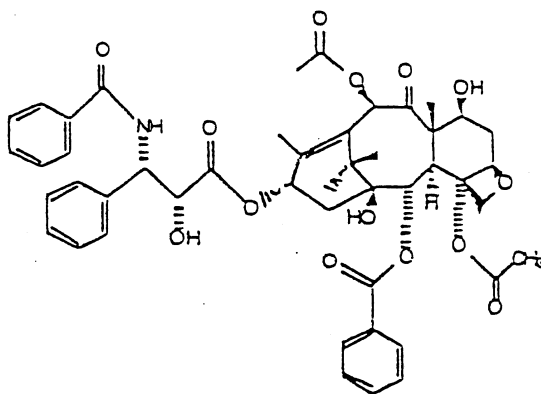


六、申請專利範圍

附件 二：第 89110075 號更正後無劃線之

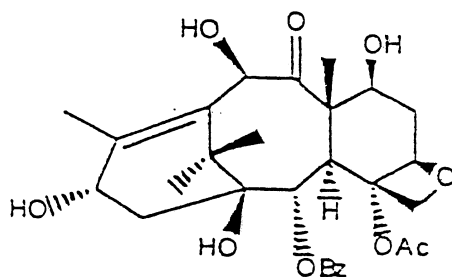
中文申請專利範圍替換本 民國 93 年 10 月 27 日呈

1. 一種合成具下式之紫杉醇之方法：



該方法包括下列步驟：

a. 令如下式之 10-脫乙酰基漿果赤黴素-III 在溶劑形成之溶液：



用形成具有式 $-Si(R)_2(OR')$ 之保護基之矽烷化試劑處理，而形成具下式之 7-O-經保護之 10-脫乙酰基漿果赤黴素-III 衍生物：

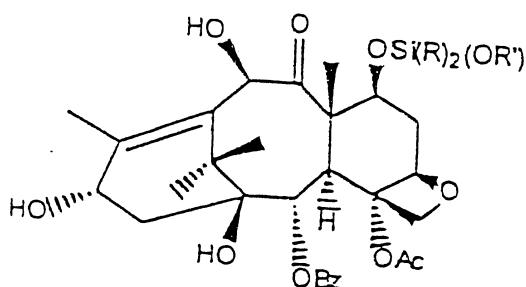
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

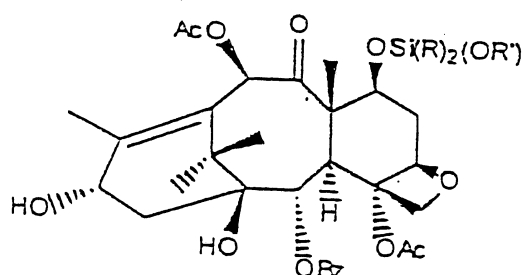
六、申請專利範圍



(其中 R 為 Me、Et、i-Pr、Bu 及 Ph，及

R' 為 Me、Et、Pr、i-Pr、t-Bu、
CH₂CF₃、CH₂CF₂CF₃、CH(CF₃)₂ 及 H，

b. 使 C-10 位置之羥基進行選擇性乙醯化作用而
形成具下式之 7-O-經保護之 10-脫乙醯基漿果赤黴素-III 衍生物：



(其中 R 為 Me、Et、i-Pr、Bu 及 Ph，及

R' 為 Me、Et、Pr、i-Pr、t-Bu、
CH₂CF₃、CH₂CF₂CF₃、CH(CF₃)₂ 及 H；
及

c. 於溶劑中，將經保護之紫杉醇側鏈與該 7-O-
經保護之 10-脫乙醯基漿果赤黴素-III 衍生物反應，使
得該側鏈偶聯於該 7-O-經保護之 10-脫乙醯基漿果
赤黴素-III 衍生物之 C-13 位置。

2. 如申請專利範圍第 1 項之方法，其中於 7-O-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

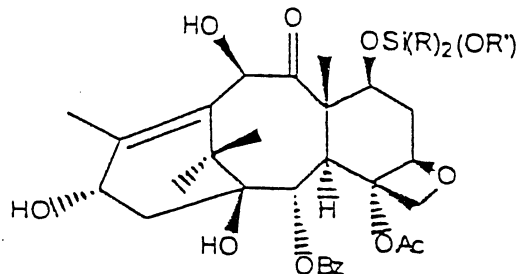
訂

線

六、申請專利範圍

位置之該保護基為二異丙基甲氧矽烷基。

3. 一種具下式之紫杉醇衍生物：

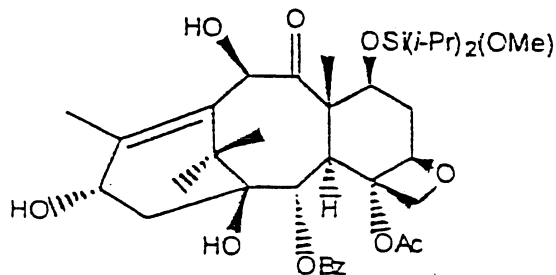


式中 $R = \text{Me}$ 、 Et 、 $i\text{-Pr}$ 、 $n\text{-Bu}$ 或 Ph ；

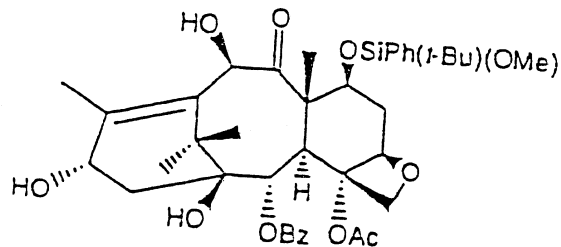
及

$R' = \text{H}$ 、 Me 、 Et 、 Pr 、 $i\text{-Pr}$ 、 $t\text{-Bu}$ 、 CH_2CF_3 、 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、或 $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ 。

4. 一種具下式之紫杉醇衍生物：



5. 一種具下式之紫杉醇衍生物：



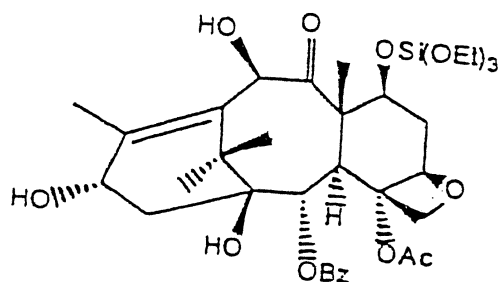
6. 一種具下式之紫杉醇衍生物：

裝

訂

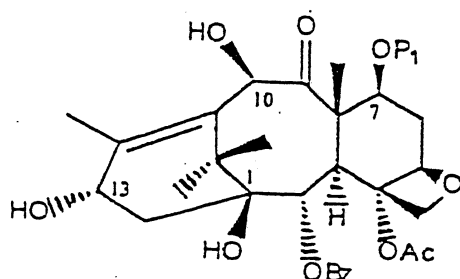
線

六、申請專利範圍



7. 一種以具下式之中間體化合物製造紫杉醇之方法

:



式中 P_1 為保護基，該製法包括下列步驟：於 C - 10 位置進行選擇性乙醯化作用，隨後於 C - 13 偶合一紫杉醇側鏈，接著以 H 置換 P_1 於 C - 7 進行脫保護作用。

8. 如申請專利範圍第 7 項之製法，其中該保護基 P_1 具有化學式： $-Si(R)_2(OR')$ ，其中 R 為 Me、Et、i-Pr、Bu 及 Ph， R' 為 Me、Et、Pr、i-Pr、t-Bu、 CH_2CF_3 、 $CH_2CF_2CF_3$ 、 $CH(CF_3)_2$ 及 H。

9. 如申請專利範圍第 8 項之製法，其中該保護基為二異丙基甲氧矽烷基。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線