



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 940280
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07H 17/04, C 07H 23/00
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.01.94
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 15.07.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 20.01.94
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP92/01605
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
23.07.91 IT 91002025 P

(71) Hakija - Sökande

1. Sicor Societa Italiana Corticosteroidi S.p.A., Via Senato 19, 20121 Milano, Italia, (IT)

(72) Keksijä - Uppfinnare

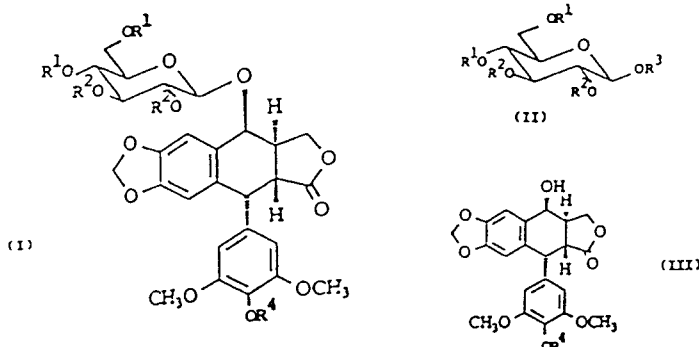
1. Allevi, Pietro, Via Terrazzano, 77, 20017 Rho, Italia, (IT)
2. Anastasia, Mario, Via Terrazzano, 77, 20017 Rho, Italia, (IT)
3. Bigatti, Ettore, Via Terrazzano, 77, 20017 Rho, Italia, (IT)
4. Macdonald, Peter, Via Terrazzano, 77, 20017 Rho, Italia, (IT)

(74) Asiamies - Ombud: Forssén & Salomaa Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Menetelmä demetyylipeppodofyyliilotoksiinin valmistamiseksi
Förfarande för framställning av demetylpepydofyllotoxin

(57) Tiivistelmä - Sammandrag



Esitetään menetelmä uusien kaavan (I) mukaisten DMEP- β -D-glukosidien valmistamiseksi, (jossa R^1 on alempi alkanoyyliryhmä, haloasetyyliryhmä, tai molemmat R^1 , otettuna yhdessä, muodostavat alkylideeni-, arylialkylideeni- tai heteroaryylialkylideeniryhmän; R^2 on alempi alkanoyyli- tai haloasetyyliryhmä; R^4 on vety, tunnettu siitä, että annetaan kaavan (III) mukaisen yhdisteen, jossa R^4 on vety, reagoita kaavan II mukaisen yhdisteen kanssa, jossa R^1 on alempi alkanoyyliryhmä, haloasetyyliryhmä, tai molemmat R^1 yhdessä otettuna, muodostavat alkylideeni-, arylialkylideeni- tai heteroaryylialkylideeniryhmän; R^2 on alempi alkanoyyli- tai haloasetyyliryhmä; R^3 on vety tai trialkyylisilyyliryhmä, Lewis-hapon, kuten booritrifluoridin, läsnäollessa. Siten valmistetut kaavan (I) mukaiset yhdisteet ovat arvokkaita väliaineita DMPE- β -D-glukosidien valmistukseen, joihin kuuluu Etoposide (I, molemmat R^1 = ettyylideeni, R^2 = H, R^4 = H) ja Teniposide (I, R^1 = tenyylideeni, R^2 = H, R^4 = H).

Här presenteras en förfarande för att producera nya DMEP- β -D-glukosider med formeln (I), där R^1 är en lägre alkanoylgrupp, haloacetylgrupp, eller bägge grupperna R^1 tagna tillsammans bildar en alkyliden-, arylalkyliden- eller heteroaryalkylidengrupp; R^2 är en lägre alkanoyl- eller haloacetylgrupp; R^4 är väte, kännetecknat därav, att en förening med formeln (III) där R^4 är väte, får reagera med en förening med formeln (II) där R^1 är en lägre alkanoylgrupp, haloacetylgrupp, eller bägge grupperna R^1 tagna tillsammans bildar en alkyliden-, arylalkyliden- eller heteroaryalkylidengrupp; R^2 är en lägre alkanoyl- eller haloacetylgrupp; R^3 är en väte eller trialkylsilylgrupp, i närvaro av en Lewis syra som borttrifluorid. Sålunda framställda föreningar med formeln (I) är värdefulla mellanprodukter för framställning av DMEP- β -D-glukosider innefattande Etoposide (I, bägge grupperna R^1 = etyliden, R^2 = H, R^4 = H) och Teniposide (I, R^1 = tenyliden, R^2 = H, R^4 = H).