

【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 7 月 30 日 (2009.7.30)

【公表番号】特表 2008-545700 (P2008-545700A)

【公表日】平成 20 年 12 月 18 日 (2008.12.18)

【年通号数】公開・登録公報 2008-050

【出願番号】特願 2008-513703 (P2008-513703)

【国際特許分類】

C 0 7 D 205/08 (2006.01)

C 0 7 D 263/26 (2006.01)

C 0 7 F 9/568 (2006.01)

C 0 7 F 19/00 (2006.01)

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

C 0 7 F 9/6596 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 205/08 K

C 0 7 D 263/26 C S P

C 0 7 D 205/08

C 0 7 F 9/568

C 0 7 F 19/00

C 0 7 F 5/02 F

C 0 7 F 7/18 A

C 0 7 F 7/18 T

C 0 7 F 9/6596

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 6 月 10 日 (2009.6.10)

【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】請求項 1

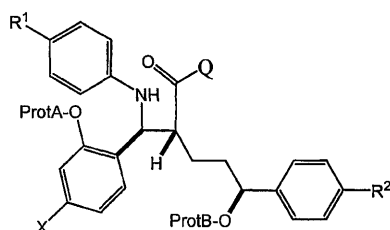
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 1】

構造式：

【化 1】



(式中、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、H、ハロゲン原子、-OH、及びメトキシ基から選択され；

X は、ヨウ素原子、臭素原子、塩素原子、トルエンシルホニル基、メタンシルホニル基及びトリフルオロメタンシルホニル基から選択され；

ProtA-O- は、オキシメチルエーテル基、アリルエーテル基、第三級アルキルエー

テル基、ベンジルエーテル基及びシリルエーテル基から選択されるフェノールのための保護基であり；

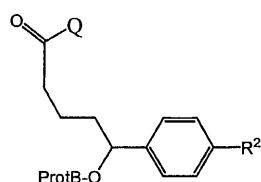
ProtB-O- は、HO-、又はオキシメチルエーテル基、テトラヒドロピラニル若しくはテトラヒドロフラニルエーテル基、メトキシシクロヘキシルエーテル基、メトキシベンジルエーテル基、シリルエーテル基及びエステル基から選択されるベンジル型アルコールのための保護基であり；並びに

Q は、トリフェニルグリコールの単一鏡像体、キラル中心少なくとも一つを有する環状窒素含有部分の単一鏡像体、及びキラル中心少なくとも一つを有する分岐状窒素含有部分の単一鏡像体から選択されるキラル補助基である）

で表される化合物の製造方法であって、

式：

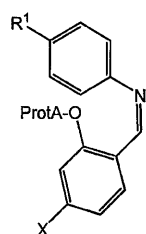
【化 2】



で表される化合物を、

式：

【化 3】



で表される化合物と反応させることを含む、前記化合物の製造方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 29

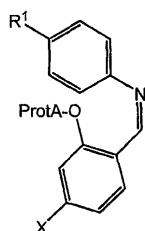
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 29】

式：

【化 39】



（式中、

R<sup>1</sup> は、H、ハロゲン原子、-OH、及びメトキシ基から選択され；

X は、ヨウ素原子、臭素原子、塩素原子、トルエンシルホニル基、メタンシルホニル基及びトリフルオロメタンシルホニル基から選択され；並びに

ProtA-O- は、オキシメチルエーテル基、アリルエーテル基、第三級アルキルエーテル基、ベンジルエーテル基及びシリルエーテル基から選択されるフェノールのための保護基であり、

但し ProtA- がベンジル基であり、R<sup>1</sup> が H であり、そして X が Br である場合、化合物は固体であり、及び純度 95% を超えるものである）

で表される化合物。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

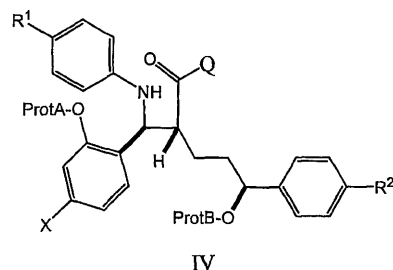
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

第3の方法の観点においては、本発明は、構造式IV：

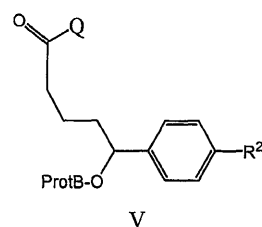
【化11】



(式中、Qは、キラル補助基である)

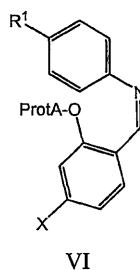
で表される化合物を製造する方法に関する。キラル補助基は、トリフェニルグリコールの単一鏡像体、キラル中心少なくとも一つを有する環状窒素含有部分の単一鏡像体、及びキラル中心少なくとも一つを有する分岐状窒素含有部分の単一鏡像体から選択される。本方法は、式V：

【化12】



で表される化合物を、式VI：

【化13】



で表される化合物と反応させることを含む。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0043

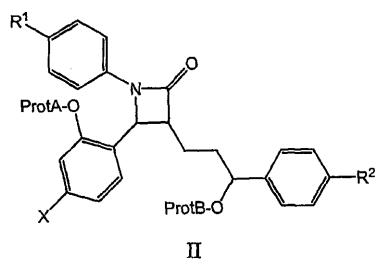
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0043】

構造式II：

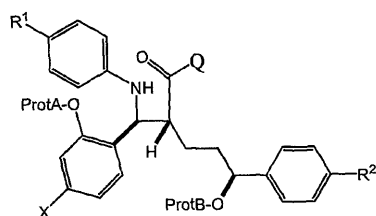
## 【化 3 6】



で表される化合物は、

式 I V :

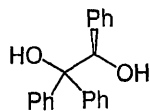
## 【化 3 7】



( 式中、Q は、窒素原子において結合されるキラル補助基である )

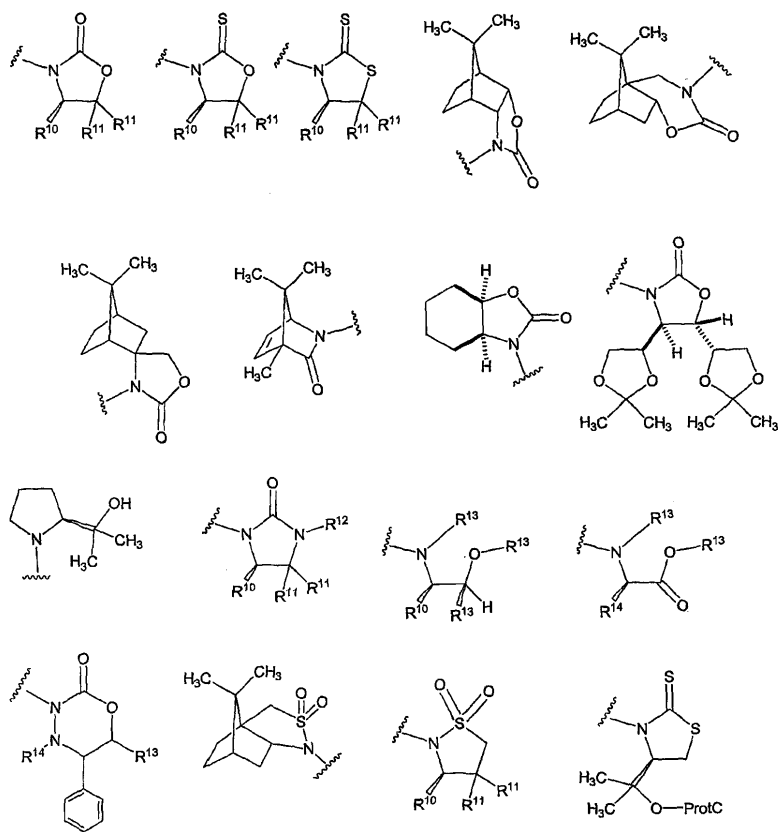
で表される化合物を環化することにより合成することができる。キラル補助基は、トリフェニルグリコールの単一鏡像体、キラル中心少なくとも一つを有する環状窒素含有部分の単一鏡像体、及びキラル中心少なくとも一つを有する分岐状窒素含有部分の単一鏡像体から選択することができる。或る実施態様においては、キラル補助基は、窒素原子において結合される環状及び分岐状窒素含有部分の単一の鏡像体から選択することができる。キラル補助基の例には、トリフェニルグリコール基 :

## 【化 3 8】



[ Braun and Galle , Synthesis 1996 , 819 - 820 を参照のこと ]、並びにキラルな窒素複素環基のクラス :

## 【化 3 9】



が含まれる。