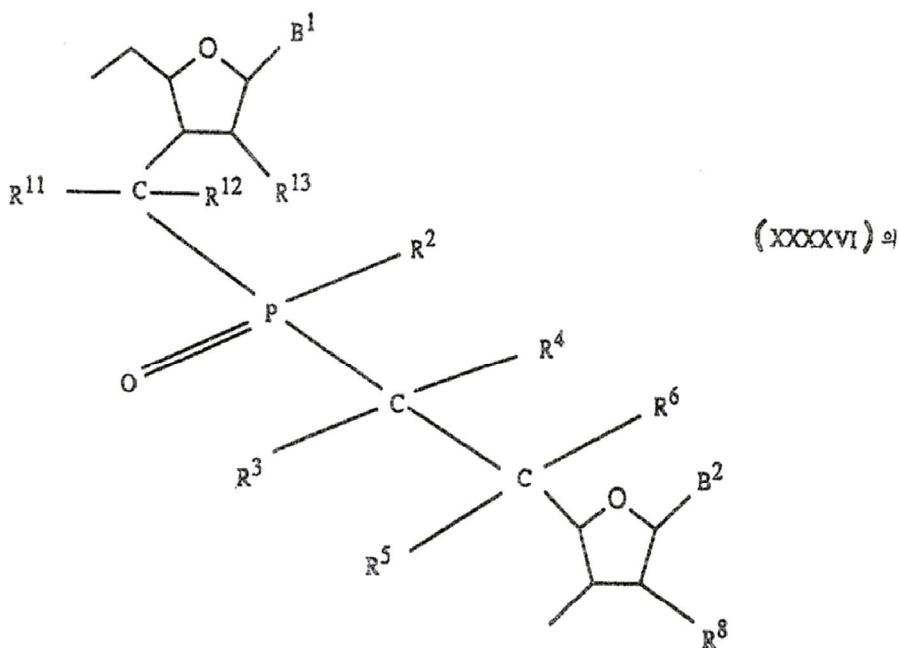
제9항 또는 제10항에 따른 디뉴클레오타이드 동족체로부터 유도된 하나 이상의 단위를 함유하는 올리고뉴클레오타이드.

청구항 21

다음 일반식(XXXXV)의 올리고뉴클레오타이드.



상기식에서, U, V 및 W는 천연 또는 합성 뉴클레오시드의 동일하거나 상이한 잔기이고, 잔기 U, V 및 W 중의 하나 이상이 제9항 또는 제10항에 따른 디뉴클레오타이드 동족체로부터 유도되는 일반식



화합물[여기서, R^2 내지 R^8 , R^{11} , R^{12} , R^{13} , B^1 및 B^2 는 제9항에서 정의한 바와 같다]이며, L은 뉴클레오시드 브릿징 그룹이고, n은 0 내지 200의 수이다.

청구항 22

제21항에 있어서, n 이 0 내지 30의 수이고, L 이 그룹 $-P(P)O-$ 인 올리고뉴클레오티드.

청구항 23

제21항 또는 제22항에 있어서, n 이 1 내지 6인 올리고뉴클레오티드.

청구항 24

제21항 내지 제23항 중의 어느 한 항에 있어서, U , V 및 W 가 천연 뉴클레오시드의 동일하거나 상이한 잔기이고, 잔기 U , V 및 W 중의 하나 이상이 일반식(XXXXVI)의 화합물(여기서, B^1 및 B^2 는 천연 뉴클레오시드 염기 라디칼이다)인 올리고뉴클레오티드.

청구항 25

제1항 내지 제10항 중의 어느 한 항에 따른 화합물 또는 제20항 내지 제24항 중의 어느 한 항에 따른 올리고뉴클레오티드를 활성 성분으로서 포함하는 약제학적 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.