

【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21年3月5日 (2009.3.5)

【公表番号】特表2008-526872(P2008-526872A)

【公表日】平成20年7月24日 (2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-029

【出願番号】特願2007-550475(P2007-550475)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/50 (2006.01)

C 0 7 C 227/14 (2006.01)

C 0 7 C 229/54 (2006.01)

C 0 7 C 65/34 (2006.01)

C 0 7 C 65/30 (2006.01)

C 0 7 C 255/57 (2006.01)

C 0 7 C 253/30 (2006.01)

C 0 7 C 303/22 (2006.01)

C 0 7 C 309/30 (2006.01)

C 0 7 C 311/16 (2006.01)

C 0 7 C 59/68 (2006.01)

C 0 7 C 63/04 (2006.01)

C 0 7 C 63/10 (2006.01)

C 0 7 D 327/08 (2006.01)

C 0 7 D 209/40 (2006.01)

C 0 7 D 213/80 (2006.01)

C 0 7 D 213/22 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 C 1/32 (2006.01)

C 0 7 C 15/14 (2006.01)

C 0 7 C 51/353 (2006.01)

C 0 7 C 231/14 (2006.01)

C 0 7 C 233/65 (2006.01)

C 0 7 C 65/105 (2006.01)

C 0 7 C 63/331 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 9/50 C S P

C 0 7 C 227/14

C 0 7 C 229/54

C 0 7 C 65/34

C 0 7 C 65/30

C 0 7 C 255/57

C 0 7 C 253/30

C 0 7 C 303/22

C 0 7 C 309/30

C 0 7 C 311/16

C 0 7 C 59/68

C 0 7 C 63/04

C 0 7 C 63/10

C 0 7 D 327/08

C 0 7 D 209/40
 C 0 7 D 213/80
 C 0 7 D 213/22
 C 0 7 D 409/04
 C 0 7 C 1/32
 C 0 7 C 15/14
 C 0 7 C 51/353
 C 0 7 C 231/14
 C 0 7 C 233/65
 C 0 7 C 65/105
 C 0 7 C 63/331
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月9日(2009.1.9)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

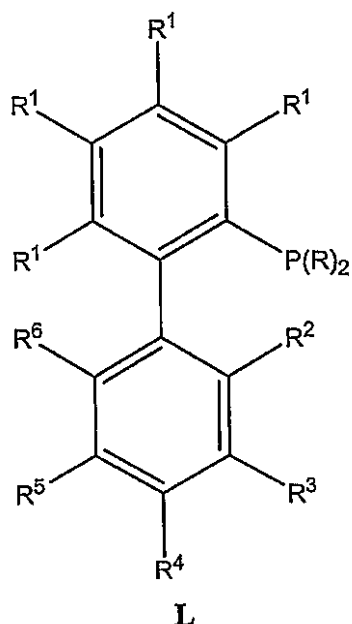
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式Lで表されるリガンドであって、

【化 1】



ここで、

Rは、各場合に対してそれぞれ別異に、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R¹は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R²は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および

- $(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択され；

R^3 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、 $-\text{R}^7$ および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択され；

R^4 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、 $-\text{R}^7$ および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、 $-\text{R}^7$ および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択され；

R^6 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択され；

R^7 は、各場合に対してそれぞれ別異に、 $-\text{C}(\text{O})\text{OM}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{SM}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{SM}$ 、 $-\text{C}(\text{NR}^8)\text{OM}$ 、 $-\text{C}(\text{NR}^8)\text{SM}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{OM}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{SM}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OM}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{SM}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OM})_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)\text{OM}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)\text{NR}^8\text{M}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^8)\text{SM}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_3\text{M}$ 、 $-\text{P}(\text{R}^8)_3\text{M}$ 、 $-\text{P}(\text{OR}^8)_3\text{M}$ および $-\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{NR}^8\text{R}^8)\text{NR}^8\text{R}^8\text{M}$ を含む群から選択され；

R^8 は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルを含む群から選択され；

Mは、アルカリ金属またはアルカリ土類金属であり；

R^{80} は、非置換または置換されたアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環または多環を表し；

mは、各場合に対してそれぞれ別異に、0～8までの整数であり；

R^3 、 R^4 または R^5 のうちの少なくともひとつは R^7 であり；さらに、

リガンドはアキラルであり、あるいは、キラルの場合には、単一の立体異性体または立体異性体の混合物であることを特徴とするリガンド。

【請求項 2】

R^3 は R^7 であり； R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 1 記載のリガンド。

【請求項 3】

R^3 は R^7 であり； R^4 および R^5 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載のリガンド。

【請求項 4】

R^3 は $-\text{S}(\text{O})_2\text{OM}$ であり； R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 1 記載のリガンド。

【請求項 5】

R^4 は R^7 であり； R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^8)_3$ 、および $-(\text{CH}_2)_m - \text{R}^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 1 記載のリガンド。

【請求項 6】

R^4 は R^7 であり； R^3 および R^5 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載のリガンド。

【請求項 7】

R^4 は $-\text{S}(\text{O})_2\text{OM}$ であり； R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテ

ロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項8】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項9】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 は、アルキルまたはアルコキシであることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項10】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はアルコキシであることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項11】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はメトキシであることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項12】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はアルキルであることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項13】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はイソプロピルであることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項14】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^3 は R^7 であり；さらに、 R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アララルキル、ヘテロアララルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項15】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^3 は R^7 であり；さらに、 R^4 および R^5 は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項16】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^3 は $-S(O)_2OM$ であり；さらに、 R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アララルキル、ヘテロアララルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項17】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^4 は R^7 であり；さらに、 R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アララルキル、ヘテロアララルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項18】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^4 は R^7 であり；さらに、 R^3 および R^5 は水素である。

【請求項19】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり； R^4 は $-S(O)_2OM$ であり；さらに、 R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アララルキル、ヘテロアララルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 20】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；さらに、R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 21】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 22】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 23】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 24】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 25】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルコキシであり；R³は-S(O)₂OMであり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 26】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルキルであり；R³は-S(O)₂OMであり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 27】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルコキシであり；R⁴は-S(O)₂OMであり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 28】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルキルであり；R⁴は-S(O)₂OMであり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 29】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はメトキシであり；R³は-S(O)₂ONaであり；さらに、R⁴およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 30】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はメトキシであり；R³およびR⁵は-S(O)₂ONaであり；さらに、R⁴は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

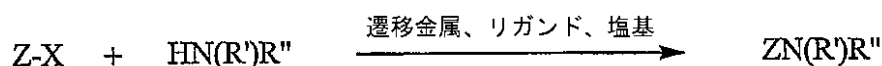
【請求項 31】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はイソプロピルであり；R⁴は-S(O)₂ONaであり；さらに、R³およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項1記載のリガンド。

【請求項 32】

次のような反応式1で表される方法であって：

【化2】



反応式1

ここで、

Zは、随意に置換されたアリール、ヘテロアリールおよびアルケニルを含む群から選択され；

Xは、Cl、Br、I、-OS(O)₂アルキル、および-OS(O)₂アリールを含む群から選択され；

R'およびR''は、各場合に対してそれぞれ別異に、H、アルキル、ヘテロアルキル、アリール、ホルミル、アシル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロアリール、アラキル、アルコキシル、アミノ、トリアルキルシリルおよびトリアリールシリルを含む群から選択され；

R'およびR''は、共同して、骨格原子数が3～10個の随意に置換された環を形成することができ；該環は、R'およびR''が結合している窒素以外に1個もしくはそれ以上のヘテロ原子を占有しており；

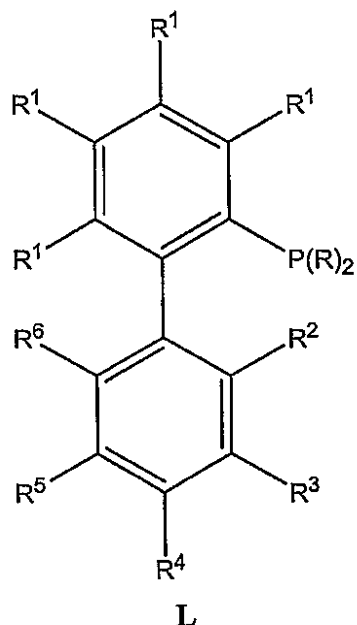
R'および/またはR''は、Zに共有結合している場合があり；

遷移金属は10族の金属から選択され；

塩基は、フッ化物、ヒドリド、水酸化物、炭酸塩、リン酸塩、アルコキシド、金属アミドおよびカルボアニオンを含む群から選択され；さらに、

リガンドは、次の構造式Lで表される化合物を含む群から選択され；

【化 3】



ここで、

Rは、各場合に対してそれぞれ別異に、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^1 は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^2 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^3 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^4 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^6 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R^7 は、各場合に対してそれぞれ別異に、 $-C(O)OM$ 、 $-C(O)SM$ 、 $-C(S)SM$ 、 $-C(NR^8)OM$ 、 $-C(NR^8)SM$ 、 $-S(O)OM$ 、 $-S(O)SM$ 、 $-S(O)_2OM$ 、 $-S(O)_2SM$ 、 $-P(O)(OM)_2$ 、 $-P(O)(OR^8)OM$ 、 $-P(O)(OR^8)NR^8M$ 、 $-P(O)(OR^8)SM$ 、 $-N(R^8)_3M$ 、 $-P(R^8)_3M$ 、 $-P(OR^8)_3M$ および $-N(R^8)C(NR^8R^8)NR^8R^8M$ を含む群から選択され；

R^8 は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルを含む群から選択され；

Mは、アルカリ金属またはアルカリ土類金属であり；

R^{80} は、非置換または置換されたアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環または多環を表し；

m は、各場合に対してそれぞれ別異に、0～8までの整数であり；

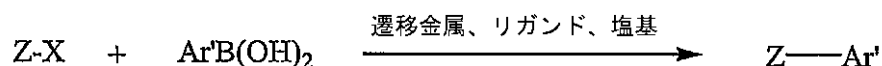
R^3 、 R^4 または R^5 のうちの少なくともひとつは R^7 であり；さらに、

リガンドはアキラルであり、あるいは、キラルの場合には、単一の立体異性体または立体異性体の混合物である
ことを特徴とする方法。

【請求項 3 3】

次のような反応式 2 で表される方法であって；

【化 4】



反応式 2

ここで、

Z および Ar' は、それぞれ別異に、随意に置換されたアリール、ヘテロアリールおよびアルケニルを含む群から選択され；

X は、 Cl 、 Br 、 I 、 $-OS(O)_2$ アルキル、および $-OS(O)_2$ アリールを含む群から選択され；

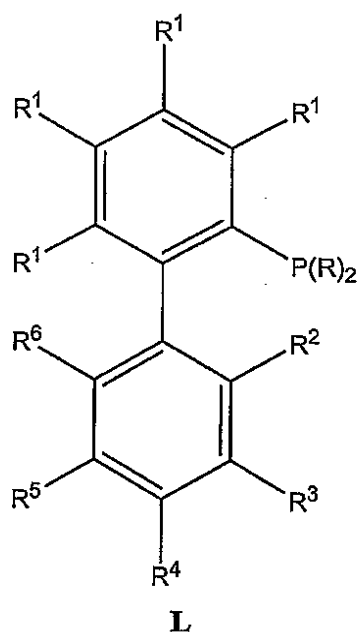
Z および Ar' は、共有結合している場合があり；

遷移金属は10族の金属から選択され；

塩基は、フッ化物、ヒドリド、水酸化物、炭酸塩、リン酸塩、アルコキシド、金属アミドおよびカルボアニオンを含む群から選択され；さらに、

リガンドは、次の構造式Lで表される化合物を含む群から選択され；

【化 5】



ここで、

R は、各場合に対してそれぞれ別異に、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^1 は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、

ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^2 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^3 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^4 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^6 は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

R^7 は、各場合に対してそれぞれ別異に、 $-C(O)OM$ 、 $-C(O)SM$ 、 $-C(S)SM$ 、 $-C(NR^8)OM$ 、 $-C(NR^8)SM$ 、 $-S(O)OM$ 、 $-S(O)SM$ 、 $-S(O)_2OM$ 、 $-S(O)_2SM$ 、 $-P(O)(OM)_2$ 、 $-P(O)(OR^8)OM$ 、 $-P(O)(OR^8)NR^8M$ 、 $-P(O)(OR^8)SM$ 、 $-N(R^8)_3M$ 、 $-P(R^8)_3M$ 、 $-P(OR^8)_3M$ および $-N(R^8)C(NR^8R^8)NR^8R^8M$ を含む群から選択され；

R^8 は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルを含む群から選択され；

M は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属であり；

R^{80} は、非置換または置換されたアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環または多環を表し；

m は、各場合に対してそれぞれ別異に、0～8までの整数であり；

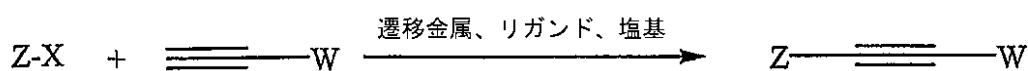
R^3 、 R^4 または R^5 のうちの少なくともひとつは R^7 であり；さらに、

リガンドはアキラルであり、あるいは、キラルの場合には、単一の立体異性体または立体異性体の混合物であることを特徴とする方法。

【請求項 3 4】

次のような反応式 3 で表される方法であって；

【化 6】



反応式 3

ここで、

Z は、随意に置換されたアリール、ヘテロアリールおよびアルケニルを含む群から選択され；

X は、 Cl 、 Br 、 I 、 $-OS(O)_2$ アルキル、および $-OS(O)_2$ アリールを含む群から選択され；

W は、アルキル、 $-COOH$ 、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-(CH_2)_m-COOH$ および $-C(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択され；

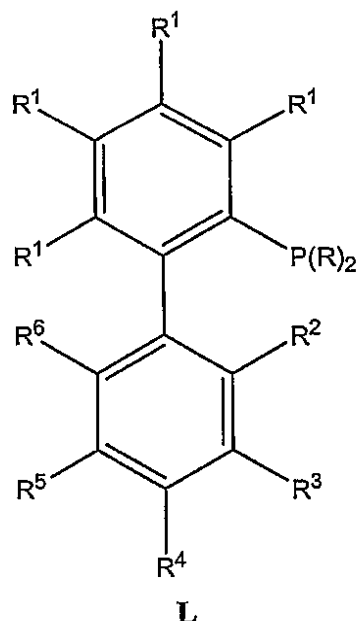
Z および W は共有結合している場合があり；

遷移金属は10族の金属から選択され；

塩基は、フッ化物、ヒドリド、水酸化物、炭酸塩、リン酸塩、アルコキシド、金属アミドおよびカルボアニオンを含む群から選択され；さらに、

リガンドは、次の構造式Lで表される化合物を含む群から選択され；

【化 7】



ここで、

Rは、各場合に対してそれぞれ別異に、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R¹は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R²は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R³は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R⁴は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R⁵は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、 $-R^7$ および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R⁶は、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m - R^{80}$ を含む群から選択され；

R⁷は、各場合に対してそれぞれ別異に、 $-C(O)OM$ 、 $-C(O)SM$ 、 $-C(S)SM$ 、 $-C(NR^8)OM$ 、 $-C(NR^8)SM$ 、 $-S(O)OM$ 、 $-S(O)SM$ 、 $-S(O)_2OM$ 、 $-S(O)_2SM$ 、 $-P(O)(OM)_2$ 、 $-P(O)(OR^8)OM$ 、 $-P(O)(OR^8)NR^8M$ 、 $-P(O)(OR^8)SM$ 、 $-N(R^8)_3M$ 、 $-P(R^8)_3M$ 、 $-P(OR^8)_3M$ および $-N(R^8)C(NR^8R^8)NR^8R^8M$ を含む群から選択され；

R⁸は、各場合に対してそれぞれ別異に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルを含む群から選択され；

Mは、アルカリ金属またはアルカリ土類金属であり；

R^{80} は、非置換または置換されたアリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環または多環を表し；

mは、各場合に対してそれぞれ別異に、0～8までの整数であり；

R^3 、 R^4 または R^5 のうちの少なくともひとつは R^7 であり；さらに、

リガンドはアキラルであり、あるいは、キラルの場合には、単一の立体異性体または立体異性体の混合物である

ことを特徴とする方法。

【請求項 3 5】

遷移金属はパラジウムであることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 3 6】

R^3 は R^7 であり； R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 3 7】

R^3 は R^7 であり； R^4 および R^5 は水素であることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 3 8】

R^3 は $-S(O)_2OM$ であり； R^4 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 3 9】

R^4 は R^7 であり； R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 0】

R^4 は R^7 であり； R^3 および R^5 は水素であることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 1】

R^4 は $-S(O)_2OM$ であり； R^3 および R^5 は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)_2$ 、 $-Si(R^8)_3$ 、および $-(CH_2)_m-R^{80}$ を含む群から選択されることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 2】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 3】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 は、アルキルまたはアルコキシであることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 4】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はアルコキシであることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 5】

Rはシクロヘキシルであり； R^1 は水素であり；さらに、 R^2 はメトキシであることを特徴とする請求項 3 2 から 3 4 いずれか 1 項記載の方法。

【請求項 4 6】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；さらに、R²はアルキルであることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項4 7】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；さらに、R²はイソプロピルであることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項4 8】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項4 9】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 0】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R³は-S(O)₂OMであり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 1】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 2】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 3】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R⁴は-S(O)₂OMであり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 4】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；さらに、R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 5】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項5 6】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R³はR⁷であり；さらに、R⁴およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2から3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 5 7】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 5 8】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶は、それぞれ別異に、水素、アルキルおよびアルコキシから選択され；R⁴はR⁷であり；さらに、R³およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 5 9】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルコキシであり；R³は-S(O)₂OMであり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 6 0】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルキルであり；R³は-S(O)₂OMであり；さらに、R⁴およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載のリガンド。

【請求項 6 1】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルコキシであり；R⁴は-S(O)₂OMであり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 6 2】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はアルキルであり；R⁴は-S(O)₂OMであり；さらに、R³およびR⁵は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アラルキル、ヘテロアラルキル、-OR⁸、-N(R⁸)₂、-Si(R⁸)₃、および-(CH₂)_m-R⁸⁰を含む群から選択されることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 6 3】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はメトキシであり；R³は-S(O)₂ONaであり；さらに、R⁴およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 6 4】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はメトキシであり；R³およびR⁵は-S(O)₂ONaであり；さらに、R⁴は水素であることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。

【請求項 6 5】

Rはシクロヘキシルであり；R¹は水素であり；R²およびR⁶はイソプロピルであり；R⁴は-S(O)₂ONaであり；さらに、R³およびR⁵は水素であることを特徴とする請求項3 2 から 3 4いずれか1項記載の方法。