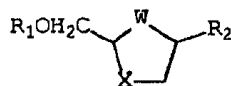


Revendicări:

1. Procedeu diastereoselectiv de obținere a cis-nucleozidei, analogilor și derivaților de nucleozidă optic activi cu formula (I)



în care :

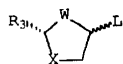
W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

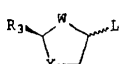
R₁ reprezintă hidrogen sau acil;

sau

R₂ reprezintă baza purinică sau pirimidinică necesară sau un analog sau derivat al acestora, **caracterizat prin aceea că** include etapa de glicozilare a bazei purinice sau pirimidinice necesare sau analogului sau derivatului acestora cu un compus intermediar cu formula (IIa) sau (IIb)

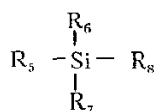


(IIa)



(IIb)

în care: R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și L reprezintă grupa care pleacă, utilizând acidul Lewis cu formula (III)



(III)

în care R₅, R₆ și R₇ se selectează în mod independent din grupa ce constă din hidrogen, C₁₋₂₀ alchil opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C₁₋₆ alcoxi sau C₆₋₂₀ ariloxi, C₇₋₂₀ aralchil opțional substituit cu halogen, C₁₋₂₀ alchil sau C₁₋₂₀ alcoxi, C₆₋₂₀ aril opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C₁₋₂₀ alchil sau C₁₋₂₀ alcoxi, trialchilsilil, fluor, brom, clor și iod; și

R₈ se selectează din grupa ce constă din fluor, brom, clor, iod, esteri ai acidului sulfonic C₁₋₂₀, opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod, alchil esteri C₁₋₂₀ opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod; triiodură; o grupă silil cu formula generală (R₅) (R₆) (R₇) Si (în care R₅, R₆ și R₇ au semnificațiile definite anterior); C₆₋₂₀ aril selenenil, C₆₋₂₀ arilsulfenil, C₆₋₂₀ alcoxi-alchil; și trialchilsiloxi.

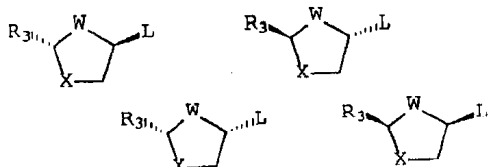
2. Procedeu conform revendicării 1, care cuprinde etapa de reducere a R₃ din baza purinică sau pirimidinică glicozilată sau din analogul sau derivatul lor pentru obținerea cis-nucleozidei sau analogul sau derivatul de nucleozidă optic activi cu formula (I).

3. Procedeu conform revendicării 1, care mai cuprinde etapa de obținere a compusului intermediar (IIa) sau (IIb) prin dezintegrarea chimică a compusului intermediar menționat din amestecul de (IIa) și (IIb) utilizând un agent auxiliar chiralic.

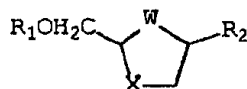
4. Procedeu conform revendicării 1, în care compusul intermediar reprezintă compusul cu formula (IIa).

5. Procedeu conform revendicării 1, în care compusul intermediar reprezintă compusul cu formula (IIb).

6. Procedeu conform revendicării 1, în care compusul intermediar se selectează din grupa ce constă din



7. Procedeu diastereoselectiv de obținere a cis-nucleozidei, analogilor și derivaților de nucleozidă optic activi cu formula (I)



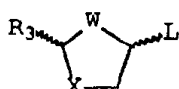
în care:

W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

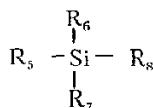
X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

R₁ reprezintă hidrogen sau acil; și

R₂ reprezintă baza purinică sau pirimidinică necesară sau un analog sau derivat al acestora, care include etapa de glicozilare a bazei purinice sau pirimidinice necesare sau a analogului sau a derivatului acestora cu un singur enantiomer al compusului cu formula (II)



în care R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și L reprezintă grupa care pleacă, utilizând acidul Lewis cu formula (III)



în care R_5 , R_6 și R_7 se selectează în mod independent din grupa ce constă din hidrogen; C_{1-20} alchil opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C_{1-6} alcoxi sau C_{6-20} ariloxi, C_{7-20} aralchil opțional substituit cu halogen, C_{1-20} alchil sau C_{1-20} alcoxi, C_{6-20} aril opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C_{1-20} alchil sau C_{1-20} alcoxi, trialchilsilil, fluor, brom, clor și iod; și

R_8 se selectează din grupa ce constă din fluor, brom, clor, iod, esteri ai acidului sulfonic C_{1-20} opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod, C_{1-20} alchil esteri opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod; triiodură; o grupă silil cu formula generală (R_5) (R_6) (R_7) Si (în care R_5 , R_6 și R_7 au semnificațiile definite anterior); C_{6-20} arilseleneni, C_{6-20} arilsulfeni, C_{6-20} alcoxi-alchil; și trialchilsiloxi.

8. Procedeu conform revendicării 7, care mai cuprinde etapa de reducere a R_3 din baza purinică sau pirimidinică glicozilată sau din analogul sau derivatul acestora pentru a obține cis-nucleozida sau analogul sau derivatul de nucleozidă optic activi cu formula (I).

9. Procedeu conform revendicării 7, care mai cuprinde etapa de dezintegrare a compusului cu formula (II) într-un singur enantiomer, utilizând un agent auxiliar chiralic până la glicozilarea bazei purinice sau pirimidinice necesare.

10. Procedeu conform oricărei din revendicările 1-9, în care W reprezintă O și X reprezintă S.

11. Procedeu conform revendicării 10, în care R_2 reprezintă o bază pirimidinică.

12. Procedeu conform revendicării 11, în care baza pirimidinică reprezintă citozină sau 5-fluorcitozină.

13. Procedeu conform oricărei din revendicările 1-9, în care acidul Lewis se selectează din grupa ce constă din trimetilsililtriflat și iodtrimetilsilan.

14. Procedeu conform revendicării 3 sau 9, în care agentul chiralic auxiliar se selectează din grupa ce constă din alcoolii chiralici și amine chiralice.

15. Procedeu conform revendicării 14, în care agentul chiralic auxiliar se selectează din grupa ce constă din (d)- mentol, (l)-mentol, (+)-norefedrină și (-)-norefedrină.

16. Procedeu conform oricărei dintre revendicările 1-9, în care R_3 se selectează din grupa ce constă din alcoxycarbonili, carboxili, dietilcarboxamidă, pirolidinamidă, metilcetonă și fenilcetonă.

17. Procedeu conform revendicării 16, în care R_3 se selectează din grupa ce constă din alcoxycarbonili și carboxili.

18. Procedeu conform revendicării 7 sau 8, care mai cuprinde etapa de obținere a compusului cu formula (II) prin reducere chemoselectivă a compusului cu formula (IVa)



și transformarea grupei hidroxil formată în grupa L ce părăsește molecula.

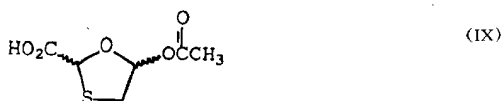
19. Procedeu conform revendicării 18, care mai cuprinde etapa de interacțiune a compusului cu formula (IVa) cu un agent chiralic auxiliar înainte de reducerea chemoselectivă.

20. Procedeu diastereoselectiv de obținere a cis-oxatiolanului, analogilor și derivaților optic activi cu formula (Ia)



în care R_1 reprezintă hidrogen sau acil; și

R_2 reprezintă baza purinică și pirimidinică necesară sau un analog sau un derivat al acestora, care cuprinde etapa de glicozilare a bazei purinice sau pirimidinice necesare sau analogului sau derivatului acestora cu un singur enantiomer al unui ester dezintegrat, derivat din compusul cu formula (IX)



utilizând acidul Lewis cu formula (III)



în care R_5 , R_6 și R_7 se selectează în mod independent din grupa ce constă din hidrogen; C_{1-20} alchil, opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C_{1-6} alcoxi sau C_{6-20} ariloxi, C_{7-20} aralchil, opțional substituit cu halogen, C_{1-20} alchil sau C_{1-20} alcoxi, C_{6-20} aril opțional substituit cu fluor, brom, clor, iod, C_{1-20} alchil sau C_{1-20} alcoxi; trialchilsilil, fluor, brom, clor și iod; și

R_8 se selectează din grupa ce constă din fluor, brom, clor, iod, esteri ai acidului sulfonic C_{1-20} opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod, C_{1-20} alchil esteri opțional substituiți cu fluor, brom, clor sau iod; triiodură; o grupă silil cu formula generală (R_5) (R_6) (R_7) Si (în care R_5 , R_6 și R_7 au semnificațiile definite anterior); C_{6-20} arilseleneni, C_{6-20} arilsulfeni, C_{6-20} alcoxialchil; și trialchilsiloxi.

21. Procedeu conform revendicării 20, care mai cuprinde etapa de reducere a bazei purinice și pirimidinice glicozilate și a analogului sau derivatului acestora pentru obținerea cis-oxatiolanului sau analogului sau derivatului optic activi cu formula (Ia).

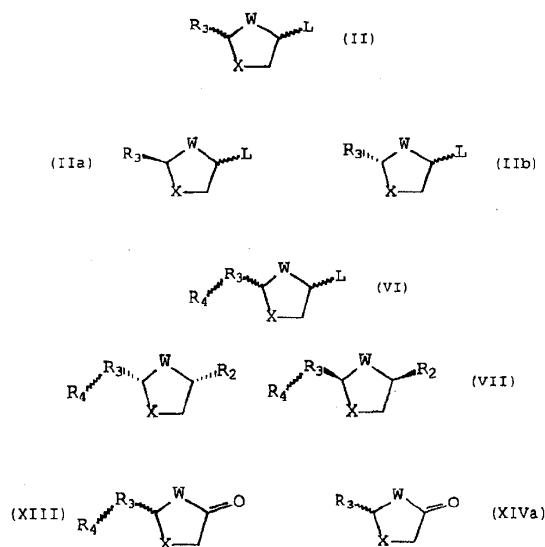
22. Procedeu conform revendicării 20, care mai cuprinde etapa de obținere a unui singur enantiomer al esterului derivat din compusul cu formula (IX), utilizând un agent chiralic auxiliar.

23. Procedeu conform revendicării 22, în care agentul chiralic auxiliar se selectează din grupa ce constă din (d)-mentol și (l)-mentol.

24. Procedeu conform revendicării 20, în care R₂ reprezintă o bază pirimidinică.

25. Procedeu conform revendicării 24, în care baza pirimidinică reprezintă citozină sau 5-fluorcitozină.

26. Compus intermediar selectat din grupa ce constă din



în care: W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

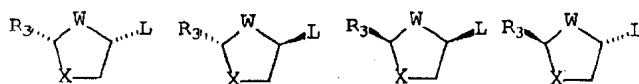
R₂ reprezintă o bază purinică sau pirimidinică sau un analog sau derivat al acestora;

R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil;

R₄ reprezintă un agent chiralic auxiliar; și

L reprezintă o grupă care pleacă.

27. Compus intermediar conform revendicării 26, selectat din grupa ce constă din



în care:

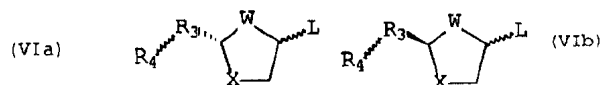
W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și

L reprezintă o grupă care pleacă.

28. Compus intermediar conform revendicării 26, selectat din grupa ce constă din



în care:

W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

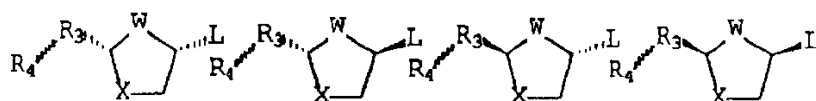
X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil;

R₄ reprezintă un agent chiralic auxiliar; și

L reprezintă o grupă care pleacă.

29. Compus intermediar conform revendicării 28, selectat din grupa ce constă din



în care:

W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil;

R₄ reprezintă un agent chiralic auxiliar; și

L reprezintă grupa care pleacă.

30. Compus intermediar conform oricărei din revendicările 26, 28 sau 29, în care R₄ se selectează din grupa ce constă din (d) - mentol și (l) - mentol.

31. Compus intermediar selectat din grupa ce constă din:

acidul trans-5-hidroxi oxatiolan-2-carboxilic;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-1,3-oxatiolan-5-on-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-1,3-oxatiolan-5-on-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-hidroxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-hidroxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-hidroxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-hidroxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-acetoxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-acetoxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-acetoxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-acetoxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5R-acetoxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-acetoxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5R-acetoxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-acetoxi-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-(citozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-(citozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-(citozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5R-(citozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5R-(5''-fluorcitozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2S-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-(5''-fluorcitozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-(N-4''-acetilcitozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'R, 2'S, 5'R)-mentil-5S-(citozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-5S-(N-4''-acetilcitozin-1''-il)-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-4R-hidroxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat; și

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-4S-hidroxi-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-4R-clor-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat; și

(1'S, 2'R, 5'S)-mentil-4S-clor-1,3-oxatiolan-2R-carboxilat;

cis-2(N-metil-N-metoxiaminocarbonil)-5-(uracil-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis- și trans-2-benzoil-5-acetoxi-1,3-oxatiolan;

cis-2-(1'-pirolidinocarbonil)-5-acetoxi-1,3-oxatiolan;

cis-2-carbometoxi-5-(5'-bromuracil-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-carboxil-5-(uracil-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-(1'-pirolidinocarbonil)-5-(uracil-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoil-5-(uracil-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis- și trans-izopropil 5-acetoxi-1,3-oxatiolan-2-carboxilat;

cis-izopropil -5-(citozin-1'-il)-1,3-oxatiolan-2-carboxilat;

cis- și trans-t-butil 5-acetoxi-1,3-oxatiolan-2-carboxilat;

cis- t-butil-5-(citozin-1'-il)-1,3-oxatiolan-2-carboxilat;

cis- și trans-2-N,N-dietilaminocarbonil- 5-acetoxi-1,3-oxatiolan;

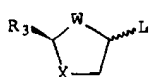
cis-2-N,N-dietilaminocarbonil- 5-(citozin-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis- și trans-2-carboetoxi-4-acetoxi-1,3-dioxolan;

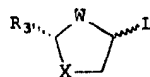
cis- și trans-2-carboetoxi-4-(timin-1'-il)-1,3-dioxolan; și

cis- și trans-2-carboetoxi-4-(N-4'-acetilcitozin-1'-il)-1,3-dioxolan.

32. Procedeu de obținere a compusului intermediar cu formula (IIa) sau (IIb), care cuprinde etapa de dezintegrare a amestecului de compuși cu formula (IIa) și (IIb), utilizând un agent chiralic auxiliar:



(IIa)



(IIb)

în care:

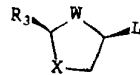
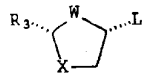
W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;

R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și

L reprezintă grupa care pleacă.

33. Procedeu de obținere a compusului cu formula



sau

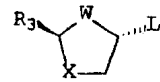
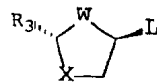
în care:

W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și

L reprezintă grupa care pleacă;

care cuprinde etapa de separare a amestecului de doi compuși prin intermediul unui agent chiralic auxiliar.

34. Procedeu de obținere a compusului cu formula



sau

în care:

W reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;X reprezintă S, S=O, SO₂ sau O;R₃ reprezintă carbonil substituit sau derivat de carbonil; și

L reprezintă grupa care pleacă;

care cuprinde etapa de separare a amestecului de doi compuși prin intermediul unui agent chiralic auxiliar.