

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
18. Mai 2007 (18.05.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2007/053869 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation:

*C07D 405/04* (2006.01)    *C07H 19/04* (2006.01)  
*C07D 495/10* (2006.01)

IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/AT2006/000458

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(22) Internationales Anmeldedatum:  
8. November 2006 (08.11.2006)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
A 1837/2005 9. November 2005 (09.11.2005) AT

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): SAISCHEK UND PARTNER MEG [AT/AT]; Z.Hd. DI Saischek Gerald, St. Veiter Strasse 13, A-8045 Graz (AT).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SAISCHEK, Gerald [AT/AT]; St. Veiter Strasse 13, A-8045 Graz (AT). SAISCHEK, Ewald [AT/AT]; Sankt Veiter Strasse 13, A-8045 Graz (AT).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN,

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Identität des Erfinders (Regel 4.17 Ziffer i)
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv)

Veröffentlicht:

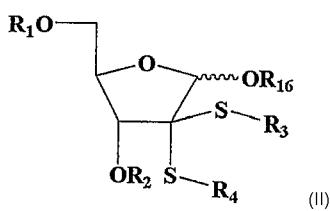
- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 26. Juli 2007

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: NOVEL 2,2-DITHIOSUBSTITUTED FURANOSE DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION AND USE THEREOF

(54) Bezeichnung: 2,2-DITHIOSUBSTITUIERTE FURANOSEDERIVATE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG



(57) Abstract: The invention relates to compounds of general formula (1), in which R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> and R<sub>4</sub> are defined as cited in the description and R<sub>5</sub> is either the radical of a base of general formula (3), in which R<sub>8</sub> and R<sub>9</sub> independently of one another represent hydrogen or an amino protecting group, preferably an optionally substituted alkanoyl or aroyl group or the radical of a base of general formula (4), in which R<sub>10</sub> represents hydrogen, a saturated or unsaturated 1-3 C alkyl group with between 1 and 3 carbon atoms, bromine, fluorine, chlorine or iodine. The compounds can be used as valuable and appropriate intermediates for the production of geminal difluoronucleosides, which are in turn used in anti-viral and anti-carcinogenic treatments. The fluorination is achieved by means of oxidative desulphofluorination, which permits the economic production of geminal fluoronucleosides.

WO 2007/053869 A3

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der allgemeinen Formel (1), in der R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> und R<sub>4</sub> die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben und R<sub>5</sub> entweder das Radikal einer Base der allgemeinen Formel (3), in der R<sub>8</sub> und R<sub>9</sub> unabhängig voneinander Wasserstoff oder eine Aminoschutzgruppe, vorzugsweise ein gegebenenfalls substituierter Alkanoyl- oder Aroylrest, oder das Radikal einer Base der allgemeinen Formel (4), in der R<sub>10</sub> Wasserstoff, einen gesättigten oder ungesättigten Alkylrest mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, oder Brom, Fluor, Chlor oder Jod bedeutet. Die Verbindungen können als wertvolle und geeignete Zwischenprodukte zur Bildung von geminalen Difluor-Nucleosiden dienen, welche zur antiviralen und antikarzinogenen Behandlung eingesetzt werden. Die Fluorierung erfolgt durch oxydative Desulfofluorierung, welche eine ökonomische Herstellung geminaler Fluor-Nucleoside ermöglicht.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/AT2006/000458

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
INV. C07D405/04 C07D495/10 C07H19/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
C07D C07H

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 544 010 A1 (JAPAN TOBACCO INC [JP]) 2 June 1993 (1993-06-02) claims 1,2 -----	1,10-14, 25
A	EP 0 576 230 A1 (LILLY CO ELI [US]) 29 December 1993 (1993-12-29) cited in the application claim 1 -----	1,25
A	EP 0 576 227 A (LILLY CO ELI [US]) 29 December 1993 (1993-12-29) cited in the application claim 1 ----- -/-	1,25

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  22 March 2007	Date of mailing of the international search report  01/06/2007
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer  Hass, Christian

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/AT2006/000458

## C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	HERTEL L W: "SYNTHESIS OF 2-DEOXY-2,2-DIFLUORO-D-RIBOSE AND 2-DEOXY-2,2-DIFLUORO-D-RIBOFURANOSYL NUCLEOSIDES" JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. EASTON, US, vol. 53, no. 11, 27 May 1988 (1988-05-27), pages 2406-2409, XP000572745 ISSN: 0022-3263 Seite 2407, Schemata I, II, III -----	1,25
A	JP 07 278178 A (JAPAN TOBACCO INC) 24 October 1995 (1995-10-24) Spalte 5, Formeln am Kopf der Spalte -----	1
A	US 4 082 911 A1 (VORBRUGGEN HELMUT) 4 April 1978 (1978-04-04) cited in the application examples -----	1
A	REINER M ET AL: "Synthesis of 3-deoxy-d-manno-2-octulosonic acid (Kdo) and d-glycero-d-talo-2-octulosonic acid (Ko) and their alpha-glycosides" TETRAHEDRON: ASYMMETRY, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 11, no. 1, January 2000 (2000-01), pages 319-335, XP004202388 ISSN: 0957-4166 Seite 320, Schema 1, Formeln 2 und 3 -----	9

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/AT2006/000458

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0544010	A1	02-06-1993	DE DE WO JP US	69206765 D1 69206765 T2 9222548 A1 4368382 A 5416204 A	25-01-1996 05-09-1996 23-12-1992 21-12-1992 16-05-1995
EP 0576230	A1	29-12-1993	AT AU BR CA CN CZ DE DE DK ES FI GR HU JP MX NO PL US	137243 T 4134893 A 9302430 A 2098875 A1 1084177 A 9301231 A3 69302330 D1 69302330 T2 576230 T3 2087657 T3 932870 A 3020064 T3 64769 A2 6056876 A 9303711 A1 932289 A 299414 A1 5430026 A	15-05-1996 23-12-1993 11-01-1994 23-12-1993 23-03-1994 13-04-1994 30-05-1996 10-10-1996 20-05-1996 16-07-1996 23-12-1993 31-08-1996 28-02-1994 01-03-1994 31-05-1994 23-12-1993 27-12-1993 04-07-1995
EP 0576227	A	29-12-1993	AU BR CA CN CZ FI HU JP MX NO PL	4134793 A 9302433 A 2098876 A1 1084178 A 9301232 A3 932868 A 64553 A2 6056877 A 9303709 A1 932287 A 299412 A1	23-12-1993 11-01-1994 23-12-1993 23-03-1994 16-03-1994 23-12-1993 28-01-1994 01-03-1994 31-05-1994 23-12-1993 27-12-1993
JP 7278178	A	24-10-1995	CA	2163890 A1	15-10-1995
US 4082911	A1			NONE	

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/AT2006/000458

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
 INV. C07D405/04 C07D495/10 C07H19/04

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
**C07D C07H**

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

**EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data**

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 544 010 A1 (JAPAN TOBACCO INC [JP]) 2. Juni 1993 (1993-06-02) Ansprüche 1,2 -----	1,10-14, 25
A	EP 0 576 230 A1 (LILLY CO ELI [US]) 29. Dezember 1993 (1993-12-29) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 -----	1,25
A	EP 0 576 227 A (LILLY CO ELI [US]) 29. Dezember 1993 (1993-12-29) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 ----- -/-	1,25



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen  Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
22. März 2007	01/06/2007
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Hass, Christian

## C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	HERTEL L W: "SYNTHESIS OF 2-DEOXY-2,2-DIFLUORO-D-RIBOSE AND 2-DEOXY-2,2-DIFLUORO-D-RIBOFURANOSYL NUCLEOSIDES" JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. EASTON, US, Bd. 53, Nr. 11, 27. Mai 1988 (1988-05-27), Seiten 2406-2409, XP000572745 ISSN: 0022-3263 Seite 2407, Schemata I, II, III -----	1,25
A	JP 07 278178 A (JAPAN TOBACCO INC) 24. Oktober 1995 (1995-10-24) Spalte 5, Formeln am Kopf der Spalte -----	1
A	US 4 082 911 A1 (VORBRUGGEN HELMUT) 4. April 1978 (1978-04-04) in der Anmeldung erwähnt Beispiele -----	1
A	REINER M ET AL: "Synthesis of 3-deoxy-d-manno-2-octulosonic acid (Kdo) and d-glycero-d-talo-2-octulosonic acid (Ko) and their alpha-glycosides" TETRAHEDRON: ASYMMETRY, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, Bd. 11, Nr. 1, Januar 2000 (2000-01), Seiten 319-335, XP004202388 ISSN: 0957-4166 Seite 320, Schema 1, Formeln 2 und 3 -----	9

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/AT2006/000458

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0544010	A1	02-06-1993	DE DE WO JP US	69206765 D1 69206765 T2 9222548 A1 4368382 A 5416204 A		25-01-1996 05-09-1996 23-12-1992 21-12-1992 16-05-1995
EP 0576230	A1	29-12-1993	AT AU BR CA CN CZ DE DE DK ES FI GR HU JP MX NO PL US	137243 T 4134893 A 9302430 A 2098875 A1 1084177 A 9301231 A3 69302330 D1 69302330 T2 576230 T3 2087657 T3 932870 A 3020064 T3 64769 A2 6056876 A 9303711 A1 932289 A 299414 A1 5430026 A		15-05-1996 23-12-1993 11-01-1994 23-12-1993 23-03-1994 13-04-1994 30-05-1996 10-10-1996 20-05-1996 16-07-1996 23-12-1993 31-08-1996 28-02-1994 01-03-1994 31-05-1994 23-12-1993 27-12-1993 04-07-1995
EP 0576227	A	29-12-1993	AU BR CA CN CZ FI HU JP MX NO PL	4134793 A 9302433 A 2098876 A1 1084178 A 9301232 A3 932868 A 64553 A2 6056877 A 9303709 A1 932287 A 299412 A1		23-12-1993 11-01-1994 23-12-1993 23-03-1994 16-03-1994 23-12-1993 28-01-1994 01-03-1994 31-05-1994 23-12-1993 27-12-1993
JP 7278178	A	24-10-1995	CA	2163890 A1		15-10-1995
US 4082911	A1			KEINE		