

【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 61/00 300

【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

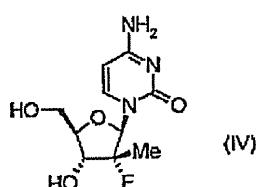
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

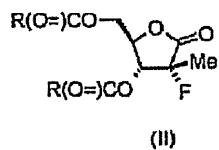
【請求項1】

式



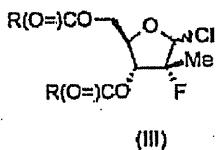
の4-アミノ-1-((2R,3R,4R,5R)-3-フルオロ-4-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル-3-メチル-テトラヒドロフラン-2-イル)-1H-ピリミジン-2-オンの製造方法において、

a) 式II



(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-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III

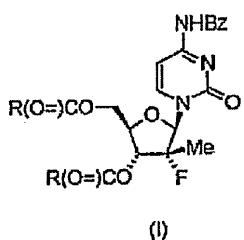


(上式中、Rはアリール又はアルキルである)

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II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Bz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-2H-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II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-N4-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-2H-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IV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)-1H-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】

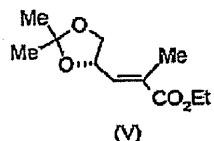
塩素化剤が塩化スルフリル、塩化チオニル又はオキシ塩化リンから選択されることを特徴とする請求項1に記載の方法。

【請求項5】

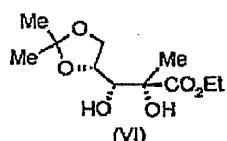
塩素化剤が、触媒量の臭化テラブチルアンモニウムの存在下での塩化スルフリルであることを特徴とする請求項4に記載の方法。

【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



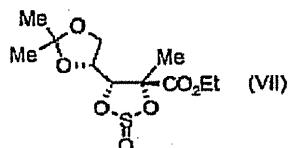
を、式 VI



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、

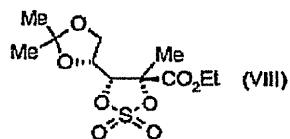
b 1) 式 VI の (2S,3R)-3-((R)-2,2-ジメチル-[1,3]ジオキソラン-4-イル)-2,3-ジヒドロキシ-2-メチル-プロピオン酸エチルエステルを式 VII



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、

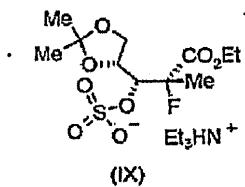
c 1) 式 VII のサルファイトを式 VIII



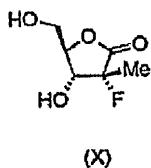
のサルフェートに更に反応させ

ここで、反応が次亜塩素酸ナトリウムを用いて実施され、

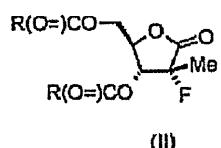
d 1) 式 VIII のサルフェートを式 IX



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 II 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 II



(上式中、R はフェニルである)
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-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。