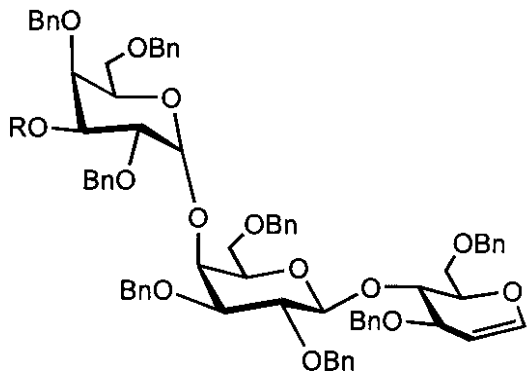
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年7月24日(2008.7.24)

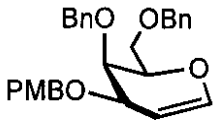
【公開番号】特開2008-133283(P2008-133283A)
【公開日】平成20年6月12日(2008.6.12)
【年通号数】公開・登録公報2008-023
【出願番号】特願2007-315261(P2007-315261)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｈ　15/10　(2006.01)
Ｃ０７Ｈ　17/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｈ　15/18　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/702　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/42　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/02　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｈ　15/10　ＣＳＰ
Ｃ０７Ｈ　17/04
Ｃ０７Ｈ　15/18
Ａ６１Ｋ　31/702
Ａ６１Ｋ　47/42
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　37/02

【手続補正書】
【提出日】平成20年5月30日(2008.5.30)
【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】
下記構造を有する化合物を合成する方法であって、
【化１】



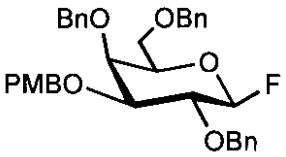
但し、ＲはＨである。
（ａ）（ｉ）下記構造を有する化合物をエポキシ化剤と反応し、エポキシドを形成するこ

と、
【化２】

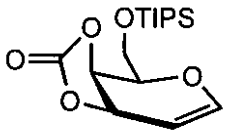


（ii）ステップ（ａ）（ｉ）で形成されたエポキシドを、R_4NF（但し、各Ｒは独立に同じであるか、又は異なっており、直鎖又は分岐鎖のアルキル、アラルキル又はアリール基である。）で開裂し、フルオロアルコールを形成すること、

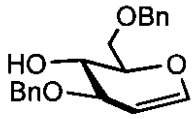
（iii）ステップ（ａ）（ii）で形成されたフルオロアルコールを、非求核性塩基及び式$C_6H_5CH_2X$（但し、ＸはＢｒ、Ｃｌ、Ｉ又はＦである。）を有する有機ハライドを用いてアルキル化し、下式を有する化合物を形成すること、
【化３】



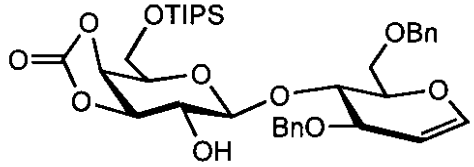
（ｂ）下記構造を有する化合物をエポキシ化剤で処理し、エポキシドを形成すること、
【化４】



（ｃ）ステップ（ｂ）で形成されたエポキシドを下記構造を有する化合物とカップリングし、
【化５】



下記構造を有する化合物を形成すること、
【化６】



（ｄ）（ｉ）ステップ（ｃ）で形成された化合物を、非求核性塩基及び式$C_6H_5CH_2X$（但し、Ｘは、Ｂｒ、Ｃｌ、Ｉ又はＦである。）を有する有機ハライドでアルキル化すること、及び

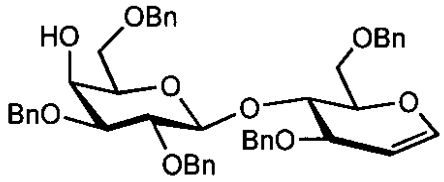
（ii）ステップ（ｄ）（ｉ）で形成された化合物を、R_4NF（但し、各Ｒは独立

に同じであるか、又は異なっており、直鎖又は分岐鎖のアルキル、アラルキル又はアリール基である。）で脱シリル化すること、

（iii）ステップ（ｄ）（ii）で形成された化合物を、金属アルコキシドで処理し、脱保護された二糖を形成すること、

（iv）ステップ（ｄ）（iii）で形成された二糖を、アルキル化し、選択的に脱保護された下記構造を有する二糖を形成すること、

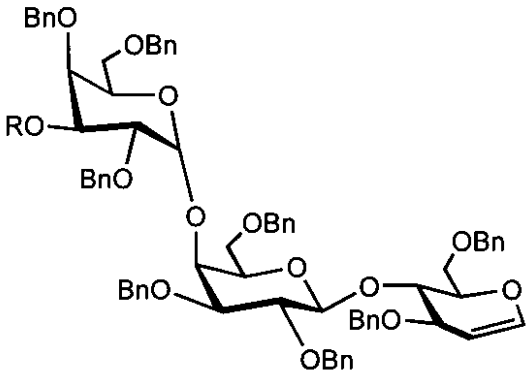
【化７】



（ｅ）（ｉ）ステップ（ｄ）（iv）で形成された選択的に脱保護された二糖を、ステップ（ａ）（iii）で形成された化合物とカップリングし、保護された三糖を形成すること、及び

（ii）ステップ（ｅ）（ｉ）で形成された保護された三糖を、脱保護し、下記構造を有する三糖を形成すること、

【化８】



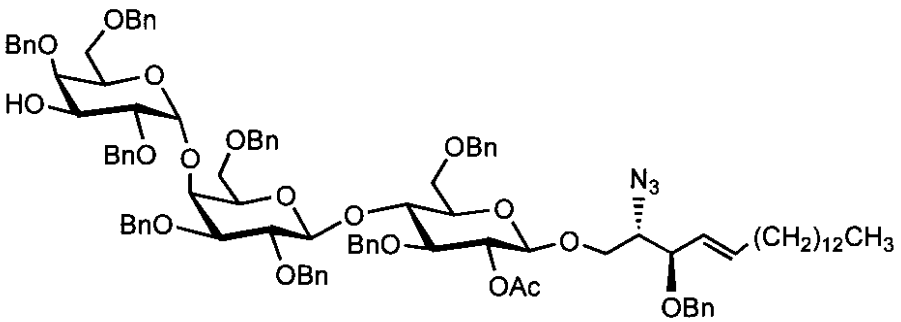
但し、ＲはＨである。

を具備した方法。

【請求項２】

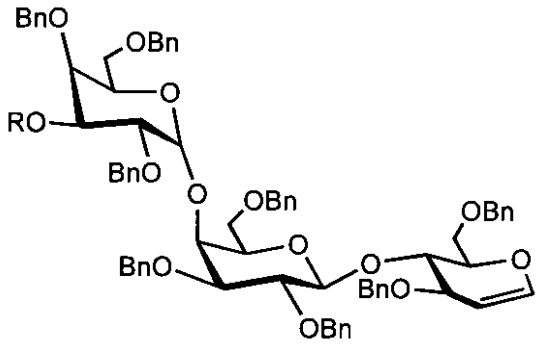
下記構造を有する三糖セラミドを合成するための方法であって、

【化９】



（ａ）請求項１に記載の方法を行うことにより、下記構造を有する三糖を合成すること、

【化１０】

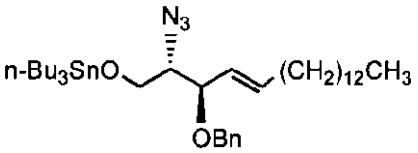


但し、ＲはＰＭＢである。

（ｂ）（ｉ）ステップ（ａ）で形成された三糖を、エポキシ化剤と反応し、三糖エポキシドを形成すること、及び

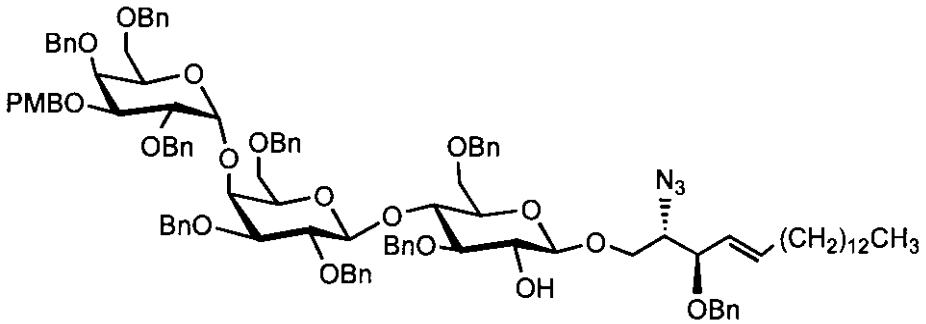
（ii）ステップ（ｂ）（ｉ）で形成された三糖エポキシドを、下記構造を有する化合物と反応し、

【化１１】



下記構造を有する保護された三糖セラミドを形成すること、

【化１２】



（ｃ）（ｉ）ステップ（ｂ）（ii）で形成されたセラミドをアシル化すること、及び

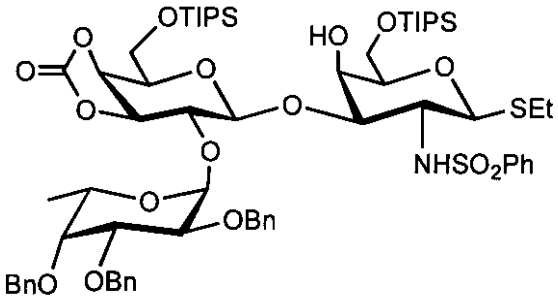
（ii）ステップ（ｃ）（ｉ）で形成された化合物を選択的に脱保護し、三糖セラミドを形成すること、

を具備した方法。

【請求項３】

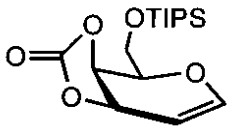
下記構造を有するメルカプト三糖を合成する方法であって、

【化１３】



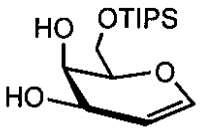
（ａ）下記構造を有する化合物を、

【化１４】



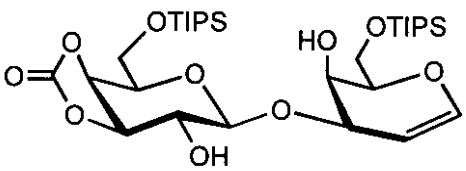
下記構造を有する化合物とカップリングし、

【化１５】



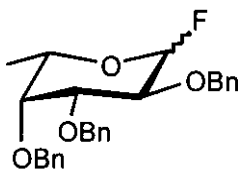
下記構造を有する二糖を形成すること、

【化１６】



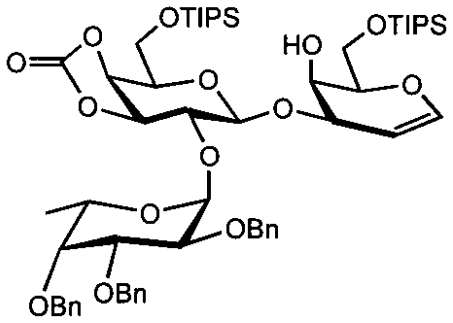
（ｂ）ステップ（ａ）で形成された二糖を、下記構造を有する化合物とカップリングし、

【化１７】



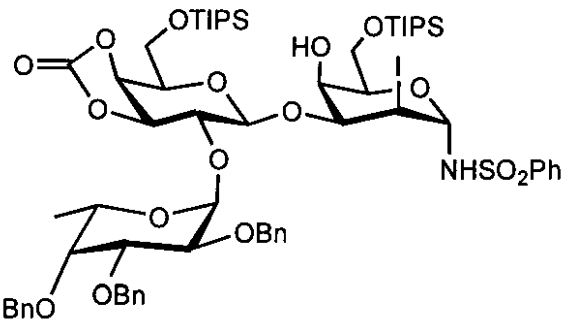
下記構造を有する三糖を形成すること、

【化１８】



（ｃ）ステップ（ｂ）で形成された三糖をヨードスルホンアミド化し、下記構造を有するヨードスルホンアミドを形成すること、

【化１９】



及び

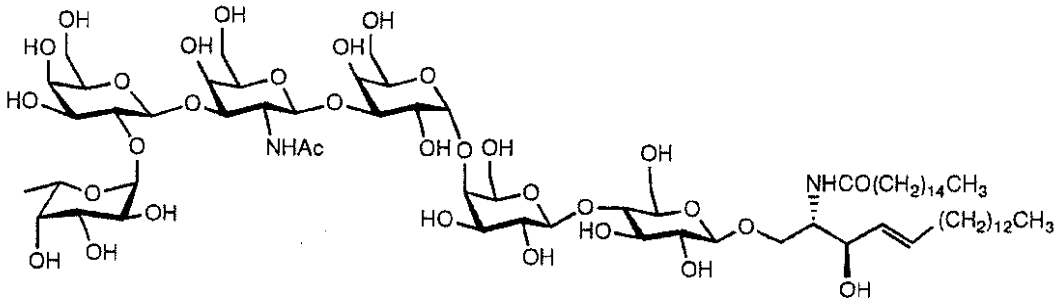
（ｄ）ステップ（ｃ）で形成されたヨードスルホンアミドをチオレートと反応し、メルカプト三糖を形成すること、

を具備した方法。

【請求項４】

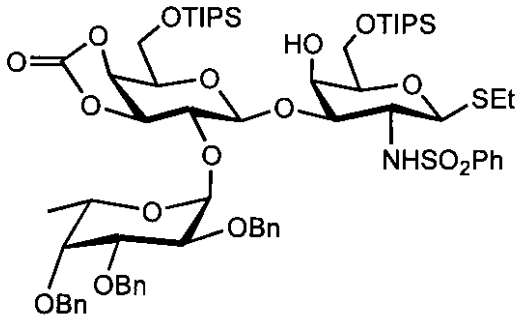
下記構造を有する六糖セラミドを合成する方法であって、

【化２０】



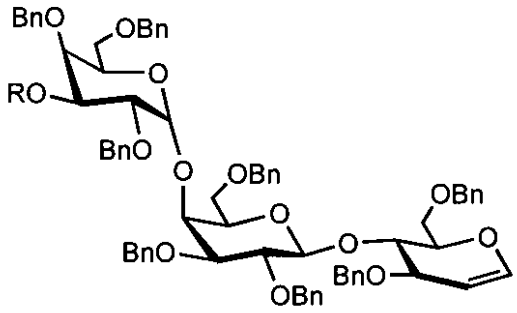
（ａ）下記構造を有する化合物を、

【化２１】



下記構造を有する化合物とカップリングし、

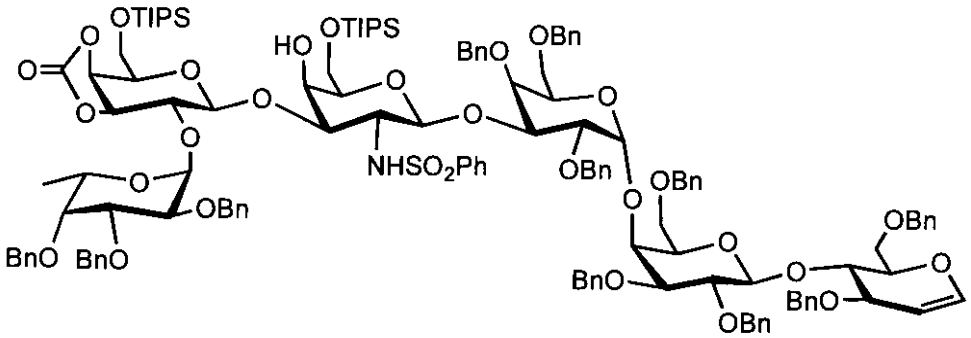
【化２２】



但し、ＲはＨである。

下記構造を有する化合物を形成すること、

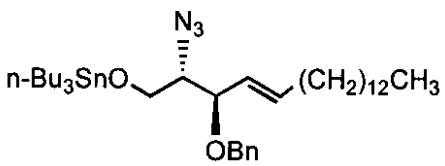
【化２３】



（ｂ）（ｉ）ステップ（ａ）で形成された化合物をエポキシ化剤と反応し、六糖エポキシドを形成すること、及び、

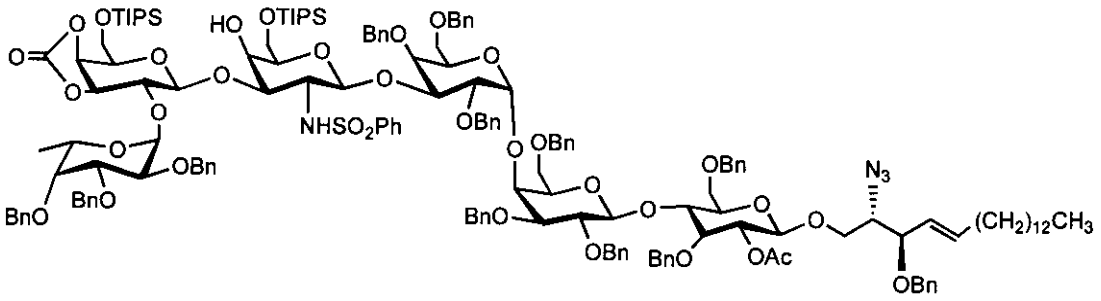
（ii）六糖エポキシドを、下記構造を有するスズエーテルと反応し、

【化２４】

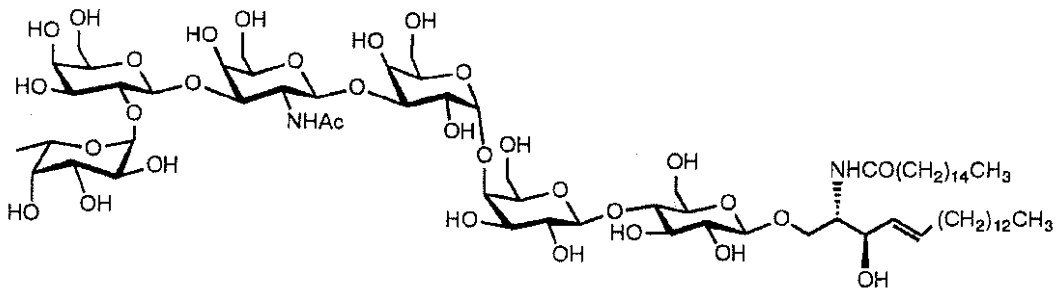


六糖アルコールを形成すること、

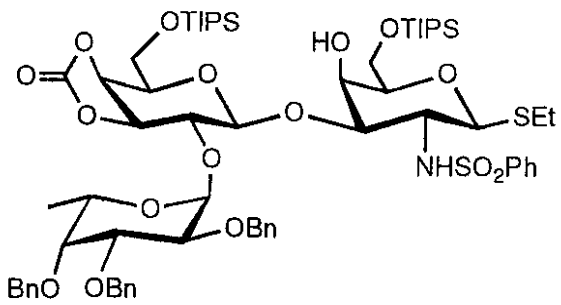
（ｃ）ステップ（ｂ）（ｉｉ）で形成された六糖アルコールを、アシル化し、下記構造を有する六糖アセテートを形成すること、
【化２５】



（ｄ）ステップ（ｃ）で形成された六糖アセテートを、パルミチン酸無水物の存在下で還元的にアシル化し、六糖セラミドを形成すること、
（ｅ）六糖セラミドを脱シリル化し、部分的に脱保護された六糖セラミドを形成すること、
（ｆ）（ｉ）部分的に脱保護された六糖セラミドを還元し、脱保護された六糖セラミドアセテートを形成すること、
（ｉｉ）脱保護された六糖セラミドアセテートをアシル化し、六糖セラミドパーアセテートを形成すること、及び
（ｇ）六糖セラミドパーアセテートをケン化し、六糖セラミドを形成すること、
を具備した方法。
【請求項５】
下記構造を有する六糖セラミドを合成する方法であって、
【化２６】

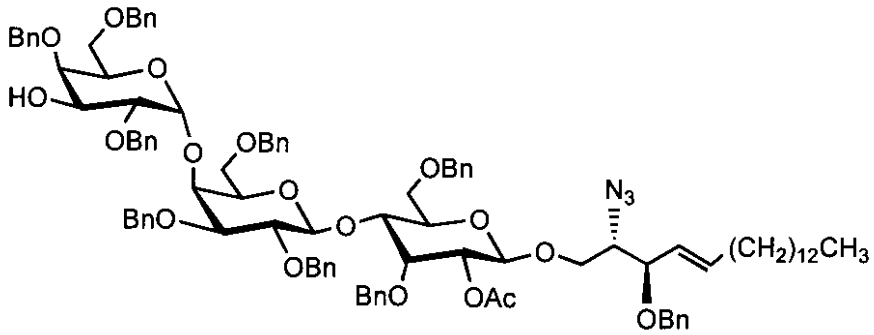


（ａ）下記構造を有する化合物を、
【化２７】



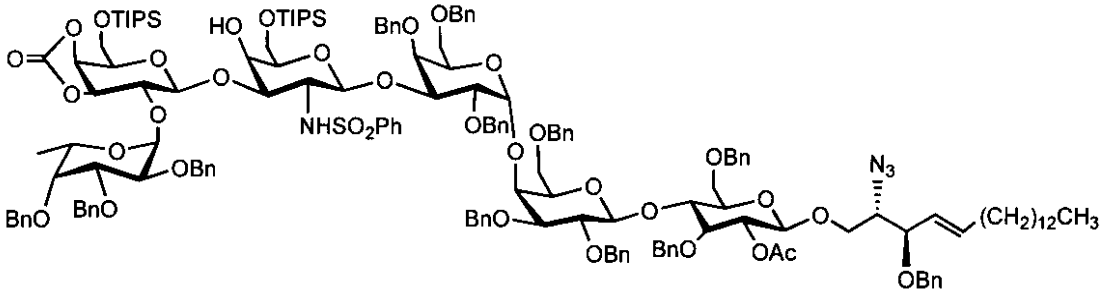
下記構造を有する化合物とカップリングし、

【化２８】



下記構造を有する六糖を形成すること、

【化２９】



及び

（ｂ）（ｉ）ステップ（ａ）で形成された六糖を、パルミチン酸無水物の存在下で還元し、パルミトイルアミドを形成すること、

（ii）パルミトイルアミドを、R_4NF（但し、各Ｒは独立に、同じであるか、又は異なっており、直鎖又は分岐鎖のアルキル、アラルキル又はアリール基である。）で脱シリル化し、部分的に脱保護された六糖を形成すること、

（iii）ステップ（ｂ）（ii）で形成された六糖を脱保護し、脱保護された六糖を形成すること、

（iv）ステップ（ｂ）（iii）で形成された六糖を、アシル化し、六糖セラミドパーアセテートを形成すること、

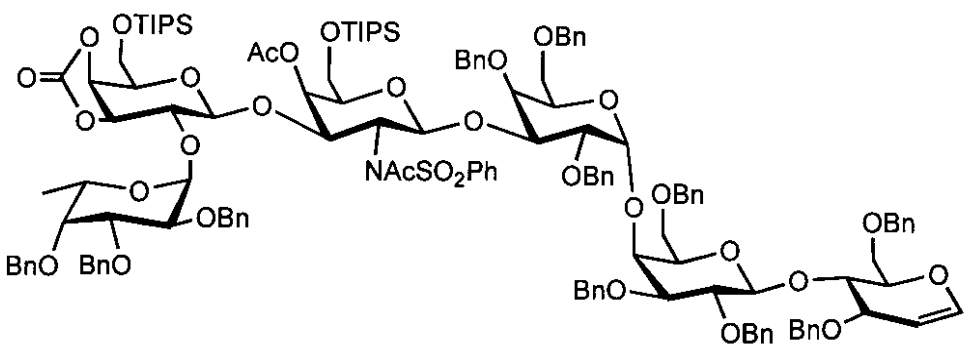
（ｖ）六糖セラミドパーアセテートをケン化し、六糖セラミドを形成すること、

を具備した方法。

【請求項６】

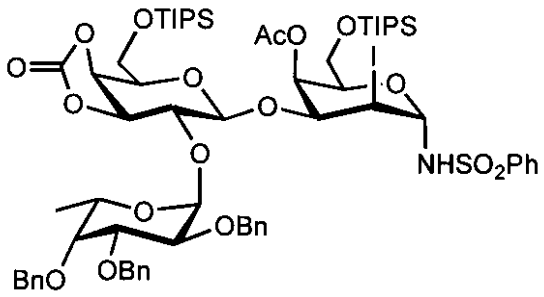
下記構造を有する六糖を合成する方法であって、

【化３０】



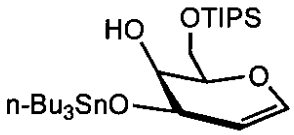
（ａ）下記構造を有する化合物を、

【化３１】



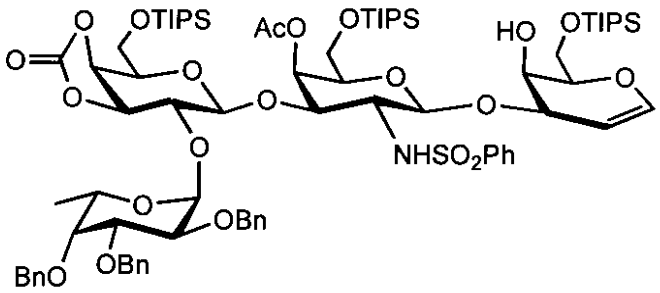
下記構造を有する化合物とカップリングし、

【化３２】



下記構造を有する化合物を形成すること、

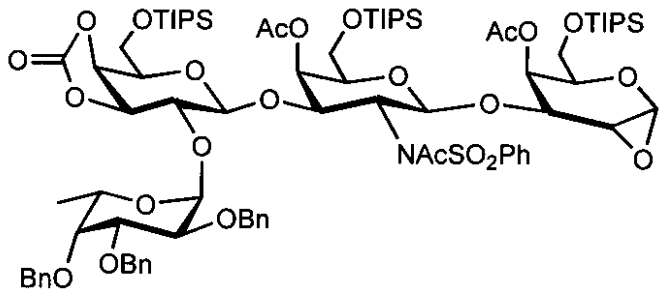
【化３３】



（ｂ）（ｉ）ステップ（ａ）で形成された化合物をアシル化すること、及び

（ii）ステップ（ｂ）（ｉ）で形成された化合物をエポキシ化剤と反応し、下記構造を有するエポキシドを形成すること、

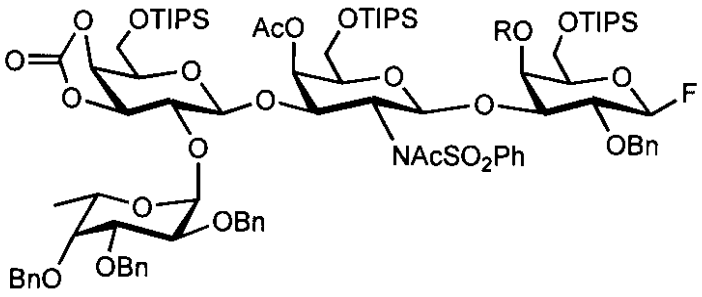
【化３４】



（ｃ）（ｉ）該エポキシドを、R_4NF（但し、各Ｒは独立に同じであるか、又は異なっており、直鎖又は分岐鎖のアルキル、アラルキル又はアリール基である。）で処理すること、及び

（ii）ステップ（ｃ）（ｉ）で形成された化合物を、アルキル化し、下記構造を有する化合物を形成すること、

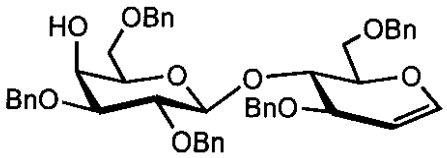
【化３５】



但し、ＲはＨ又はアシルである。

（ｄ）ステップ（ｃ）（ｉｉ）で形成された化合物を、下記構造を有する化合物とカップリングし六糖を形成すること、

【化３６】

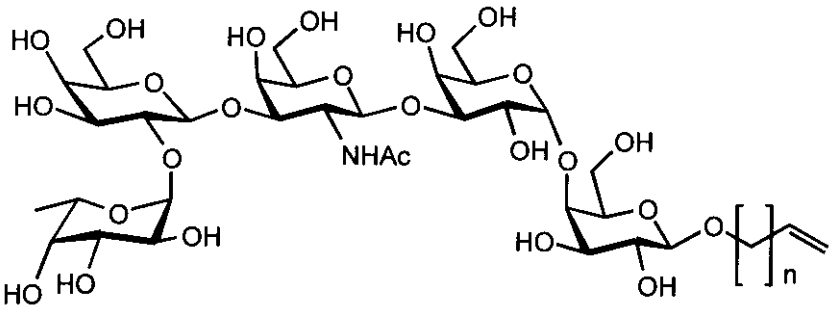


を具備した方法。

【請求項７】

下記構造を有する化合物。

【化３７】

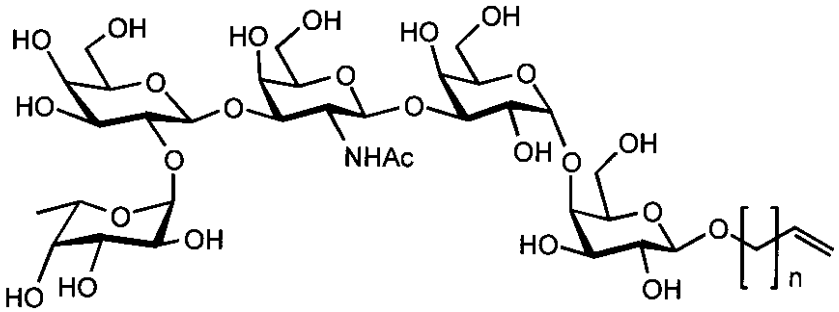


但し、ｎは０から９の間の整数である。

【請求項８】

タンパク質キャリアーに結合された、下記構造を有する化合物。

【化３８】



但し、ｎは０から９の間の整数である。