

【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 25 年 4 月 4 日 (2013.4.4)

【公表番号】特表 2010-505954 (P2010-505954A)

【公表日】平成 22 年 2 月 25 日 (2010.2.25)

【年通号数】公開・登録公報 2010-008

【出願番号】特願 2009-532372 (P2009-532372)

【国際特許分類】

C 07 H 19/067 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/067

C 07 B 61/00 3 0 0

【誤訳訂正書】

【提出日】平成 25 年 2 月 13 日 (2013.2.13)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

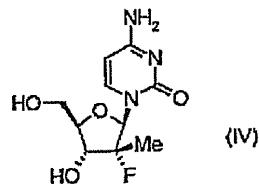
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

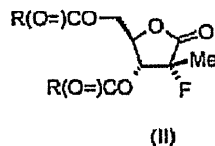
【請求項 1】

式



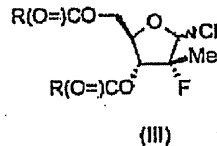
の 4 - アミノ - 1 - ( ( 2 R , 3 R , 4 R , 5 R ) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ヒドロキシメチル - 3 - メチル - テトラヒドロフラン - 2 - イル ) - 1 H - ピリミジン - 2 - オンの製造方法において、

a) 式 I I



( 上式中、R はアリール又はアルキルである )

の ( アリール ) アルカン酸 ( 2 R , 3 R , 4 R ) - 2 - ( アリール ) アルカノイルオキシメチル - 4 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - オキソ - テトラヒドロフラン - 3 - イルエステルを、式 I I I

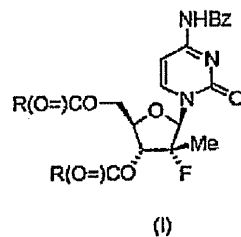


(上式中、R はアリール又はアルキルである)

の(アリール)アルカン酸(2R, 3R, 4R) - 2 - (アリール)アルカノイルオキシメチル - 5 - クロロ - 4 - フルオロ - 4 - メチル - テトラヒドロフラン - 3 - イルエステルに転換させ、

ここで、転換が、還元剤の存在下での還元と、続く塩素化剤の存在下での塩素化を含み

b) 式 I I I の(アリール)アルカン酸(2R, 3R, 4R) - 2 - (アリール)アルカノイルオキシメチル - 5 - クロロ - 4 - フルオロ - 4 - メチル - テトラヒドロフラン - 3 - イルエステルを式 I



(上式中、R がアリール又はアルキルであり B z がベンゾイルである)の

(アリール)アルカン酸(2R, 3R, 4R, 5R) - 3 - (アリール)アルカノイルオキシ - 5 - (4 - ベンゾイルアミノ - 2 - オキソ - 2 H - ピリミジン - 1 - イル) - 4 - フルオロ - 4 - メチル - テトラヒドロフラン - 2 - イルメチルエステルに転換させ、

ここで、転換が、ルイス酸の存在下で式 I I I の(アリール)アルカン酸(2R, 3R, 4R) - 2 - (アリール)アルカノイルオキシメチル - 5 - クロロ - 4 - フルオロ - 4 - メチル - テトラヒドロフラン - 3 - イルエステルを O - トリメチルシリル - N 4 - ベンゾイルシトシンと反応させることを含み、

c) 式 I の(アリール)アルカン酸(2R, 3R, 4R, 5R) - 3 - (アリール)アルカノイルオキシ - 5 - (4 - ベンゾイルアミノ - 2 - オキソ - 2 H - ピリミジン - 1 - イル) - 4 - フルオロ - 4 - メチル - テトラヒドロフラン - 2 - イルメチルエステルを加水分解して、式 I V の 4 - アミノ - 1 - ((2R, 3R, 4R, 5R) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ヒドロキシメチル - 3 - メチル - テトラヒドロフラン - 2 - イル) - 1 H - ピリミジン - 2 - オンを得、

ここで、加水分解が塩基の存在下で実施される  
ことを含む方法。

【請求項 2】

R がフェニルの意味であることを特徴とする請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

還元剤が水素化ビス - (2 - メトキシエトキシ) (2, 2, 2 - トリフルオロ - エトキシ) アルミニウムナトリウムであることを特徴とする請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

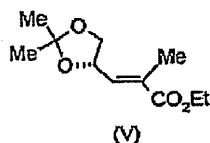
塩素化剤が塩化スルフリル、塩化チオニル又はオキシ塩化リンから選択されることを特徴とする請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

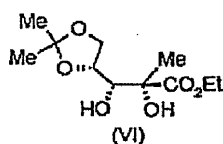
塩素化剤が、触媒量の臭化テトラブチルアンモニウムの存在下での塩化スルフリルであることを特徴とする請求項 4 に記載の方法。

## 【請求項 6】

a 1) 式 V の (E) - 3 - ((S) - 2, 2 - ジメチル - [1, 3] ジオキソラン - 4 - イル) - 2 - メチル - アクリル酸エチルエステル



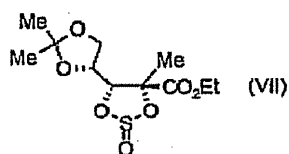
を、式 V I



の (2S, 3R) - 3 - ((R) - 2, 2 - ジメチル - [1, 3] ジオキソラン - 4 - イル) - 2, 3 - ジヒドロキシ - 2 - メチルプロピオン酸エチルエステルに転換させ、

ここで、転換が重炭酸ナトリウム及びエチレングリコールの存在下での過マンガン酸ナトリウムを用いて実施され、

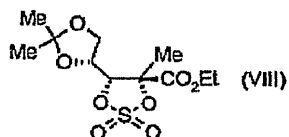
b 1) 式 V I の (2S, 3R) - 3 - ((R) - 2, 2 - ジメチル - [1, 3] ジオキソラン - 4 - イル) - 2, 3 - ジヒドロキシ - 2 - メチル - プロピオン酸エチルエステルを式 V I I



のサルファイトに転換させ

ここで、転換が塩化チオニルを用いて実施され、

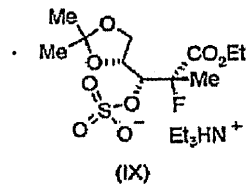
c 1) 式 V I I のサルファイトを式 V I I I



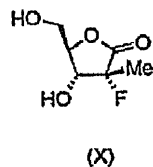
のサルフェートに更に反応させ

ここで、反応が次亜塩素酸ナトリウムを用いて実施され、

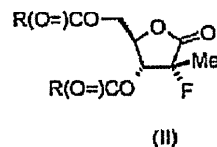
d 1) 式 V I I I のサルフェートを式 I X



のフルオロヒドリンサルフェートに転換させ、  
ここで、転換がトリアルキルアミンを用いて実施され、  
 e 1) 式 IX のフルオロヒドリンサルフェートを式 X



のラクトンに分解させ、  
ここで、分解が、塩化バリウム水を用いて実施され、  
 最後に  
 f 1) 式 X のラクトンをアシル化して、R がフェニルである式 I I の最終産物を形成させ  
、ここで、アシル化が安息香酸無水物を用いて実施されることを含む、式 I I



(上式中、R はフェニルである)  
 の (アリール) アルカン酸 (2 R, 3 R, 4 R) - 2 - (アリール) アルカノイルオキシ  
 メチル - 4 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - オキソ - テトラヒドロフラン - 3 - イルエステ  
 ルの調製を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

トリエチルアミン - トリハイドロフロライドと共にトリエチルアミンが使用されること  
 を特徴とする請求項 6 に記載の方法。