

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成23年12月8日(2011.12.8)

【公開番号】特開2011-148817(P2011-148817A)

【公開日】平成23年8月4日(2011.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2011-031

【出願番号】特願2011-61926(P2011-61926)

【国際特許分類】

C 07 H 19/04 (2006.01)

C 07 H 19/06 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/04

C 07 H 19/06

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月25日(2011.10.25)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

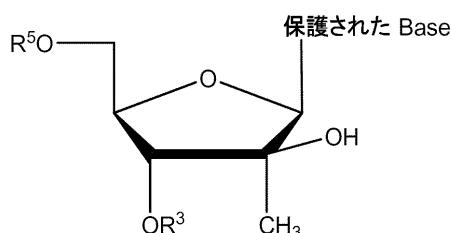
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の工程：

(a) 以下の式：

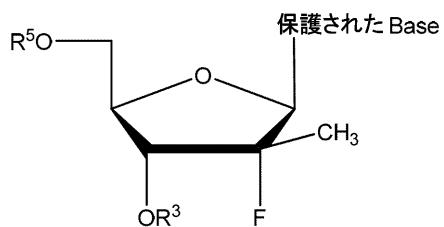


[上式中、

塩基は上で定義される通りであり、保護基はベンゾイルであり；

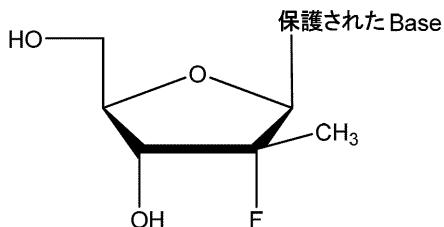
R<sup>3</sup>とR<sup>5</sup>はそれぞれ独立にテトラヒドロピラニル、メチル、エチル、ベンジル、ベンゾイル、p-メトキシベンジル、ベンジルオキシメチル、フェノキシメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メシリル、トシリル、トリフルオロアセチル、又はトリクロロアセチルである]

のヌクレオシド中間体を三フッ化ジエチルアミノ硫黄又は三フッ化ビス(2-アミノエチル)アミノ硫黄と反応させ、以下の式：



のフッ素化中間体を得る工程と、

( b ) 以下の式 :

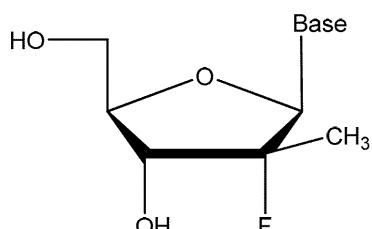


の中間体を得るために三ハロゲン化ホウ素で処理することによって、

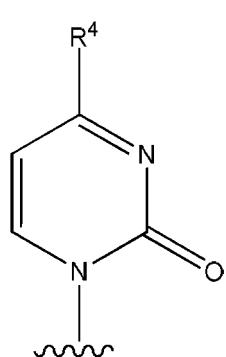
工程 ( a ) の生成物の  $R^3$  と  $R^5$  基を脱保護する工程と、

( c ) 所望のヌクレオシドを得るために工程 ( b ) の生成物を鹼化させる工程とを含む

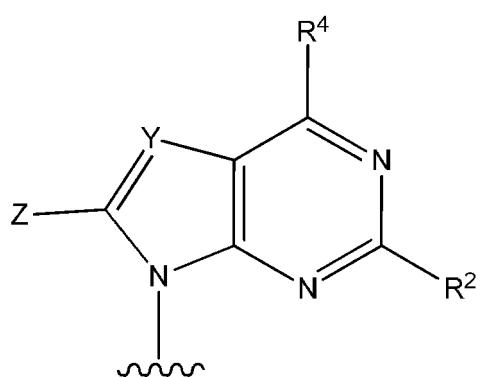
、  
以下の式 :



[ 上式中、  
塩基が



又は



であり、

ここで、  $R^2$  と  $R^4$  は独立して H、 OH、 NH<sub>2</sub> 又は OR' であり；

Z は H であり；

R' は C<sub>1</sub> - C<sub>1,2</sub> の直鎖、分岐、又は環式アルキルで置換されていてもよく；

Y は N 又は CH である】

の 2' - デオキシ - 2' - フルオロ - 2' - C - メチル - - D - リボフラノシリヌクレ

オシドの調製方法。

【請求項 2】

工程 ( b ) の三ハロゲン化ホウ素が三フッ化ホウ素、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素又は三ヨウ化ホウ素から選択される、請求項 1 の方法。

【請求項 3】

工程 ( c ) の鹹化がアルコール中の金属アルコラートを用いてなされる、請求項 1 の方法。

【請求項 4】

アルコール中の金属アルコラートがメタノール中のナトリウムメトキシドである、請求項 3 の方法。