

【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17年4月7日(2005.4.7)

【公表番号】特表2004-509131(P2004-509131A)

【公表日】平成16年3月25日(2004.3.25)

【年通号数】公開・登録公報2004-012

【出願番号】特願2002-526897(P2002-526897)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 J 71/00

【F I】

C 0 7 J 71/00

【手続補正書】

【提出日】平成15年5月20日(2003.5.20)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

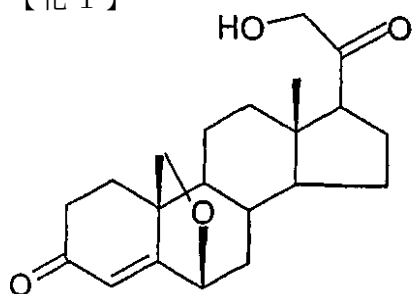
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の21-ヒドロキシ-6,19-オキシドプロゲステロン(1)、

【化1】



(1)

あるいはそのアシル又はホスフェート誘導体の製造方法であって、以下のステップ：

- a) 21-アセトキシプレグネノロンを準備し；
- b) 21-アセトキシプレグネノロンのC-3ヒドロキシ基を不安定なエステル形成により保護し；
- c) 上記エステル保護された21-アセトキシプレグネノロンのC5-C6の位置の二重結合への臭素及びヒドロキシ基の付加によりそのプロモヒドリン産物を得；
- d) 照射下、「スアレ試薬」(ジアセトキシヨードベンゼン)及びヨウ素を用いてC19原子による分子内の環化を実施し、それにより骨格内に6,19オキシド架橋を得、
- e) 選択的な加水分解を実施し、続いて、酸化を実施して、プロモケトンを得、
- f) ステップe)から得られたプロモケトンの加水分解を実施して、21-ヒドロキシ-6,19-オキシドプロゲステロン(1)を得；そして、場合により
- g) 化合物(1)をアシル化剤又はリン酸化剤と反応させる、を含む上記製造方法。

【請求項2】

21-アセテート誘導体が、ステップf)の21-ヒドロキシ-6,19-オキシドプロゲステロン(1)

のアセチル化により得られる、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

C1-18アシル誘導体が、C1-18の酸、無水物、活性エステル、又は塩化アシルを用いた21-ヒドロキシ-6,19-オキシドprogesteron(1)のエステル化により得られる、請求項1に記載の方法。

【請求項4】

21-プロピオネート、21-ヘキサクシネート、21-ホスフェート、21-オレエート誘導体が、プロピオン酸、コハク酸、オレイン酸、又はそれらの無水物、活性エステル、若しくは酸塩化物を用いたステップf)の21-ヒドロキシ-6,19-オキシドprogesteron(1)のエステル化により得られる、請求項1に記載の方法。

【請求項5】

前記21-ホスフェート誘導体が、リン酸化剤を用いたステップf)のオキシドprogesteron(1)の反応により得られる、請求項1に記載の方法。

【請求項6】

ステップb)に関して、ギ酸エステルを与える、請求項1～5にいずれか1項に記載の方法。

【請求項7】

前記分子内の環化ステップd)を、溶媒としてのジクロロメタン中で実施する、請求項1～6のいずれか1項に記載の方法。

【請求項8】

前記ステップe)における選択的な加水分解を、溶媒としてのMeOH/ジクロロメタン中でHClを用いて実施する、請求項1～7のいずれか1項に記載の方法。

【請求項9】

前記ステップe)における酸化を、塩化クロム酸ピリジニウム(PCC)を用いて実施する、請求項1～8のいずれか1項に記載の方法。

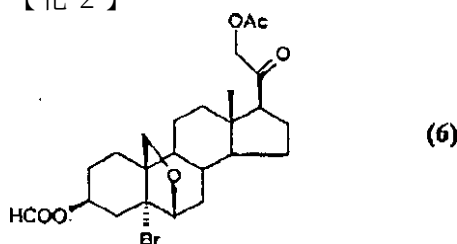
【請求項10】

前記ステップf)における加水分解を、溶媒としてのMeOH/ジクロロメタン中でKOHを用いて実施する、請求項1～9のいずれか1項に記載の方法。

【請求項11】

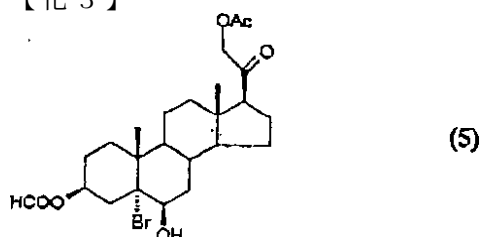
以下の(6)：

【化2】



で表される分子の製造方法であって、以下の分子(5)：

【化3】



の6-OHとC₁₉の間の分子内の環化を実施するステップを含む上記製造方法。

【請求項12】

前記の分子内の環化を、DIAB及びI₂を用いた光化学反応により行う、請求項11に記載の方法。

【請求項13】

前記の分子内の環化を、 CH_2Cl_2 中で行う、請求項11又は12に記載の方法。