

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2008140171/04, 09.03.2007

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
09.03.2007

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

10.03.2006 JP 2006-066818

24.03.2006 JP 2006-084285

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2010 Бюл. № 11

(45) Опубликовано: 20.04.2012 Бюл. № 11

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: US 5352814 A, 04.10.1994. JP 07-285983 A, 31.10.1995. RU 2234502 C2, 20.08.2004. KAZUHIRO MATSUMOTO ET AL. Construction of Pseudo-Heterochiral and Homochiral Di- μ -oxotitanium (Schiff base) Dimers and Enantioselective Epoxidation Using Aqueous Hydrogen Peroxide. Angewandte Chemie, International Edition, 2005, 44, p.4935-4939.

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 10.10.2008

(86) Заявка РСТ:
JP 2007/054730 (09.03.2007)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2007/105658 (20.09.2007)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спаская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

КОНДО Соити (JP),
САРУХАСИ Ковитиро (JP),
БАТАНАБЕ Хисаюки (JP),
КАЦУКИ Цутому (JP)

(73) Патентообладатель(и):

НИССАН КЕМИКАЛ ИНДАСТРИЗ, ЛТД.
(JP)

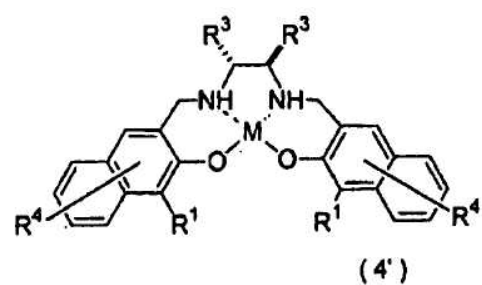
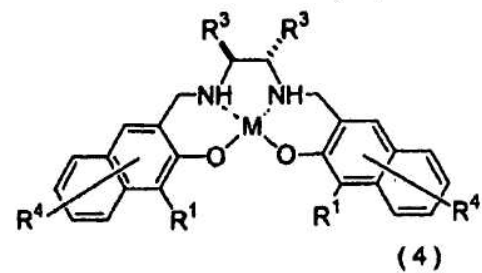
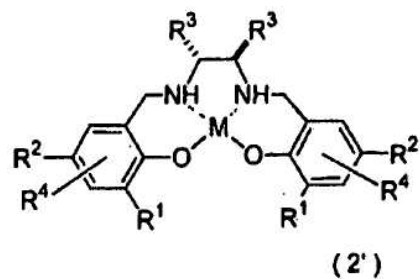
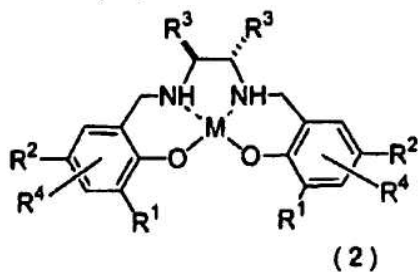
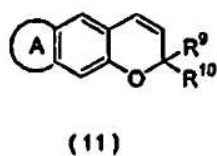
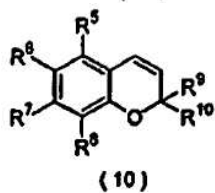
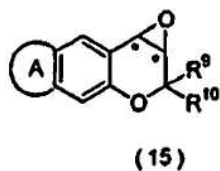
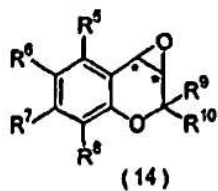
(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ОПТИЧЕСКИ АКТИВНОГО СОЕДИНЕНИЯ ОКСИДА ХРОМЕНА

(57) Реферат:

Изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хромена, представленного формулой (14) или формулой (15), где R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} и А являются такими, как определено в формуле изобретения, а абсолютная конфигурация атомов углерода, обозначенных *, означает (R) или (S), который включает асимметрическое

эпоксидование соединения хромена, представленного формулой (10) или формулой (11), с окислителем в растворителе с использованием оптически активных комплексов титана, представленных формулой (2), формулой (2'), формулой (4) и формулой (4'), где R^1 , R^2 , R^3 и R^4 имеют определения, указанные в формуле изобретения, в качестве катализатора для асимметрического

окисления оптически активного соединения хрома с высокой энантиоселективностью и высоким химическим выходом. Технический результат - разработка эффективного способа получения оптически активного соединения оксида хрома, которое представляет собой важное промежуточное соединение, используемое для получения соединения бензопирана, являющегося эффективным для лечения аритмии. 17 з.п. ф-лы, 26 пр.



RU 2 4 4 8 1 1 2 C 2

RU 2 4 4 8 1 1 2 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.

C07D 493/04 (2006.01)*C07D 491/153* (2006.01)*C07F 7/28* (2006.01)*B01J 31/16* (2006.01)(12) **ABSTRACT OF INVENTION**(21)(22) Application: **2008140171/04, 09.03.2007**(24) Effective date for property rights:
09.03.2007

Priority:

(30) Priority:

10.03.2006 JP 2006-066818**24.03.2006 JP 2006-084285**(43) Application published: **20.04.2010 Bull. 11**(45) Date of publication: **20.04.2012 Bull. 11**(85) Commencement of national phase: **10.10.2008**

(86) PCT application:

JP 2007/054730 (09.03.2007)

(87) PCT publication:

WO 2007/105658 (20.09.2007)

Mail address:

**129090, Moskva, ul.B.Spaskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
E.E.Nazinoj**

(72) Inventor(s):

**KONDO Soiti (JP),
SARUKhASI Kovitiro (JP),
VATANABE Khisajuki (JP),
KATsUKI Tsutomu (JP)**

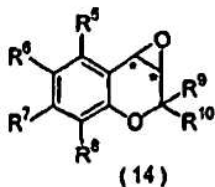
(73) Proprietor(s):

NISSAN KEMIKAL INDASTRIZ, LTD. (JP)(54) **METHOD OF PRODUCING OPTICALLY ACTIVE CHROMENE OXIDE COMPOUND**

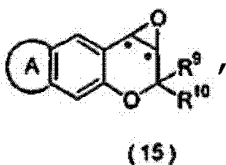
(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

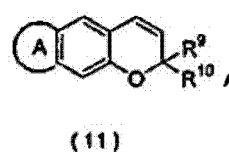
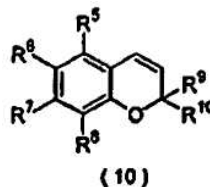
SUBSTANCE: invention relates to a method of
producing an optically active chromene oxide
compound of formula



formula

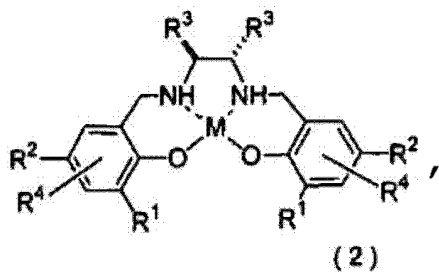
where $R^5, R^6, R^7, R^8,$

R^9, R^{10} and A are as described in the claim, and the
absolute configuration of carbon atoms, denoted by *,
denotes (R) or (S), which includes asymmetric
epoxidation of a chromene compound of formula
or formula



with an oxidant in a solvent

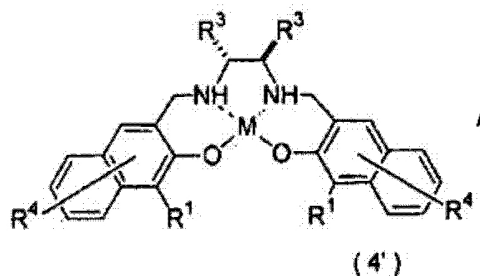
using optically active titanium complexes of formula



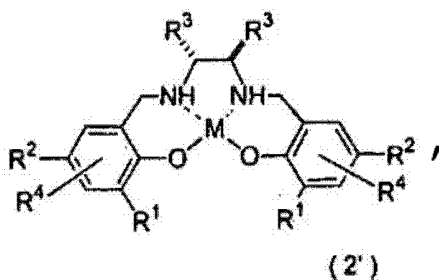
formula

formula

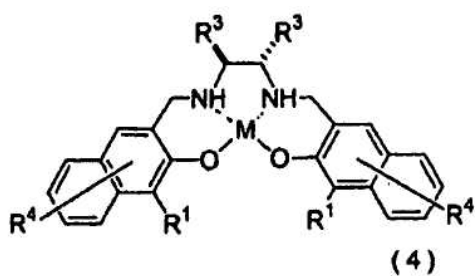
where



formula



and



R^1 , R^2 , R^3 and R^4 are defined in the claim, as a catalyst for asymmetric oxidation of the optically active chromene compound with high enantioselectivity and high chemical output.

EFFECT: efficient method of producing an optically active chromene oxide compound, which is an important intermediate compound used to produce a benzopyran compound, which is effective in treating arrhythmia.

18 cl, 26 ex

RU 2448112 C2

RU 2448112 C2

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к эффективному способу получения оптически активного соединения оксида хрома, которое представляет собой важное промежуточное соединение, используемое для получения соединения бензопирана, являющегося эффективным при лечении аритмии.

Уровень техники

Ранее были описаны соединения бензопирана, которые могут быть использованы в качестве лекарственного средства против аритмии, а также способ их получения.

Так, например, соединение бензопирана получают путем асимметрического эпоксидирования соединения хрома с использованием оптически активного комплекса марганца, в результате чего образуется оптически активное соединение оксида хрома, а затем размыкают кольцо эпоксида с помощью соединения амина (см. патентный документ 1).

Ранее уже был описан способ получения оптически активного соединения оксида хрома путем асимметрического эпоксидирования соединения хрома с использованием оптически активного комплекса марганца (см. патентный документ 2, патентный документ 3, патентный документ 4, патентный документ 5 и патентный документ 6). В вышеупомянутых патентных документах описаны примеры получения оптически активных соединений оксида хрома с использованием оптически активных комплексов марганца в качестве катализаторов, а также с использованием йодозобензола, гипохлорита натрия или 30% водного раствора пероксида водорода в качестве соокисляющего реагента.

Для асимметрической реакции окисления, проводимой с использованием оптического активного комплекса марганца, помимо соокисляющего реагента, требуется присутствие добавки, а именно аксиального лиганда, такого как 4-фенилпиридин-N-оксид, а поэтому желательно разработать другой способ получения оптически активного оксида хрома без использования аксиального донорного лиганда.

В отличие от этого сообщалось, что с использованием даже 0,01-0,2 моль% асимметрического оптического активного комплекса марганца можно получить оптически активное соединение оксида хрома с высоким химическим и оптическим выходом (см. патентный документ 7). Однако в этом патентном документе описан лишь один пример йодозобензола, используемого в качестве соокисляющего реагента. А поэтому, желательно разработать более выгодный и более эффективный способ для получения такого соединения.

Также сообщалось, что с использованием комплекса оптически активного титана «ди-μ-оксотитан-саладен» может быть проведена в высокой степени энантиоселективная асимметрическая реакция эпоксидирования различных простых олефинов, не содержащих гетероатома(ов). Однако в этой работе не приводится каких-либо примеров олефиновых соединений, содержащих гетероатом(ы), и соединений хрома (не-патентный документ 8).

[Патентный документ 1] Публикация заявки на патент Японии № JP-A-2001-151767.

[Патентный документ 2] Публикация заявки на патент Японии № JP-A-05-301878.

[Патентный документ 3] Публикация заявки на патент Японии № JP-A-07-285983.

[Патентный документ 4] Публикация заявки на патент Японии № JP-A-08-245668.

[Патентный документ 5] WO 2005/090357A1.

[Патентный документ 6] WO 2005/080368A2.

[Патентный документ 7] Публикация заявки на патент Японии № JP-A-11-335384.

[Не-патентный документ 8] K. Matsumoto, Y. Sawada, B. Saito, K. Sakai and T. Katsuki, Angew. Chem. Int. Ed. (2005), 44, 4935-4939.

Описание изобретения

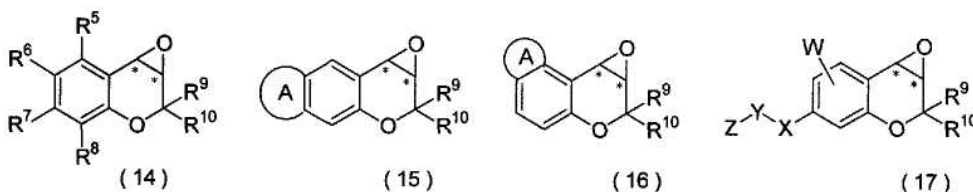
[Проблема, которая может быть решена с использованием настоящего изобретения]

Настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома, которое представляет собой важное промежуточное соединение, используемое для получения соединения бензопирана, эффективного при лечении аритмии.

[Средства для решения указанной проблемы]

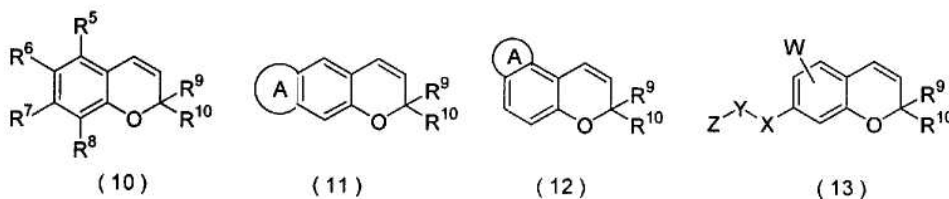
В результате интенсивного исследования по разработке способа получения оптически активного соединения оксида хрома, которое представляет собой важное промежуточное соединение, используемое для получения соединения бензопирана, эффективного для лечения аритмии, авторами настоящего изобретения было обнаружено, что оптически активное соединение оксида хрома может быть получено с высокой энантиоселективностью и с высоким химическим выходом с использованием оптического активного комплекса титана в качестве катализатора, и на основе этого было разработано настоящее изобретение.

В соответствии с первым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома, представленного формулой (14), формулой (15), формулой (16) или формулой (17):



(где R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , A, W, X, Y и Z являются такими, описано ниже, а абсолютная конфигурация атомов углерода, обозначенных *, означает (R) или (S)), где указанный способ включает:

асимметрическое эпоксицирование соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), с окислителем в растворителе;



(где каждый из R^5 , R^6 , R^7 и R^8 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой,

C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может
 5 быть необязательно замещена атомом галогена, C_{6-10} арильной группой (C_{6-10} арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкильной группой или C_{1-4} алкоксигруппой)), C_{1-4} алкилкарбонил($N-C_{1-4}$ алкил)аминогруппу
 10 (алкилкарбонил($N-C_{1-4}$ алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкоксикарбонильную группу (алкоксикарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{6-10} арилкарбониламиногруппу (арилкарбониламиногруппа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или
 15 нитрогруппой), C_{6-10} арилкарбонил($N-C_{1-4}$ алкил)аминогруппу (арилкарбонил(N -алкил)аминогруппа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бензилкарбониламиногруппу, формильную группу, карбамоильную группу,
 20 C_{1-4} алкилсульфонильную группу, C_{6-10} арилсульфонильную группу (алкилсульфонильная группа и арилсульфонильная группа могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), сульфамойльную группу, C_{1-4} алкилсульфонамидную группу,
 25 C_{6-10} арилсульфонамидную группу (алкилсульфонамидная группа и арилсульфонамидная группа могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой,
 30 C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (арилсульфон бис(арилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или (N,N' -
 35 (C_{1-4} алкилсульфон)(C_{6-10} арилсульфон))имидную группу (алкилсульфон и арилсульфон (N,N' -(алкилсульфон)(арилсульфон))имидной группы могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);

40 каждый из R^9 и R^{10} в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу
 45 (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть
 50 необязательно замещена атомом галогена));

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (11) и в формуле (12) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа

может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена));

неполная циклическая структура А в формуле (11) и в формуле (12) представляет собой неполную структуру, представленную 5-, 6- или 7-членным кольцом, образующим кольцо, конденсированное с частью бензольного кольца (каждое из 5-, 6- или 7-членных колец может быть необязательно замещено hR^{11} (R^{11} представляет собой атом галогена, гидроксигруппу, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилкоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилкоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формамидную группу, карбамоильную группу, сульфогруппу, сульфоаминогруппу, сульфоамильную группу, сульфонильную группу, аминогруппу, карбоксильную группу, C_{1-6} алкиламиногруппу, ди- C_{1-6} алкиламиногруппу, C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{1-6} алкилсульфонамидную группу, C_{6-14} арилсульфонамидную группу, C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу, C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, C_{1-6} алкилсульфонильную группу, C_{6-14} арилсульфонильную группу или C_{6-14} арилкарбонильную группу (алкиламиногруппа, диалкиламиногруппа, алкилкарбониламиногруппа, алкилсульфонамидная группа, арилсульфонамидная группа, алкиламинокарбонильная группа, диалкиламинокарбонильная группа, алкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа, алкилсульфонильная группа, арилсульфонильная группа и арилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена); где h означает целое число 1-6, а если h равно целому числу 2-6, то R^{11} могут быть одинаковыми или различными); 1-3 атома кислорода, азота или серы могут присутствовать отдельно или в комбинации с другими атомами на кольце; число ненасыщенных связей в кольце, содержащем ненасыщенную(ые) связь(и) и конденсированном с бензольным кольцом, составляет 1, 2 или 3, а атом(ы) углерода, составляющий(ие) данное кольцо, может представлять собой карбонил или тиокарбонил);

X в формуле (13) представляет собой NR^{20} (R^{20} представляет собой атом водорода или C_{1-4} алкильную группу);

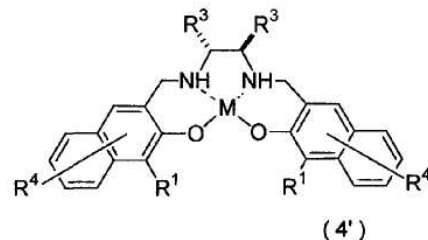
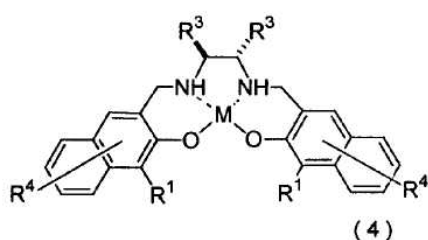
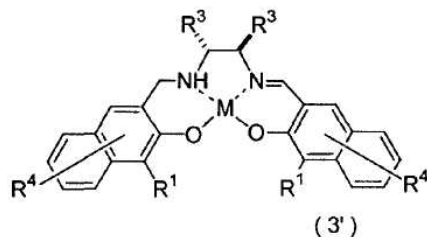
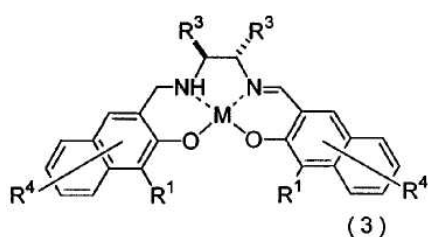
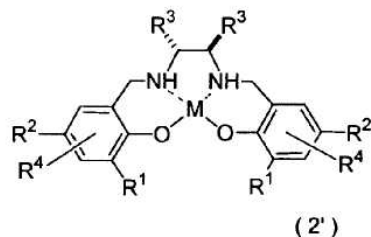
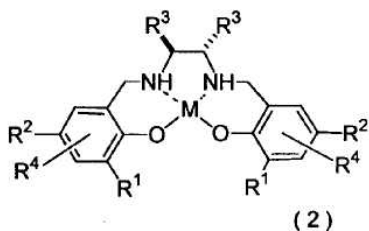
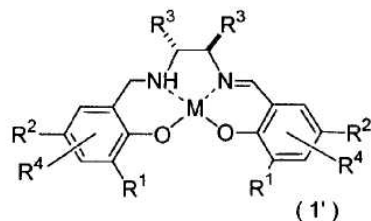
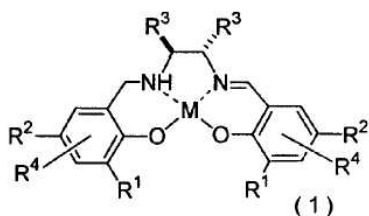
Y в формуле (13) представляет собой связь, SO или SO_2 ;

Z в формуле (13) представляет собой C₁₋₄алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена 1-5 атомами галогена или фенильной группой (фенильная группа может быть необязательно замещена C₁₋₄алкильной группой)) или фенильную группу (фенильная группа может быть необязательно замещена C₁₋₄алкильной группой);

W в формуле (13) представляет собой атом водорода, гидроксигруппу, C₁₋₆алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), атом галогена, C₁₋₄алкильную группу или C₁₋₆алкилсульфонамидную группу (алкильная группа и алкилсульфонамидная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена); и

каждый из R⁹ и R¹⁰ в формуле (13) независимо представляет собой атом водорода, C₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C₆₋₁₄арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C₁₋₆алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C₁₋₆алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)));

где вышеуказанное эпоксидирование осуществляют с использованием любых оптически активных комплексов титана, представленных формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) и формулой (4'), в качестве катализатора,



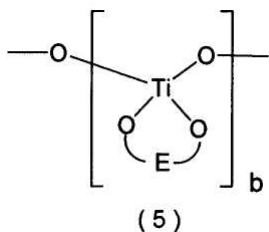
где R^1 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-22} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена, C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой, и является оптически активным или оптически неактивным);

R^2 представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-18} арильную группу;

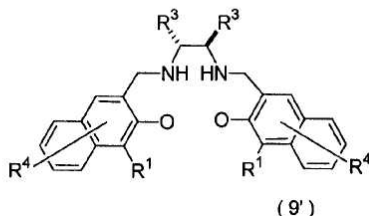
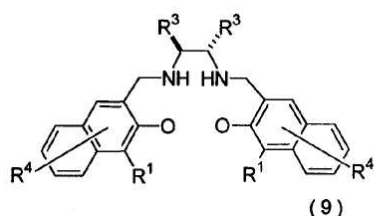
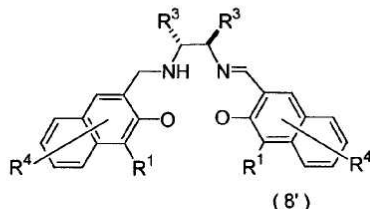
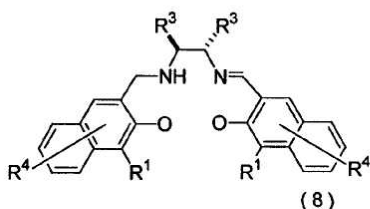
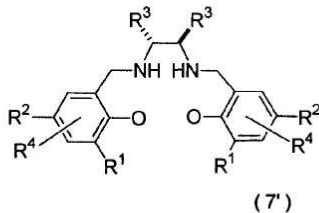
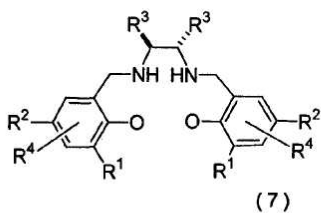
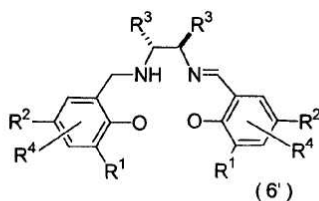
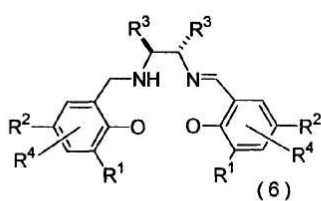
R^3 представляет собой C_{1-4} алкильную группу, C_{6-18} арильную группу или двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

каждый из R^4 независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу;

M представляет собой TiJ^1J^2 (в TiJ^1J^2 , Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляет собой атом галогена или C_{1-4} алкоксид, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5))



(где, в неполной структуре О-Е-О, О представляет собой атом кислорода, а группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6), соответствующей формуле (1); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6'), соответствующей формуле (1'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8), соответствующей формуле (3); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8'), соответствующей формуле (3'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9'), соответствующей формуле (4'));



b представляет собой целое число 1-10, а R¹, R², R³ и R⁴ являются такими, как определено выше)).

В соответствии со вторым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно первому аспекту изобретения, в котором соединение хрома, представленное формулой (10), подвергают асимметрической реакции эпексидирования в растворителе с

окислителем с использованием оптически активного комплекса титана, представленного формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) или формулой (4'), в качестве катализатора,

5 где каждый из R^5 и R^6 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой,
10 C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкоксигруппу (алкоксигруппа
15 может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и
20 алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкилкарбонил(N-
25 C_{1-4} алкил)аминогруппу (алкилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{6-10} арилкарбонил(N-
 C_{1-4} алкил)аминогруппу (арилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или
30 нитрогруппой), карбамоильную группу, бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или
35 нитрогруппой), бис(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (арилсульфон бис(арилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или (N,N'-(C_{1-4} алкилсульфон)(C_{6-10} арилсульфон))имидную группу (алкилсульфон и
40 арилсульфон (N,N'-(алкилсульфон)(арилсульфон))имидной группы могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);

R^7 в формуле (10) представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу,
40 бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой),
бис(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (арилсульфон бис(арилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой,
45 C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или (N,N'-(C_{1-4} алкилсульфон)(C_{6-10} арилсульфон))имидную группу (алкилсульфон и арилсульфон (N,N'-(алкилсульфон)(арилсульфон))имидной группы могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой,
50 цианогруппой или нитрогруппой);

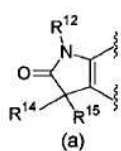
R^8 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена); и

R^9 и R^{10} в формуле (10) представляют собой C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена).

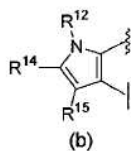
В соответствии с третьим аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно второму аспекту изобретения, где каждый из R^5 и R^6 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, нитрогруппу, атом фтора, метоксигруппу, метилкарбониламиногруппу или метилкарбонил(N-этил)аминогруппу; R^7 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу; R^8 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или трифторметильную группу; а R^9 и R^{10} в формуле (10) представляют собой метильную группу.

В соответствии с четвертым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно первому аспекту изобретения, где соединение хрома, представленное формулами (11) или (12), у которого неполная циклическая структура А представлена формулой (a), формулой (b), формулой (c), формулой (d), формулой (e), формулой (f), формулой (g), формулой (h), формулой (i), формулой (j), формулой (k), формулой (l), формулой (m), формулой (n), формулой (o), формулой (p), формулой (q), формулой (r), формулой (s), формулой (t), формулой (u), формулой (v), формулой (w), формулой (x), формулой (y), формулой (z), формулой (aa), формулой (ab), формулой (ac), формулой (ad), формулой (ae), формулой (af), формулой (ag) и формулой (ah), подвергают асимметрическому эпоксидированию в растворителе с окислителем с использованием любых оптически активных комплексов титана, представленных формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) или формулой (4'), в качестве катализатора

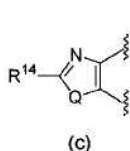
5



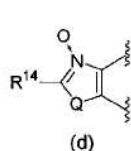
(a)



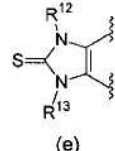
(b)



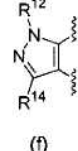
(c)



(d)

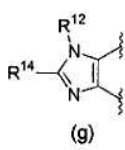


(e)

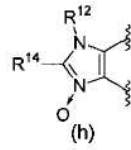


(f)

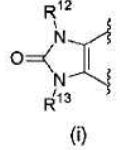
10



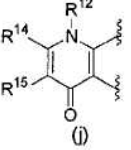
(g)



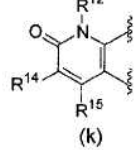
(h)



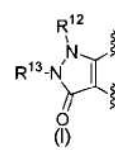
(i)



(j)

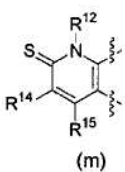


(k)

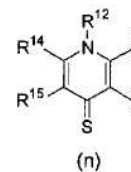


(l)

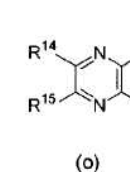
15



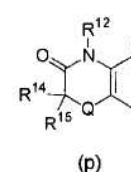
(m)



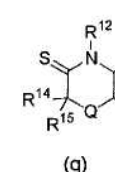
(n)



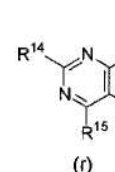
(o)



(p)

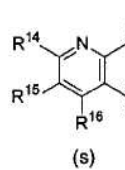


(q)

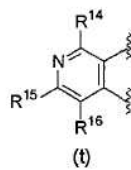


(r)

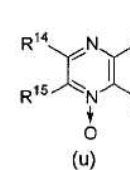
20



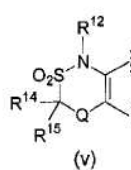
(s)



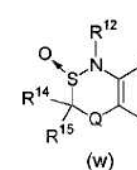
(t)



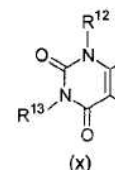
(u)



(v)

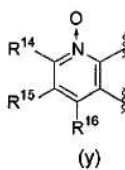


(w)

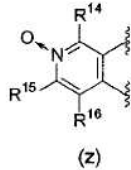


(x)

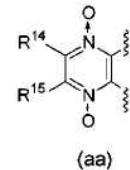
25



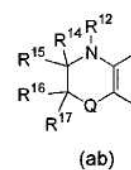
(y)



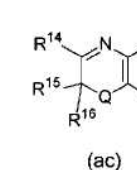
(z)



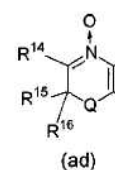
(aa)



(ab)

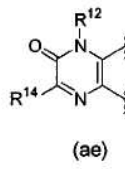


(ac)

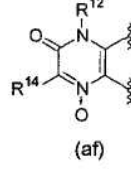


(ad)

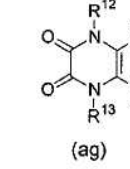
30



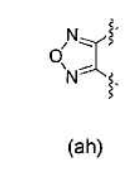
(ae)



(af)



(ag)



(ah)

35

(где каждый из R^{12} и R^{13} в формуле (a), формуле (b), формуле (e), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (i), формуле (j), формуле (k), формуле (l), формуле (m), формуле (n), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (x), формуле (ab), формуле (ae), формуле (af) и формуле (ag) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C_{6-14} арильной группой или C_{2-9} гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена qR^{18} (R^{18} имеет такие же значения, как и R^{11} ; q равно целому числу 1-3, а все R^{18} могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)), C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{3-8} циклоалкилкарбонильную группу, C_{1-6} алкоксикарбонильную группу,

C_{1-6} алкилсульфонильную группу (циклоалкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа и алкилсульфонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), карбоксильную группу,

C_{6-14} арилкарбонильную группу (арилкарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена) или C_{2-9} гетероарилкарбонильную группу), C_{6-14} арильную группу, C_{2-9} гетероарильную группу (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена qR^{18} (R^{18} имеет такие же значения, как и R^{11} ; q равно целому числу 1-3, а все R^{18} могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)), C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу, C_{3-8} циклоалкилкарбонильную группу, C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, C_{1-6} алкилсульфонильную группу, C_{6-14} арилсульфонильную группу,

C_{2-9} гетероарилсульфонильную группу (каждая из арилсульфонильной и гетероарилсульфонильной групп может быть необязательно замещена qR^{18} (R^{18} имеет такие же значения, как и R^{11} ; q равно целому числу 1-3, а все R^{18} могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)), карбоксильную группу, C_{6-14} арилкарбонильную группу или C_{2-9} гетероарилкарбонильную группу (каждая из арилкарбонильной и гетероарилкарбонильной групп может быть необязательно замещена qR^{18} (R^{18} имеет такие же значения, как и R^{11} ; q равно целому числу 1-3, а все R^{18} могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3));

каждый из R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} в формуле (a), формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (j), формуле (k), формуле (m), формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s), формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (y), формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae) и в формуле (af), независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C_{6-14} арильной группой, C_{2-9} гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена и rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-6} алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппой, C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группой, C_{1-6} алкоксикарбонильной группой, C_{1-6} алкилсульфонильной группой (циклоалкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа и алкилсульфонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), карбоксильной группой, C_{6-14} арилкарбонильной группой (арилкарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена) или C_{2-9} гетероарилкарбонильной группой), C_{3-8} циклоалкильную группу (циклоалкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой или гидроксигруппой), C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой

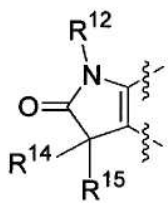
(алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), карбоксильной группой, аминогруппой, гидроксигруппой, C₆₋₁₄арильной группой или C₂₋₉гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), C₁₋₆тиоалкоксигруппу (тиоалкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), карбоксильной группой, гидроксигруппой, C₆₋₁₄арильной группой или C₂₋₉гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), гидроксигруппу, C₆₋₁₄арильную группу, C₂₋₉гетероарильную группу (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), C₁₋₆алкилкарбонилксигруппу, нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формамидную группу, аминогруппу, сульфогруппу, C₁₋₆алкиламиногруппу, ди-C₁₋₆алкиламиногруппу, C₆₋₁₄ариламиногруппу, C₂₋₉гетероариламиногруппу (каждая из ариламино и гетероариламиногрупп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), C₁₋₆алкилкарбониламиногруппу, C₁₋₆алкилсульфонамидную группу, карбамоильную группу, C₁₋₆алкиламинокарбонильную группу, ди-C₁₋₆алкиламинокарбонильную группу, C₁₋₆алкилкарбонильную группу, C₆₋₁₄арилкарбонильную группу, C₂₋₉гетероарилкарбонильную группу (каждая из арилкарбонильной и гетероарилкарбонильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), C₁₋₆алкоксикарбонильную группу, сульфоамильную группу, C₁₋₆алкилсульфонильную группу, C₆₋₁₄арилсульфонильную группу, C₂₋₉гетероарилсульфонильную группу (каждая из арилсульфонильной и гетероарилсульфонильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), карбоксильную группу или C₂₋₉гетероциклизную группу (гетероциклильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, карбоксильной группой или гидроксигруппой), C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C₆₋₁₄арильной группой, C₂₋₉гетероарильной группой (каждая из арил и гетероарилгрупп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, формильной группой, формамидной группой, аминогруппой, C₁₋₆алкиламиногруппой, ди-C₁₋₆алкиламиногруппой, C₁₋₆алкилкарбониламиногруппой, C₁₋₆алкилсульфонамидной группой, карбамоильной группой, C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, ди-C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, C₁₋₆алкилкарбонильной группой, C₁₋₆алкоксикарбонильной группой, сульфоамильной группой, C₁₋₆алкилсульфонильной группой, карбоксильной группой или

С₆₋₁₄арилкарбонильной группой); и

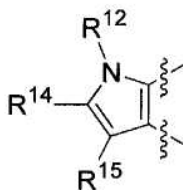
Q в формуле (с), формуле (d), формуле (р), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (ab), формуле (ac) и в формуле (ad) представляет собой O (атом кислорода), S (атом серы), SO (сульфинильную группу) или SO₂ (сульфонильную группу)).

В соответствии с пятым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно четвертому аспекту изобретения, где R⁹ и R¹⁰ в формуле (11) или в формуле (12) представляют собой метильную группу.

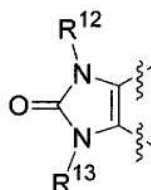
В соответствии с шестым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно четвертому или пятому аспектам изобретения, где A в формуле (11) или в формуле (12) представлены нижеследующими формулами, а именно формулой (a), формулой (b), формулой (i), формулой (k), формулой (o), формулой (p), формулой (s), формулой (v), формулой (y), формулой (ae), формулой (ag) и формулой (ah):



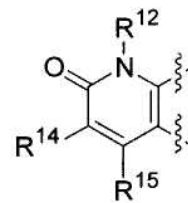
(a)



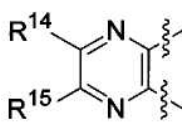
(b)



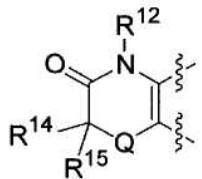
(i)



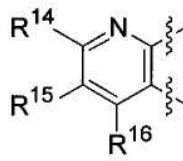
(k)



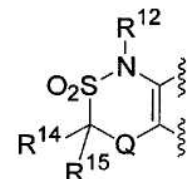
(o)



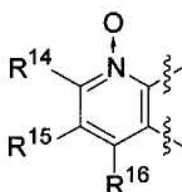
(p)



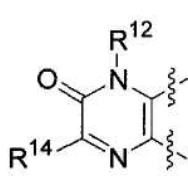
(s)



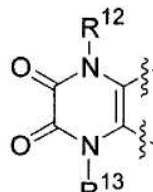
(v)



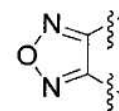
(y)



(ae)



(ag)



(ah)

(где R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵ и R¹⁶ имеют значения, определенные в четвертом аспекте).

В соответствии с седьмым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно шестому аспекту изобретения, где A в формуле (11) или в формуле (12) имеет формулу (a), формулу (b), формулу (i), формулу (k), формулу (o), формулу (p), формулу (s), формулу (v), формулу (y), формулу (ae), формулу (ag) и формулу (ah); каждый из R¹² и R¹³ в формуле (a), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) и в формуле (ag) независимо представляют собой атом водорода, С₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), С₁₋₆алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппу или гидроксигруппу; а каждый из R¹⁴, R¹⁵

и R¹⁶ в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и в формуле (ae) независимо представляет собой атом водорода, атом галогена или C₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть
 5 необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, ди-
 C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, C₁₋₆алкилкарбонилоксигруппой, C₁₋₆алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная
 10 группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C₁₋₆алкилкарбониламиногруппой, C₃₋₈циклоалкилкарбонильной группой или C₁₋₆алкоксикарбонильной группой), а Q представляет собой O (атом кислорода).

В соответствии с восьмым аспектом, настоящее изобретение относится к способу
 15 получения оптически активного соединения оксида хрома согласно седьмому аспекту изобретения, где A в формуле (11) или в формуле (12) представлен формулой (a), формулой (b), формулой (i), формулой (k), формулой (o), формулой (p), формулой (s), формулой (v), формулой (y), формулой (ae), формулой (ag) или формулой (ah); каждый из R¹² и R¹³ в формуле (a), формуле (b), формуле (i),
 20 формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) и в формуле (ag) независимо представляют собой атом водорода или метильную группу, а каждый из R¹⁴, R¹⁵ и R¹⁶ в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и в формуле (ae) независимо представляет собой атом
 25 водорода, атом галогена или C₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, ди-
 C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, C₁₋₆алкилкарбонилоксигруппой, C₁₋₆алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная
 30 группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C₁₋₆алкилкарбониламиногруппой, C₃₋₈циклоалкилкарбонильной группой или C₁₋₆алкоксикарбонильной группой), а Q представляет собой O (атом кислорода).

В соответствии с девятым аспектом, настоящее изобретение относится к способу
 35 получения оптически активного соединения оксида хрома согласно первому аспекту изобретения, в котором соединение хрома, представленное формулой (13), подвергают асимметрическому эпоксицированию в растворителе с окислителем с
 40 использованием оптически активного комплекса титана, представленного формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) и формулой (4'), в качестве катализатора, а R⁹ и R¹⁰ в формуле (13) представляют собой метильную группу.

В соответствии с десятым аспектом, настоящее изобретение относится к способу
 45 получения оптически активного соединения оксида хрома согласно девятому аспекту изобретения, в котором W в формуле (13) представляет собой атом водорода, гидроксигруппу, метоксигруппу, атом хлора, атом брома, метильную группу, этильную группу или метансульфонамидную группу.

В соответствии с одиннадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к
 50 способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно девятому или десятому аспекту изобретения, в котором Y в формуле (13) представляет собой SO₂ (сульфонильную группу), а Z представляет собой

C₁₋₄алкильную группу.

В соответствии с двенадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно десятому аспекту изобретения, в котором Y в формуле (13) представляет собой
5 связь, а Z представляет собой C₁₋₄алкильную группу.

В соответствии с тринадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно первому аспекту изобретения, в котором R¹ в формуле (1), формуле (1'), формуле (2),
10 формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой C₆₋₂₂арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена C₁₋₄алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C₁₋₇алкоксигруппой или бензилоксигруппой, и является
15 оптически активным или оптически неактивным);

R² представляет собой атом водорода, атом галогена, C₁₋₄алкильную группу, C₁₋₄алкоксигруппу, C₆₋₁₂арилоксигруппу или C₆₋₁₈арильную группу;

R³ представляет собой C₁₋₄алкильную группу, C₆₋₁₈арильную группу или

20 двухвалентную C₃₋₅группу, где два R³, взятые вместе, образуют кольцо; и

каждый из R⁴ независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C₁₋₄алкильную группу, C₁₋₄алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу;

M представляет собой TiJ¹J² (где Ti представляет собой атом титана, а каждый из
25 J¹ и J² независимо представляют собой атом галогена или C₁₋₄алкоксид, или J¹ и J², взятые вместе, образуют атом кислорода, либо J¹ и J², взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)

(где, в неполной структуре O-E-O, O представляет собой атом кислорода, а группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (6), соответствующей
30 формуле (1); группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (6'), соответствующей формуле (1'); группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа O-E-O представлена

нижеследующей формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа O-E-O
35 представлена нижеследующей формулой (8), соответствующей формуле (3); группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (8'), соответствующей формуле (3'); группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей

формуле (4); и группа O-E-O представлена нижеследующей формулой (9'),
40 соответствующей формуле (4');

b представляет собой целое число 1-10, а R¹, R², R³ и R⁴ являются такими, как определено выше)).

В соответствии с четырнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно

45 тринадцатому аспекту изобретения, в котором R¹ в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и формуле (4') представляет собой фенильную группу (фенильная группа может быть

необязательно замещена C₁₋₄алкильной группой (алкильная группа может быть
50 необязательно замещена атомом галогена), бензилоксигруппой или

C₁₋₇алкоксигруппой) или нафтильную группу (нафтильная группа может быть
необязательно замещена C₁₋₄алкильной группой (алкильная группа может быть
необязательно замещена атомом галогена), C₁₋₇алкоксигруппой или фенильной

группой);

R^2 представляет собой атом водорода;

R^3 представляет собой двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

R^4 представляет собой атом водорода, и

M представляет собой TiJ^1J^2 (где Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляют собой атом галогена или C_{1-4} алкоксид, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)

(где, в неполной структуре $O-E-O$, O представляет собой атом кислорода, а группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (6), соответствующей формуле (1); группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (6'),

соответствующей формуле (1'); группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа $O-E-O$

представлена нижеследующей формулой (8), соответствующей формуле (3); группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (8'), соответствующей формуле (3'); группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа $O-E-O$ представлена нижеследующей формулой (9'),

соответствующей формуле (4'); b представляет собой целое число 1-10, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как определено выше)).

В соответствии с пятнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно любому из 1-14 аспектов изобретения, в котором количество используемого оптически активного комплекса титана по отношению к количеству соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), составляет 0,001-100 моль%.

В соответствии с шестнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно любому из 1-14 аспектов изобретения, в котором растворителем, используемым для асимметрического эпоксицирования, является галогеновый растворитель, ароматический углеводородный растворитель, сложноэфирный растворитель, эфирный растворитель, нитриловый растворитель, спиртовой растворитель или их смеси.

В соответствии с семнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно любому из 1-14 аспектов изобретения, в котором окислителем, используемым в асимметрической реакции эпоксицирования, является йодозобензол, гипохлорит натрия, *m*-хлорпербензойная кислота, оксон (зарегистрированный под торговым знаком E.I. du Pont de Nemours and Company), водный раствор пероксида водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (UHP), оксазиридин, *N*-метилморфолиноксид (NMO), трет-бутилгидропероксид (TBHP), гидропероксид кумола (CHP) или их смеси.

В соответствии с восемнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно семнадцатому аспекту изобретения, в котором окислителем, используемым для асимметрической реакции эпоксицирования, является водный раствор пероксида

водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (УНР) или их смеси.

В соответствии с девятнадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно
 5
 восемнадцатому аспекту изобретения, в котором окислителем, используемым для асимметрической реакции эпоксицирования, является водный раствор пероксида водорода в концентрации 1-100 мас. %

В соответствии с двадцатым аспектом, настоящее изобретение относится к
 10
 способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно любому из 1-14 аспектов изобретения, в котором количество окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, по отношению к количеству соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), составляет 1-10 эквивалентов.

В соответствии с двадцать первым аспектом, настоящее изобретение относится к
 15
 способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно двадцатому аспекту изобретения, в котором способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой
 20
 постадийное или непрерывное добавление.

В соответствии с двадцать вторым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно
 двадцать первому аспекту изобретения, в котором способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой
 25
 непрерывное добавление, скорость которого составляет от 0,01 до 40000 эквивалентов в час.

В соответствии с двадцать третьим аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно
 30
 двадцать первому аспекту изобретения, в котором способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой постадийное добавление, где число стадий составляет в пределах от 2 до 100.

В соответствии с двадцать четвертым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома согласно
 35
 любому из 1-23 аспектов изобретения, где температура реакции асимметрического эпоксицирования составляет от 0°C до температуры перегонки растворителя.

В соответствии с своим двадцать пятым аспектом, настоящее изобретение относится к способу получения оптически активного соединения оксида хрома
 40
 согласно любому из 1-24 аспектов изобретения, где давление в реакционной системе асимметрического эпоксицирования составляет от 10 кПа до 1100 кПа.

[Эффекты изобретения]

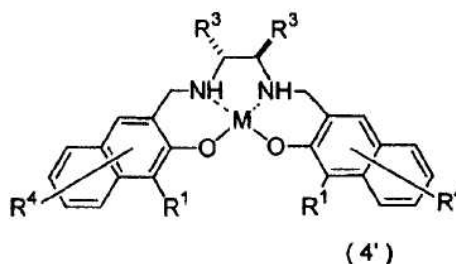
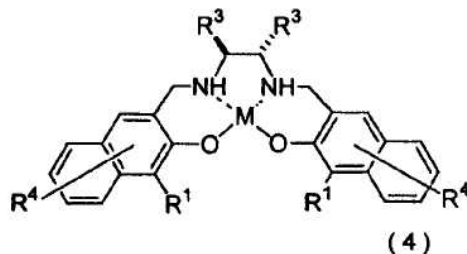
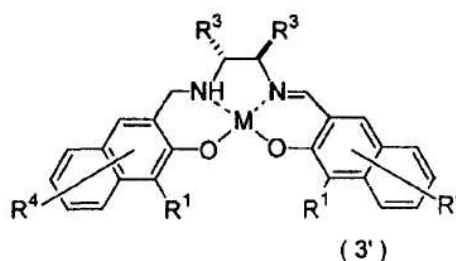
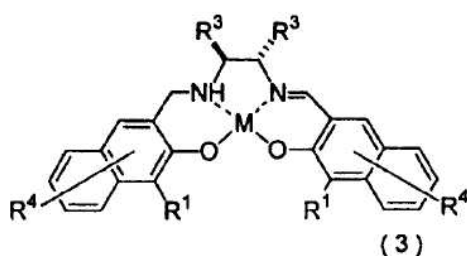
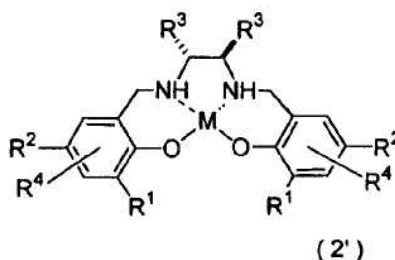
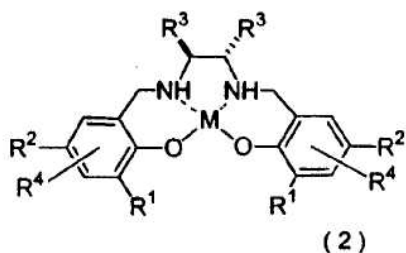
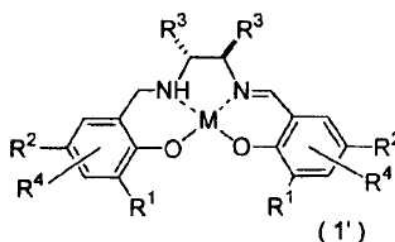
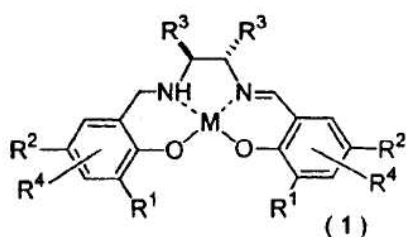
В соответствии с настоящим изобретением может быть эффективно получено оптически активное соединение оксида хрома, которое является важным
 45
 промежуточным соединением для получения соединения бензопирана, которое может быть использовано для лечения аритмии.

Наилучшие варианты осуществления изобретения

Используемые в настоящем документе обозначения означают: «н» («н») -
 50
 нормальный; («и») - изо, «втор» - вторичный, «трет» - третичный; «с» - цикло; «о» - орто; «м» - мета, а «п» - пара.

Настоящее изобретение подробно описано ниже. В настоящем изобретении, комплекс титана, используемый для асимметрической реакции эпоксицирования

соединения хрома с окислителем, представлен ниже следующими формулами, а именно формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) и формулой (4'):



где R^1 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-22} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой) и является оптически активным или оптически неактивным;

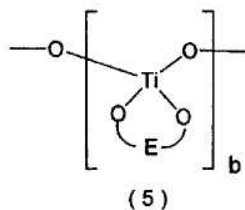
R^2 представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-18} арильную группу;

R^3 представляет собой C_{1-4} алкильную группу, C_{6-18} арильную группу или двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

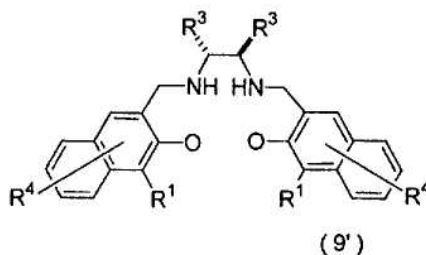
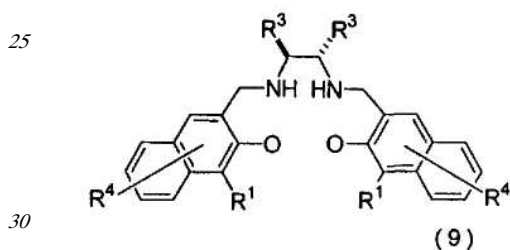
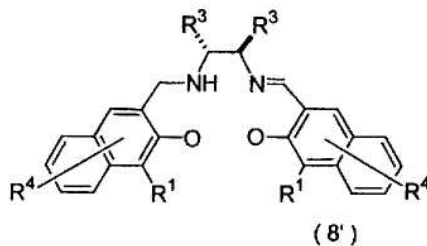
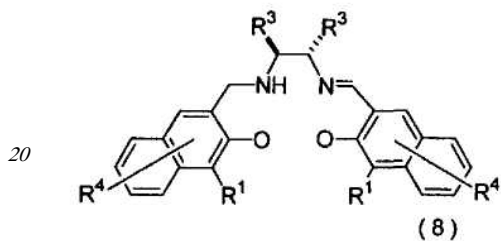
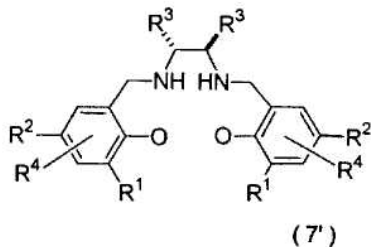
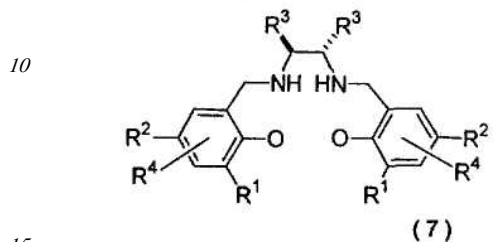
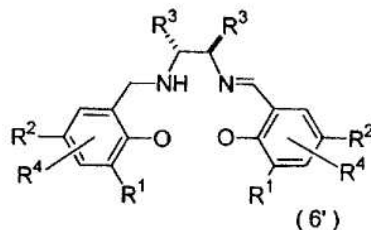
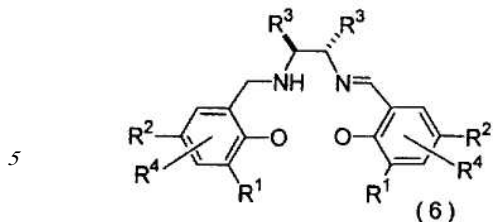
каждый из R^4 независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу;

M представляет собой TiJ^1J^2 (в TiJ^1J^2 , Ti представляет собой атом титана, а

каждый из J^1 и J^2 независимо представляют собой атом галогена или C_{1-4} -алкоксидную группу, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)



(где, в неполной структуре О-Е-О, О представляет собой атом кислорода, а группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6), соответствующей формуле (1); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6'), соответствующей формуле (1'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8), соответствующей формуле (3); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8'), соответствующей формуле (3'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9'), соответствующей формуле (4'));



25
b представляет собой целое число 1-10, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как определено выше).

35 Каждая группа-заместитель в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') описана ниже.

R^1 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-22} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой и является оптически активным или оптически неактивным);

45 R^1 конкретно описан в вышеуказанной формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4').

Примерами атомов галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода;

50 примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа;

примерами C_{1-4} алкоксигрупп являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, циклопропоксигруппа, н-бутоксигруппа,

изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа и циклобутоксигруппа; примерами C_{6-12} арилоксигруппы являются фенилоксигруппа, 1-нафтилоксигруппа, 2-нафтилоксигруппа, 2-бифенилоксигруппа, 3-бифенилоксигруппа и 4-бифенилоксигруппа; и

5 примерами C_{6-22} арильной группы (арильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой и является оптически активной или оптически неактивной) являются фенильная группа, 2-метилфенильная группа, 2-трифторметилфенильная группа, 4-метилфенильная группа, 2-этилфенильная группа, 2-пентафторэтилфенильная группа, 3,5-диметилфенильная группа, 2-метоксифенильная группа, 3-метоксифенильная группа, 4-метоксифенильная группа, 2-этоксифенильная группа, 2-изопропоксифенильная группа, 2-бензилоксифенильная группа, 3,5-диметоксифенильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 2-бифенилильная группа, 3-бифенилильная группа, 4-бифенилильная группа, 2-метил-1-нафтильная группа, 2-фенил-1-нафтильная группа, 2-метокси-1-нафтильная группа, 2-(3,5-диметилфенил)-1-нафтильная группа, 2-(4-метилфенил)-1-нафтильная группа, 2-(о-бифенилил)-1-нафтильная группа, 2-(м-бифенилил)-1-нафтильная группа и 2-(п-бифенилил)-1-нафтильная группа. Вышеупомянутая C_{6-22} арильная группа может быть оптически активной или оптически неактивной.

R^1 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) или в формуле (4') предпочтительно, представляет собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, атом йода, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, циклопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, циклобутоксигруппу, фенилоксигруппу, 1-нафтилоксигруппу, 2-нафтилоксигруппу, фенильную группу, 2-метилфенильную группу, 2-трифторметилфенильную группу, 4-метилфенильную группу, 2-этилфенильную группу, 3,5-диметилфенильную группу, 2-метоксифенильную группу, 3-метоксифенильную группу, 4-метоксифенильную группу, 2-этоксифенильную группу, 2-изопропоксифенильную группу, 2-бензилоксифенильную группу, 3,5-диметоксифенильную группу, 1-нафтильную группу, 2-нафтильную группу, 2-бифенилильную группу, 3-бифенилильную группу, 4-бифенилильную группу, 2-фенил-1-нафтильную группу, 2-метокси-1-нафтильную группу, 2-(м-бифенилил)-1-нафтильную группу и 2-(п-бифенилил)-1-нафтильную группу. Из указанных атомов и групп, более предпочтительными для R^1 являются фенильная группа, 2-метилфенильная группа, 2-трифторметилфенильная группа, 2-этилфенильная группа, 2-метоксифенильная группа, 2-бензилоксифенильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 2-бифенилильная группа, 2-фенил-1-нафтильная группа, 2-метокси-1-нафтильная группа, 2-(м-бифенилил)-1-нафтильная группа или 2-(п-бифенилил)-1-нафтильная группа (2-фенил-1-нафтильная группа, 2-метокси-1-нафтильная группа, 2-(м-бифенилил)-1-нафтильная группа и 2-(п-бифенилил)-1-нафтильная группа являются оптически активными или оптически неактивными), а наиболее предпочтительными для R^1 являются фенильная группа, 2-метилфенильная группа, 2-трифторметилфенильная группа, 2-метоксифенильная группа, 2-бензилоксифенильная группа и 2-фенил-1-нафтильная группа.

R^2 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-18} арильную группу.

R^2 конкретно описан в вышеуказанной формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4').

Примерами атомов галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода;

примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа;

примерами C_{1-4} алкоксигруппы являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, циклопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа и циклобутоксигруппа;

примерами C_{6-12} арилоксигруппы являются фенилоксигруппа, 1-нафтилоксигруппа, 2-нафтилоксигруппа, 2-бифенилилоксигруппа, 3-бифенилилоксигруппа и 4-бифенилилоксигруппа; а

примерами C_{6-18} арильной группы являются фенильная группа, 3,5-диметилфенильная группа, 4-метилфенильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 2-бифенилильная группа, 2-фенил-1-нафтильная группа, 2-метил-1-нафтильная группа, 2-(3,5-диметилфенил)-1-нафтильная группа, 2-(4-метилфенил)-1-нафтильная группа и 2-метокси-1-нафтильная группа.

R^2 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') предпочтительно представляет собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, атом йода, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, трет-бутильную группу, метоксигруппу, фенилоксигруппу, 1-нафтилоксигруппу, 2-нафтилоксигруппу, фенильную группу, 3,5-диметилфенильную группу, 4-метилфенильную группу, 3,5-диметоксифенильную группу, 4-метоксифенильную группу, 1-нафтильную группу, 2-нафтильную группу, 2-бифенилильную группу, 3-бифенилильную группу, 4-бифенилильную группу и 2-метокси-1-нафтильную группу. Из указанных атомов и групп, более предпочтительными для R^2 являются атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, атом йода, метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, трет-бутильная группа, метоксигруппа, фенилоксигруппа, фенильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа и 2-бифенилильная группа, а наиболее предпочтительным для R^2 является атом водорода.

R^3 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой C_{1-4} алкильную группу, C_{6-18} арильную группу или двухвалентную C_{3-5} группу, в случае, если два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо.

R^3 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') конкретно описан ниже.

Примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа;

примерами C_{6-18} арильной группы являются фенильная группа, 3,5-диметилфенильная группа, 2,4,6-триметилфенильная группа, 4-метилфенильная группа, 1-нафтильная группа, 2-бифенилильная группа, 2-фенил-1-нафтильная группа, 2-метил-1-нафтильная группа, 2-(3,5-диметилфенил)-1-нафтильная группа, 2-

(4-метилфенил)-1-нафтильная группа и 2-метокси-1-нафтильная группа; и если два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо, то они представляют собой двухвалентную C_{3-5} группу, и примерами такой двухвалентной группы являются триметиленовая группа и тетраметиленовая группа.

R^3 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') предпочтительно представляет собой фенильную группу, 3,5-диметилфенильную группу, 2,4,6-триметилфенильную группу, 4-метилфенильную группу и тетраметиленовую группу, образованную посредством связывания двух R^3 , и из указанных групп, более предпочтительной для R^3 является тетраметиленовая группа, образованная посредством связывания двух R^3 друг с другом.

R^4 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу.

R^4 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и формуле (4') конкретно описан ниже.

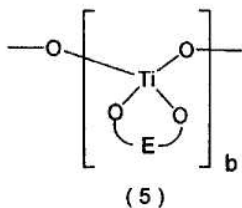
Примерами атомов галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода;

примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа; а

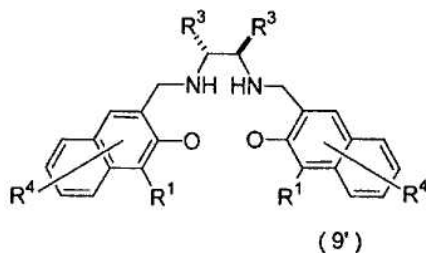
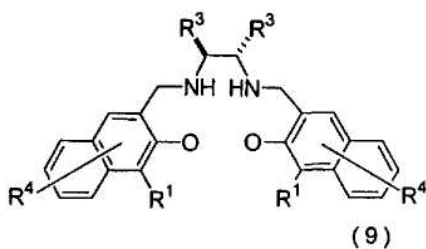
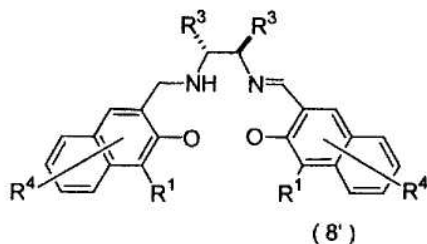
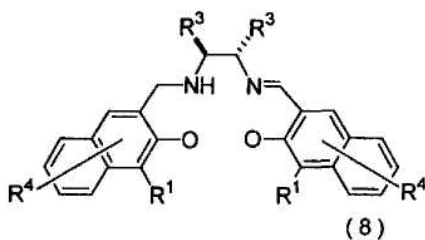
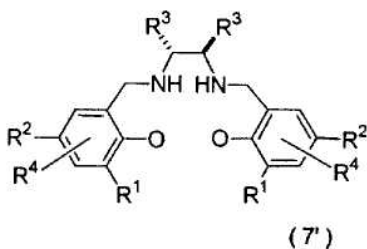
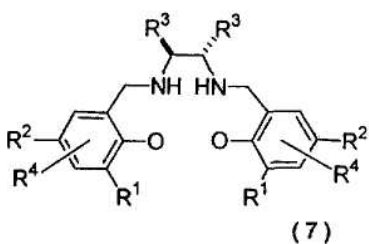
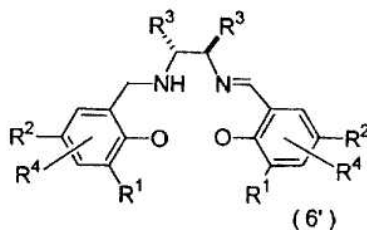
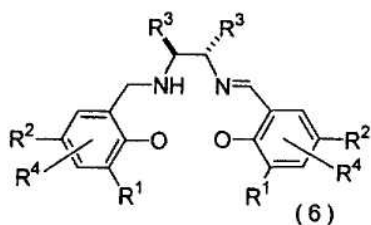
примерами C_{1-4} алкоксигруппы являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа и трет-бутоксигруппа.

R^4 в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') предпочтительно представляет собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, втор-бутоксигруппу и трет-бутоксигруппу. Из указанных атомов и групп, более предпочтительным для R^4 является атом водорода.

M в формуле (1), формуле (1'), формуле (2), формуле (2'), формуле (3), формуле (3'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой TiJ^1J^2 (в TiJ^1J^2 , Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляют собой атом галогена или C_{1-4} алкоксидную группу, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)



где, в неполной структуре О-Е-О, О представляет собой атом кислорода, а группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6), соответствующей формуле (1); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (6'), соответствующей формуле (1'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8), соответствующей формуле (3); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (8'), соответствующей формуле (3'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9'), соответствующей формуле (4'); и



в представляет собой целое число 1-10, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как определено выше.

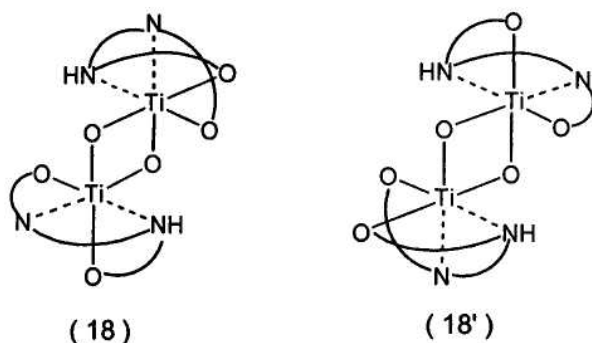
Если J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, то соединения формулы (1), формулы (1'), формулы (2), формулы (2'), формулы (3), формулы (3'), формулы (4) и формулы (4') представляют собой одноядерные комплексы оксититана в виде целых молекулярных структур, а если J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5), то соединения формулы (1), формулы (1'), формулы (2), формулы (2'), формулы (3), формулы (3'), формулы (4) и формулы (4') представляют собой многоядерные комплексы, а именно $(b+1)$ -ядерные комплексы μ -оксититана в виде целых молекулярных структур.

Кроме того, если соединения формулы (1), формулы (1'), формулы (2), формулы (2'), формулы (3), формулы (3'), формулы (4) и формулы (4') представляют собой комплексы оксититана или $(b+1)$ -ядерные комплексы μ -оксититана, то оптически активным комплексом титана может быть смесь из комплексов оксититана или $(b+1)$ -ядерных комплексов μ -оксититана, где b равно любому числу от 1 до 10.

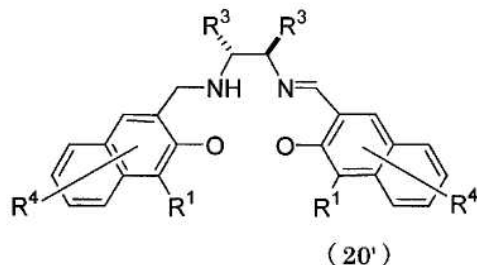
Предпочтительно, если J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5). В таких случаях, оптически активным комплексом титана является одноядерный комплекс оксититана или $(b+1)$ -ядерный комплекс μ -оксититана (где b равно любому целому числу от 1 до 10).

Кроме того, оптически активные комплексы титана согласно изобретению подразделяются на оптически активные комплексы титана-салаалена, представленные формулой (1), формулой (1'), формулой (3) и формулой (3'), и комплексы титана-салаана, представленные вышеуказанной формулой (2), формулой (2'), формулой (4) и формулой (4'), и комбинации предпочтительных групп-заместителей и структур целых молекул описаны ниже.

Оптически активные комплексы титана-салаалена, представленные вышеуказанными формулой (1), формулой (1'), формулой (3) и формулой (3'), включают J^1 и J^2 , где указанные J^1 и J^2 , связанные вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5), при этом предпочтительно, чтобы b в формуле (5) было равно 1. В этом случае, соединения формулы (1), формулы (1'), формулы (3) и формулы (3') представляют собой двухъядерные комплексы μ -оксититана, представленные нижеследующей формулой (18) и формулой (18'), в виде целых молекулярных структур:



(где группа O-NH-N-O представлена в нижеследующей формуле (19), соответствующей формуле (1), в нижеследующей формуле (19'), соответствующей формуле (1'), в нижеследующей формуле (20), соответствующей формуле (2), в нижеследующей формуле (20'), соответствующей формуле (2'), и



20

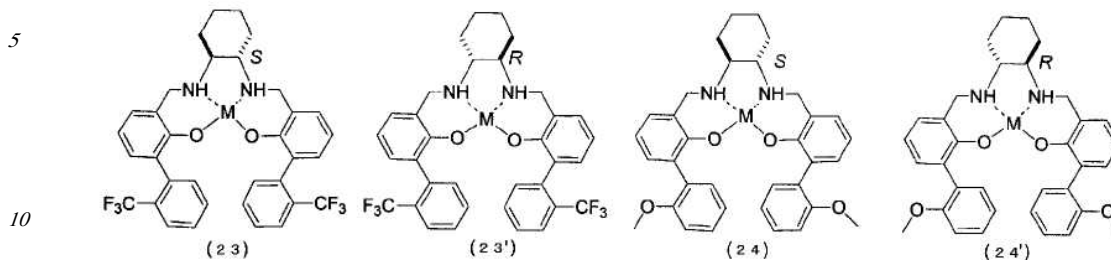
25



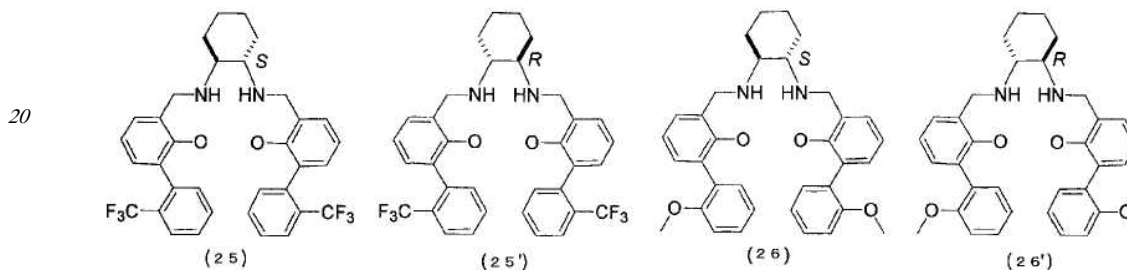
50

Стр.: 30

активных комплексов титана-салана, представленных формулой (2), формулой (2'), формулой (4) и формулой (4'), являются одноядерные комплексы оксотитана, представленные нижеследующими формулами (23), (23'), (24) и (24'):



15 (где М представляет собой TiJ^1J^2 , где J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5), где b равно целому числу 1-10, а неполные структуры О-Е-О представлены нижеследующими формулами (25), (25'), (26) или (26'))



25 или олигомер μ -оксититана, образованный посредством связывания $(b+1)$ -частей одноядерных комплексов оксотитана (b равно целому числу 1-10).

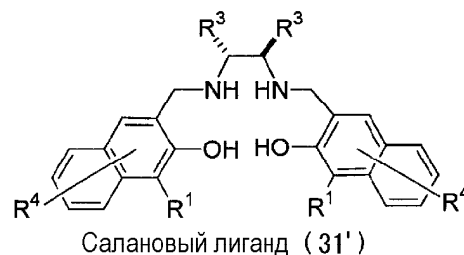
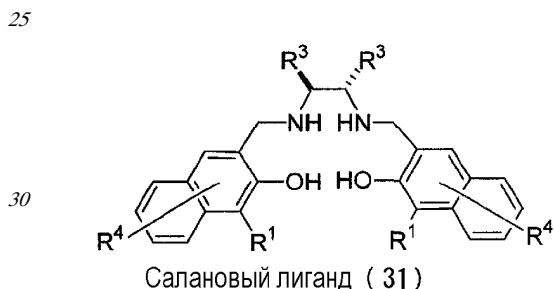
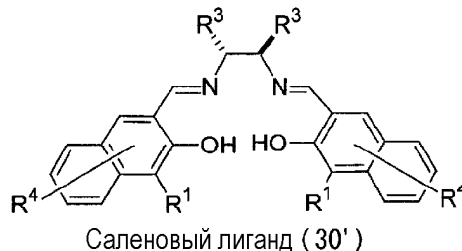
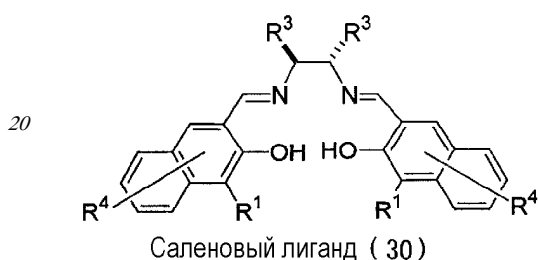
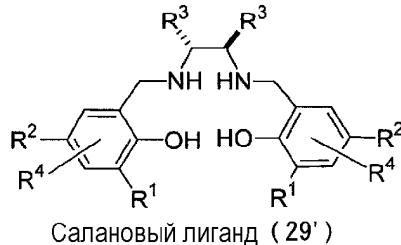
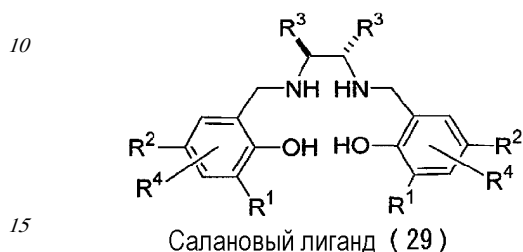
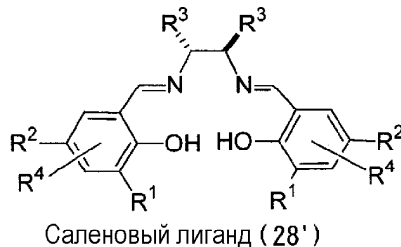
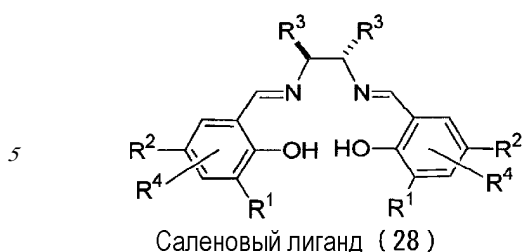
Кроме того, ниже описан способ получения оптически активных комплексов титана, представленных формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) и формулой (4').

30 Салановые лиганды, представленные формулой (29), формулой (29'), формулой (31) и формулой (31'), которые представляют собой лиганды комплексов титана-салана, представленные формулой (2), формулой (2'), формулой (4) и формулой (4') соответственно, могут быть получены путем восстановления соединений салена, представленных нижеследующей формулой (28), формулой (28'), формулой (30) и формулой (30') соответственно.

35 Примерами восстановителей являются боргидрид натрия ($NaBH_4$), цианоборгидрид натрия ($NaBH_3CN$) и алюмогидрид лития ($LiAlH_4$), а предпочтительным является боргидрид натрия ($NaBH_4$).

45

50



25

30

35

40

45

Оптически активные комплексы титана-сала, представленные формулой (2), формулой (2'), формулой (4) и формулой (4'), могут быть получены посредством взаимодействия соответствующих салановых лигандов с алкоксидом титана, тетрахлоридом титана или тетрабромидом титана в органическом растворителе, таком как дихлорметан, с последующей обработкой полученной смеси водой или водосодержащим растворителем (смешанный растворитель получают путем смешивания 0,1-100 мас. % воды в органическом растворителе, и примерами используемого органического растворителя являются ТГФ, метанол и изопропанол). Количество используемой воды, предпочтительно, составляет в пределах от 1 до 1000 моль, а более предпочтительно, в пределах от 1 до 10 моль по отношению к эквиваленту вышеупомянутого саланового лиганда.

Кроме того, вышеупомянутый оптически активный комплекс титана-сала образуется *in situ*, а асимметрическое эпоксирирование соединения хрома может быть также осуществлено без выделения комплекса, используемого в качестве катализатора.

50

В этом случае, реакция присоединения воды может быть также осуществлена путем добавления водного раствора пероксида водорода, используемого в качестве окислителя.

Предпочтительными соединениями титана являются алкоксиды титана, и

примерами алкоксидов титана являются тетраметоксид титана, тетраэтоксид титана, тетра-н-пропоксид титана, тетраизопропоксид титана, тетра-н-бутоксид титана и тетра-трет-бутоксид титана. Более предпочтительным алкоксидом титана является тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$). Количество используемого алкоксида титана, предпочтительно, составляет от 1 до 2 моль на один моль вышеупомянутого саланового лиганда.

Оптически активные комплексы титана-саладена, представленные формулой (1), формулой (1'), формулой (3) и формулой (3'), могут быть получены методом, описанным в не-патентном документе 8 (Angew. Chem. Int. Ed. (2005), 44, 4935-4939). То есть, салаленовый комплекс получают посредством взаимодействия соответствующего саланового лиганда с алкоксидом титана с образованием комплекса титана и восстановлением одной из двух иминовых связей в салановом лиганде в результате проведения реакции Меервейна-Понндорфа-Верлея (MPV), а после завершения реакции полученную смесь обрабатывают водой или водосодержащим растворителем (смешанный растворитель получают путем смешивания 0,1-100 мас.% воды в органическом растворителе, а примерами используемого органического растворителя являются ТГФ, метанол и изопропанол).

Кроме того, вышеупомянутый оптически активный комплекс титана-саладена образуется *in situ*, а асимметрическое эпоксидование соединения хрома может быть также осуществлено без выделения комплекса, используемого в качестве катализатора.

Примерами алкоксидов титана являются тетраметоксид титана, тетраэтоксид титана, тетра-н-пропоксид титана, тетраизопропоксид титана, тетра-н-бутоксид титана и тетра-трет-бутоксид титана. Предпочтительным алкоксидом титана является тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$). Количество используемого алкоксида титана, предпочтительно, составляет от 1 до 2 моль на один моль вышеупомянутого саланового лиганда. Количество используемой воды, предпочтительно, составляет от 1 до 1000 моль, а более предпочтительно, от 1 до 10 моль по отношению к эквиваленту вышеупомянутого саланового лиганда.

Примерами растворителей для реакции, используемых для получения оптически активного комплекса титана, являются апротонный органический растворитель, протонный органический растворитель или их смеси. Примерами апротонного органического растворителя являются галогеновый растворитель, ароматический углеводородный растворитель, сложноэфирный растворитель, эфирный растворитель или нитриловый растворитель, а в частности, такими растворителями являются дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлорэтан, хлорбензол, толуол, этилацетат, тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, бутиронитрил, пропионитрил и ацетонитрил. Примерами протонного органического растворителя являются спиртовой растворитель, а в частности, такими растворителями являются этанол, изопропанол и трет-бутанол.

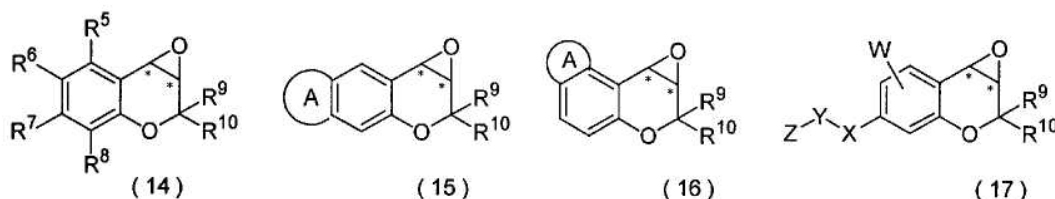
Предпочтительным растворителем для реакции является апротонный органический растворитель, такой как дихлорметан, 1,2-дихлорэтан, хлорбензол, толуол и этилацетат.

В способе получения соединения согласно изобретению, один из энантиомеров соединения оксида хрома может быть получен с высокой селективностью посредством асимметрического эпоксибования соединения хрома, которое является исходным материалом, с использованием оптически активного комплекса титана формулы (1), формулы (1'), формулы (2), формулы (2'), формулы (3),

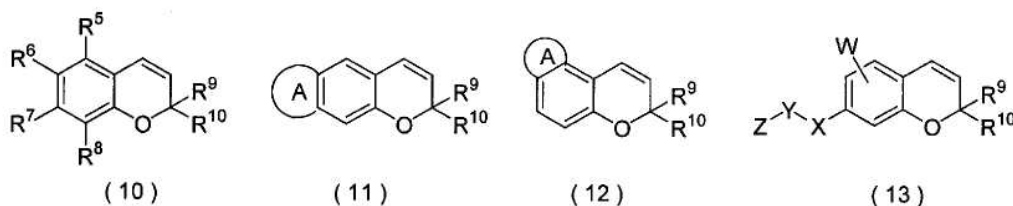
формулы (3'), формулы (4) и формулы (4'). В частности, один из двух энантиомеров оптически активного соединения оксида хрома может быть селективно получен с использованием любого из комплексов формулы (1) и формулы (1'); один из двух энантиомеров оптически активного соединения оксида хрома может быть селективно получен с использованием любого из комплексов формулы (2) и формулы (2'); один из двух энантиомеров оптически активного соединения оксида хрома может быть селективно получен с использованием любого из комплексов формулы (3) и формулы (3'); и один из двух энантиомеров оптически активного соединения оксида хрома может быть селективно получен с использованием любого из комплексов формулы (4) и формулы (4').

Ниже описан способ получения оптически активного соединения оксида хрома согласно изобретению.

Такой способ представляет собой способ получения оптически активного соединения оксида хрома, представленного формулой (14), формулой (15), формулой (16) или формулой (17):



где R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , A, W, X, Y и Z являются такими, как они были описаны ниже, а абсолютная конфигурация атомов углерода, обозначенных *, означает (R) или (S); где указанный способ включает растворение соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), и оптически активного комплекса титана, представленного формулой (1), формулой (1'), формулой (2), формулой (2'), формулой (3), формулой (3'), формулой (4) и формулой (4'), в органическом растворителе в атмосфере азота или в условиях окружающей среды; асимметрическое эпоксидование, осуществляемое путем добавления окислителя в реакционный раствор, и перемешивание



где каждый из R^5 , R^6 , R^7 и R^8 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и

алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, фенильной группой (фенильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, 5 цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкильной группой или C_{1-4} алкоксигруппой)), C_{1-4} алкилкарбонил(N- C_{1-4} алкил)аминогруппу (алкилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкоксикарбонильную группу (алкоксикарбонильная группа может быть 10 необязательно замещена атомом галогена), C_{6-10} арилкарбониламиногруппу (арилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), C_{6-10} арилкарбонил(N- C_{1-4} алкил)аминогруппу (арилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, 15 C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бензилкарбониламиногруппу, формильную группу, карбамоильную группу, C_{1-4} алкилсульфонильную группу, C_{6-10} арилсульфонильную группу (алкилсульфонильная группа и арилсульфонильная группа могут быть замещены 20 атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), сульфоамонийную группу, C_{1-4} алкилсульфонамидную группу, C_{6-10} арилсульфонамидную группу (алкилсульфонамидная группа и арилсульфонамидная группа могут быть замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной 25 группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена), C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (арилсульфон бис(арилсульфон)имидной 30 группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или (N,N'-(C_{1-4} алкилсульфон)(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (алкилсульфон и арилсульфон (N,N'-(алкилсульфон)(арилсульфон)имидной группы могут быть 35 замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена 40 атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-6} алкоксигруппой 45 (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена));

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (11) и в формуле (12) независимо представляет 50 собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена

атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть

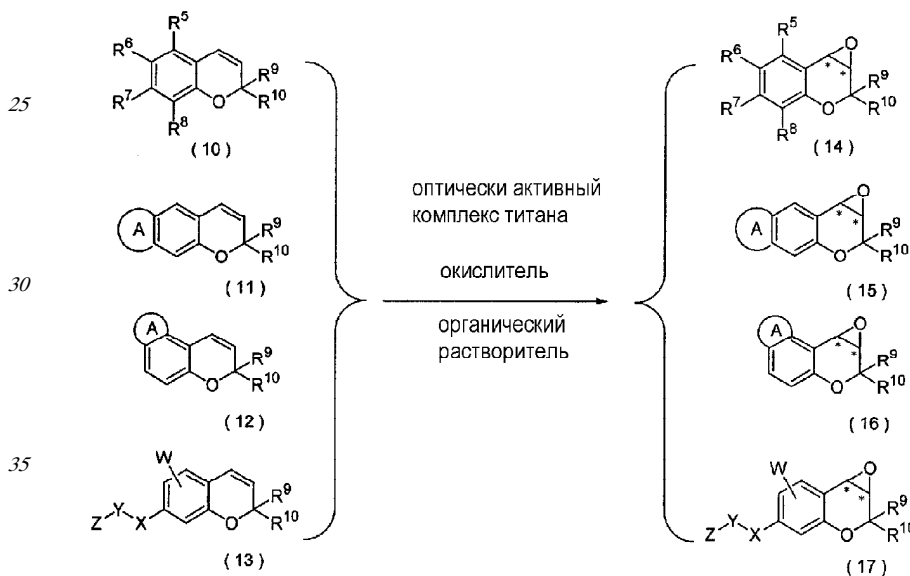
необязательно замещена атомом галогена));

неполная циклическая структура А в формуле (11) и в формуле (12) представляет собой неполную структуру, представленную 5-, 6- или 7-членным кольцом, образующим кольцо, конденсированное с частью бензольного кольца (каждое из 5-, 6- или 7-членных колец может быть необязательно замещено hR^{11} (R^{11} может быть необязательно замещен атомом галогена, гидроксигруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилкоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилкоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формамидную группу, карбамоильную группу, сульфогруппу, сульфоаминогруппу, сульфоамидную группу, сульфонильную группу, аминогруппу, карбоксильную группу, C_{1-6} алкиламиногруппу, ди- C_{1-6} алкиламиногруппу, C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{1-6} алкилсульфонамидную группу, C_{6-14} арилсульфонамидную группу, C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу, C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, C_{1-6} алкилсульфонильную группу, C_{6-14} арилсульфонильную группу или C_{6-14} арилкарбонильную группу (алкиламиногруппа, диалкиламиногруппа, алкилкарбониламиногруппа, алкилсульфонамидная группа, арилсульфонамидная группа, алкиламинокарбонильная группа, диалкиламинокарбонильная группа, алкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа, алкилсульфонильная группа, арилсульфонильная группа или арилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена); где h означает целое число 1-6, а если h равно целому числу 2-6, то R^{11} могут быть одинаковыми или различными); 1-3 атома кислорода, азота или серы могут присутствовать отдельно или в комбинации с другими атомами на кольце; число ненасыщенных связей в кольце, содержащем ненасыщенную(ые) связь(и) и конденсированном с бензольным кольцом, составляет 1, 2 или 3, а атом(ы) углерода, составляющий(ие) данное кольцо, может представлять собой карбонильную группу или тионильную группу); X в формуле (13) представляет собой NR^{20} (R^{20} представляет собой атом водорода или C_{1-4} алкильную группу); Y в формуле (13) представляет собой химическую связь, SO или SO_2 ; Z в формуле (13) представляет собой C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена 1-5 атомами галогена или фенильной группой (фенильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной

группой)) или фенильную группу (фенильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой); W в формуле (13) представляет собой атом водорода, гидроксигруппу, C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть
 5 необязательно замещена атомом галогена), атом галогена, C_{1-4} алкильную группу или C_{1-6} алкилсульфонамидную группу (алкильная группа и алкилсульфонамидная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена); и

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (13) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена
 10 атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная
 15 группа может быть необязательно замещена атомом галогена или C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)). Такое оптически активное соединение
 20 оксида хрома может быть получено методом, проиллюстрированным на реакционной схеме 1.

Реакционная схема 1



На реакционной схеме 1, где $R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, A, W, X, Y$ и Z являются
 40 такими, как они были описаны выше, а абсолютная конфигурация атомов углерода, обозначенных *, означает (R) или (S), проиллюстрирован способ получения оптически активного соединения оксида хрома, представленного формулой (14), формулой (15), формулой (16) и формулой (17), осуществляемый путем обработки
 45 соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) и формулой (13) соответственно, окислителем и оптически активным комплексом титана.

Соединение хрома, представленное формулой (10), формулой (11),
 50 формулой (12) и формулой (13), которое является исходным соединением согласно изобретению, может быть синтезировано общими методами синтеза бензопиранового кольца. Синтез конденсированного кольца формулы (11) и формулы (12) может быть осуществлен различными методами синтеза гетероциклов,

в комбинации необязательно с методами синтеза бензопиранового кольца.

о Общие методы синтеза бензопиранового кольца

Бензопирановое кольцо может быть синтезировано известными методами (методами, описанными в публикациях J. M. Evans et al., J. Med. Chem. 1984, 27, 1127.,
 5 J. Med. Chem. 1986, 29, 2194., J. T. North et al., J. Org. Chem. 1995, 60, 3397., в публикациях заявок на патент Японии №№ JP-A-56-57785, JP-A-56-57786, JP-A-58-188880, JP-A-2-141, JP-A-10-87650 и JP-A-11-209366, и в других работах).

о Индол и оксииндол

10 Индол и оксииндол могут быть синтезированы известными методами (методами, описанными в публикациях T. Sakamoto et al., Heterocycles, 1986, 24, 31., M. Belley et al., Synthesis, 2001, 222., A. D. Cross et al., J. Chem. Soc., 1961, 2714 и в других работах).

о Имидазолинон

15 Имидазолинон может быть синтезирован известным методом (методом, описанным в публикации J. Kitteringham et al., Synthetic Commun., 2000, 30, 1937).

о Хиолин

Хиолин может быть синтезирован известными методами (методами, описанными в публикациях S. Imor et al., Synthetic Commun., 1996, 26, 2197., Y. Kitahara et al.,
 20 Tetrahedron, 1997, 53, 6001., A. G. Osborne et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1993, 1, 181, R. T. Shuman et al., J. Org. Chem., 1990, 55, 738., T. Sakamoto et al., Chem. Pharm. Bull., 1981, 29, 2485, Y. Tsuji et al., J. Org. Chem., 1987, 52, 1673, Z. Song et al., J. Heterocyclic Chem., 1993, 30, 17, и в других работах).

о Хиолинон

25 Хиолинон может быть синтезирован известными методами (методами, описанными в публикациях M. R. Sabol et al., Synthetic Commun., 2000, 30, 427, Z-Y. Yang et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40, 4505., H-B Sun et al., Synthesis, 1997, 1249., A. Guiotto et al., J. Heterocyclic Chem., 1989, 26, 917., K. Konno et al., Heterocycles, 1986, 24,
 30 2169, E. Fernandez et al., Synthesis, 1995, 1362, и в других работах).

о Бензотиазол и триазол

Бензотиазол и триазол могут быть синтезированы известными методами (методами, описанными в публикациях N.B. Ambati et al., Synthetic Commun., 1997, 27,
 1487., D.E. Burton et al., J. Chem. Soc (C), 1968, 1268, и в других работах).

35 о Хиноксалин и хиноксалинон

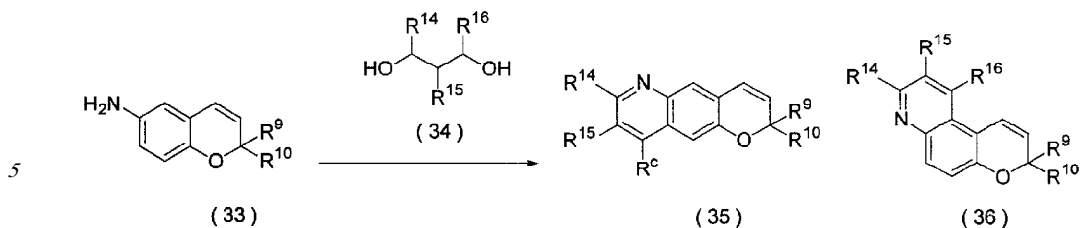
Хиноксалин и хиноксалинон могут быть синтезированы известными методами (методами, описанными в публикациях J.H. Liu et al., J. Org. Chem., 2000, 65, 3395., J. J. Li et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40, 4507., Y. Ahmed et al., Bull. Chem. Soc. Jpn., 1987,
 40 60, 1145, и в других работах).

о Бензоксазинон

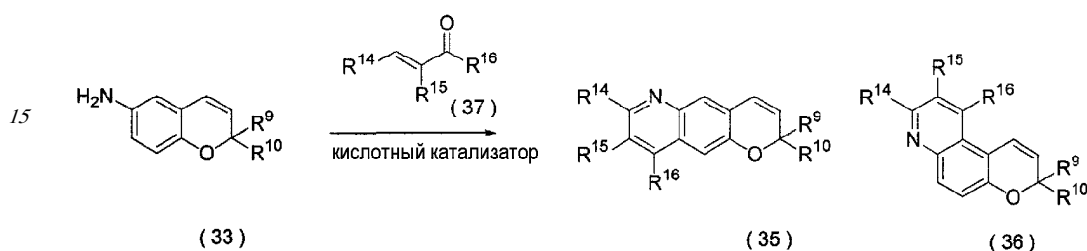
Бензоксазинон может быть синтезирован известными методами (методами, описанными в публикациях G. H. Jones et al., J. Med. Chem., 1987, 30, 295., J. L. Wright et al., J. Med. Chem. 2000, 43, 3408., M. Kluge et al., J. Heterocyclic Chem., 1995, 32, 395, и
 45 в других работах).

Соединения, представленные формулой (35) и (36), могут быть получены посредством взаимодействия соединения (33) с соединением (34) (Публикации: Y. Tsuji et al., J. Org. Chem. 1987, 52, 1673).

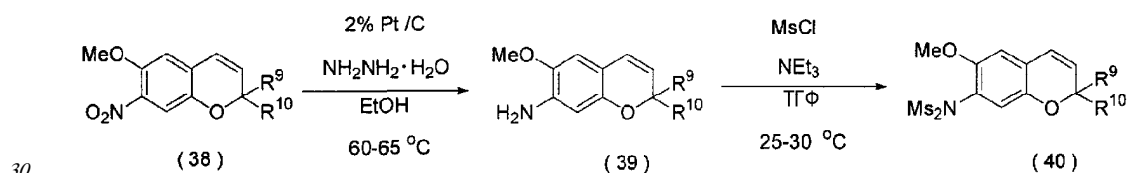
50



Соединения, представленные формулой (35) и (36), могут быть также получены посредством взаимодействия соединения (33) с соединением (37) в присутствии
 10 кислотного катализатора (Публикации: Y. Kitahara et al., Tetrahedron, 1997, 53, 6001, Z. Song et al., J. Heterocyclic Chem., 1993, 30, 17).



20 Соединение хрома, представленное нижеследующей формулой (40) может быть синтезировано из соединения (38) путем восстановления нитрогруппы соединения (38) в присутствии платины на угле в качестве катализатора с
 25 получением аминного соединения (39) с последующим мезилированием аминной группы соединения (39).



Каждая группа-заместитель соединений хрома, представленных формулой (10), формулой (11), формулой (12) и формулой (13), конкретно описана ниже.

Ниже описана каждая группа-заместитель для соединения формулы (10). Каждый
 35 из R⁵, R⁶, R⁷ и R⁸ в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C₁₋₄алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C₁₋₄алкоксигруппой, C₁₋₄алкилкарбонилксигруппой, C₁₋₄алкилкарбониламиногруппой или C₁₋₄алкоксикарбонильной группой
 40 (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C₁₋₄алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой,
 45 C₁₋₄алкоксигруппой, C₁₋₄алкилкарбонилксигруппой, C₁₋₄алкилкарбониламиногруппой или C₁₋₄алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C₁₋₄алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может
 50 быть необязательно замещена атомом галогена, C₆₋₁₀арильной группой (C₆₋₁₀арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C₁₋₄алкильной группой или

C_{1-4} алкоксигруппой)), C_{1-4} алкилкарбонил($N-C_{1-4}$ алкил)аминогруппу (алкилкарбонил(N -алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкоксикарбонильную группу (алкоксикарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{6-10} арилкарбониламиногруппу (арилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), C_{6-10} арилкарбонил($N-C_{1-4}$ алкил)аминогруппу (арилкарбонил(N -алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бензилкарбониламиногруппу, формильную группу, карбамоильную группу, C_{1-4} алкилсульфонильную группу (алкилсульфонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{6-10} арилсульфонильную группу (арилсульфонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), сульфоамидную группу, C_{1-4} алкилсульфонамидную группу, C_{6-10} арилсульфонамидную группу (алкилсульфонамидная группа и арилсульфонамидная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть необязательно замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), бис(C_{6-10} арилсульфон)имидную группу (арилсульфон бис(арилсульфон)имидной группы может быть необязательно замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или (N,N' -(C_{1-4} алкилсульфон)(C_{6-10} арилсульфон))имидную группу (алкилсульфон и арилсульфон (N,N' -(алкилсульфон)(арилсульфон))имидной группы могут быть необязательно замещены атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой).

Каждая группа-заместитель R^5 , R^6 , R^7 и R^8 в формуле (10) конкретно описана ниже.

Примерами атомов галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода; примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, трихлорметильная группа, этильная группа, n -пропильная группа, изопропильная группа, циклопропильная группа, n -бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа и циклобутильная группа; примерами C_{1-4} алкоксигруппы являются метоксигруппа, трифторметоксигруппа, трихлорметоксигруппа, этоксигруппа, n -пропоксигруппа, изопропоксигруппа, циклопропоксигруппа, n -бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа и циклобутоксигруппа; примерами C_{1-4} алкилкарбониламиногруппы являются метилкарбониламиногруппа, трифторметилкарбониламиногруппа, трихлорметилкарбониламиногруппа, этилкарбониламиногруппа, n -пропилкарбониламиногруппа, изопропилкарбониламиногруппа, циклопропилкарбониламиногруппа, n -бутилкарбониламиногруппа, изобутилкарбониламиногруппа, втор-бутилкарбониламиногруппа, трет-бутилкарбониламиногруппа, циклобутилкарбониламиногруппа, p -метоксифенилметилкарбониламиногруппа, p -нитрофенилметилкарбониламиногруппа и p -

метоксифенилэтилкарбониламиногруппа; примерами C_{1-6} алкилкарбонил(N- C_{1-4} алкил)аминогруппы являются метилкарбонил(N-метил)аминогруппа, трифторметилкарбонил(N-метил)аминогруппа, метилкарбонил(N-этил)аминогруппа, трифторметилкарбонил(N-этил)аминогруппа, этилкарбонил(N-этил)аминогруппа, н-пропилкарбонил(N-этил)аминогруппа, изопропилкарбонил(N-этил)аминогруппа, циклопропилкарбонил(N-этил)аминогруппа, н-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппа, изобутилкарбонил(N-этил)аминогруппа, втор-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппа, трет-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппа и циклобутилкарбонил(N-этил)аминогруппа; примерами C_{1-4} алкоксикарбонильной группы являются метоксикарбонильная группа, трифторметоксикарбонильная группа, этоксикарбонильная группа, н-пропоксикарбонильная группа, изопропоксикарбонильная группа, циклопропоксикарбонильная группа, н-бутоксикарбонильная группа, изобутоксикарбонильная группа, втор-бутоксикарбонильная группа, трет-бутоксикарбонильная группа и циклобутоксикарбонильная группа; примерами C_{6-10} арилкарбониламиногруппы являются фенилкарбониламиногруппа, 1-нафтилкарбониламиногруппа и 2-нафтилкарбониламиногруппа; примерами C_{6-10} арилкарбонил(N- C_{1-4} алкил)аминогруппы являются фенилкарбонил(N-метил)аминогруппа, фенилкарбонил(N-этил)аминогруппа, 1-нафтилкарбонил(N-этил)аминогруппа и 2-нафтилкарбонил(N-этил)аминогруппа; примерами C_{1-4} алкилсульфонильной группы являются метансульфонильная группа, трифторметансульфонильная группа, этансульфонильная группа, н-пропансульфонильная группа, изопропансульфонильная группа, циклопропансульфонильная группа, н-бутансульфонильная группа, изобутансульфонильная группа, втор-бутансульфонильная группа, трет-бутансульфонильная группа и циклобутансульфонильная группа; примерами C_{6-10} арилсульфонильной группы являются бензолсульфонильная группа, п-фторбензолсульфонильная группа, п-толуолсульфонильная группа, 1-нафталинсульфонильная группа и 2-нафталинсульфонильная группа; примерами C_{1-4} алкилсульфонамидной группы являются метансульфонамидная группа, трифторметансульфонамидная группа, этансульфонамидная группа, н-пропансульфонамидная группа, изопропансульфонамидная группа, циклопропансульфонамидная группа, н-бутансульфонамидная группа, изобутансульфонамидная группа, втор-бутансульфонамидная группа, трет-бутансульфонамидная группа и циклобутансульфонамидная группа; примерами C_{6-10} арилсульфонамидной группы являются бензолсульфонамидная группа, п-фторбензолсульфонамидная группа, п-толуолсульфонамидная группа, 1-нафталинсульфонамидная группа и 2-нафталинсульфонамидная группа; примерами бис(C_{1-4} алкилсульфон)амидной группы являются бис(метансульфон)имидная группа, бис(трифторметансульфон)имидная группа, бис(этансульфон)имидная группа, бис(н-пропансульфон)имидная группа, бис(изопропансульфон)имидная группа, бис(циклопропансульфон)имидная группа, бис(н-бутансульфон)имидная группа, бис(изобутансульфон)имидная группа, бис(втор-бутансульфон)имидная группа, бис(трет-бутансульфон)имидная группа и бис(циклобутансульфон)имидная группа; примерами бис(C_{6-10} арилсульфон)имидной группы являются бис(бензолсульфон)имидная группа, бис(п-фторбензолсульфон)имидная группа, бис(п-толуолсульфон)имидная группа, бис(1-нафталинсульфон)имидная группа и бис(2-нафталинсульфон)имидная группа; а примерами (N,N'-

(C₁₋₄алкилсульфон)(C₆₋₁₀арилсульфон))имидной группы являются (N,N'-(метан)(бензол))имидная группа, (N,N'-(трифторметан)(бензол))имидная группа, (N,N'-(трифтометан)(п-фторбензол))имидная группа, (N,N'-(этан)(бензол))имидная группа, (N,N'-(метан)(п-толуол))имидная группа, (N,N'-(трифторметан)(п-толуол))имидная группа, (N,N'-(этан)(п-толуол))имидная группа, (N,N'-(метан)(1-нафталин))имидная группа, (N,N'-(трифторметан)(1-нафталин))имидная группа, (N,N'-(этан)(1-нафталин))имидная группа, (N,N'-(метан)(2-нафталин))имидная группа, (N,N'-(трифторметан)(2-нафталин))имидная группа и (N,N'-(этан)(2-нафталин))имидная группа.

R⁵ и R⁶ в формуле (10) независимо и предпочтительно представляют собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом фтора, атом хлора, атом брома, атом иода, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, циклопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу, циклобутильную группу, метоксигруппу, трифторметоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, циклопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, циклобутоксигруппу, метилкарбониламиногруппу, трифторметилкарбониламиногруппу, этилкарбониламиногруппу, н-пропилкарбониламиногруппу, изопропилкарбониламиногруппу, циклопропилкарбониламиногруппу, н-бутилкарбониламиногруппу, изобутилкарбониламиногруппу, втор-бутилкарбониламиногруппу, трет-бутилкарбониламиногруппу, циклобутилкарбониламиногруппу, метилкарбонил(N-метил)аминогруппу, трифторметилкарбонил(N-метил)аминогруппу, метилкарбонил(N-этил)аминогруппу, трифторметилкарбонил(N-этил)аминогруппу, этилкарбонил(N-этил)аминогруппу, н-пропилкарбонил(N-этил)аминогруппу, изопропилкарбонил(N-этил)аминогруппу, циклопропилкарбонил(N-этил)аминогруппу, н-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппу, изобутилкарбонил(N-этил)аминогруппу, втор-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппу, трет-бутилкарбонил(N-этил)аминогруппу, циклобутилкарбонил(N-этил)аминогруппу, метоксикарбонильную группу, трифторметоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, фенилкарбониламиногруппу, 1-нафтилкарбониламиногруппу, 2-нафтилкарбониламиногруппу, фенилкарбонил(N-метил)аминогруппу, фенилкарбонил(N-этил)аминогруппу, 1-нафтилкарбонил(N-этил)аминогруппу, 2-нафтилкарбонил(N-этил)аминогруппу, бензилкарбониламиногруппу, формильную группу, карбамоильную группу, метансульфонамидную группу, трифторметансульфонамидную группу, этансульфонамидную группу, н-пропансульфонамидную группу, изопропансульфонамидную группу, циклопропансульфонамидную группу, н-бутансульфонамидную группу, изобутансульфонамидную группу, втор-бутансульфонамидную группу, трет-бутансульфонамидную группу, циклобутансульфонамидную группу, бис(метансульфон)имидную группу, бис(трифторметансульфон)имидную группу, бис(этансульфон)имидную группу, бис(н-пропансульфон)имидную группу, бис(изопропансульфон)имидную группу, бис(циклопропансульфон)имидную группу, бис(н-бутансульфон)имидную группу, бис(изобутансульфон)имидную группу, бис(втор-бутансульфон)имидную группу, бис(трет-бутансульфон)имидную группу, бис(циклобутансульфон)имидную группу,

бис(бензолсульфон)имидную группу, бис(п-толуолсульфон)имидную группу, бис(1-нафталинсульфон)имидную группу, бис(2-нафталинсульфон)имидную группу, (N,N'-(метан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(этан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(метан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(этан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(метан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(этан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(метан)(2-нафталин))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(2-нафталин))имидную группу и (N,N'-(этан)(2-нафталин))имидную группу, а более предпочтительно, атом водорода, нитрогруппу, атом фтора, атом хлора, метоксигруппу, метилкарбониламиногруппу, метилкарбонил(N-этил)аминогруппу, бис(трифторметансульфон)имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(бензол))имидную группу и (N,N'-(трифторметан)(п-толуол))имидную группу.

R^7 в формуле (10) предпочтительно представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, метансульфонамидную группу, трифторметансульфонамидную группу, этансульфонамидную группу, н-пропансульфонамидную группу, изопропансульфонамидную группу, циклопропансульфонамидную группу, н-бутансульфонамидную группу, изобутансульфонамидную группу, втор-бутансульфонамидную группу, трет-бутансульфонамидную группу, циклобутансульфонамидную группу, бис(метансульфон)имидную группу, бис(трифторметансульфон)имидную группу, бис(этансульфон)имидную группу, бис(н-пропансульфон)имидную группу, бис(изопропансульфон)имидную группу, бис(циклопропансульфон)имидную группу, бис(н-бутансульфон)имидную группу, бис(изобутансульфон)имидную группу, бис(втор-бутансульфон)имидную группу, бис(трет-бутансульфон)имидную группу, бис(циклобутансульфон)имидную группу, бис(бензолсульфон)имидную группу, бис(п-толуолсульфон)имидную группу, бис(1-нафталинсульфон)имидную группу, бис(2-нафталинсульфон)имидную группу, (N,N'-(метан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(п-фторбензол))имидную группу, (N,N'-(этан)(бензол))имидную группу, (N,N'-(метан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(этан)(п-толуол))имидную группу, (N,N'-(метан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(этан)(1-нафталин))имидную группу, (N,N'-(метан)(2-нафталин))имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(2-нафталин))имидную группу и (N,N'-(этан)(2-нафталин))имидную группу, а более предпочтительно, атом водорода, нитрогруппу, бис(метансульфон)имидную группу, бис(трифторметансульфон)имидную группу, (N,N'-(трифторметан)(бензол))имидную группу и (N,N'-(трифторметан)(п-толуол))имидную группу.

R^8 в формуле (10) предпочтительно представляет собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, цианогруппу, нитрогруппу, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, циклопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, втор-бутильную группу, трет-бутильную группу и циклобутильную группу, а более предпочтительно, атом водорода, атом фтора, нитрогруппу, метильную группу и трифторметильную группу.

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно

замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)).

Каждая группа-заместитель для R^9 и R^{10} в формуле (10) конкретно описана ниже.

Примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, 1-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, 1-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа и 3,3-диметил-н-бутильная группа, а примерами C_{6-14} арильной группы являются фенильная группа, о-бифенилильная группа, м-бифенилильная группа, п-бифенилильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 1-антрильная группа, 2-антрильная группа, 9-антрильная группа, 1-фенантрильная группа, 2-фенантрильная группа, 3-фенантрильная группа, 4-фенантрильная группа и 9-фенантрильная группа.

R^9 и R^{10} в формуле (10) предпочтительно представляют собой атом водорода, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу и фенильную группу, а более предпочтительно, метильную группу.

Каждая группа-заместитель в формуле (11) и в формуле (12) описана ниже.

Каждый из R^9 и R^{10} в формуле (11) и в формуле (12) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C_{6-14} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой), или C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)).

Каждая группа-заместитель для R^9 и R^{10} в формуле (11) и в формуле (12) конкретно описана ниже.

Примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, 1-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, 1-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа и 3,3-диметил-н-бутильная группа, а примерами C_{6-14} арильной группы являются фенильная группа, о-бифенилильная группа, м-бифенилильная группа, п-бифенилильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 1-антрильная группа, 2-антрильная группа, 9-антрильная группа, 1-фенантрильная группа, 2-

фенантрильная группа, 3-фенантрильная группа, 4-фенантрильная группа и 9-фенантрильная группа.

R^9 и R^{10} в формуле (11) и в формуле (12), предпочтительно, представляют собой атом водорода, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу и фенильную группу, а более предпочтительно, метильную группу.

Неполная циклическая структура А в формуле (11) и в формуле (12) описана ниже.

Неполная циклическая структура А означает неполную структуру,

представленную 5-, 6- или 7-членным кольцом, образующим кольцо,

конденсированное с частью бензольного кольца (каждое из 5-, 6- или 7-членных колец может быть необязательно замещено hR^{11} (R^{11} может быть необязательно

атомом галогена, гидроксигруппой, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой,

цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой,

C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или

C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть

необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа

может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой,

цианогруппой, аминогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой,

C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или

C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть

необязательно замещены атомом галогена)), нитрогруппой, цианогруппой,

формильной группой, формамидной группой, карбамоильной группой,

сульфогруппой, сульфоаминогруппой, сульфоамонийной группой, сульфонильной

группой, аминогруппой, карбоксильной группой, C_{1-6} алкиламиногруппой, ди-

C_{1-6} алкиламиногруппой, C_{1-6} алкилкарбониламиногруппой,

C_{1-6} алкилсульфонамидной группой, C_{6-14} арилсульфонамидной группой,

C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой,

C_{1-6} алкилкарбонильной группой, C_{1-6} алкоксикарбонильной группой,

C_{1-6} алкилсульфонильной группой, C_{6-14} арилсульфонильной группой или

C_{6-14} арилкарбонильной группой (алкиламиногруппа, диалкиламиногруппа,

алкилкарбониламиногруппа, алкилсульфонамидная группа, арилсульфонамидная

группа, алкиламинокарбонильная группа, диалкиламинокарбонильная группа,

алкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа, алкилсульфонильная

группа, арилсульфонильная группа или арилкарбонильная группа могут быть

необязательно замещены атомом галогена); где h означает целое число 1-6, а если h

равно целому числу 2-6, то R^{11} могут быть одинаковыми или различными); 1-3 атома

кислорода, азота или серы могут присутствовать отдельно или в комбинации с

другими атомами на кольце; число ненасыщенных связей в кольце, содержащем

ненасыщенную(ые) связь(и) и конденсированном с бензольным кольцом,

составляет 1, 2 или 3, а атомы углерода, составляющие данное кольцо, могут

представлять собой карбонил или тиокарбонил).

R^{11} конкретно описан ниже.

Примерами атомов галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода;

примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная

группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, 1-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, 1-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа, 3,3-диметил-н-бутильная группа, метилкарбонилметильная группа, этилкарбонилметильная группа, метилкарбонилэтильная группа, этилкарбонилэтильная группа, метилкарбониламинометильная группа, трифторметилкарбониламинометильная группа, этилкарбониламинометильная группа, метилкарбониламиноэтильная группа, этилкарбониламиноэтильная группа, метоксикарбонилметильная группа, трифторметоксикарбонилметильная группа, этоксикарбонилметильная группа, метоксикарбонилэтильная группа и этоксикарбонилэтильная группа;

примерами C_{1-6} алкоксигруппы являются метоксигруппа, трифторметоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа, 1-пентилоксигруппа, 2-пентилоксигруппа, 3-пентилоксигруппа, изопентилоксигруппа, неопентилоксигруппа, 2,2-диметилпропоксигруппа, 1-гексилоксигруппа, 2-гексилоксигруппа, 3-гексилоксигруппа, 1-метил-н-пентилоксигруппа, 1,1,2-триметил-н-пропоксигруппа, 1,2,2-триметил-н-пропоксигруппа, 3,3-диметил-н-бутоксигруппа, метилкарбонилметоксигруппа, этилкарбонилметоксигруппа, метилкарбонилэтоксигруппа, этилкарбонилэтоксигруппа, метилкарбониламинометоксигруппа, трифторметилкарбониламинометоксигруппа, этилкарбониламинометоксигруппа, метилкарбониламиноэтоксигруппа, этилкарбониламиноэтоксигруппа, метоксикарбонилметоксигруппа, трифторметоксикарбонилметоксигруппа, этоксикарбонилметоксигруппа, метоксикарбонилэтоксигруппа и этоксикарбонилэтоксигруппа;

примерами C_{1-6} алкиламиногруппы являются метиламиногруппа, трифторметиламиногруппа, этиламиногруппа, н-пропиламиногруппа, изопропиламиногруппа, циклопропиламиногруппа, н-бутиламиногруппа, изобутиламиногруппа, втор-бутиламиногруппа, трет-бутиламиногруппа, циклобутиламиногруппа, 1-пентиламиногруппа, 2-пентиламиногруппа, 3-пентиламиногруппа, изопентиламиногруппа, неопентиламиногруппа, трет-пентиламиногруппа, циклопентиламиногруппа, 1-гексиламиногруппа, 2-гексиламиногруппа, 3-гексиламиногруппа, циклогексиламиногруппа, 1-метил-н-пентиламиногруппа, 1,1,2-триметил-н-пропиламиногруппа, 1,2,2-триметил-н-пропиламиногруппа и 3,3-диметил-н-бутиламиногруппа;

примерами ди- C_{1-6} алкиламиногруппы являются диметиламиногруппа, ди-(трифторметил)аминогруппа, диэтиламиногруппа, ди-н-пропиламиногруппа, ди-изопропиламиногруппа, дициклопропиламиногруппа, ди-н-бутиламиногруппа, диизобутиламиногруппа, ди-втор-бутиламиногруппа, ди-трет-бутиламиногруппа, дициклобутиламиногруппа, ди-1-пентиламиногруппа, ди-2-пентиламиногруппа, ди-3-пентиламиногруппа, диизопентиламиногруппа, ди-неопентиламиногруппа, ди-трет-пентиламиногруппа, ди-циклопентиламиногруппа, ди-1-гексиламиногруппа, ди-2-гексиламиногруппа, ди-3-гексиламиногруппа, дициклогексиламиногруппа, ди-(1-метил-н-пентил)аминогруппа, ди-(1,1,2-триметил-н-пропил)аминогруппа, ди-(1,2,2-триметил-н-пропил)аминогруппа, ди-(3,3-диметил-н-бутил)аминогруппа,

метил(этил)аминогруппа, метил(н-пропил)аминогруппа, метил(изопропил)аминогруппа, метил(циклопропил)аминогруппа, метил(н-бутил)аминогруппа, метил(изобутил)аминогруппа, метил(втор-бутил)аминогруппа, метил(трет-бутил)аминогруппа, метил(циклобутил)аминогруппа, этил(н-пропил)аминогруппа, этил(изопропил)аминогруппа, этил(циклопропил)аминогруппа, этил(н-бутил)аминогруппа, этил(изобутил)аминогруппа, этил(втор-бутил)аминогруппа, этил(трет-бутил)аминогруппа, этил(циклобутил)аминогруппа, н-пропил(изопропил)аминогруппа, н-пропил(циклопропил)аминогруппа, н-пропил(н-бутил)аминогруппа, н-пропил(изобутил)аминогруппа, н-пропил(втор-бутил)аминогруппа, н-пропил(трет-бутил)аминогруппа, н-пропил(циклобутил)аминогруппа, изопропил(циклопропил)аминогруппа, изопропил(н-бутил)аминогруппа, изопропил(изобутил)аминогруппа, изопропил(втор-бутил)аминогруппа, изопропил(трет-бутил)аминогруппа, изопропил(циклобутил)аминогруппа, циклопропил(н-бутил)аминогруппа, циклопропил(изобутил)аминогруппа, циклопропил(втор-бутил)аминогруппа, циклопропил(трет-бутил)аминогруппа, циклопропил(циклобутил)аминогруппа, н-бутил(изобутил)аминогруппа, н-бутил(втор-бутил)аминогруппа, н-бутил(трет-бутил)аминогруппа, н-бутил(циклобутил)аминогруппа, изобутил(втор-бутил)аминогруппа, изобутил(трет-бутил)аминогруппа, изобутил(циклобутил)аминогруппа, втор-бутил(трет-бутил)аминогруппа, втор-бутил(циклобутил)аминогруппа и трет-бутил(циклобутил)аминогруппа;

примерами C_{1-6} алкилкарбониламиногруппы являются метилкарбониламиногруппа, трифторметилкарбониламиногруппа, этилкарбониламиногруппа, н-пропилкарбониламиногруппа, изопропилкарбониламиногруппа, н-бутилкарбониламиногруппа, изобутилкарбониламиногруппа, втор-бутилкарбониламиногруппа, трет-бутилкарбониламиногруппа, 1-пентилкарбониламиногруппа, 2-пентилкарбониламиногруппа, 3-пентилкарбониламиногруппа, изопентилкарбониламиногруппа, неопентилкарбониламиногруппа, трет-пентилкарбониламиногруппа, 1-гексилкарбониламиногруппа, 2-гексилкарбониламиногруппа и 3-гексилкарбониламиногруппа;

примерами C_{1-6} алкилсульфонамидной группы являются метансульфонамидная группа, трифторметансульфонамидная группа, этансульфонамидная группа, н-пропансульфонамидная группа, изопропансульфонамидная группа, н-бутансульфонамидная группа, изобутансульфонамидная группа, втор-бутансульфонамидная группа, трет-бутансульфонамидная группа, 1-пентансульфонамидная группа, 2-пентансульфонамидная группа, 3-пентансульфонамидная группа, изопентансульфонамидная группа, неопентансульфонамидная группа, трет-пентансульфонамидная группа, 1-гексансульфонамидная группа, 2-гексансульфонамидная группа и 3-гексансульфонамидная группа;

примерами C_{6-14} арилсульфонамидной группы являются бензолсульфонамидная группа, п-толуолсульфонамидная группа, о-бифенилсульфонамидная группа, м-бифенилсульфонамидная группа, п-бифенилсульфонамидная группа, 1-нафталинсульфонамидная группа, 2-нафталинсульфонамидная группа, 1-антраценсульфонамидная группа, 2-антраценсульфонамидная группа, 9-антраценсульфонамидная группа, 1-фенантренсульфонамидная группа, 2-

фенантренсульфонамидная группа, 3-фенантренсульфонамидная группа, 4-фенантренсульфонамидная группа и 9-фенантренсульфонамидная группа;

примерами C_{1-6} алкиламинокарбонильной группы являются

метиламинокарбонильная группа, трифторметиламинокарбонильная группа, этиламинокарбонильная группа, н-пропиламинокарбонильная группа, изопропиламинокарбонильная группа, н-бутиламинокарбонильная группа, изобутиламинокарбонильная группа, втор-бутиламинокарбонильная группа, трет-бутиламинокарбонильная группа, 1-пентиламинокарбонильная группа, 2-пентиламинокарбонильная группа, 3-пентиламинокарбонильная группа, изопентиламинокарбонильная группа, неопентиламинокарбонильная группа, трет-пентиламинокарбонильная группа, 1-гексиламинокарбонильная группа, 2-гексиламинокарбонильная группа и 3-гексиламинокарбонильная группа;

примерами ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группы являются

диметиламинокарбонильная группа, ди-(трифторметил)аминокарбонильная группа, диэтиламинокарбонильная группа, ди-н-пропиламинокарбонильная группа, диизопропиламинокарбонильная группа, дициклопропиламинокарбонильная группа, ди-н-бутиламинокарбонильная группа, диизобутиламинокарбонильная группа, ди-втор-бутиламинокарбонильная группа, ди-трет-бутиламинокарбонильная группа, дициклобутиламинокарбонильная группа, ди-1-пентиламинокарбонильная группа, ди-2-пентиламинокарбонильная группа, ди-3-пентиламинокарбонильная группа, ди-изопентиламинокарбонильная группа, динеопентиламинокарбонильная группа, ди-трет-пентиламинокарбонильная группа, дициклопентиламинокарбонильная группа, ди-1-гексиламинокарбонильная группа, ди-2-гексиламинокарбонильная группа, ди-3-гексиламинокарбонильная группа, дициклогексиламинокарбонильная группа, ди-(1-метил-н-пентил)аминокарбонильная группа, ди-(1,1,2-триметил-н-пропил)аминокарбонильная группа, ди-(1,2,2-триметил-н-пропил)аминокарбонильная группа, ди-(3,3-диметил-н-бутил)аминокарбонильная группа, метил(этил)аминокарбонильная группа, трифторметил(этил)аминокарбонильная группа, метил(н-пропил)аминокарбонильная группа, метил(изопропил)аминокарбонильная группа, метил(циклопропил)аминокарбонильная группа, метил(н-бутил)аминокарбонильная группа, метил(изобутил)аминокарбонильная группа, метил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, метил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, метил(циклобутил)аминокарбонильная группа, этил(н-пропил)аминокарбонильная группа, этил(изопропил)аминокарбонильная группа, этил(циклопропил)аминокарбонильная группа, этил(н-бутил)аминокарбонильная группа, этил(изобутил)аминокарбонильная группа, этил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, этил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, этил(циклобутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(изопропил)аминокарбонильная группа, н-пропил(циклопропил)аминокарбонильная группа, н-пропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(изобутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(циклобутил)аминокарбонильная группа, изопропил(циклопропил)аминокарбонильная группа, изопропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(изобутил)аминокарбонильная группа, изопропил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(трет-

бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(циклобутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(изобутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(втор-
 5 бутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(изобутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа, изобутил(втор-
 10 бутил)аминокарбонильная группа, изобутил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, изобутил(циклобутил)аминокарбонильная группа, втор-бутил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, втор-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа и трет-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкилкарбонильной группы являются метилкарбонильная группа, трифторметилкарбонильная группа, этилкарбонильная группа, н-пропилкарбонильная группа, изопропилкарбонильная группа, н-бутилкарбонильная группа, изобутилкарбонильная группа, втор-бутилкарбонильная группа, трет-бутилкарбонильная группа, 1-пентилкарбонильная группа, 2-пентилкарбонильная
 15 группа, 3-пентилкарбонильная группа, изопентилкарбонильная группа, неопентилкарбонильная группа, трет-пентилкарбонильная группа, 1-гексилкарбонильная группа, 2-гексилкарбонильная группа и 3-гексилкарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкоксикарбонильной группы являются метоксикарбонильная группа, трифторметоксикарбонильная группа, этоксикарбонильная группа, н-пропоксикарбонильная группа, изопропоксикарбонильная группа, н-бутоксикарбонильная группа, изобутоксикарбонильная группа, втор-бутоксикарбонильная группа, трет-бутоксикарбонильная группа, 1-пентилоксикарбонильная группа, 2-пентилоксикарбонильная группа, 3-пентилоксикарбонильная группа, изопентилоксикарбонильная группа, неопентилоксикарбонильная группа, трет-пентилоксикарбонильная группа, 1-гексилоксикарбонильная группа, 2-гексилоксикарбонильная группа и 3-гексилоксикарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкилсульфонильной группы являются метансульфонильная группа, трифторметансульфонильная группа, этансульфонильная группа, н-пропансульфонильная группа и н-бутансульфонильная группа;

примерами C_{6-14} арилсульфонильной группы являются бензолсульфонильная группа, п-фторбензолсульфонильная группа, п-толуолсульфонильная группа, о-бифенилсульфонильная группа, м-бифенилсульфонильная группа, п-бифенилсульфонильная группа, 1-нафталинсульфонильная группа, 2-нафталинсульфонильная группа, 1-антраценсульфонильная группа, 2-антраценсульфонильная группа, 9-антраценсульфонильная группа, 1-фенантренсульфонильная группа, 2-фенантренсульфонильная группа, 3-фенантренсульфонильная группа, 4-фенантренсульфонильная группа и 9-фенантренсульфонильная группа; а

примерами C_{6-14} арилкарбонильной группы являются фенилкарбонильная группа, п-фторфенилкарбонильная группа, о-бифенилкарбонильная группа, м-бифенилкарбонильная группа, п-фенилкарбонильная группа, 1-нафтилкарбонильная группа, 2-нафтилкарбонильная группа, 1-антрилкарбонильная группа, 2-антрилкарбонильная группа, 9-антрилкарбонильная группа, 1-

фенантрилкарбонильная группа, 2-фенантрилкарбонильная группа, 3-фенантрилкарбонильная группа, 4-фенантрилкарбонильная группа и 9-фенантрилкарбонильная группа.

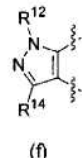
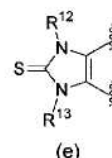
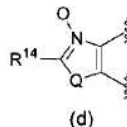
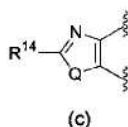
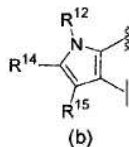
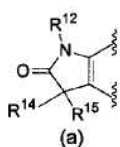
Предпочтительные атомы и группы для вышеупомянутого R¹¹ конкретно описаны ниже.

R¹¹, предпочтительно, представляет собой атом фтора, атом хлора, атом брома, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопротильную группу, н-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, 3,3-диметил-н-бутильную группу, метилкарбонилоксиметильную группу, этилкарбонилоксиметильную группу, метилкарбонилоксиэтильную группу, этилкарбонилоксиэтильную группу, метилкарбониламинометильную группу, трифторметилкарбониламинометильную группу, этилкарбониламинометильную группу, метилкарбониламиноэтильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метоксикарбонилметильную группу, трифторметоксикарбонилметильную группу, этоксикарбонилметильную группу, метоксикарбонилэтильную группу, этоксикарбонилэтильную группу, метоксигруппу, трифторметоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, 3,3-диметил-н-бутоксигруппу, метилкарбонилоксиметоксигруппу, этилкарбонилоксиметоксигруппу, метилкарбонилоксиэтоксигруппу, этилкарбонилоксиэтоксигруппу, метилкарбонилоксиаминометоксигруппу, трифторметилкарбониламинометоксигруппу, этилкарбониламинометоксигруппу, метилкарбониламиноэтоксигруппу, этилкарбониламиноэтоксигруппу, метоксикарбонилметоксигруппу, трифторметоксикарбонилметоксигруппу, этоксикарбонилметоксигруппу, метоксикарбонилэтоксигруппу, метиламиногруппу, трифторметиламиногруппу, этиламиногруппу, н-пропиламиногруппу, изопропиламиногруппу, н-бутиламиногруппу, диметиламиногруппу, ди-(трифторметил)аминогруппу, диэтиламиногруппу, ди-н-пропиламиногруппу, диизопропиламиногруппу, ди-н-бутиламиногруппу, метилкарбониламиногруппу, трифторметилкарбониламиногруппу, этилкарбониламиногруппу, н-пропилкарбониламиногруппу, изопропилкарбониламиногруппу, н-бутилкарбониламиногруппу, метансульфонамидную группу, трифторметансульфонамидную группу, этансульфонамидную группу, н-пропансульфонамидную группу, изопропансульфонамидную группу, н-бутансульфонамидную группу, бензолсульфонамидную группу, п-толуолсульфонамидную группу, метиламинокарбонильную группу, трифторметиламинокарбонильную группу, этиламинокарбонильную группу, н-пропиламинокарбонильную группу, изопропиламинокарбонильную группу, н-бутиламинокарбонильную группу, диметиламинокарбонильную группу, ди(трифторметил)аминокарбонильную группу, диэтиламинокарбонильную группу, ди-н-пропиламинокарбонильную группу, диизопропиламинокарбонильную группу, дициклопропиламинокарбонильную группу, ди-н-бутиламинокарбонильную группу, метил(этил)аминокарбонильную группу, трифторметил(этил)аминокарбонильную группу, метилкарбонильную группу, трифторметилкарбонильную группу, этилкарбонильную группу, н-пропилкарбонильную группу, изопропилкарбонильную группу, н-бутилкарбонильную группу, метоксикарбонильную группу, трифторметоксикарбонильную группу,

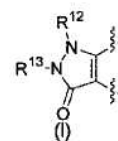
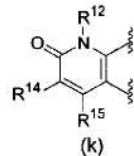
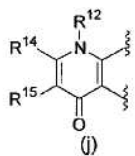
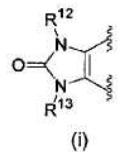
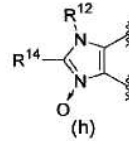
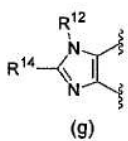
этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу,
 изопропоксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу,
 изобутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, трет-
 5 бутоксикарбонильную группу, метансульфонильную группу,
 трифторметансульфонильную группу, этансульфонильную группу,
 бензолсульфонильную группу, о-бифенилсульфонильную группу, м-
 бифенилсульфонильную группу, п-бифенилсульфонильную группу, 1-
 10 нафталинсульфонильную группу, 2-нафталинсульфонильную группу,
 фенилкарбонильную группу, о-бифенилкарбонильную группу, м-
 бифенилкарбонильную группу, п-бифенилкарбонильную группу, 1-
 нафтилкарбонильную группу, 2-нафтилкарбонильную группу, гидроксигруппу,
 нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формамидную группу,
 15 карбамоильную группу, сульфоаминогруппу, сульфамойльную группу, аминогруппу
 и карбоксильную группу.

Каждая из групп-заместителей R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} в формуле (a),
 формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (e), формуле (f), формуле (g),
 формуле (h), формуле (i), формуле (j), формуле (k), формуле (l), формуле (m),
 20 формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s),
 формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (x), формуле (y),
 формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae),
 формуле (af), формуле (ag) и формуле (ah) описаны ниже.

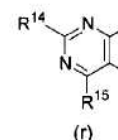
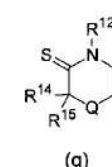
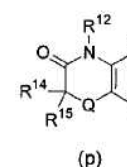
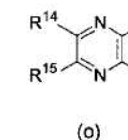
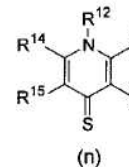
5



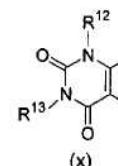
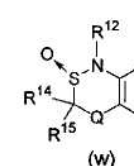
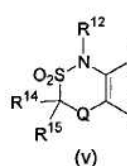
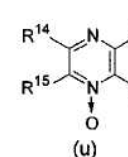
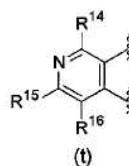
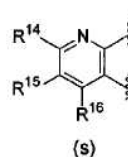
10



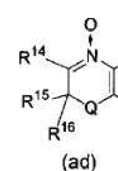
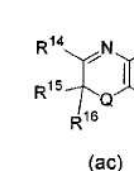
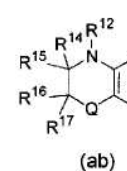
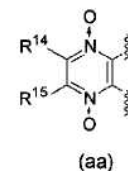
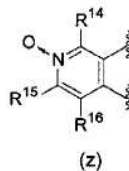
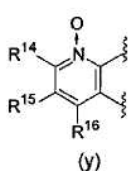
15



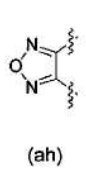
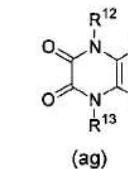
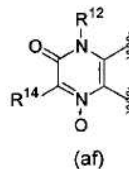
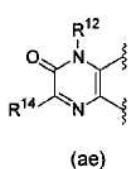
20



25



30



35

где неполная циклическая структура А в формуле (11) или в формуле (12),
представлена формулой (a), формулой (b), формулой (c), формулой (d), формулой (e),
формулой (f), формулой (g), формулой (h), формулой (i), формулой (j), формулой (k),
формулой (l), формулой (m), формулой (n), формулой (o), формулой (p),
формулой (q), формулой (r), формулой (s), формулой (t), формулой (u), формулой (v),
формулой (w), формулой (x), формулой (y), формулой (z), формулой (aa), формулой
(ab), формулой (ac), формулой (ad), формулой (ae), формулой (af), формулой (ag) и
формулой (ah).

45

Ниже впервые приводится описание R^{12} и R^{13} в формуле (a), формуле (b),
формуле (e), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (i), формуле (j),
формуле (k), формуле (l), формуле (m), формуле (n), формуле (p), формуле (q),
формуле (v), формуле (w), формуле (x), формуле (ab), формуле (ae), формуле (af) и
формуле (ag).

50

Каждый из R^{12} и R^{13} в формуле (a), формуле (b), формуле (e), формуле (f),
формуле (g), формуле (h), формуле (i), формуле (j), формуле (k), формуле (l),
формуле (m), формуле (n), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w),

формуле (x), формуле (ab), формуле (ae), формуле (af) и формуле (ag) независимо представляет собой атом водорода, C₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена),
 5 аминогруппой, гидроксигруппой, C₆₋₁₄арильной группой или C₂₋₉гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена qR¹⁸ (R¹⁸ имеет такие же значения, как и R¹¹; q равно целому числу 1-3, а все R¹⁸ могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)),
 10 C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, ди-C₁₋₆алкиламинокарбонильной группой, C₁₋₆алкилкарбонилоксигруппой, C₁₋₆алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C₁₋₆алкилкарбониламиногруппой,
 15 C₃₋₈циклоалкилкарбонильной группой, C₁₋₆алкоксикарбонильной группой, C₁₋₆алкилсульфонильной группой (циклоалкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа и алкилсульфонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), карбоксильную группу,
 20 C₆₋₁₄арилкарбонильную группу (арилкарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена) или необязательно замещена C₂₋₉гетероарилкарбонильной группой), C₆₋₁₄арильную группу, C₂₋₉гетероарильную группу (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена qR¹⁸ (R¹⁸ имеет такие же значения, как и R¹¹; q равно целому числу 1-3, а
 25 все R¹⁸ могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)), C₁₋₆алкиламинокарбонильную группу, ди-C₁₋₆алкиламинокарбонильную группу, C₁₋₆алкилкарбонильную группу, C₃₋₈циклоалкилкарбонильную группу, C₁₋₆алкоксикарбонильную группу, C₁₋₆алкилсульфонильную группу,
 30 C₆₋₁₄арилсульфонильную группу, C₂₋₉гетероарилсульфонильную группу (арилсульфонильная и гетероарилсульфонильная группы может быть необязательно замещены qR¹⁸ (R¹⁸ имеет такие же значения, как и R¹¹; q равно целому числу 1-3, а все R¹⁸ могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)),
 35 карбоксильную группу, C₆₋₁₄арилкарбонильную группу или C₂₋₉гетероарилкарбонильную группу (арилкарбонильная и гетероарилкарбонильная группы могут быть необязательно замещены qR¹⁸ (R¹⁸ имеет такие же значения, как и R¹¹; q равно целому числу 1-3, а все R¹⁸ могут быть одинаковыми или различными, если q равно 2 или 3)).
 40

Ниже конкретно описана каждая из групп-заместителей для R¹² и R¹³ в формуле (a), формуле (b), формуле (e), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (i), формуле (j), формуле (k), формуле (l), формуле (m), формуле (n), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (x), формуле (ab), формуле (ae),
 45 формуле (af) и формуле (ag).

Примерами C₁₋₆алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-
 50 бутильная группа, н-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, н-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа,

3,3-диметил-н-бутильная группа, метилкарбонилоксиметильная группа, этилкарбонилоксиметильная группа, метилкарбонилоксиэтильная группа, этилкарбонилоксиэтильная группа, метилкарбониламинометильная группа, трифторметилкарбониламинометильная группа, этилкарбониламинометильная группа, метилкарбониламиноэтильная группа, этилкарбониламиноэтильная группа, метоксикарбонилметильная группа, этоксикарбонилметильная группа, метоксикарбонилэтильная группа и этоксикарбонилэтильная группа; а примерами C_{6-14} арильной группы являются фенильная группа, о-бифенилильная группа, м-бифенилильная группа, п-бифенилильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 1-антрильная группа, 2-антрильная группа, 9-антрильная группа, 1-фенантрильная группа, 2-фенантрильная группа, 3-фенантрильная группа, 4-фенантрильная группа и 9-фенантрильная группа.

Примерами C_{2-9} гетероарильной группы являются C_{2-6} моноциклическая гетероциклическая группа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая гетероциклическая группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

Примерами C_{2-6} моноциклической гетероциклической группы, имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенильная группа, 3-тиенильная группа, 2-фурильная группа, 3-фурильная группа, 2-пиранильная группа, 3-пиранильная группа, 4-пиранильная группа, 1-пирролильная группа, 2-пирролильная группа, 3-пирролильная группа, 1-имидазолильная группа, 2-имидазолильная группа, 4-имидазолильная группа, 1-пиразолильная группа, 3-пиразолильная группа, 4-пиразолильная группа, 2-тиазолильная группа, 4-тиазолильная группа, 5-тиазолильная группа, 3-изотиазолильная группа, 4-изотиазолильная группа, 5-изотиазолильная группа, 2-оксазолильная группа, 4-оксазолильная группа, 5-оксазолильная группа, 3-изоксазолильная группа, 4-изоксазолильная группа, 5-изоксазолильная группа, 2-пиридиная группа, 3-пиридиная группа, 4-пиридиная группа, 2-пирадинильная группа, 2-пиримидинильная группа, 4-пиримидинильная группа, 5-пиримидинильная группа, 3-пиридазинильная группа, 4-пиридазинильная группа, 2-1,3,4-оксадиазолильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолильная группа, 3-1,2,4-оксадиазолильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолильная группа, 3-1,2,4-тиадиазолильная группа, 5-1,2,4-тиадиазолильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолильная группа и 3-1,2,5-тиадиазолильная группа; а примерами C_{5-9} -конденсированной бициклической гетероциклической группы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-бензофуранильная группа, 3-бензофуранильная группа, 4-бензофуранильная группа, 5-бензофуранильная группа, 6-бензофуранильная группа, 7-бензофуранильная группа, 1-изобензофуранильная группа, 4-изобензофуранильная группа, 5-изобензофуранильная группа, 2-бензотиенильная группа, 3-бензотиенильная группа, 4-бензотиенильная группа, 5-бензотенильная группа, 6-бензотиенильная группа, 7-бензотиенильная группа, 1-изобензотиенильная группа, 4-изобензотиенильная группа, 5-изобензотиенильная группа, 2-хроменильная группа, 3-хроменильная группа, 4-хроменильная группа, 5-хроменильная группа, 6-хроменильная группа, 7-хроменильная группа, 8-хроменильная группа, 1-индолидинильная группа, 2-индолидинильная группа, 3-индолидинильная группа, 5-индолидинильная группа, 6-индолидинильная группа, 7-индолидинильная группа, 8-индолидинильная группа, 1-изоиндолильная группа, 2-изоиндолильная группа, 4-изоиндолильная группа, 5-изоиндолильная группа, 1-

индолильная группа, 2-индолильная группа, 3-индолильная группа, 4-индолильная
группа, 5-индолильная группа, 6-индолильная группа, 7-индолильная группа, 1-
индазолильная группа, 2-индазолильная группа, 3-индазолильная группа, 4-
индазолильная группа, 5-индазолильная группа, 6-индазолильная группа, 7-
индазолильная группа, 1-пурининая группа, 2-пурининая группа, 3-пурининая
группа, 6-пурининая группа, 7-пурининая группа, 8-пурининая группа, 2-
хинолильная группа, 3-хинолильная группа, 4-хинолильная группа, 5-хинолильная
группа, 6-хинолильная группа, 7-хинолильная группа, 8-хинолильная группа, 1-
изохинолильная группа, 3-изохинолильная группа, 4-изохинолильная группа, 5-
изохинолильная группа, 6-изохинолильная группа, 7-изохинолильная группа, 8-
изохинолильная группа, 1-фталадиниальная группа, 5-фталадиниальная группа, 6-
фталадиниальная группа, 1-2,7-нафтиридиновая группа, 3-2,7-нафтиридиновая
группа, 4-2,7-нафтиридиновая группа, 1-2,6-нафтиридиновая группа, 3-2,6-
нафтиридиновая группа, 4-2,6-нафтиридиновая группа, 2-1,8-нафтиридиновая
группа, 3-1,8-нафтиридиновая группа, 4-1,8-нафтиридиновая группа, 2-1,7-
нафтиридиновая группа, 3-1,7-нафтиридиновая группа, 4-1,7-нафтиридиновая
группа, 5-1,7-нафтиридиновая группа, 6-1,7-нафтиридиновая группа, 8-1,7-
нафтиридиновая группа, 2-1,6-нафтиридиновая группа, 3-1,6-нафтиридиновая
группа, 4-1,6-нафтиридиновая группа, 5-1,6-нафтиридиновая группа, 7-1,6-
нафтиридиновая группа, 8-1,6-нафтиридиновая группа, 2-1,5-нафтиридиновая
группа, 3-1,5-нафтиридиновая группа, 4-1,5-нафтиридиновая группа, 6-1,5-
нафтиридиновая группа, 7-1,5-нафтиридиновая группа, 8-1,5-нафтиридиновая
группа, 2-хиноксапиниальная группа, 5-хиноксапиниальная группа, 6-
хиноксапиниальная группа, 2-хиназолинническая группа, 4-хиназолинническая группа, 5-
хиназолинническая группа, 6-хиназолинническая группа, 7-хиназолинническая группа, 8-
хиназолинническая группа, 3-циннолининиальная группа, 4-циннолининиальная группа, 5-
циннолининиальная группа, 6-циннолининиальная группа, 7-циннолининиальная группа, 8-
циннолининиальная группа, 2-птеридиниальная группа, 4-птеридиниальная группа, 6-
птеридиниальная группа и 7-птеридиниальная группа.

Примерами C_{1-6} алкиламинокарбонильной группы являются метиламинокарбонильная группа, этиламинокарбонильная группа, н-пропиламинокарбонильная группа, изопропиламинокарбонильная группа, н-бутиламинокарбонильная группа, изобутиламинокарбонильная группа, втор-бутиламинокарбонильная группа, трет-бутиламинокарбонильная группа, 1-пентиламинокарбонильная группа, 2-пентиламинокарбонильная группа, 3-пентиламинокарбонильная группа, изопентиламинокарбонильная группа, неопентиламинокарбонильная группа, трет-пентиламинокарбонильная группа, 1-гексиламинокарбонильная группа, 2-гексиламинокарбонильная группа и 3-гексиламинокарбонильная групп;

45 примерами ди-С₁₋₆алкиламинокарбонильной группы являются
диметиламинокарбонильная группа, диэтиламинокарбонильная группа, ди-н-
пропиламинокарбонильная группа, диизопропиламинокарбонильная группа,
дициклопропиламинокарбонильная группа, ди-н-бутиламинокарбонильная группа,
диизобутиламинокарбонильная группа, ди-втор-бутиаминокарбонильная группа, ди-
50 трет-бутиламинокарбонильная группа, дициклобутиламинокарбонильная группа,
ди-1-пентиламинокарбонильная группа, ди-2-пентиламинокарбонильная группа,
ди-3-пентиламинокарбонильная группа, ди-изопентиламинокарбонильная группа,
динеопентиламинокарбонильная группа, ди-трет-пентиламинокарбонильная группа,

[illegible]

примерами C_{1-6} алкилкарбонильной группы являются метилкарбонильная группа, этилкарбонильная группа, н-пропилкарбонильная группа, изопропилкарбонильная группа, н-бутилкарбонильная группа, изобутилкарбонильная группа, втор-бутилкарбонильная группа, трет-бутилкарбонильная группа, 1-пентилкарбонильная группа, 2-пентилкарбонильная группа, 3-пентилкарбонильная группа, изопентилкарбонильная группа, неопентилкарбонильная группа, трет-пентилкарбонильная группа, 1-гексилкарбонильная группа, 2-гексилкарбонильная группа и 3-гексилкарбонильная группа;

примерами C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группы являются циклопропилкарбонильная группа, циклобутилкарбонильная группа, 1-метилциклопропилкарбонильная группа, 2-метилциклопропилкарбонильная группа,

циклопентилкарбонильная группа, 1-метилциклобутилкарбонильная группа, 2-метилциклобутилкарбонильная группа, 3-метилциклобутилкарбонильная группа, 1,2-диметилциклопропилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этилциклопропилкарбонильная группа, 2-этилциклопропилкарбонильная группа, циклогексилкарбонильная группа, циклогептилкарбонильная группа, циклооктилкарбонильная группа, 1-метил-циклогексилкарбонильная группа, 2-метилциклогексилкарбонильная группа, 3-метилциклогексилкарбонильная группа, 1,2-диметилциклогексилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этилциклопропилкарбонильная группа, 1-метилциклопентилкарбонильная группа, 2-метилциклопентилкарбонильная группа, 3-метилциклопентилкарбонильная группа, 1-этилциклобутилкарбонильная группа, 2-этилциклобутилкарбонильная группа, 3-этилциклобутилкарбонильная группа, 1,2-диметилциклобутилкарбонильная группа, 1,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,2-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,4-диметилциклобутилкарбонильная группа, 3,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 1-н-пропилциклопропилкарбонильная группа, 2-н-пропилциклопропилкарбонильная группа, 1-изопропилциклопропилкарбонильная группа, 2-изопропилциклопропилкарбонильная группа, 1,2,2-триметилциклопропилкарбонильная группа, 1,2,3-триметилциклопропилкарбонильная группа, 2,2,3-триметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этил-2-метилциклопропилкарбонильная группа, 2-этил-1-метилциклопропилкарбонильная группа, 2-этил-2-метилциклопропилкарбонильная группа и 2-этил-3-метилциклопропилкарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкоксикарбонильной группы являются метоксикарбонильная группа, этоксикарбонильная группа, н-пропоксикарбонильная группа, изопропоксикарбонильная группа, н-бутоксикарбонильная группа, изобутоксикарбонильная группа, втор-бутоксикарбонильная группа, трет-бутоксикарбонильная группа, 1-пентилоксикарбонильная группа, 2-пентилоксикарбонильная группа, 3-пентилоксикарбонильная группа, изопентилоксикарбонильная группа, неопентилоксикарбонильная группа, трет-пентилоксикарбонильная группа, 1-гексилоксикарбонильная группа, 2-гексилоксикарбонильная группа и 3-гексилоксикарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкилсульфонильной группы являются метансульфонильная группа, трифторметансульфонильная группа и этансульфонильная группа; а

примерами C_{6-14} арилсульфонильной группы являются бензолсульфонильная группа, о-бифенилсульфонильная группа, м-бифенилсульфонильная группа, п-бифенилсульфонильная группа, 1-нафталинсульфонильная группа, 2-нафталинсульфонильная группа, 1-антраценсульфонильная группа, 2-антраценсульфонильная группа, 9-антраценсульфонильная группа, 1-фенантренсульфонильная группа, 2-фенантренсульфонильная группа, 3-фенантренсульфонильная группа, 4-фенантренсульфонильная группа и 9-фенантренсульфонильная группа.

Примерами C_{2-9} гетероарилсульфонильной группы являются C_{2-6} -моноциклическая гетероциклическая сульфонильная группа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая

гетероциклическая сульфонильная группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

Примерами C_{2-6} моноциклической гетероциклической сульфонильной группы,

имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенилсульфонильная группа, 3-тиенилсульфонильная группа, 2-фурилсульфонильная группа, 3-фурилсульфонильная группа, 2-пиранилсульфонильная группа, 3-пиранилсульфонильная группа, 4-пиранилсульфонильная группа, 1-пирролилсульфонильная группа, 2-пирролилсульфонильная группа, 3-пирролилсульфонильная группа, 1-имидазолилсульфонильная группа, 2-имидазолилсульфонильная группа, 4-имидазолилсульфонильная группа, 1-пиразолилсульфонильная группа, 3-пиразолилсульфонильная группа, 4-пиразолилсульфонильная группа, 2-тиазолилсульфонильная группа, 4-тиазолилсульфонильная группа, 5-тиазолилсульфонильная группа, 3-изотиазолилсульфонильная группа, 4-изотиазолилсульфонильная группа, 5-изотиазолилсульфонильная группа, 2-оксазолилсульфонильная группа, 4-оксазолилсульфонильная группа, 5-оксазолилсульфонильная группа, 3-изоксазолилсульфонильная группа, 4-изоксазолилсульфонильная группа, 5-изоксазолилсульфонильная группа, 2-пиридилсульфонильная группа, 3-пиридилсульфонильная группа, 4-пиридилсульфонильная группа, 2-пирадинилсульфонильная группа, 2-пиримидинилсульфонильная группа, 4-пиримидинилсульфонильная группа, 5-пиримидинилсульфонильная группа, 3-пиридазинилсульфонильная группа, 4-пиридазинилсульфонильная группа, 2-1,3,4-оксадиазолилсульфонильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолилсульфонильная группа, 3-1,2,4-оксадиазолилсульфонильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолилсульфонильная группа, 3-1,2,4-тиадиазолилсульфонильная группа, 5-1,2,4-тиадиазолилсульфонильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолилсульфонильная группа и 3-1,2,5-тиадиазолилсульфонильная группа.

Примерами C₅-9-конденсированной бициклической гетероциклической сульфонильной группы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-бензофуранилсульфонильная группа, 3-бензофуранилсульфонильная группа, 4-бензофуранилсульфонильная группа, 5-бензофуранилсульфонильная группа, 6-бензофуранилсульфонильная группа, 7-бензофуранилсульфонильная группа, 1-изобензофуранилсульфонильная группа, 4-изобензофуранилсульфонильная группа, 5-изобензофуранилсульфонильная группа, 2-бензотиенилсульфонильная группа, 3-бензотиенилсульфонильная группа, 4-бензотиенилсульфонильная группа, 5-бензотиенилсульфонильная группа, 6-бензотиенилсульфонильная группа, 7-бензотиенилсульфонильная группа, 1-изобензотиенилсульфонильная группа, 4-изобензотиенилсульфонильная группа, 5-изобензотиенилсульфонильная группа, 2-хроменилсульфонильная группа, 3-хроменилсульфонильная группа, 4-хроменилсульфонильная группа, 5-хроменилсульфонильная группа, 6-хроменилсульфонильная группа, 7-хроменилсульфонильная группа, 8-хроменилсульфонильная группа, 1-индолидинилсульфонильная группа, 2-индолидинилсульфонильная группа, 3-индолидинилсульфонильная группа, 5-индолидинилсульфонильная группа, 6-индолидинилсульфонильная группа, 7-индолидинилсульфонильная группа, 8-индолидинилсульфонильная группа, 1-изоиндолилсульфонильная группа, 2-изоиндолилсульфонильная группа, 4-изоиндолилсульфонильная группа, 5-изоиндолилсульфонильная группа, 1-индолилсульфонильная группа, 2-индолилсульфонильная группа, 3-индолилсульфонильная группа, 4-индолилсульфонильная группа, 5-

[illegible]

Примерами C_{6-14} арилкарбонильной группы являются фенилкарбонильная группа, о-бифенилкарбонильная группа, м-бифенилкарбонильная группа, п-фенилкарбонильная группа, 1-нафтилкарбонильная группа, 2-нафтилкарбонильная группа, 1-антрилкарбонильная группа, 2-антрилкарбонильная группа, 9-антрилкарбонильная группа, 1-фенантрилкарбонильная группа, 2-фенантрилкарбонильная группа, 3-фенантрилкарбонильная группа, 4-фенантрилкарбонильная группа и 9-фенантрилкарбонильная группа.

Примерами C_{2-9} -гетероарилкарбонильной группы являются C_{2-6} -моноциклическая гетероциклическая карбонильная группа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая гетероциклическая

карбонильная группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

Примерами C_{2-6} -моноциклической гетероциклической карбонильной группы, имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенилкарбонильная группа, 3-тиенилкарбонильная группа, 2-фурилкарбонильная группа, 3-фурилкарбонильная группа, 2-пиранилкарбонильная группа, 3-пиранилкарбонильная группа, 4-пиранилкарбонильная группа, 1-пирролилкарбонильная группа, 2-пирролилкарбонильная группа, 3-пирролилкарбонильная группа, 1-имидазолилкарбонильная группа, 2-имидазолилкарбонильная группа, 4-имидазолилкарбонильная группа, 1-пиразолилкарбонильная группа, 3-пиразолилкарбонильная группа, 4-пиразолилкарбонильная группа, 2-тиазолилкарбонильная группа, 4-тиазолилкарбонильная группа, 5-тиазолилкарбонильная группа, 3-изотиазолилкарбонильная группа, 4-изотиазолилкарбонильная группа, 5-изотиазолилкарбонильная группа, 2-оксазолилкарбонильная группа, 4-оксазолилкарбонильная группа, 5-оксазолилкарбонильная группа, 3-изоксазолилкарбонильная группа, 4-изоксазолилкарбонильная группа, 5-изоксазолилкарбонильная группа, 2-пиридилкарбонильная группа, 3-пиридилкарбонильная группа, 4-пиридилкарбонильная группа, 2-пирадинилкарбонильная группа, 2-пиримидинилкарбонильная группа, 4-пиримидинилкарбонильная группа, 5-пиримидинилкарбонильная группа, 3-пиридазинилкарбонильная группа, 4-пиридазинилкарбонильная группа, 2-1,3,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 5-1,2,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолилкарбонильная группа и 3-1,2,5-тиадиазолилкарбонильная группа.

Примерами C_{5-9} -конденсированной бициклической гетероциклической карбонильной группы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-бензофуранилкарбонильная группа, 3-бензофуранилкарбонильная группа, 4-бензофуранилкарбонильная группа, 5-бензофуранилкарбонильная группа, 6-бензофуранилкарбонильная группа, 7-бензофуранилкарбонильная группа, 1-изобензофуранилкарбонильная группа, 4-изобензофуранилкарбонильная группа, 5-изобензофуранилкарбонильная группа, 2-бензотиенилкарбонильная группа, 3-бензотиенилкарбонильная группа, 4-бензотиенилкарбонильная группа, 5-бензотиенилкарбонильная группа, 6-бензотиенилкарбонильная группа, 7-бензотиенилкарбонильная группа, 1-изобензотиенилкарбонильная группа, 4-изобензотиенилкарбонильная группа, 5-изобензотиенилкарбонильная группа, 2-хроменилкарбонильная группа, 3-хроменилкарбонильная группа, 4-хроменилкарбонильная группа, 5-хроменилкарбонильная группа, 6-хроменилкарбонильная группа, 7-хроменилкарбонильная группа, 8-хроменилкарбонильная группа, 1-индолидинилкарбонильная группа, 2-индолидинилкарбонильная группа, 3-индолидинилкарбонильная группа, 5-индолидинилкарбонильная группа, 6-индолидинилкарбонильная группа, 7-индолидинилкарбонильная группа, 8-индолидинилкарбонильная группа, 1-изоиндолилкарбонильная группа, 2-изоиндолилкарбонильная группа, 4-

[illegible]

50 R¹² и R¹³ в формуле (a), формуле (b), формуле (e), формуле (f), формуле (g),
формуле (h), формуле (i), формуле (j), формуле (k), формуле (l), формуле (m),
формуле (n), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (x),
формуле (ab), формуле (ae), формуле (af) и формуле (ag), предпочтительно,
представляют собой атом водорода, метильную группу, этильную группу, н-

пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, метилкарбонил оксиметильную группу, этилкарбонил оксиметильную группу, метилкарбонил оксиэтильную группу, этилкарбонил оксиэтильную группу, метилкарбониламинометильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метилкарбониламиноэтильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метилкарбониламиноэтильную группу, метоксикарбонилметильную группу, этоксикарбонилметильную группу, метоксикарбонилэтильную группу, этоксикарбонилэтильную группу, фенильную группу, о-бифенильную группу, м-бифенильную группу, п-бифенильную группу, 1-нафтильную группу, 2-нафтильную группу, 2-пиридилную группу, 3-пиридилную группу, 4-пиридилную группу, метиламинокарбонильную группу, этиламинокарбонильную группу, н-пропиламинокарбонильную группу, изопропиламинокарбонильную группу, н-бутиламинокарбонильную группу, диметиламинокарбонильную группу, диэтиламинокарбонильную группу, ди-н-пропиламинокарбонильную группу, диизопропиламинокарбонильную группу, дициклопропиламинокарбонильную группу, ди-н-бутиламинокарбонильную группу, метилкарбонильную группу, этилкарбонильную группу, н-пропилкарбонильную группу, изопропилкарбонильную группу, н-бутилкарбонильную группу, циклопентилкарбонильную группу, циклогексилкарбонильную группу, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу, изобутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, трет-бутоксикарбонильную группу, метансульфонильную группу, трифторметансульфонильную группу, бензолсульфонильную группу, о-бифенилсульфонильную группу, м-бифенилсульфонильную группу, п-бифенилсульфонильную группу, 1-нафталинсульфонильную группу, 2-нафталинсульфонильную группу, 2-пиридилсульфонильную группу, 3-пиридилсульфонильную группу, 4-пиридилсульфонильную группу, фенилкарбонильную группу, о-бифенилкарбонильную группу, м-бифенилкарбонильную группу, п-бифенилкарбонильную группу, 1-нафтилкарбонильную группу, 2-нафтилкарбонильную группу, 2-пиридилкарбонильную группу, 3-пиридилкарбонильную группу и 4-пиридилкарбонильную группу, а более предпочтительно, атом водорода и метильную группу.

R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} в формуле (a), формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (j), формуле (k), формуле (m), формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s), формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (y), формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae) и в формуле (af) описаны ниже. Каждый из R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} в формуле (a), формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (j), формуле (k), формуле (m), формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s), формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (y), формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae) и в формуле (af) независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно

замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C_{6-14} арильной группой, C_{2-9} гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди-
 5 C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонилксигруппу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу (алкилкарбонилксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{3-8} циклоалкилкарбонильную группу,
 10 C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, C_{1-6} алкилсульфонильную группу (циклоалкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа и алкилсульфонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), карбоксильную группу, C_{6-14} арилкарбонильную группу (арилкарбонильная группа
 15 может быть необязательно замещена атомом галогена) или C_{2-9} гетероарилкарбонильную группу), C_{3-8} циклоалкильную группу (циклоалкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена),
 20 аминогруппой или гидроксигруппой), C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, или C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)), карбоксильной группой, аминогруппой, гидроксигруппой, C_{6-14} арильной группой
 25 или C_{2-9} гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), C_{1-6} тиоалкоксигруппу (тиоалкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена),
 30 карбоксильной группой, гидроксигруппой, C_{6-14} арильной группой или C_{2-9} гетероарильной группой (каждая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q))), гидроксигруппу, C_{6-14} арильную группу или
 35 C_{2-9} гетероарильную группу (любая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), C_{1-6} алкилкарбонилксигруппу, нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формамидную группу, аминогруппу, сульфогруппу, C_{1-6} алкиламиногруппу, ди- C_{1-6} алкиламиногруппу, C_{6-14} ариламиногруппу,
 40 C_{2-9} гетероариламиногруппу (каждая из ариламино- и гетероариламиногрупп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{1-6} алкилсульфонамидную группу, карбамоильную группу,
 45 C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу, C_{6-14} арилкарбонильную группу, C_{2-9} гетероарилкарбонильную группу (любая из арилкарбонильной и гетероарилкарбонильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет
 50 такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, сульфоамидную группу, C_{1-6} алкилсульфонильную группу, C_{6-14} арилсульфонильную группу, C_{2-9} гетероарилсульфонильную группу (любая из арилсульфонильной и

гетероарилсульфонильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), карбоксильную группу или C_{2-9} гетероциклическую группу (гетероциклическая группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, карбоксильной группой или гидроксигруппой), C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{6-14} арильной группой, C_{2-9} гетероарильной группой (любая из арильной и гетероарильной групп может быть необязательно замещена rR^{19} (R^{19} имеет такие же значения, как и R^{11} ; r имеет такие же значения, как и q)), гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, формильной группой, формамидной группой, аминогруппой, C_{1-6} алкиламиногруппой, ди- C_{1-6} алкиламиногруппой, C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилсульфонамидной группой, карбамоильной группой, C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилкарбонильной группой, C_{1-6} алкоксикарбонильной группой, сульфамойльной группой, C_{1-6} алкилсульфонильной группой, карбоксильной группой или C_{6-14} арилкарбонильной группой).

Каждый атом и каждая группа-заместитель для R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} в формуле (a), формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (j), формуле (k), формуле (m), формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s), формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (y), формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae) и в формуле (af) конкретно описаны ниже. Примерами атома галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

Примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, н-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, н-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа, 3,3-диметил-н-бутильная группа, метилкарбонилоксиметильная группа, этилкарбонилоксиметильная группа, метилкарбонилоксиэтильная группа, этилкарбонилоксиэтильная группа, метилкарбониламинометильная группа, этилкарбониламинометильная группа, метилкарбониламиноэтильная группа, этилкарбониламиноэтильная группа, метоксикарбонилметильная группа, этоксикарбонилметильная группа, метоксикарбонилэтильная группа и этоксикарбонилэтильная группа;

примерами C_{3-8} циклоалкильной группы являются циклопропил, циклобутил, 1-метил-циклопропил, 2-метил-циклопропил, циклопентил, 1-метил-циклобутил, 2-метил-циклобутил, 3-метил-циклобутил, 1,2-диметилциклопропил, 2,3-диметилциклопропил, 1-этилциклопропил, 2-этилциклопропил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, 1-метилциклогексил, 2-метилциклогексил, 3-метилциклогексил, 1,2-диметилциклогексил, 2,3-диметилциклопропил, 1-этилциклопропил, 1-метилциклопентил, 2-метилциклопентил, 3-метил-циклопентил, 1-этилциклобутил, 2-этилциклобутил, 3-этилциклобутил, 1,2-диметилциклобутил, 1,3-

диметилциклобутил, 2,2-диметилциклобутил, 2,3-диметилциклобутил, 2,4-диметилциклобутил, 3,3-диметилциклобутил, 1-н-пропилциклопропил, 2-н-пропилциклопропил, 1-изопропилциклопропил, 2-изопропилциклопропил, 1,2,2-триметилциклопропил, 1,2,3-триметилциклопропил, 2,2,3-триметилциклопропил, 1-этил-2-метилциклопропил, 2-этил-1-метилциклопропил, 2-этил-2-метилциклопропил и 2-этил-3-метилциклопропил;

примерами C_{1-6} алкоксигруппы являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа, 1-пентилоксигруппа, 2-пентилоксигруппа, 3-пентилоксигруппа, изопентилоксигруппа, неопентилоксигруппа, 2,2-диметилпропоксигруппа, 1-гексилоксигруппа, 2-гексилоксигруппа, 3-гексилоксигруппа, 1-метил-н-пентилоксигруппа, 1,1,2-триметил-н-пропоксигруппа, 1,2,2-триметил-н-пропоксигруппа и 3,3-диметил-н-бутоксигруппа;

примерами C_{1-6} тиоалкоксигруппы являются метилтио, этилтио, н-пропилтио, изопропилтио, циклопропилтио, н-бутилтио, изобутилтио, втор-бутилтио, трет-бутилтио, н-пентилтио, изопентилтио, неопентилтио, трет-пентилтио, н-гексилтио и циклогексилтио; и

примерами C_{6-14} арильной группы являются фенильная группа, о-бифенилильная группа, м-бифенилильная группа, п-бифенилильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 1-антрильная группа, 2-антрильная группа, 9-антрильная группа, 1-фенантрильная группа, 2-фенантрильная группа, 3-фенантрильная группа, 4-фенантрильная группа и 9-фенантрильная группа.

Примерами C_{2-9} гетероарильной группы являются C_{2-6} моноциклическая гетероциклическая группа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая гетероциклическая группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

Примерами C_{2-6} моноциклической гетероциклической группы, имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенильная группа, 3-тиенильная группа, 2-фурильная группа, 3-фурильная группа, 2-пиранильная группа, 3-пиранильная группа, 4-пиранильная группа, 1-пирролильная группа, 2-пирролильная группа, 3-пирролильная группа, 1-имидазолильная группа, 2-имидазолильная группа, 4-имидазолильная группа, 1-пиразолильная группа, 3-пиразолильная группа, 4-пиразолильная группа, 2-тиазолильная группа, 4-тиазолильная группа, 5-тиазолильная группа, 3-изотиазолильная группа, 4-изотиазолильная группа, 5-изотиазолильная группа, 2-оксазолильная группа, 4-оксазолильная группа, 5-оксазолильная группа, 3-изоксазолильная группа, 4-изоксазолильная группа, 5-изоксазолильная группа, 2-пиридиная группа, 3-пиридиная группа, 4-пиридиная группа, 2-пирадинильная группа, 2-пиримидинильная группа, 4-пиримидинильная группа, 5-пиримидинильная группа, 3-пиридазинильная группа, 4-пиридазинильная группа, 2-1,3,4-оксадиазолильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолильная группа, 3-1,2,4-оксадиазолильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолильная группа, 3-1,2,4-тиадиазолильная группа, 5-1,2,4-тиадиазолильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолильная группа и 3-1,2,5-тиадиазолильная группа.

Примерами C_{5-9} -конденсированной бициклической гетероциклической группы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-бензофуранильная группа, 3-бензофуранильная группа, 4-бензофуранильная группа, 5-бензофуранильная группа, 6-бензофуранильная группа, 7-бензофуранильная группа, 1-

изобензофуранильная группа, 4-изобензофуранильная группа, 5-
 изобензофуранильная группа, 2-бензотиенильная группа, 3-бензотиенильная
 группа, 4-бензотиенильная группа, 5-бензотиенильная группа, 6-бензотиенильная
 группа, 7-бензотиенильная группа, 1-изобензотиенильная группа, 4-
 5 изобензотиенильная группа, 5-изобензотиенильная группа, 2-хроменильная группа,
 3-хроменильная группа, 4-хроменильная группа, 5-хроменильная группа, 6-
 хроменильная группа, 7-хроменильная группа, 8-хроменильная группа, 1-
 индолидинильная группа, 2-индолидинильная группа, 3-индолидинильная группа, 5-
 10 индолидинильная группа, 6-индолидинильная группа, 7-индолидинильная группа, 8-
 индолидинильная группа, 1-изоиндолильная группа, 2-изоиндолильная группа, 4-
 изоиндолильная группа, 5-изоиндолильная группа, 1-индолильная группа, 2-
 индолильная группа, 3-индолильная группа, 4-индолильная группа, 5-индолильная
 группа, 6-индолильная группа, 7-индолильная группа, 1-индазолильная группа, 2-
 15 индазолильная группа, 3-индазолильная группа, 4-индазолильная группа, 5-
 индазолильная группа, 6-индазолильная группа, 7-индазолильная группа, 1-
 пуринильная группа, 2-пуринильная группа, 3-пуринильная группа, 6-пуринильная
 группа, 7-пуринильная группа, 8-пуринильная группа, 2-хинолильная группа, 3-
 20 хинолильная группа, 4-хинолильная группа, 5-хинолильная группа, 6-хинолильная
 группа, 7-хинолильная группа, 8-хинолильная группа, 1-изохинолильная группа, 3-
 изохинолильная группа, 4-изохинолильная группа, 5-изохинолильная группа, 6-
 изохинолильная группа, 7-изохинолильная группа, 8-изохинолильная группа, 1-
 фталадинильная группа, 5-фталадинильная группа, 6-фталадинильная группа, 1-2,7-
 25 нафтиридиинильная группа, 3-2,7-нафтиридиинильная группа, 4-2,7-нафтиридиинильная
 группа, 1-2,6-нафтиридиинильная группа, 3-2,6-нафтиридиинильная группа, 4-2,6-
 нафтиридиинильная группа, 2-1,8-нафтиридиинильная группа, 3-1,8-нафтиридиинильная
 группа, 4-1,8-нафтиридиинильная группа, 2-1,7-нафтиридиинильная группа, 3-1,7-
 30 нафтиридиинильная группа, 4-1,7-нафтиридиинильная группа, 5-1,7-нафтиридиинильная
 группа, 6-1,7-нафтиридиинильная группа, 8-1,7-нафтиридиинильная группа, 2-1,6-
 нафтиридиинильная группа, 3-1,6-нафтиридиинильная группа, 4-1,6-нафтиридиинильная
 группа, 5-1,6-нафтиридиинильная группа, 7-1,6-нафтиридиинильная группа, 8-1,6-
 нафтиридиинильная группа, 2-1,5-нафтиридиинильная группа, 3-1,5-нафтиридиинильная
 35 группа, 4-1,5-нафтиридиинильная группа, 6-1,5-нафтиридиинильная группа, 7-1,5-
 нафтиридиинильная группа, 8-1,5-нафтиридиинильная группа, 2-хиноксалинильная
 группа, 5-хиноксалинильная группа, 6-хиноксалинильная группа, 2-хиназолинильная
 группа, 4-хиназолинильная группа, 5-хиназолинильная группа, 6-хиназолинильная
 40 группа, 7-хиназолинильная группа, 8-хиназолинильная группа, 3-циннолинильная
 группа, 4-циннолинильная группа, 5-циннолинильная группа, 6-циннолинильная
 группа, 7-циннолинильная группа, 8-циннолинильная группа, 2-птеридинильная
 группа, 4-птеридинильная группа, 6-птеридинильная группа и 7-птеридинильная
 группа.

45 Примерами C_{1-6} алкилкарбонилокси группы являются метилкарбонилокси группа,
 этилкарбонилокси группа, н-пропилкарбонилокси группа,
 изопропилкарбонилокси группа, н-бутилкарбонилокси группа,
 изобутилкарбонилокси группа, втор-бутилкарбонилокси группа, трет-
 50 бутилкарбонилокси группа, 1-пентилкарбонилокси группа, 2-
 пентилкарбонилокси группа, 3-пентилкарбонилокси группа,
 изопентилкарбонилокси группа, неопентилкарбонилокси группа, трет-
 пентилкарбонилокси группа, 1-гексилкарбонилокси группа, 2-

гексилкарбонилокси́группа, 3-гексилкарбонилокси́группа, 1-метил-н-пентилкарбонилокси́группа, 1,1,2-триметил-н-пропилкарбонилокси́группа, 1,2,2-триметил-н-пропилкарбонилокси́группа и 3,3-диметил-н-бутилкарбонилокси́группа;

5 примерами C₁₋₆алкиламиногруппы являются метиламиногруппа, этиламиногруппа, н-пропиламиногруппа, изопропиламиногруппа, циклопропиламиногруппа, н-бутиламиногруппа, изобутиламиногруппа, втор-бутиламиногруппа, трет-бутиламиногруппа, циклобутиламиногруппа, 1-пентиламиногруппа, 2-пентиламиногруппа, 3-пентиламиногруппа, 10 изопентиламиногруппа, неопентиламиногруппа, трет-пентиламиногруппа, циклопентиламиногруппа, 1-гексиламиногруппа, 2-гексиламиногруппа, 3-гексиламиногруппа, циклогексиламиногруппа, 1-метил-н-пентиламиногруппа, 1,1,2-триметил-н-пропиламиногруппа, 1,2,2-триметил-н-пропиламиногруппа и 3,3-диметил-н-бутиламиногруппа;

15 примерами ди-C₁₋₆алкиламиногруппы являются диметиламиногруппа, диэтиламиногруппа, ди-н-пропиламиногруппа, ди-изопропиламиногруппа, дициклопропиламиногруппа, ди-н-бутиламиногруппа, диизобутиламиногруппа, ди-втор-бутиламиногруппа, ди-трет-бутиламиногруппа, дициклобутиламиногруппа, 20 ди-1-пентиламиногруппа, ди-2-пентиламиногруппа, ди-3-пентиламиногруппа, диизопентиламиногруппа, динеопентиламиногруппа, ди-трет-пентиламиногруппа, ди-циклопентиламиногруппа, ди-1-гексиламиногруппа, ди-2-гексиламиногруппа, ди-3-гексиламиногруппа, дициклогексиламиногруппа, ди-(1-метил-н-пентил)аминогруппа, ди-(1,1,2-триметил-н-пропил)аминогруппа, ди-(1,2,2-триметил-н-пропил)аминогруппа, ди-(3,3-диметил-н-бутил)аминогруппа, метил(этил)аминогруппа, метил(н-пропил)аминогруппа, метил(изопропил)аминогруппа, метил(циклопропил)аминогруппа, метил(н-бутил)аминогруппа, метил(изобутил)аминогруппа, метил(втор-бутил)аминогруппа, 30 метил(трет-бутил)аминогруппа, метил(циклобутил)аминогруппа, этил(н-пропил)аминогруппа, этил(изопропил)аминогруппа, этил(циклопропил)аминогруппа, этил(н-бутил)аминогруппа, этил(изобутил)аминогруппа, этил(втор-бутил)аминогруппа, этил(трет-бутил)аминогруппа, этил(циклобутил)аминогруппа, н-пропил(изопропил)аминогруппа, н-пропил(циклопропил)аминогруппа, н-пропил(н-бутил)аминогруппа, н-пропил(изобутил)аминогруппа, н-пропил(втор-бутил)аминогруппа, н-пропил(трет-бутил)аминогруппа, н-пропил(циклобутил)аминогруппа, изопропил(циклопропил)аминогруппа, 40 изопропил(н-бутил)аминогруппа, изопропил(изобутил)аминогруппа, изопропил(втор-бутил)аминогруппа, изопропил(трет-бутил)аминогруппа, изопропил(циклобутил)аминогруппа, циклопропил(н-бутил)аминогруппа, циклопропил(изобутил)аминогруппа, циклопропил(втор-бутил)аминогруппа, циклопропил(трет-бутил)аминогруппа, циклопропил(циклобутил)аминогруппа, н-бутил(изобутил)аминогруппа, н-бутил(втор-бутил)аминогруппа, н-бутил(трет-бутил)аминогруппа, н-бутил(циклобутил)аминогруппа, изобутил(втор-бутил)аминогруппа, изобутил(трет-бутил)аминогруппа, изобутил(циклобутил)аминогруппа, втор-бутил(трет-бутил)аминогруппа, втор-бутил(циклобутил)аминогруппа и трет-бутил(циклобутил)аминогруппа;

50 примерами C₆₋₁₄ариламиногруппы являются фениламиногруппа, о-бифенилиламиногруппа, м-бифенилиламиногруппа, п-бифенилиламиногруппа, 1-нафтиламиногруппа, 2-нафтиламиногруппа, 1-антриламиногруппа, 2-

антриламиногруппа, 9-антриламиногруппа, 1-фенантриламиногруппа, 2-фенантриламиногруппа, 3-фенантриламиногруппа, 4-фенантриламиногруппа и 9-фенантриламиногруппа; а

5 примерами C_{2-9} -гетероариламиногруппы являются C_{2-6} -моноциклическая гетероциклическая аминогруппа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая гетероциклическая аминогруппа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

10 Примерами C_{2-6} -моноциклической гетероциклической аминогруппы, имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиениламиногруппа, 3-тиениламиногруппа, 2-фуриламиногруппа, 3-фуриламиногруппа, 2-пираниламиногруппа, 3-пираниламиногруппа, 4-пираниламиногруппа, 1-пирролиламиногруппа, 2-пирролиламиногруппа, 3-пирролиламиногруппа, 1-имидазолиламиногруппа, 2-имидазолиламиногруппа, 4-имидазолиламиногруппа, 1-пиразолиламиногруппа, 3-пиразолиламиногруппа, 4-пиразолиламиногруппа, 2-тиазолиламиногруппа, 4-тиазолиламиногруппа, 5-тиазолиламиногруппа, 3-изотиазолиламиногруппа, 4-изотиазолиламиногруппа, 5-изотиазолиламиногруппа, 2-оксазолиламиногруппа, 4-оксазолиламиногруппа, 5-оксазолиламиногруппа, 3-изоксазолиламиногруппа, 4-изоксазолиламиногруппа, 5-изоксазолиламиногруппа, 2-пиридиламиногруппа, 3-пиридиламиногруппа, 4-пиридиламиногруппа, 2-пирадиниламиногруппа, 2-пиримидиниламиногруппа, 4-пиримидиниламиногруппа, 5-пиримидиниламиногруппа, 3-пиридазиниламиногруппа, 4-пиридазиниламиногруппа, 2-1,3,4-оксадиазолиламиногруппа, 2-1,3,4-тиадиазолиламиногруппа, 3-1,2,4-оксадиазолиламиногруппа, 5-1,2,4-оксадиазолиламиногруппа, 3-1,2,4-тиадиазолиламиногруппа, 5-1,2,4-тиадиазолиламиногруппа, 3-1,2,5-оксадиазолиламиногруппа и 3-1,2,5-тиадиазолиламиногруппа.

30 Примерами C_{5-9} -конденсированной бициклической гетероциклической аминогруппы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-бензофуриламиногруппа, 3-бензофуриламиногруппа, 4-бензофуриламиногруппа, 5-бензофуриламиногруппа, 6-бензофуриламиногруппа, 7-бензофуриламиногруппа, 1-изобензофуриламиногруппа, 4-изобензофуриламиногруппа, 5-изобензофуриламиногруппа, 2-бензотиениламиногруппа, 3-бензотиениламиногруппа, 4-бензотиениламиногруппа, 5-бензотиениламиногруппа, 6-бензотиениламиногруппа, 7-бензотиениламиногруппа, 1-изобензотиениламиногруппа, 4-изобензотиениламиногруппа, 5-изобензотиениламиногруппа, 2-хромениламиногруппа, 3-хромениламиногруппа, 4-хромениламиногруппа, 5-хромениламиногруппа, 6-хромениламиногруппа, 7-хромениламиногруппа, 8-хромениламиногруппа, 1-индолидиниламиногруппа, 2-индолидиниламиногруппа, 3-индолидиниламиногруппа, 5-индолидиниламиногруппа, 6-индолидиниламиногруппа, 7-индолидиниламиногруппа, 8-индолидиниламиногруппа, 1-изоиндолиламиногруппа, 2-изоиндолиламиногруппа, 4-изоиндолиламиногруппа, 5-изоиндолиламиногруппа, 1-индолиламиногруппа, 2-индолиламиногруппа, 3-индолиламиногруппа, 4-индолиламиногруппа, 5-индолиламиногруппа, 6-индолиламиногруппа, 7-индолиламиногруппа, 1-индазолиламиногруппа, 2-индазолиламиногруппа, 3-индазолиламиногруппа, 4-индазолиламиногруппа, 5-индазолиламиногруппа, 6-

индазолиламиногруппа, 7-индазолиламиногруппа, 1-пуриниламиногруппа, 2-пуриниламиногруппа, 3-пуриниламиногруппа, 6-пуриниламиногруппа, 7-пуриниламиногруппа, 8-пуриниламиногруппа, 2-хинолиламиногруппа, 3-хинолиламиногруппа, 4-хинолиламиногруппа, 5-хинолиламиногруппа, 6-хинолиламиногруппа, 7-хинолиламиногруппа, 8-хинолиламиногруппа, 1-изохинолиламиногруппа, 3-изохинолиламиногруппа, 4-изохинолиламиногруппа, 5-изохинолиламиногруппа, 6-изохинолиламиногруппа, 7-изохинолиламиногруппа, 8-изохинолиламиногруппа, 1-фталадиниламиногруппа, 5-фталадиниламиногруппа, 6-фталадиниламиногруппа, 1-2,7-нафтиридиниламиногруппа, 3-2,7-нафтиридиниламиногруппа, 4-2,7-нафтиридиниламиногруппа, 1-2,6-нафтиридиниламиногруппа, 3-2,6-нафтиридиниламиногруппа, 4-2,6-нафтиридиниламиногруппа, 2-1,8-нафтиридиниламиногруппа, 3-1,8-нафтиридиниламиногруппа, 4-1,8-нафтиридиниламиногруппа, 2-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 3-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 4-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 5-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 6-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 8-1,7-нафтиридиниламиногруппа, 2-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 3-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 4-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 5-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 7-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 8-1,6-нафтиридиниламиногруппа, 2-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 3-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 4-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 6-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 7-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 8-1,5-нафтиридиниламиногруппа, 2-хиноксалиниламиногруппа, 5-хиноксалиниламиногруппа, 6-хиноксалиниламиногруппа, 2-хиназолиниламиногруппа, 4-хиназолиниламиногруппа, 5-хиназолиниламиногруппа, 6-хиназолиниламиногруппа, 7-хиназолиниламиногруппа, 8-хиназолиниламиногруппа, 3-циннолиниламиногруппа, 4-циннолиниламиногруппа, 5-циннолиниламиногруппа, 6-циннолиниламиногруппа, 7-циннолиниламиногруппа, 8-циннолиниламиногруппа, 2-птеридиниламиногруппа, 4-птеридиниламиногруппа, 6-птеридиниламиногруппа и 7-птеридиниламиногруппа.

Примерами C_{1-6} алкилкарбониламиногруппы являются метилкарбониламиногруппа, этилкарбониламиногруппа, н-пропилкарбониламиногруппа, изопропилкарбониламиногруппа, н-бутилкарбониламиногруппа, изобутилкарбониламиногруппа, втор-бутилкарбониламиногруппа, трет-бутилкарбониламиногруппа, 1-пентилкарбониламиногруппа, 2-пентилкарбониламиногруппа, 3-пентилкарбониламиногруппа, изопентилкарбониламиногруппа, неопентилкарбониламиногруппа, трет-пентилкарбониламиногруппа, 1-гексилкарбониламиногруппа, 2-гексилкарбониламиногруппа и 3-гексилкарбониламиногруппа;

примерами C_{1-6} алкилсульфонамидной группы являются метансульфонамидная группа, этансульфонамидная группа, н-пропансульфонамидная группа, изопропансульфонамидная группа, н-бутансульфонамидная группа, изобутансульфонамидная группа, втор-бутансульфонамидная группа, трет-бутансульфонамидная группа, 1-пентансульфонамидная группа, 2-пентансульфонамидная группа, 3-пентансульфонамидная группа, изопентансульфонамидная группа, неопентансульфонамидная группа, трет-пентансульфонамидная группа, 1-гексансульфонамидная группа, 2-

гексансульфонамидная группа и 3-гексансульфонамидная группа;

примерами C_{1-6} алкиламинокарбонильной группы являются метиламинокарбонильная группа, этиламинокарбонильная группа, н-пропиламинокарбонильная группа, изопропиламинокарбонильная группа, н-бутиламинокарбонильная группа, изобутиламинокарбонильная группа, втор-бутиламинокарбонильная группа, трет-бутиламинокарбонильная группа, 1-пентиламинокарбонильная группа, 2-пентиламинокарбонильная группа, 3-пентиламинокарбонильная группа, изопентиламинокарбонильная группа, неопентиламинокарбонильная группа, трет-пентиламинокарбонильная группа, 1-гексиламинокарбонильная группа, 2-гексиламинокарбонильная группа и 3-гексиламинокарбонильная группа;

примерами ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группы являются диметиламинокарбонильная группа, диэтиламинокарбонильная группа, ди-н-пропиламинокарбонильная группа, диизопропиламинокарбонильная группа, дициклопропиламинокарбонильная группа, ди-н-бутиламинокарбонильная группа, диизобутиламинокарбонильная группа, ди-втор-бутиламинокарбонильная группа, ди-трет-бутиламинокарбонильная группа, дициклобутиламинокарбонильная группа, ди-1-пентиламинокарбонильная группа, ди-2-пентиламинокарбонильная группа, ди-3-пентиламинокарбонильная группа, ди-изопентиламинокарбонильная группа, динеопентиламинокарбонильная группа, ди-трет-пентиламинокарбонильная группа, дициклопентиламинокарбонильная группа, ди-1-гексиламинокарбонильная группа, ди-2-гексиламинокарбонильная группа, ди-3-гексиламинокарбонильная группа, дициклогексиламинокарбонильная группа, ди-(1-метил-н-пентил)аминокарбонильная группа, ди-(1,1,2-триметил-н-пропил)аминокарбонильная группа, ди-(1,2,2-триметил-н-пропил)аминокарбонильная группа, ди-(3,3-диметил-н-бутил)аминокарбонильная группа, метил(этил)аминокарбонильная группа, метил(н-пропил)аминокарбонильная группа, метил(изопропил)аминокарбонильная группа, метил(циклопропил)аминокарбонильная группа, метил(н-бутил)аминокарбонильная группа, метил(изобутил)аминокарбонильная группа, метил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, метил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, метил(циклобутил)аминокарбонильная группа, этил(н-пропил)аминокарбонильная группа, этил(изопропил)аминокарбонильная группа, этил(циклопропил)аминокарбонильная группа, этил(н-бутил)аминокарбонильная группа, этил(изобутил)аминокарбонильная группа, этил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, этил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, этил(циклобутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(изопропил)аминокарбонильная группа, н-пропил(циклопропил)аминокарбонильная группа, н-пропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(изобутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, н-пропил(циклобутил)аминокарбонильная группа, изопропил(циклопропил)аминокарбонильная группа, изопропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(изобутил)аминокарбонильная группа, изопропил(втор-бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, изопропил(циклобутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(н-бутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(изобутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(втор-

бутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, циклопропил(циклобутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(изобутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(втор-
 5 бутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, н-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа, изобутил(втор-
 бутил)аминокарбонильная группа, изобутил(трет-бутил)аминокарбонильная группа, изобутил(циклобутил)аминокарбонильная группа, втор-бутил(трет-
 10 бутил)аминокарбонильная группа, втор-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа и трет-бутил(циклобутил)аминокарбонильная группа;

примерами C_{1-6} алкилкарбонильной группы являются метилкарбонильная группа, этилкарбонильная группа, н-пропилкарбонильная группа, изопропилкарбонильная группа, н-бутилкарбонильная группа, изобутилкарбонильная группа, втор-
 15 бутилкарбонильная группа, трет-бутиламинокарбонильная группа, 1-пентилкарбонильная группа, 2-пентилкарбонильная группа, 3-пентилкарбонильная группа, изопентилкарбонильная группа, неопентилкарбонильная группа, трет-пентилкарбонильная группа, 1-гексилкарбонильная группа, 2-гексилкарбонильная группа и 3-гексилкарбонильная группа; а

примерами C_{6-14} арилкарбонильной группы являются фенилкарбонильная группа, о-бифенилилкарбонильная группа, м-бифенилилкарбонильная группа, п-фенилилкарбонильная группа, 1-нафтилкарбонильная группа, 2-
 20 нафтилкарбонильная группа, 1-антрилкарбонильная группа, 2-антрилкарбонильная группа, 9-антрилкарбонильная группа, 1-фенантрилкарбонильная группа, 2-фенантрилкарбонильная группа, 3-фенантрилкарбонильная группа, 4-
 25 фенантрилкарбонильная группа и 9-фенантрилкарбонильная группа.

Примерами C_{2-9} гетероарилкарбонильной группы являются C_{2-6} моноциклическая гетероциклическая карбонильная группа, имеющая 5-7-членное кольцо, которое
 30 может содержать 1-3 атомов кислорода, атомов азота, атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая гетероциклическая карбонильная группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.

Примерами C_{2-6} моноциклической гетероциклической карбонильной группы, имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенилкарбонильная группа, 3-
 35 тиенилкарбонильная группа, 2-фурилкарбонильная группа, 3-фурилкарбонильная группа, 2-пиранилкарбонильная группа, 3-пиранилкарбонильная группа, 4-пиранилкарбонильная группа, 1-пирролилкарбонильная группа, 2-пирролилкарбонильная группа, 3-пирролилкарбонильная группа, 1-
 40 имидазолилкарбонильная группа, 2-имидазолилкарбонильная группа, 4-имидазолилкарбонильная группа, 1-пиразолилкарбонильная группа, 3-пиразолилкарбонильная группа, 4-пиразолилкарбонильная группа, 2-тиазолилкарбонильная группа, 4-тиазолилкарбонильная группа, 5-
 45 тиазолилкарбонильная группа, 3-изотиазолилкарбонильная группа, 4-изотиазолилкарбонильная группа, 5-изотиазолилкарбонильная группа, 2-оксазолилкарбонильная группа, 4-оксазолилкарбонильная группа, 5-оксазолилкарбонильная группа, 3-изоксазолилкарбонильная группа, 4-изоксазолилкарбонильная группа, 5-изоксазолилкарбонильная группа, 2-
 50 пиридилкарбонильная группа, 3-пиридилкарбонильная группа, 4-пиридилкарбонильная группа, 2-пирадинилкарбонильная группа, 2-пиримидинилкарбонильная группа, 4-пиримидинилкарбонильная группа, 5-пиримидинилкарбонильная группа, 3-придазинилкарбонильная группа, 4-

пиридазинилкарбонильная группа, 2-1,3,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 5-1,2,4-тиадиазолилкарбонильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолилкарбонильная группа и 3-1,2,5-тиадиазолилкарбонильная группа.

[illegible]

нафтиридинилкарбонильная группа, 3-1,7-нафтиридинилкарбонильная группа, 4-1,7-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 5-1,7-нафтиридинилкарбонильная группа, 6-1,7-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 8-1,7-нафтиридинилкарбонильная группа, 2-1,6-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 3-1,6-нафтиридинилкарбонильная группа, 4-1,6-
 5 нафтиридинилкарбонильная группа, 5-1,6-нафтиридинилкарбонильная группа, 7-1,6-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 8-1,6-нафтиридинилкарбонильная группа, 2-1,5-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 3-1,5-нафтиридинилкарбонильная группа, 4-1,5-
 нафтиридинилкарбонильная группа, 6-1,5-нафтиридинилкарбонильная группа, 7-1,5-
 10 нафтиридинилкарбонильная группа, 8-1,5-нафтиридинилкарбонильная группа, 2-
 хиноксалинилкарбонильная группа, 5-хиноксалинилкарбонильная группа, 6-
 хиноксалинилкарбонильная группа, 2-хиназолинилкарбонильная группа, 4-
 хиназолинилкарбонильная группа, 5-хиназолинилкарбонильная группа, 6-
 хиназолинилкарбонильная группа, 7-хиназолинилкарбонильная группа, 8-
 15 хиназолинилкарбонильная группа, 3-циннолинилкарбонильная группа, 4-
 циннолинилкарбонильная группа, 5-циннолинилкарбонильная группа, 6-
 циннолинилкарбонильная группа, 7-циннолинилкарбонильная группа, 8-
 циннолинилкарбонильная группа, 2-птеридинилкарбонильная группа, 4-
 20 птеридинилкарбонильная группа, 6-птеридинилкарбонильная группа и 7-
 птеридинилкарбонильная группа.

Примерами C_{1-6} -алкоксикарбонильной группы являются метоксикарбонильная
 группа, этоксикарбонильная группа, н-пропоксикарбонильная группа,
 25 изопропоксикарбонильная группа, н-бутоксикарбонильная группа,
 изобутоксикарбонильная группа, втор-бутоксикарбонильная группа, трет-
 бутоксикарбонильная группа, 1-пентилоксикарбонильная группа, 2-
 пентилоксикарбонильная группа, 3-пентилоксикарбонильная группа,
 изопентилоксикарбонильная группа, неопентилоксикарбонильная группа, трет-
 30 пентилоксикарбонильная группа, 1-гексилоксикарбонильная группа, 2-
 гексилоксикарбонильная группа и 3-гексилоксикарбонильная группа; а

примерами C_{1-6} -алкилсульфонильной группы являются метансульфонильная
 группа, трифторметансульфонильная группа и этансульфонильная группа.
 Примерами C_{6-14} -арилсульфонильной группы являются бензолсульфонильная
 35 группа, о-бифенилсульфонильная группа, м-бифенилсульфонильная группа, п-
 бифенилсульфонильная группа, 1-нафталинсульфонильная группа, 2-
 нафталинсульфонильная группа, 1-антраценсульфонильная группа, 2-
 антраценсульфонильная группа, 9-антраценсульфонильная группа, 1-
 40 фенантреносульфонильная группа, 2-фенантреносульфонильная группа, 3-
 фенантреносульфонильная группа, 4-фенантреносульфонильная группа и 9-
 фенантреносульфонильная группа.

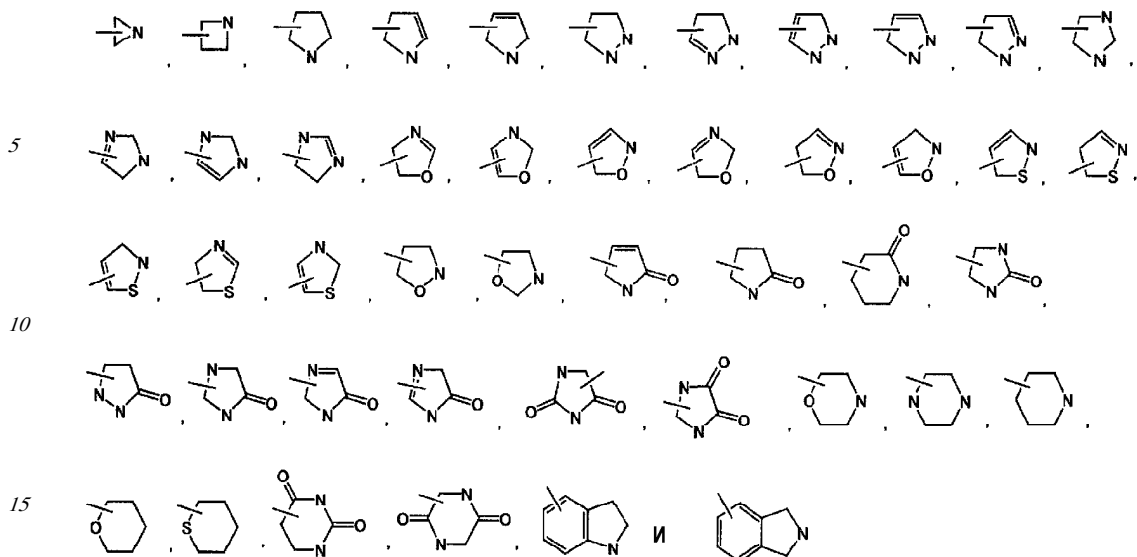
Примерами C_{2-9} -гетероарилсульфонильной группы являются
 45 C_{2-6} -моноциклическая гетероциклическая сульфонильная группа, имеющая 5-7-
 членное кольцо, которое может содержать 1-3 атома кислорода, атомов азота,
 атомов серы и их комбинации, и C_{5-9} -конденсированная бициклическая
 гетероциклическая сульфонильная группа, имеющая 8-10 атомов на кольце.
 Примерами C_{2-6} -моноциклической гетероциклической сульфонильной группы,
 50 имеющей 5-7-членное кольцо, являются 2-тиенилсульфонильная группа, 3-
 тиенилсульфонильная группа, 2-фурилсульфонильная группа, 3-
 фурилсульфонильная группа, 2-пиранилсульфонильная группа, 3-
 пиранилсульфонильная группа, 4-пиранилсульфонильная группа, 1-

пирролилсульфонильная группа, 2-пирролилсульфонильная группа, 3-
 пирролилсульфонильная группа, 1-имидазолсульфонильная группа, 2-
 имидазолсульфонильная группа, 4-имидазолсульфонильная группа, 1-
 пиразолсульфонильная группа, 3-пиразолсульфонильная группа, 4-
 5 пиразолсульфонильная группа, 2-тиазолсульфонильная группа, 4-
 тиазолсульфонильная группа, 5-тиазолсульфонильная группа, 3-
 изотиазолсульфонильная группа, 4-изотиазолсульфонильная группа, 5-
 10 изотиазолсульфонильная группа, 2-оксазолсульфонильная группа, 4-
 оксазолсульфонильная группа, 5-оксазолсульфонильная группа, 3-
 изоксазолсульфонильная группа, 4-изоксазолсульфонильная группа, 5-
 изоксазолсульфонильная группа, 2-пиридилсульфонильная группа, 3-
 пиридилсульфонильная группа, 4-пиридилсульфонильная группа, 2-
 15 пирадинилсульфонильная группа, 2-пиримидинилсульфонильная группа, 4-
 пиримидинилсульфонильная группа, 5-пиримидинилсульфонильная группа, 3-
 пиридазинилсульфонильная группа, 4-пиридазинилсульфонильная группа, 2-1,3,4-
 оксадиазолсульфонильная группа, 2-1,3,4-тиадиазолсульфонильная группа, 3-
 1,2,4-оксадиазолсульфонильная группа, 5-1,2,4-оксадиазолсульфонильная
 20 группа, 3-1,2,4-тиадиазолсульфонильная группа, 5-1,2,4-
 тиадиазолсульфонильная группа, 3-1,2,5-оксадиазолсульфонильная группа и 3-
 1,2,5-тиадиазолсульфонильная группа.

Примерами C₅₋₉-конденсированной бициклической гетероциклической
 сульфониальной группы, имеющей 8-10 атомов на кольце, являются 2-
 25 бензофуранилсульфонильная группа, 3-бензофуранилсульфонильная группа, 4-
 бензофуранилсульфонильная группа, 5-бензофуранилсульфонильная группа, 6-
 бензофуранилсульфонильная группа, 7-бензофуранилсульфонильная группа, 1-
 изобензофуранилсульфонильная группа, 4-изобензофуранилсульфонильная группа,
 30 5-изобензофуранилсульфонильная группа, 2-бензотиенилсульфонильная группа, 3-
 бензотиенилсульфонильная группа, 4-бензотиенилсульфонильная группа, 5-
 бензотиенилсульфонильная группа, 6-бензотиенилсульфонильная группа, 7-
 бензотиенилсульфонильная группа, 1-изобензотиенилсульфонильная группа, 4-
 изобензотиенилсульфонильная группа, 5-изобензотиенилсульфонильная группа, 2-
 35 хроменилсульфонильная группа, 3-хроменилсульфонильная группа, 4-
 хроменилсульфонильная группа, 5-хроменилсульфонильная группа, 6-
 хроменилсульфонильная группа, 7-хроменилсульфонильная группа, 8-
 хроменилсульфонильная группа, 1-индолидинилсульфонильная группа, 2-
 40 индолидинилсульфонильная группа, 3-индолидинилсульфонильная группа, 5-
 индолидинилсульфонильная группа, 6-индолидинилсульфонильная группа, 7-
 индолидинилсульфонильная группа, 8-индолидинилсульфонильная группа, 1-
 изоиндолилсульфонильная группа, 2-изоиндолилсульфонильная группа, 4-
 изоиндолилсульфонильная группа, 5-изоиндолилсульфонильная группа, 1-
 45 индолилсульфонильная группа, 2-индолилсульфонильная группа, 3-
 индолилсульфонильная группа, 4-индолилсульфонильная группа, 5-
 индолилсульфонильная группа, 6-индолилсульфонильная группа, 7-
 индолилсульфонильная группа, 1-индазолсульфонильная группа, 2-
 50 индазолсульфонильная группа, 3-индазолсульфонильная группа, 4-
 индазолсульфонильная группа, 5-индазолсульфонильная группа, 6-
 индазолсульфонильная группа, 7-индазолсульфонильная группа, 1-
 пуринилсульфонильная группа, 2-пуринилсульфонильная группа, 3-

пуринилсульфонильная группа, 6-пуринилсульфонильная группа, 7-
 пуринилсульфонильная группа, 8-пуринилсульфонильная группа, 2-
 хинолилсульфонильная группа, 3-хинолилсульфонильная группа, 4-
 хинолилсульфонильная группа, 5-хинолилсульфонильная группа, 6-
 хинолилсульфонильная группа, 7-хинолилсульфонильная группа, 8-
 хинолилсульфонильная группа, 1-изохинолилсульфонильная группа, 3-
 изохинолилсульфонильная группа, 4-изохинолилсульфонильная группа, 5-
 изохинолилсульфонильная группа, 6-изохинолилсульфонильная группа, 7-
 изохинолилсульфонильная группа, 8-изохинолилсульфонильная группа, 1-
 фталадинилсульфонильная группа, 5-фталадинилсульфонильная группа, 6-
 фталадинилсульфонильная группа, 1-2,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 3-2,7-
 нафтиридинилсульфонильная группа, 4-2,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 1-
 2,6-нафтиридинилсульфонильная группа, 3-2,6-нафтиридинилсульфонильная группа,
 4-2,6-нафтиридинилсульфонильная группа, 2-1,8-нафтиридинилсульфонильная
 группа, 3-1,8-нафтиридинилсульфонильная группа, 4-1,8-
 нафтиридинилсульфонильная группа, 2-1,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 3-
 1,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 4-1,7-нафтиридинилсульфонильная группа,
 5-1,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 6-1,7-нафтиридинилсульфонильная
 группа, 8-1,7-нафтиридинилсульфонильная группа, 2-1,6-
 нафтиридинилсульфонильная группа, 3-1,6-нафтиридинилсульфонильная группа, 4-
 1,6-нафтиридинилсульфонильная группа, 5-1,6-нафтиридинилсульфонильная группа,
 7-1,6-нафтиридинилсульфонильная группа, 8-1,6-нафтиридинилсульфонильная
 группа, 2-1,5-нафтиридинилсульфонильная группа, 3-1,5-
 нафтиридинилсульфонильная группа, 4-1,5-нафтиридинилсульфонильная группа, 6-
 1,5-нафтиридинилсульфонильная группа, 7-1,5-нафтиридинилсульфонильная группа,
 8-1,5-нафтиридинилсульфонильная группа, 2-хиноксалинилсульфонильная группа, 5-
 хиноксалинилсульфонильная группа, 6-хиноксалинилсульфонильная группа, 2-
 хиназолинилсульфонильная группа, 4-хиназолинилсульфонильная группа, 5-
 хиназолинилсульфонильная группа, 6-хиназолинилсульфонильная группа, 7-
 хиназолинилсульфонильная группа, 8-хиназолинилсульфонильная группа, 3-
 циннолинилсульфонильная группа, 4-циннолинилсульфонильная группа, 5-
 циннолинилсульфонильная группа, 6-циннолинилсульфонильная группа, 7-
 циннолинилсульфонильная группа, 8-циннолинилсульфонильная группа, 2-
 птеридинилсульфонильная группа, 4-птеридинилсульфонильная группа, 6-
 птеридинилсульфонильная группа и 7-птеридинилсульфонильная группа.

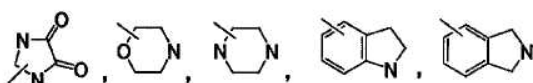
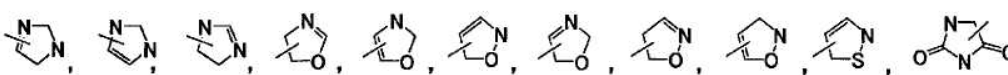
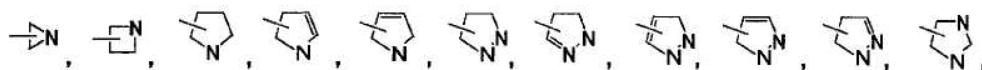
Примерами C_{2-9} гетероциклической группы являются моноциклическая и
 бициклическая гетероциклическая группа с конденсированными кольцами,
 содержащая один или несколько атомов, независимо выбранных из атома азота,
 атома кислорода и атома серы, и 2-9 атомов углерода, а в частности, такой группой
 являются следующие группы:



В вышеуказанных формулах, символ «-» (который указывает на химическую связь), имеющийся в каждой циклической структуре, означает, что группа-заместитель может присутствовать в любом положении, которое может быть замещено в данной химической структуре, и не означает какое-либо конкретное положение замещения.

R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶ и R¹⁷ в формуле (a), формуле (b), формуле (c), формуле (d), формуле (f), формуле (g), формуле (h), формуле (j), формуле (k), формуле (m), формуле (n), формуле (o), формуле (p), формуле (q), формуле (r), формуле (s), формуле (t), формуле (u), формуле (v), формуле (w), формуле (y), формуле (z), формуле (aa), формуле (ab), формуле (ac), формуле (ad), формуле (ae) и в формуле (af) независимо и предпочтительно, представляют собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, 3,3-диметил-н-бутильную группу, метилкарбонил оксиметильную группу, этилкарбонил оксиметильную группу, метилкарбонил оксиэтильную группу, этилкарбонил оксиэтильную группу, метилкарбонил амин метильную группу, этилкарбонил амин метильную группу, метилкарбонил амин этильную группу, этилкарбонил амин этильную группу, метоксикарбонил метильную группу, этоксикарбонил метильную группу, метоксикарбонил этильную группу, этоксикарбонил этильную группу, циклопропильную группу, циклопентильную группу, циклогексильную группу, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, метилтиогруппу, этилтиогруппу, фенильную группу, о-бифенильную группу, м-бифенильную группу, п-бифенильную группу, 1-нафтильную группу, 2-нафтильную группу, 2-пиридилную группу, 3-пиридилную группу, 4-пиридилную группу, метилкарбонил оксигруппу, этилкарбонил оксигруппу, н-пропилкарбонил оксигруппу, изопропилкарбонил оксигруппу, н-бутилкарбонил оксигруппу, трет-бутилкарбонил оксигруппу, метиламиногруппу, этиламиногруппу, н-пропиламиногруппу, изопропиламиногруппу, н-бутиламиногруппу, диметиламиногруппу, диэтиламиногруппу, ди-н-пропиламиногруппу, диизопропиламиногруппу, ди-н-бутиламиногруппу, фениламиногруппу, о-бифениламиногруппу, м-бифениламиногруппу, п-бифениламиногруппу, 1-нафтиламиногруппу, 2-нафтиламиногруппу, 2-

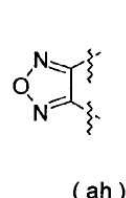
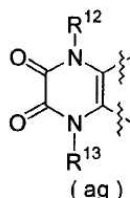
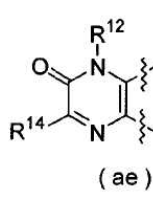
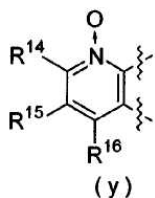
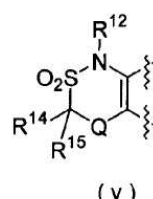
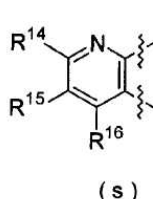
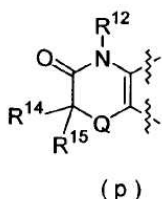
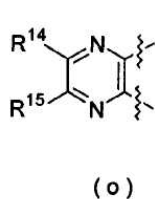
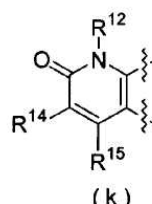
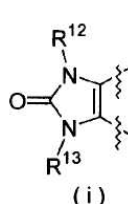
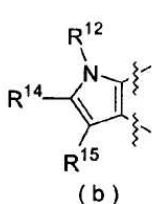
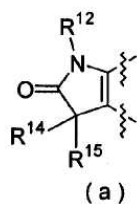
пиридиламиногруппу, 3-пиридиламиногруппу, 4-пиридиламиногруппу, метилкарбониламиногруппу, этилкарбониламиногруппу, н-пропилкарбониламиногруппу, изопропилкарбониламиногруппу, н-бутилкарбониламиногруппу, метансульфонамидную группу, этансульфонамидную
 5 группу, н-пропансульфонамидную группу, изопропансульфонамидную группу, н-бутансульфонамидную группу, метиламинокарбонильную группу, этиламинокарбонильную группу, н-пропиламинокарбонильную группу, изопропиламинокарбонильную группу, н-бутиламинокарбонильную группу,
 10 диметиламинокарбонильную группу, диэтиламинокарбонильную группу, ди-н-пропиламинокарбонильную группу, диизопропиламинокарбонильную группу, дициклопропиламинокарбонильную группу, ди-н-бутиламинокарбонильную группу, метилкарбонильную группу, этилкарбонильную группу, н-пропилкарбонильную группу, изопропилкарбонильную группу, н-бутилкарбонильную группу,
 15 фенилкарбонильную группу, о-бифенилкарбонильную группу, м-бифенилкарбонильную группу, п-бифенилкарбонильную группу, 1-нафтилкарбонильную группу, 2-нафтилкарбонильную группу, 2-пиридилкарбонильную группу, 3-пиридилкарбонильную группу, 4-пиридилкарбонильную группу, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу, изобутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, трет-бутоксикарбонильную группу, метансульфонильную группу, трифторметансульфонильную группу,
 25 бензолсульфонильную группу, о-бифенилсульфонильную группу, м-бифенилсульфонильную группу, п-бифенилсульфонильную группу, 1-нафталинсульфонильную группу, 2-нафталинсульфонильную группу, 2-пиридилсульфонильную группу, 3-пиридилсульфонильную группу, 4-пиридилсульфонильную группу, аминогруппу, цианогруппу, карбамоильную группу,
 30 карбоксильную группу и нижеследующие группы:



В вышеуказанных формулах, символ «-» (который указывает на химическую связь), имеющийся в каждой циклической структуре, означает, что группа-заместитель может присутствовать в любом положении, которое может быть
 45 замещено в данной химической структуре, и не означает какое-либо конкретное положение замещения.

Q в формуле (с), формуле (d), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (ab), формуле (ac) и в формуле (ad) представляет собой O (атом кислорода),
 50 S (атом серы), SO (сульфинильную группу) или SO₂ (сульфонильную группу). Q в формуле (с), формуле (d), формуле (p), формуле (q), формуле (v), формуле (w), формуле (ab), формуле (ac) и в формуле (ad), предпочтительно, представляет собой O (атом кислорода).

В случае, если неполная циклическая структура А в формуле (11) или в формуле (12) представлена формулой (а), формулой (b), формулой (i), формулой (k), формулой (o), формулой (p), формулой (s), формулой (v), формулой (y), формулой (ae), формулой (ag) или формулой (ah), ниже приводится описание R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (а), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y), формуле (ae), формуле (ag) или в формуле (ah).



В случае, если неполная циклическая структура А в формуле (11) или в формуле (12) представлена формулой (а), формулой (b), формулой (i), формулой (k), формулой (o), формулой (p), формулой (s), формулой (v), формулой (y), формулой (ae), формулой (ag) или формулой (ah), ниже приводится описание R^{12} и R^{13} в формуле (а), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) или формуле (ag).

Каждый из R^{12} и R^{13} в формуле (а), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) и в формуле (ag) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, аминогруппой или гидроксигруппой).

Каждая группа-заместитель для R^{12} и R^{13} в формуле (а), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) и в формуле (ag) конкретно описана ниже.

Примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, метоксиметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, н-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, н-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа и 3,3-диметил-н-бутильная группа.

R^{12} и R^{13} в формуле (a), формуле (b), формуле (i), формуле (k), формуле (p), формуле (v), формуле (ae) и в формуле (ag) независимо представляет собой атом водорода, метильную группу, трифторметильную группу, метоксиметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, аминогруппу и гидроксигруппу, а более предпочтительно, атом водорода и метильную группу.

В случае, если неполная циклическая структура A в формуле (11) или в формуле (12) представлена формулой (a), формулой (b), формулой (i), формулой (k), формулой (o), формулой (p), формулой (s), формулой (v), формулой (y), формулой (ae), формулой (ag) или формулой (ah), ниже приводится описание R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и формуле (ae). Каждый из R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и формуле (ae) независимо представляет собой атом водорода, атом галогена или C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-6} алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппой, C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группой или C_{1-6} алкоксикарбонильной группой).

Каждый атом и каждая группа-заместитель для R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и формуле (ae) конкретно описаны ниже.

Примерами атома галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода;

примерами C_{1-6} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, н-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, н-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа, 3,3-диметил-н-бутильная группа, метилкарбонилоксиметильная группа, этилкарбонилоксиметильная группа, метилкарбонилоксиэтильная группа, этилкарбонилоксиэтильная группа, метилкарбониламинометильная группа, этилкарбониламинометильная группа, метилкарбониламиноэтильная группа, этилкарбониламиноэтильная группа, метоксикарбонилметильная группа, этоксикарбонилметильная группа, метоксикарбонилэтильная группа, трифторметоксикарбонилметильная группа и этоксикарбонилэтильная группа. Примерами C_{1-6} алкилкарбониламиногруппы являются метилкарбониламиногруппа, трифторметилкарбониламиногруппа, этилкарбониламиногруппа, н-пропилкарбониламиногруппа, изопропилкарбониламиногруппа, н-бутилкарбониламиногруппа, изобутилкарбониламиногруппа, втор-бутилкарбониламиногруппа, трет-бутилкарбониламиногруппа, 1-пентилкарбониламиногруппа, 2-пентилкарбониламиногруппа, 3-

пентилкарбониламиногруппа, изопентилкарбониламиногруппа, неопентилкарбониламиногруппа, трет-пентилкарбониламиногруппа, 1-гексилкарбониламиногруппа, 2-гексилкарбониламиногруппа и 3-гексилкарбониламиногруппа;

5 примерами C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группы являются циклопропилкарбонильная группа, циклобутилкарбонильная группа, 1-метил-циклопропилкарбонильная группа, 2-метилциклопропилкарбонильная группа, циклопентилкарбонильная группа, 1-метилциклобутилкарбонильная группа, 2-метилциклобутилкарбонильная группа, 3-метилциклобутилкарбонильная группа, 1,2-10 диметилциклопропилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этилциклопропилкарбонильная группа, 2-этилциклопропилкарбонильная группа, циклогексилкарбонильная группа, циклогептилкарбонильная группа, циклооктилкарбонильная группа, 1-метил-циклогексилкарбонильная группа, 2-метилциклогексилкарбонильная группа, 3-метилциклогексилкарбонильная группа, 1,2-15 диметилциклогексилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этилциклопропилкарбонильная группа, 1-метилциклопентилкарбонильная группа, 2-метилциклопентилкарбонильная группа, 3-метилциклопентилкарбонильная группа, 1-этилциклобутилкарбонильная группа, 2-этилциклобутилкарбонильная группа, 3-этилциклобутилкарбонильная группа, 1,2-диметилциклобутилкарбонильная группа, 1,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,2-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 2,4-25 диметилциклобутилкарбонильная группа, 3,3-диметилциклобутилкарбонильная группа, 1-н-пропилциклопропилкарбонильная группа, 2-н-пропилциклопропилкарбонильная группа, 1-изопропилциклопропилкарбонильная группа, 2-изопропилциклопропилкарбонильная группа, 1,2,2-триметилциклопропилкарбонильная группа, 1,2,3-30 триметилциклопропилкарбонильная группа, 2,2,3-триметилциклопропилкарбонильная группа, 1-этил-2-метилциклопропилкарбонильная группа, 2-этил-1-метилциклопропилкарбонильная группа, 2-этил-2-метилциклопропилкарбонильная группа и 2-этил-3-метилциклопропилкарбонильная группа; а

35 примерами C_{1-6} алкоксикарбонильной группы являются метоксикарбонильная группа, этоксикарбонильная группа, н-пропоксикарбонильная группа, изопропоксикарбонильная группа, н-бутоксикарбонильная группа, 40 изобутоксикарбонильная группа, втор-бутоксикарбонильная группа, трет-бутоксикарбонильная группа, 1-пентилоксикарбонильная группа, 2-пентилоксикарбонильная группа, 3-пентилоксикарбонильная группа, изопентилоксикарбонильная группа, неопентилоксикарбонильная группа, трет-пентилоксикарбонильная группа, 1-гексилоксикарбонильная группа, 2-45 гексилоксикарбонильная группа и 3-гексилоксикарбонильная группа.

R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (a), формуле (b), формуле (k), формуле (o), формуле (p), формуле (s), формуле (v), формуле (y) и формуле (ae) независимо представляют собой атом водорода, атом фтора, атом хлора, атом брома, метильную группу, 50 трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, н-пентильную группу, изопентильную группу, метилкарбонилоксиметильную группу, этилкарбонилоксиметильную группу, метилкарбонилоксиэтильную группу, этилкарбонилоксиэтильную группу,

метилкарбонилкарбониламинометильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метилкарбониламиноэтильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метоксикарбонилметильную группу, этоксикарбонилметильную группу, метоксикарбонилэтильную группу, трифторметоксикарбонилметильную группу и этоксикарбонилэтильную группу, а более предпочтительно, атом водорода, атом фтора, атом хлора, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, метилкарбонилоксиметильную группу, этилкарбонилоксиметильную группу, метилкарбониламиноэтильную группу, этилкарбониламиноэтильную группу, метоксикарбонилметильную группу и трифторметоксикарбонилметильную группу.

Неполные циклические структуры А в формуле (11) или в формуле (12) представлены формулой (p) и формулой (v), а Q в формуле (p) или в формуле (v) означает О (атом кислорода), S (атом серы), SO (сульфинильную группу) или SO₂ (сульфонильную группу). Q в формуле (p) или в формуле (v), предпочтительно, представляет собой О (атом кислорода).

R⁹, R¹⁰, W, X, Y и Z в формуле (13) описаны ниже.

Каждый из R⁹ и R¹⁰ в формуле (13) независимо представляет собой атом водорода, C₁₋₆алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой), C₆₋₁₄арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, нитрогруппой, цианогруппой, C₁₋₆алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C₁₋₆алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой) или C₁₋₆алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена)).

Каждая группа-заместитель для R⁹ и R¹⁰ в формуле (13) конкретно описана ниже.

Примерами C₁₋₆алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, метоксиметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа, трет-бутильная группа, н-пентильная группа, 2-пентильная группа, 3-пентильная группа, изопентильная группа, неопентильная группа, 2,2-диметилпропильная группа, 1-гексильная группа, 2-гексильная группа, 3-гексильная группа, 1-метил-н-пентильная группа, 1,1,2-триметил-н-пропильная группа, 1,2,2-триметил-н-пропильная группа, 3,3-диметил-н-бутильная группа, а примерами C₆₋₁₄арильной группы являются фенильная группа, о-бифенилильная группа, м-бифенилильная группа, п-бифенилильная группа, 1-нафтильная группа, 2-нафтильная группа, 1-антрильная группа, 2-антрильная группа, 9-антрильная группа, 1-фенантрильная группа, 2-фенантрильная группа, 3-фенантрильная группа, 4-фенантрильная группа и 9-фенантрильная группа.

R⁹ и R¹⁰ в формуле (13), предпочтительно, представляют собой метильную группу, трифторметильную группу и этильную группу, а более предпочтительно, метильную группу.

W в формуле (13), предпочтительно, представляет собой атом водорода, гидроксигруппу, C₁₋₆алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), атом галогена, C₁₋₄алкильную группу или C₁₋₆алкилсульфонамидную группу (алкильная группа и алкилсульфонамидная

группа могут быть необязательно замещены атомом галогена).

Каждый атом и каждая группа-заместитель для W в формуле (13) конкретно описаны ниже.

5 Примерами C₁₋₆-алкоксигруппы являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа, 1-пентилоксигруппа, 2-пентилоксигруппа, 3-пентилоксигруппа, изопентилоксигруппа, неопентилоксигруппа, 2,2-диметилпропоксигруппа, 1-гексилоксигруппа, 2-гексилоксигруппа, 3-гексилоксигруппа, 1-метил-н-пентилоксигруппа, 1,1,2-триметил-н-пропоксигруппа, 1,2,2-триметил-н-пропоксигруппа и 3,3-диметил-н-бутоксигруппа;

примерами атома галогена являются атом фтора, атом хлора, атом брома и атом иода;

15 примерами C₁₋₄-алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа; а

примерами C₁₋₆-алкилсульфонамидной группы являются метансульфонамидная группа, трифторметансульфонамидная группа, этансульфонамидная группа, н-пропансульфонамидная группа, изопропансульфонамидная группа, н-бутансульфонамидная группа, изобутансульфонамидная группа, втор-бутансульфонамидная группа, трет-бутансульфонамидная группа, 1-пентансульфонамидная группа, 2-пентансульфонамидная группа, 3-пентансульфонамидная группа, изопентансульфонамидная группа, 25 неопентансульфонамидная группа, трет-пентансульфонамидная группа, 1-гексансульфонамидная группа, 2-гексансульфонамидная группа и 3-гексансульфонамидная группа.

W в формуле (13), предпочтительно, представляет собой атом водорода, 30 гидроксигруппу, атом фтора, атом хлора, атом брома, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, метансульфонамидную группу, трифторметансульфонамидную группу, этансульфонамидную группу, н-пропансульфонамидную группу, изопропансульфонамидную группу и н-бутансульфонамидную группу, а более предпочтительно, атом водорода, 35 гидроксигруппу, атом фтора, метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, метоксигруппу, метансульфонамидную группу и трифторметансульфонамидную группу.

40 X в формуле (13) представляет собой NR²⁰; N представляет собой атом азота, а R²⁰ представляет собой атом водорода или C₁₋₄-алкильную группу.

Каждая группа-заместитель R²⁰ для X в формуле (13) описана ниже.

45 Примерами C₁₋₄-алкильной группы являются метильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа.

R²⁰ для X в формуле (13), предпочтительно, представляет собой атом водорода, метильную группу и этильную группу.

50 Y в формуле (13) представляет собой химическую связь, SO (сульфинильную группу) или SO₂ (сульфонильную группу), а предпочтительно, химическую связь и SO₂.

Z в формуле (13) представляет собой C₁₋₄-алкильную группу (C₁₋₄-алкильная

группа может быть необязательно замещена 1-5 атомами галогена или фенильной группой (фенильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой)) или фенильную группу (фенильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой).

Каждая группа-заместитель для Z в формуле (13) конкретно описана ниже.

Примерами C_{1-4} алкильной группы являются метильная группа, трифторметильная группа, этильная группа, н-пропильная группа, изопропильная группа, н-бутильная группа, изобутильная группа, втор-бутильная группа и трет-бутильная группа.

Z в формуле (13), предпочтительно, представляет собой метильную группу, трифторметильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу и фенильную группу.

Если оптически активный комплекс титана, представленный любыми из таких формул, как формула (1), формула (1'), формула (2), формула (2'), формула (3), формула (3'), формула (4) и формула (4'), используется в качестве катализатора, то количество используемого оптически активного комплекса титана по отношению к количеству соединения хромена, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), составляет от 0,001 до 100 моль%, предпочтительно, от 0,01 до 20 моль%, а более предпочтительно, от 0,3 до 5 моль%.

Если в реакции асимметрического эпоксицирования, оптически активный комплекс титана, представленный любой из формул (1), (1'), (2), (2'), (3), (3'), (4) и (4'), используется в качестве катализатора и если в этой реакции применяется апротонный органический растворитель, то таким апротонным органическим растворителем является галогеновый растворитель, ароматический углеводородный растворитель, сложноэфирный растворитель, эфирный растворитель или нитриловый растворитель, а если применяется протонный органический растворитель, то таким протонным органическим растворителем является спиртовой растворитель. Примерами галогенового растворителя являются дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлорэтан и хлорбензол; примерами ароматического углеводородного растворителя являются бензол и толуол; примером сложноэфирного растворителя является этилацетат; примерами эфирного растворителя являются тетрагидрофуран и диэтиловый эфир; а примерами нитрилового растворителя являются бутиронитрил, пропионитрил и ацетонитрил. Примерами спиртового растворителя являются метанол, этанол и изопропанол. Более того, может быть включена смесь вышеупомянутых растворителей. Кроме того, если в данной реакции используется водный раствор пероксида водорода, то органический слой и водный слой могут быть разделены путем смешивания водного раствора пероксида водорода с органическим растворителем, который не растворяется в воде. Однако, такой двухфазный растворитель может быть также использован в качестве растворителя для реакции согласно изобретению. Предпочтительным растворителем является апротонный органический растворитель, такой как дихлорметан, 1,2-дихлорэтан, хлорбензол, толуол, этилацетат и их смеси.

Для получения нужного соединения, к органическому растворителю добавляют соединение хромена, оптически активный комплекс титана и окислитель. Добавление, предпочтительно, осуществляют в следующем порядке: сначала к раствору органического растворителя добавляют окислитель, а затем соединение хромена и оптически активный комплекс титана.

Конкретными примерами окислителя, используемого в данной реакции, являются йодозобензол, гипохлорит натрия, м-хлорпербензойная кислота, оксон (зарегистрированный под торговым знаком DuPont), водный раствор пероксида водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (UHP), оксазиридин, N-метилморфолиноксид (NMO), трет-бутилгидропероксид (ТВНР), гидропероксид кумола (СНР) или их комбинации. Из этих окислителей, предпочтительными являются водный раствор пероксида водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (UHP) и их смеси. Если окислителем является водный раствор пероксида водорода, то его концентрация может составлять от 1 до 100 мас.%, а предпочтительно, от 5 до 60 мас.%.

Количество окислителя, используемого в данной реакции, по отношению к количеству соединения хрома, представленного формулой (10), формулой (11), формулой (12) или формулой (13), может составлять от 1 до 10 эквивалентов, а предпочтительно, от 1 до 3 эквивалентов.

Примерами способа добавления окислителя, кроме однократного добавления, являются постадийное добавление и непрерывное добавление.

Если добавление осуществляют непрерывно, то предпочтительно, чтобы скорость добавления была такой, при которой не будет происходить резкого увеличения температуры реакционной системы растворителей, а в частности, скорость добавления должна составлять от 0,01 до 40000 эквивалентов в час, а более предпочтительно, в пределах от 0,05 до 0,3 эквивалентов в час. Термин «постадийное добавление» означает метод отдельного добавления используемого окислителя, осуществляемого «р» раз (р может быть любым целым числом). Части добавляемого окислителя могут быть равными или неравными, а «р» предпочтительно, равно 2-100.

Температура реакции может составлять в пределах от -78°C до температуры перегонки растворителя или в пределах от температуры плавления растворителя до температуры перегонки растворителя, предпочтительно, в пределах от -20 до 50°C, а более предпочтительно, от 0°C до 35°C.

Давление в реакционной системе эпоксидирования может составлять от 10 кПа до 1100 кПа, предпочтительно, от 15 кПа до 200 кПа. При подаче давления, реакция может протекать при температуре, превышающей температуру перегонки растворителя при нормальном давлении.

Время реакции может быть уменьшено за счет дополнительного добавления катализатора, а именно оптически активного комплекса титана, во время реакции. Кроме того, время реакции может быть уменьшено за счет дополнительного добавления окислителя.

После завершения реакции, нужное оптически активное соединение оксида хрома может быть получено путем разделения и очистки реакционной смеси посредством процедуры перегонки, колоночной хроматографии на силикагеле, процедуры разделения и экстракции, процедуры перекристаллизации или смешанной процедуры.

Оптическая чистота полученного оптически активного соединения оксида хрома может быть проанализирована с помощью анализа, проводимого с применением оптически активной высокоэффективной жидкостной хроматографии, анализа, проводимого с применением оптически активной газовой хроматографии, или измерения уровня оптического вращения.

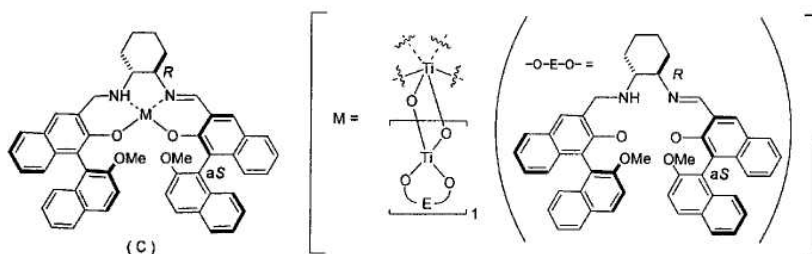
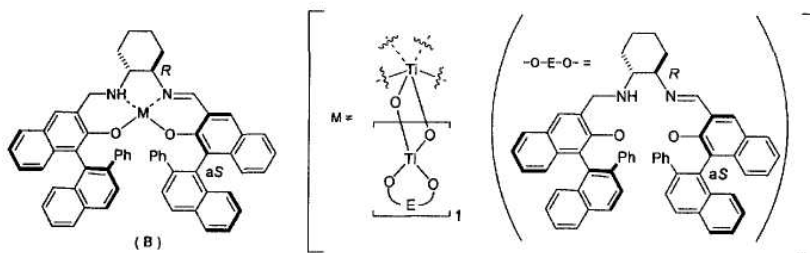
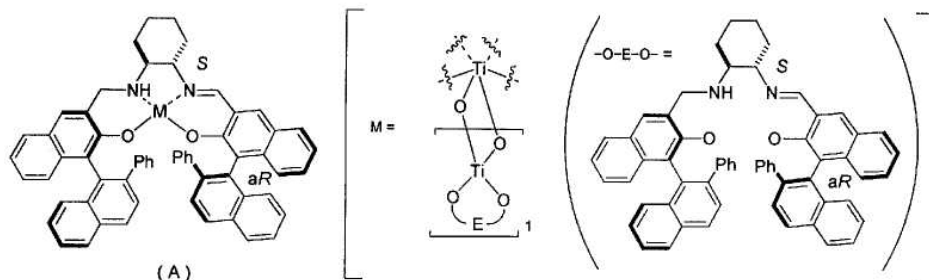
Настоящее изобретение более подробно описано на нижеследующих примерах.

Однако настоящее изобретение не ограничивается этими примерами.

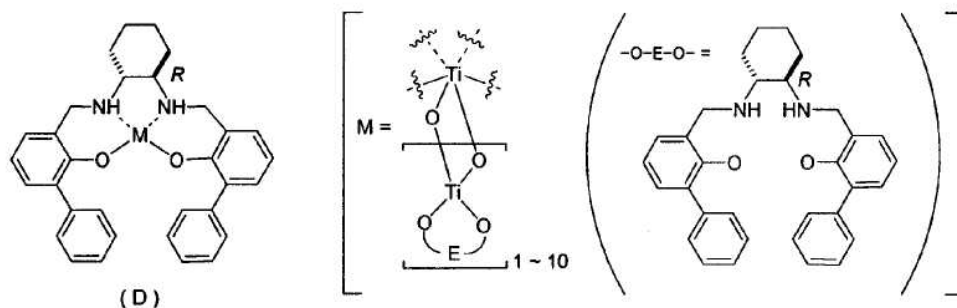
Из оптически активных соединений хромена, описанных в этих примерах, некоторые соединения имеют абсолютную конфигурацию асимметрических атомов углерода, которая пока еще точно не известна. Что касается этих соединений, то в описании химических формул и названий соединений приводится их предполагаемая абсолютная конфигурация, отмеченная звездочкой (*), стоящей после каждого названия соединения и каждого асимметрического атома углерода в химической формуле.

Синтез оптически активных комплексов титана-салаалена (А), (В) и (С)

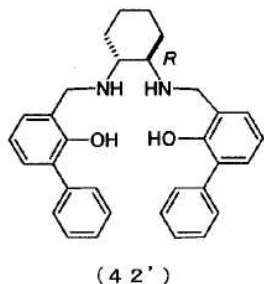
Оптически активные комплексы титана-салаалена (А), (В) и (С), используемые в примерах, были синтезированы методом, описанным в не-патентном документе 8 (Angew. Chem. Int. Ed., 44, 4935-4939 (2005)).



Оптически активный комплекс титана-салаана (D), представленный указанными ниже формулами, был получен методом, описанным ниже.



Салановый лиганд (42')

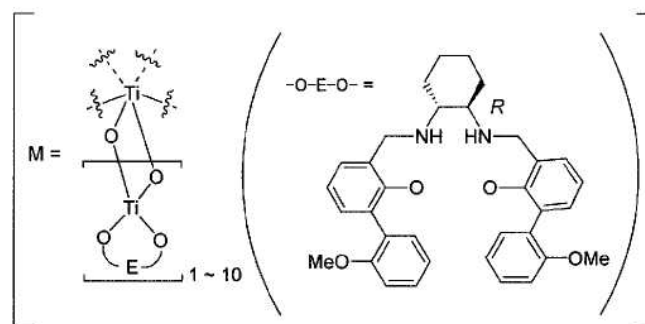
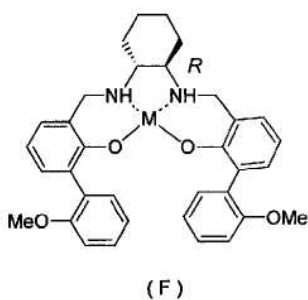
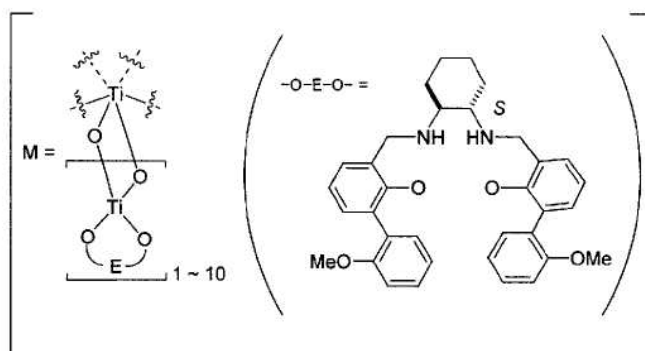
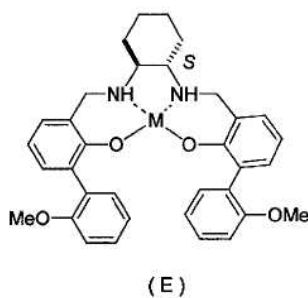


К дихлорметановому растворителю для реакции саланового лиганда (42') добавляли 1,1 моль на один моль саланового лиганда (42') тетраизопропоксида титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$) в атмосфере азота при 25-28°C. Затем смесь перемешивали в течение 5 часов и добавляли воду при 25-28°C, и полученный реакционный раствор перемешивали в течение 12 часов. Растворитель для реакции удаляли путем перегонки с получением неочищенного продукта, и этот продукт перекристаллизовывали с дихлорметаном с получением оптически активного комплекса титана (D).

Слегка желтовато-белое твердое вещество

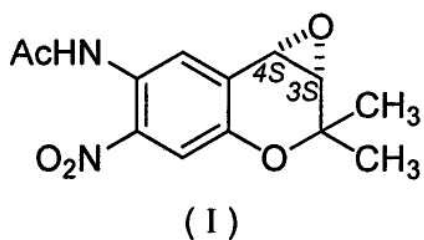
$\text{MC}(\text{CSI})=1082, 2163$.

Оптически активные комплексы титана-сала (E) и (F) были также получены методом, описанным выше.



Пример 1

Синтез (3S,4S)-6-ацетамид-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (I))



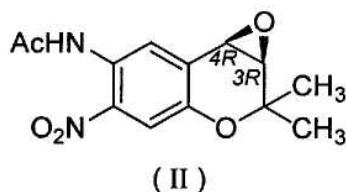
6-ацетамид-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопиран (0,54 г, 2,1 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (3 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (B) (38 мг, 0,021 ммоль) (1,0 моль% по отношению к субстрату) при 28°C. К реакционному раствору, при перемешивании, в течение 10 часов добавляли 7,5% водный раствор пероксида водорода (1,4 г, 3,1 ммоль) при 28°C. Начальное время добавления 7,5% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 14 часов после начала реакции снова добавляли 7,5% водный раствор пероксида водорода (0,1 г, 0,2 ммоль), и полученный раствор снова перемешивали при 28°C в течение 19 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (6 мл) и дистиллированную воду (6 мл), и органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном (6 мл), и отделенный органический слой объединяли, и этот объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Полученный продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (I) в виде желтоватого порошка (0,49 г, выход: 86%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK OJ-RH, элюент: ацетонитрил/метанол/0,01М водный раствор хлорида натрия=1/3/5 (об./об./об.), скорость потока: 1,5 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3S,4S) - 15,9 минут, энантиомер (3R,4R) - 11,7 минут, измеренная длина волны (полосы поглощения): 242 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,27 (с, 3H), 1,59 (с, 3H), 2,28 (с, 3H), 3,55 (д, J=4,1 Гц, 1H), 3,97 (д, J=4,1 Гц, 1H), 7,64 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 10,10 (шир., 1H).

Пример 2

Синтез (3R,4R)-6-ацетамид-3,4-эпоксид-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (II))



6-Ацетамид-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопиран (537,4 мг, 2,1 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (3 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (E) (25,6 мг, 0,021 ммоль) (1,0 моль% по отношению к субстрату) при 30°C. К реакционному раствору, при перемешивании, в течение 1 секунды добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (302,7 мг, 2,7 ммоль) при 30°C. Затем, полученный раствор снова перемешивали в течение 7 часов при 30°C. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан и дистиллированную воду, и органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном, и отделенный органический слой объединяли, и объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Полученный продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (II) в виде желтоватого порошка (0,53 г, выход: 93%, оптическая чистота: 99,9% э.и. (энантиомерный избыток) или более).

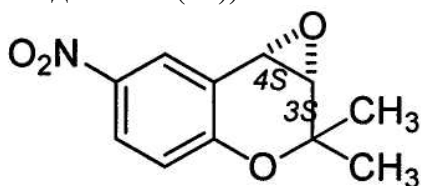
Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK OJ-RH, элюент: ацетонитрил/метанол/0,01М водный раствор хлорида натрия=1/3/5 (об./об./об.), скорость потока: 1,5 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3R,4R) - 13,4 минут, энантиомер (3S,4S) - 17,5 минут, измеренная

длина волны: 242 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,27 (с,3H), 1,59 (с,3H), 2,28 (с,3H), 3,55 (д, $J=4,2$ Гц, 1H), 3,97 (д, $J=4,5$ Гц, 1H), 7,63 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 10,09 (шир., 1H).

Пример 3

Синтез (3S,4S)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-6-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (III))



(III)

2,2-Диметил-6-нитро-2H-1-бензопиран (0,41 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (8 мл) оптически активного комплекса титана-саладена (B) (73 мг, 0,041 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. К реакционному раствору, при перемешивании, в течение 2 секунд при 25°C.

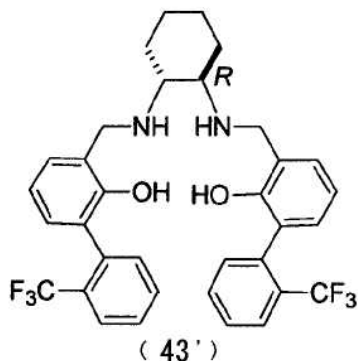
добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль). Начальное время добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали в течение 27 часов после начала реакции при 25°C. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (6 мл) и дистиллированную воду (6 мл), и органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном, и отделенный органический слой объединяли, а затем, объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (III) в виде беловато-желтого порошка (0,43 г, выход: 97%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALCEL OD-H, элюент: н-гексан/изопропанол=9/1 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3S,4S) - 9,6 минут, энантиомер (3R,4R) - 8,4 минут, измеренная длина волны: 300 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,33 (с,3H), 1,63 (с,3H), 3,57 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 4,00 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 6,89 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 8,15 (дд, $J=9,1, 2,8$ Гц, 1H), 8,31 (д, $J=2,8$ Гц, 1H).

Пример 4

Синтез (3S,4S)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-6-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (III))



(43')

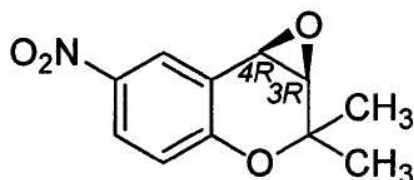
Тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$) (2,3 мг, 0,0080 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (0,3 мл) саланового лиганда (4,9 мг, 0,0080 ммоль) (4,0

моль% по отношению к субстрату), представленного формулой (43'), при 20°C. После перемешивания в течение 1 часа при 20°C, к раствору добавляли 2,2-диметил-6-нитро-2Н-1-бензопиран (41 мг, 0,20 ммоль). 30% водный раствор пероксида водорода (0,034 г, 0,30 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции и брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (III) составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3S,4S) - 15,8 минут, энантиомер (3R,4R) - 12,6 минут, измеренная длина волны: 330 нм.

Пример 5

Синтез (3R,4R)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-6-нитро-2Н-1-бензопирана (Соединения (IV))



(IV)

2,2-Диметил-6-нитро-2Н-1-бензопиран (0,41 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (6 мл) оптически активного комплекса титана-салана (Е) (48 мг, 0,040 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции, и к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5 мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (IV) в виде беловато-желтого порошка (0,41 г, выход: 94%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3R,4R)- 12,6 минут, энантиомер (3S,4S) - 15,8 минут, измеренная длина волны: 330 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,33 (с,3H), 1,62 (с,3H), 3,58 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 4,00 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 6,89 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 8,14 (дд, $J=8,6$, 3,0 Гц, 1H), 8,30 (д, $J=3,0$ Гц, 1H).

Пример 6

Синтез (3R,4R)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-6-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (IV))

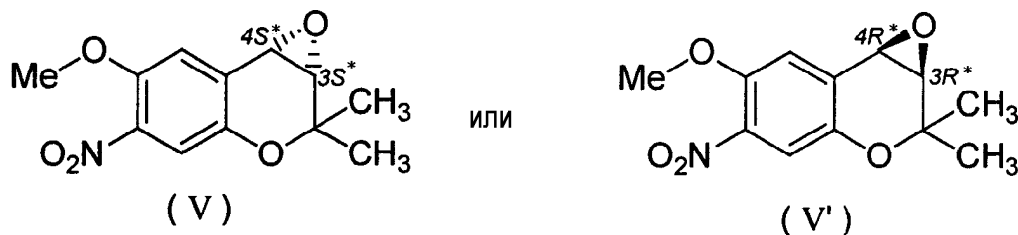
2,2-Диметил-6-нитро-2H-1-бензопиран (0,41 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (8 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (А) (73 мг, 0,041 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C.

При перемешивании реакционного раствора, в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль) при 25°C. После добавления, раствор оставляли для непрерывного перемешивания при 25°C. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 8 часов после начала реакции брали образец реакционного раствора, и Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (IV) составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 96% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH, элюент: ацетонитрил/20 mM (pH8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции (3R,4R) - 5,2 минуты, энантиомер (3S,4S) - 6,1 минута, измеренная длина волны: 330 нм.

Пример 7

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопирана (Соединения (V)), * означает относительную конфигурацию



2,2-Диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопиран (0,47 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (8 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (В) (71 мг, 0,040 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль) при 25°C. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 25°C в течение 19 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (3 мл) и дистиллированную воду (3 мл), после чего органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном (3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (V) в виде желтоватого масла (0,50 г, выход: 99%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

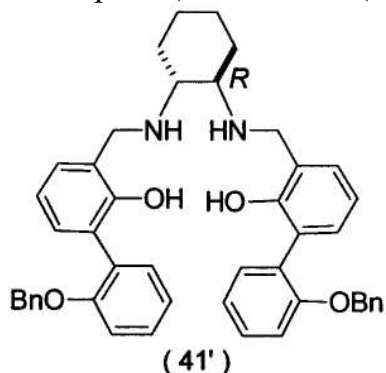
Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,8 мл/мин, температура

колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 12,1 минута, энантиомер - 11,3 минут, измеренная длина волны: 225 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,26 (с,3H), 1,59 (с,3H), 3,53 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 3,90 (д, $J=4,4$ Гц, 1H), 3,95 (с, 3H), 7,08 (с, 1H), 7,33 (с, 1H).

Пример 8

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопирана (Соединения (V), * означает относительную конфигурацию)



Тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$) (5,7 мг, 0,020 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (0,9 мл) саланового лиганда (14 мг, 0,020 ммоль), представленного формулой (41'), при 20°C. После перемешивания в течение 1 часа при 20°C, к раствору добавляли 2,2-диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопиран (0,118 г, 0,50 ммоль). 30% водный раствор пероксида водорода (0,085 г, 0,75 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции и брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (V) составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 18,3 минут, энантиомер - 17,5 минут, измеренная длина волны: 225 нм.

Пример 9

Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопирана (Соединения (V'), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопиран (0,47 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (7 мл) оптически активного комплекса титана-салан (E) (48 мг, 0,040 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции, и к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5 мл), после чего

органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (V') в виде желтоватого масла (0,48 г, выход: 96%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 17,5 минут, энантиомер - 18,3 минут, измеренная длина волны: 225 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,26 (с,3H), 1,58 (с,3H), 3,54 (д, J=4,5 Гц, 1H), 3,91 (д, J=4,5 Гц, 1H), 3,95 (с,3H), 7,09 (с,1H), 7,32 (с,1H).

Пример 10

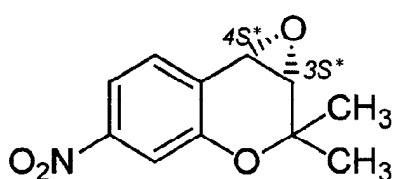
Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопирана (Соединения (V'), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-нитро-6-метокси-2H-1-бензопиран (0,47 мг, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (8 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (A) (71 мг, 0,040 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора при 25°C добавляли в течение 2 секунд 30% водный раствор пероксида водорода (0,24 г, 2,1 ммоль). Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 18 часов после начала реакции брали образец реакционного раствора, и степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (V') составляла 99% или более, оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,8 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 11,3 минут, энантиомер - 12,1 минут, измеренная длина волны: 225 нм.

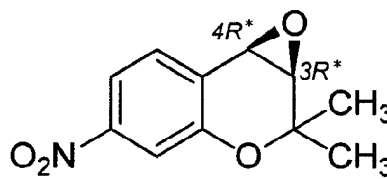
Пример 11

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VI), * означает относительную конфигурацию)



(VI)

или



(VI')

2,2-Диметил-7-нитро-2H-1-бензопиран (0,21 мг, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (B) (36 мг, 0,020 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль). Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 25°C в течение 27 часов

после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (2 мл) и дистиллированную воду (2 мл), после чего органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном (2 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VI) в виде желтоватого порошка (0,43 г, выход: 99%, оптическая чистота: 99,9% э.и.).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH, элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 9,2 минуты, энантиомер - 4,9 минуты, измеренная длина волны: 220 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,29 (с,3H), 1,62 (с,3H), 3,58 (д, J=4,4 Гц, 1H), 3,97 (д, J=4,4 Гц, 1H), 7,50 (д, J=8,3 Гц, 1H), 7,67 (дд, J=8,3, 2,2 Гц, 1H), 7,80 (д, J=2,2 Гц, 1H).

Пример 12

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VI), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-нитро-2H-1-бензопиран (0,41 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (6 мл) оптически активного комплекса титана-салана (F) (48 мг, 0,040 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,25 г, 2,2 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5 мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VI) в виде желтоватых кристаллов (0,44 г, выход: 98%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 25,2 минут, энантиомер - 13,9 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,29 (с,3H), 1,61 (с,3H), 3,60 (д, J=4,5 Гц, 1H), 3,99 (д, J=4,5 Гц, 1H), 7,52 (д, J=8,3 Гц, 1H), 7,62 (д, J=2,1 Гц, 1H), 7,70 (дд, J=8,3, 2,1 Гц, 1H).

Пример 13

Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VI), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-нитро-2H-1-бензопиран (0,21 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) оптически активного комплекса титана-салалена (A) (36 мг, 0,020 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора, в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль) при 25°C. Затем реакционный раствор оставляли для непрерывного перемешивания при 25°C.

Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 24 часов после начала реакции брали образец реакционного раствора, и степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (VI) составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH, элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 4,9 минуты, энантиомер - 9,2 минуты, измеренная длина волны: 220 нм.

Пример 14

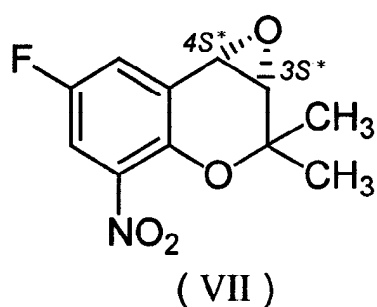
Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-нитро-2Н-1-бензопирана (Соединения (VI)'), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-нитро-2Н-1-бензопиран (0,205 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (3 мл) оптически активного комплекса титана-салаана (Е) (24 мг, 0,020 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. После перемешивания раствора в течение 24 часов после начала реакции при 20°C брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (VI') составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

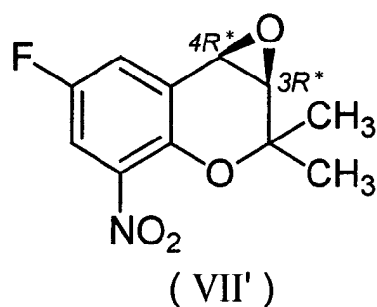
Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 13,9 минут, энантиомер - 25,2 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

Пример 15

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-6-фтор-3,4-дигидро-2,2-диметил-8-нитро-2Н-1-бензопирана (Соединения (VII)'), * означает относительную конфигурацию)



или



6-Фтор-2,2-диметил-8-нитро-2Н-1-бензопиран (0,23 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (В) (37 мг, 0,021 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль). Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 25°C в течение 29 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору

добавляли дихлорметан (2 мл) и дистиллированную воду (2 мл), после чего органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном (2 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта.

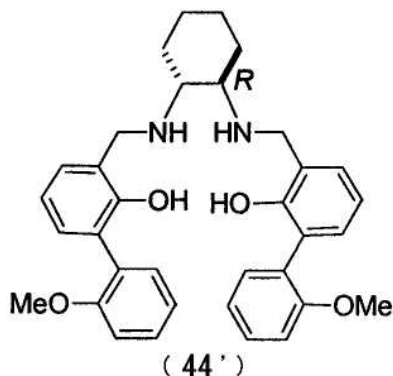
Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VII) в виде желтоватого порошка (0,23 г, выход: 94%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 17,4 минут, энантиомер - 18,1 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,33 (с,3H), 1,64 (с,3H), 3,57 (д, J=4,4 Гц, 1H), 3,94 (д, J=4,4 Гц, 1H), 7,35 (дд, J=4,4, 7,1 Гц, 1H), 7,56 (дд, J=4,4, 7,9 Гц, 1H).

Пример 16

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-6-фтор-3,4-дигидро-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VII), * означает относительную конфигурацию)



Тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$) (11 мг, 0,040 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (1,7 мл) саланового лиганда (43 мг, 0,080 ммоль) (4,0 моль% по отношению к субстрату), представленного формулой (44'), при 25°C.

После перемешивания в течение 1 часа при 20°C, к раствору добавляли 6-фтор-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопиран (0,446 г, 2,0 ммоль). 30% водный раствор пероксида водорода (0,25 г, 2,2 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, добавляли первую часть при 20°C, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 40 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5 мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VII) в виде желтоватого масла (0,43 г, выход: 90%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура

колонок: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 16,8 минут, энантиомер - 17,3 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,33 (с,3H), 1,63 (с,3H), 3,60 (д, J=4,5 Гц, 1H), 3,98 (д, J=4,5 Гц, 1H), 7,38 (дд, J=3,0, 7,4 Гц, 1H), 7,54 (дд, J=3,0, 7,4 Гц, 1H).

Пример 17

Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпоксид-6-фтор-3,4-дигидро-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VII)'), * означает относительную конфигурацию)

6-Фтор-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопиран (0,23 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (А) (37 мг, 0,021 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 25°C. При перемешивании реакционного раствора, в течение 2 секунд добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль) при 25°C. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 3 часа после начала реакции брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (VII') составляла 76%, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура колонок: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 18,1 минуты, энантиомер - 17,4 минуты, измеренная длина волны: 220 нм.

Пример 18

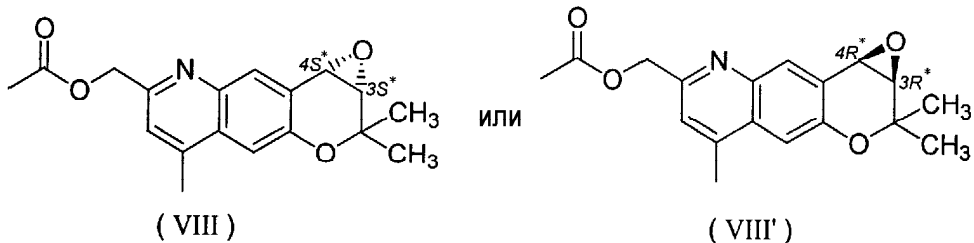
Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпоксид-6-фтор-3,4-дигидро-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопирана (Соединения (VII)'), * означает относительную конфигурацию)

6-Фтор-2,2-диметил-8-нитро-2H-1-бензопиран (0,23 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (3 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (Е) (24 мг, 0,020 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,12 г, 1,1 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. После перемешивания раствора в течение 24 часов после начала реакции при 20°C брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (VII') составляла 96%, а оптическая чистота составляла 99% э.и. или более.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 0,5 мл/мин, температура колонок: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 17,3 минут, энантиомер - 16,8 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

Пример 19

Синтез (3R*,4R*)-(3,4-эпоксид-2,2,9-триметил-3,4-дигидро-2H-пирано(2,3-г)хинолин-7-ил)метилацетата (Соединения (VIII)'), * означает относительную конфигурацию)



(2,2,9-Триметил-2Н-пирано(2,3-*g*)хинолин-7-ил)метилацетат (0,61 г, 2,1 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (3 мл) оптически активного комплекса титана-салаалена (А) (71 мг, 0,040 ммоль) (1,9 моль% по отношению к субстрату) при 28°C. При перемешивании реакционного раствора в течение 10 часов добавляли 7,5% водный раствор пероксида водорода (1,4 г, 3,1 ммоль). Начало первого добавления 7,5% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 12 часов после начала реакции снова добавляли 7,5% водный раствор пероксида водорода (0,1 г, 0,2 ммоль) при 28°C, а затем полученный раствор перемешивали при 28°C в течение 14 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (6 мл) и дистиллированную воду (6 мл), после чего органический слой отделяли. Органический слой, экстрагированный из водного слоя дихлорметаном (6 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VIII') в виде желтоватого масла (0,65 г, выход: 99%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH, элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 3,9 минут, энантиомер - 9,3 минут, измеренная длина волны: 254 нм.

$$^1\text{H-NMR (CDCl}_3\text{)} \delta: 1,30 \text{ (c, 3H)}, 1,65 \text{ (c, 3H)}, 2,19 \text{ (c, 3H)}, 2,62 \text{ (д, J=0,8 Гц, 3H)}, 3,61 \text{ (д, J=4,4 Гц, 1H)}, 4,15 \text{ (д, J=4,4 Гц, 1H)}, 5,30 \text{ (c, 2H)}, 7,26 \text{ (c, 1H)}, 7,32 \text{ (c, 1H)}, 8,10 \text{ (c, 1H)}.$$

Пример 20

Синтез (3S*,4S*)-(3,4-эпокси-2,2,9-триметил-3,4-дигидро-2H-пирано(2,3-g)хинолин-7-ил)метилацетата (Соединения (VIII), * означает относительную конфигурацию)

(2,2,9-Триметил-2Н-пирано(2,3-*g*)хинолин-7-ил)метилацетат (34,2 мг, 0,12 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (1,2 мл) оптически активного комплекса титана-салана (D) (6,2 мг, 0,006 ммоль) (5,0 моль% по отношению к субстрату) при 28°C. При перемешивании реакционного раствора в течение 1 секунды добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (8,5 мг, 0,075 ммоль) при 28°C. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Через 20 минут после начала реакции в течение 1 секунды при 28°C снова добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (8,5 мг, 0,075 ммоль). Полученный раствор непрерывно перемешивали при 28°C, и через 3 часа брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (VIII) составляла 80%, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH, элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт

реакции - 10,2 минуты, энантиомер - 4,1 минуты, измеренная длина волны: 254 нм.

Пример 21

Синтез (3R*,4R*)-(3,4-эпокси-2,2,9-триметил-3,4-дигидро-2H-пирано(2,3-g)хинолин-7-ил)метилацетата (Соединения (VIII)'), * означает относительную конфигурацию)

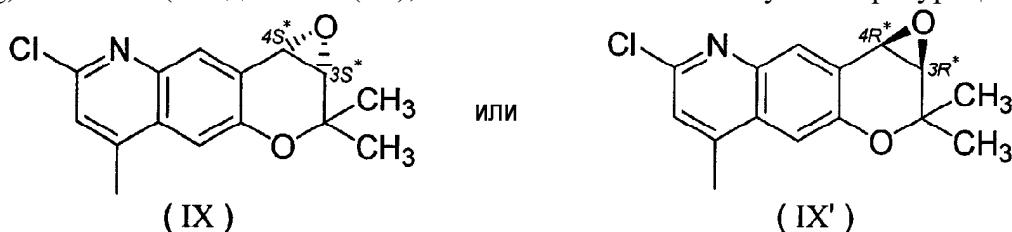
(2,2,9-Триметил-2Н-пирано(2,3-г)хинолин-7-ил)метилацетат (0,595 г, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) оптически активного комплекса титана-салана (Е) (48 мг, 0,040 ммоль)(2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°С. 30% водный раствор пероксида водорода (0,34 г, 3,0 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°С, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали при 20°С в течение 24 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5 мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (VIII') в виде желтоватого порошка (0,61 г, выход: 97%, оптическая чистота: 99,3% э.и.).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 11,2 минут, энантиомер - 26,6 минут, измеренная длина волны: 320 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,30 (с, 3H), 1,65 (с, 3H), 2,19 (с, д, J=1,9 Гц, 3H), 2,60 (с, 3H), 3,60 (дд, J=4,5 Гц, 1,9 Гц, 1H), 4,14 (д, J=4,5 Гц, 1H), 5,30 (с, 2H), 7,25 (с, 1H), 7,31 (с, 1H), 8,10 (с, 1H).

Пример 22

Синтез (3S*,4S*)-7-хлор-3,4-эпоксид-(2,2,9-триметил-3,4-дигидро-2H-пирано(2,3-g)хинолина (Соединения (IX), * означает относительную конфигурацию)



7-Хлор-2,2,9-триметил-2Н-пирано(2,3-*g*)хинолин (0,26 г, 1,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (2 мл) оптически активного комплекса титана-салаана (F) (120 мг, 0,10 ммоль)(10 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,17 г, 1,5 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 26 часов после начала реакции. После завершения реакции, к реакционному раствору добавляли дихлорметан (5 мл) и дистиллированную воду (5

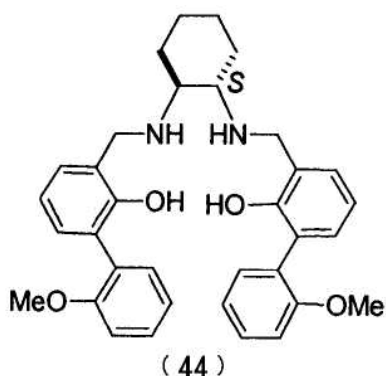
мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (5 мл и 3 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (IX) в виде слегка желтоватого порошка (0,21 г, выход: 77%, оптическая чистота: 99,9% э.и. или более).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 42,1 минут, энантиомер - 21,7 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,30 (с, 3H), 1,64 (с, 3H), 2,56 (с, 3H), 3,61 (д, $J=4,2$ Гц, 1H), 4,13 (д, $J=4,2$ Гц, 1H), 7,15 (с, 1H), 7,27 (с, 1H), 8,00 (с, 1H).

Пример 23

Синтез (3R*,4R*)-7-хлор-3,4-эпокси-(2,2,9-триметил-3,4-дигидро-2H-пирано(2,3-g)хинолина (Соединения (IX')), * означает относительную конфигурацию)



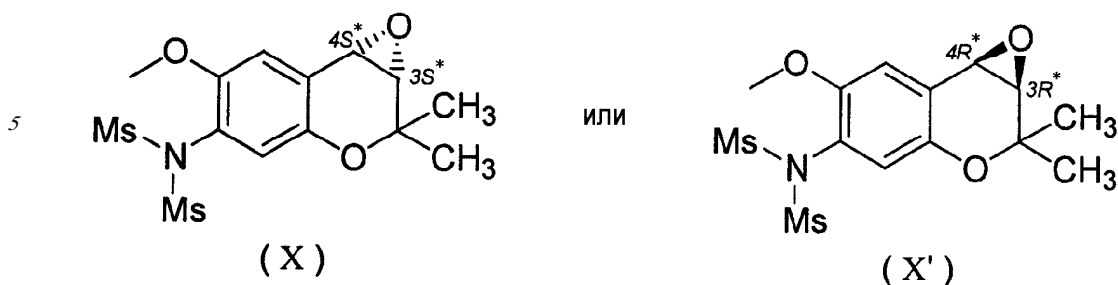
Тетраизопропоксид титана ($\text{Ti}(\text{Oi-Pr})_4$) (2,8 мг, 0,010 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (0,5 мл) саланового лиганда (27 мг, 0,050 ммоль) (10 моль% по отношению к субстрату), представленного формулой (44), при 20°C. После перемешивания в течение 1 часа при 20°C, к раствору добавляли 7-хлор-2,2,9-триметил-2H-пирано(2,3-g)хинолин (0,130 г, 0,50 ммоль) и дихлорметан (1 мл). 30% водный раствор пероксида водорода (0,085 г, 0,75 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. После перемешивания раствора при 20°C в течение 45 часов после начала реакции брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединения (IX') составляла 99% или более, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 mM (pH 8) фосфатно-буферный раствор=6/4 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 21,7 минут, энантиомер - 42,1 минут, измеренная длина волны: 220 нм.

Пример 24

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2H-1-бензопирана (Соединения (X), * означает относительную

конфигурацию)



10

2,2-Диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2Н-1-бензопиран (0,18 г, 0,50 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (1 мл) оптически активного комплекса титана-салана (F) (12 мг, 0,010 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,085 г, 0,75 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Затем, полученный раствор перемешивали при 20°C в течение 30 часов после начала реакции, а затем к реакционному раствору добавляли дихлорметан (2 мл) и дистиллированную воду (2 мл), после чего органический слой отделяли. Органические слои, дважды экстрагированные из водного слоя дихлорметаном (2 мл и 1 мл), и отделенный органический слой объединяли, а затем объединенный слой конденсировали с получением неочищенного продукта. Продукт очищали колоночной хроматографией с получением соединения (X) в виде белого порошка (0,18 г, выход: 97,5%, оптическая чистота: 99% э.и.).

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (рН 8) фосфатно-буферный раствор=3/7 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 19,8 минут, энантиомер - 18,6 минут, измеренная длина волны: 320 нм.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ: 1,26 (с,3H), 1,55 (с,3H), 3,35 (с,3H), 3,42 (с,3H), 3,49 (д, J=4,5 Гц, 1H), 3,88 (с,3H), 3,88 (д, J=4,5 Гц, 1H), 6,77 (с,1H), 7,00 (с,1H).

Пример 25

Синтез (3R*,4R*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2Н-1-бензопирана (Соединения (X')), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2Н-1-бензопиран (72 мг, 0,20 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (1 мл) оптически активного комплекса титана-салана (Е) (12 мг, 0,010 ммоль) (2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,034 г, 0,30 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Раствор перемешивали при 20°C в течение 48 часов после начала реакции и брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (X') составляла 99%, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (pH 8) фосфатно-буферный раствор=3/7 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 18,5 минут, энантиомер - 20,0 минут, измеренная длина волны: 320 нм.

Пример 26

Синтез (3S*,4S*)-3,4-эпокси-3,4-дигидро-2,2-диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2Н-1-бензопирана (Соединения (X), * означает относительную конфигурацию)

2,2-Диметил-7-диметансульфониламино-6-метокси-2Н-1-бензопиран (72 мг, 0,20 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (0,5 мл) оптически активного комплекса титана-саладена (С) (16 мг, 0,010 ммоль)(2,0 моль% по отношению к субстрату) при 20°C. 30% водный раствор пероксида водорода (0,034 г, 0,30 ммоль) разделяли на три равные части, и при перемешивании реакционного раствора, сначала, при 20°C, добавляли первую часть, через 30 минут добавляли вторую часть, а еще через 1 час добавляли третью часть. Начало первого добавления 30% водного раствора пероксида водорода определяли как начало реакции. Раствор перемешивали при 20°C в течение 24 часов после начала реакции и брали образец реакционного раствора. Степень превращения реакции взятого образца анализировали с помощью ВЭЖХ. Степень превращения в соединение (X) составляла 83%, а оптическая чистота составляла 99% э.и.

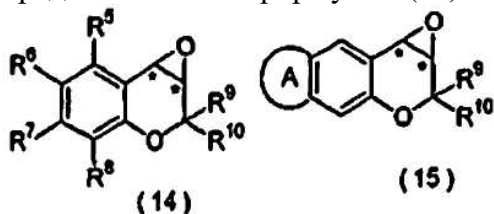
Аналитические условия: название колонки: CHIRALPAK AD-RH (три колонки, последовательно соединенные друг с другом), элюент: ацетонитрил/20 мМ (pH 8) фосфатно-буферный раствор=3/7 (об./об.), скорость потока: 1,0 мл/мин, температура колонки: 40°C, время удерживания: продукт реакции - 19,8 минут, энантиомер - 18,6 минут, измеренная длина волны: 320 нм.

ПРОМЫШЛЕННОЕ ПРИМЕНЕНИЕ

В соответствии с настоящим изобретением, оптически активное соединение оксида хрома, имеющее высокую оптическую чистоту, составляющую 99% э.и. или более, может быть получено с высоким выходом, то есть 90% или более, без осуществления процедуры оптического разделения нужного соединения, и такое соединение может быть с успехом использовано в качестве важного промежуточного соединения для получения соединения бензопирана, которое является эффективным для лечения аритмии. А поэтому настоящее изобретение имеет промышленное применение.

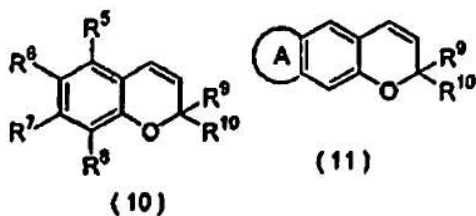
Формула изобретения

1. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома, представленного формулой (14) или формулой (15):



(где R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ и А являются такими, как описано ниже, а абсолютная конфигурация атомов углерода, обозначенных *, означает (R) или (S)), где указанный способ включает:

асимметрическое эпоксидирование соединения хрома, представленного формулой (10) или формулой (11), с окислителем в растворителе;

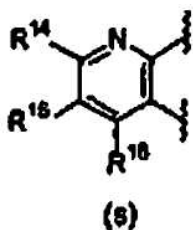


(где каждый из R^5 , R^6 , R^7 и R^8 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилоксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкилкарбонил(N- C_{1-4} алкил)аминогруппу (алкилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкоксикарбонильную группу (алкоксикарбонильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), формильную группу, карбамоильную группу, C_{1-4} алкилсульфонильную группу (алкилсульфонильная группа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой), сульфоамильную группу, C_{1-4} алкилсульфонамидную группу (алкилсульфонамидная группа может быть замещена атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой) или бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);

каждый из R^9 и R^{10} в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода или C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой);

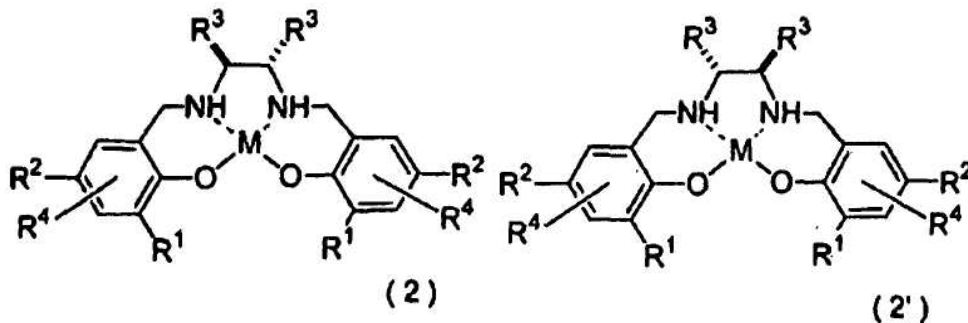
каждый из R^9 и R^{10} в формуле (11) независимо представляет собой атом водорода, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена или C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена) или гидроксигруппой));

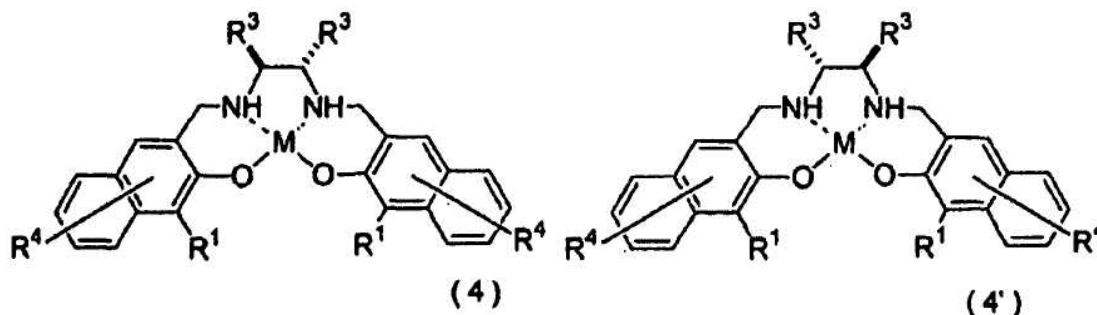
соединение хрома, представленное формулой (11), у которого неполная циклическая структура А представлена формулой (s):



(где каждый из R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (s) независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть
необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа
может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой,
гидроксигруппой, C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди-
 C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппой,
 C_{1-6} алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная
группа могут быть необязательно замещены атомом галогена),
 C_{1-6} алкилкарбониламиногруппой, C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группой,
 C_{1-6} алкоксикарбонильной группой, C_{1-6} алкилсульфонильной группой
(циклоалкилкарбонильная группа, алкоксикарбонильная группа и
алкилсульфонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)
или карбоксильной группой), C_{3-8} циклоалкильную группу (циклоалкильная группа
может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой
(алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена),
аминогруппой или гидроксигруппой), C_{1-6} алкоксигруппу (алкоксигруппа может
быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой
(алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена),
карбоксильной группой, аминогруппой или гидроксигруппой),
 C_{1-6} тиоалкоксигруппу (тиоалкоксигруппа может быть необязательно замещена
атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно
замещена атомом галогена), карбоксильной группой или гидроксигруппой),
гидроксигруппу, C_{6-14} арильную группу, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппу,
нитрогруппу, цианогруппу, формильную группу, формаимидную группу,
аминогруппу, сульфогруппу, C_{1-6} алкиламиногруппу, ди- C_{1-6} алкиламиногруппу,
 C_{1-6} алкилкарбониламиногруппу, C_{1-6} алкилсульфонамидную группу,
карбамоильную группу, C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, ди-
 C_{1-6} алкиламинокарбонильную группу, C_{1-6} алкилкарбонильную группу,
 C_{1-6} алкоксикарбонильную группу, сульфоамидную группу,
 C_{1-6} алкилсульфонильную группу или карбоксильную группу);

где вышеуказанное эпоксицирование осуществляют с использованием любых
оптически активных комплексов титана, представленных формулой (2), формулой
(2'), формулой (4) и формулой (4'), в качестве катализатора,





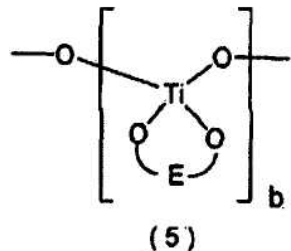
10 где R^1 в формуле (2), формуле (2'), формуле (4) и формуле (4') представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, C_{6-12} арилоксигруппу или C_{6-22} арильную группу (арильная группа может быть
15 необязательно замещена, C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой, и является оптически активным или оптически неактивным);

R^2 представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу или C_{1-4} алкоксигруппу;

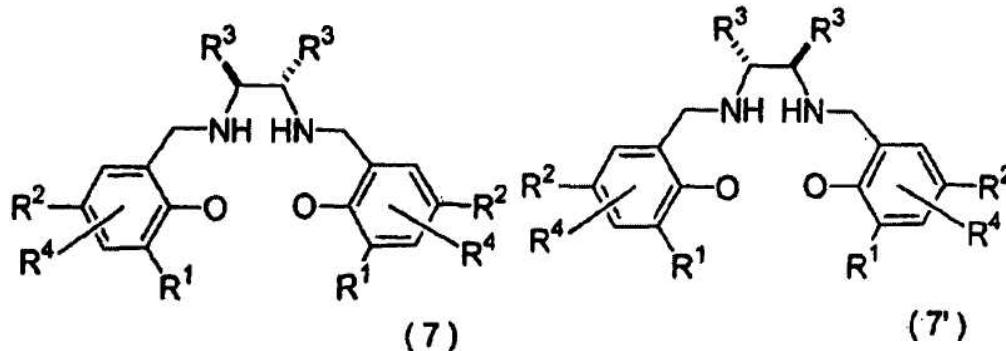
20 R^3 представляет собой C_{1-4} алкильную группу или двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

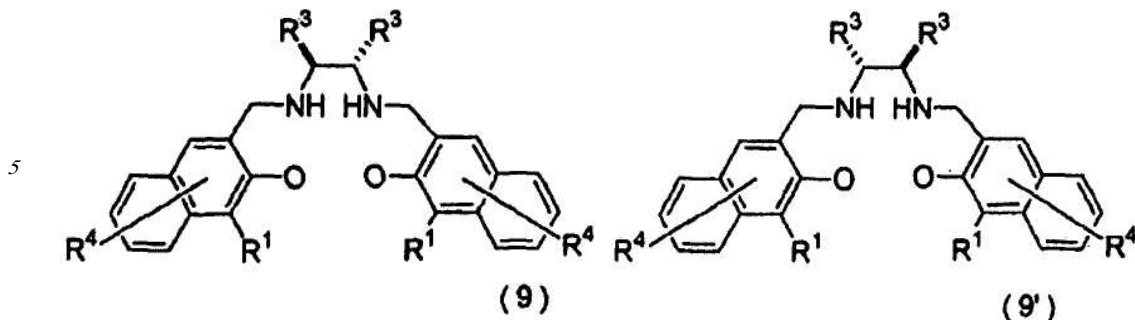
каждый из R^4 независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу;

25 М представляет собой TiJ^1J^2 (в TiJ^1J^2 , Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляет собой атом галогена или C_{1-4} алкоксид, или J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)



35 (где, в неполной структуре О-Е-О, О представляет собой атом кислорода, а группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7), соответствующей формуле (2); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (7'),
40 соответствующей формуле (2'); группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа О-Е-О представлена нижеследующей формулой (9'), соответствующей формуле (4'); и





10 б представляет собой целое число 1, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как они были определены выше)).

2. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.1, где соединение хрома, представленное формулой (10), подвергают асимметрической
15 реакции эпексидирования в растворителе с окислителем с использованием оптически активного комплекса титана, представленного формулой (2), формулой (2'), формулой (4) или формулой (4'), в качестве катализатора,

 где каждый из R^5 и R^6 в формуле (10) независимо представляет собой атом
20 водорода, цианогруппу, нитрогруппу, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа,
25 алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкоксигруппу (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена, гидроксигруппой, цианогруппой, нитрогруппой, C_{1-4} алкоксигруппой, C_{1-4} алкилкарбонилксигруппой, C_{1-4} алкилкарбониламиногруппой или C_{1-4} алкоксикарбонильной группой
30 (алкоксигруппа, алкилкарбонилксигруппа, алкилкарбониламиногруппа и алкоксикарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена)), C_{1-4} алкилкарбониламиногруппу (алкилкарбониламиногруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-4} алкилкарбонил(N-
35 C_{1-4} алкил)аминогруппу (алкилкарбонил(N-алкил)аминогруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), карбамоильную группу, бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);

R^7 в формуле (10) представляет собой атом водорода, цианогруппу, нитрогруппу, бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу (алкилсульфон бис(алкилсульфон)имидной группы может быть замещен атомом галогена, C_{1-4} алкильной группой, C_{1-4} алкоксигруппой, цианогруппой или нитрогруппой);
45

R^8 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или C_{1-4} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена); и

R^9 и R^{10} в формуле (10) представляют собой C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена).
50

3. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.2, где каждый из R^5 и R^6 в формуле (10) независимо представляет собой атом водорода,

нитрогруппу, атом фтора, метоксигруппу, метилкарбониламиногруппу или метилкарбонил(N-этил)аминогруппу; R^7 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или бис(C_{1-4} алкилсульфон)имидную группу; R^8 в формуле (10) представляет собой атом водорода, нитрогруппу или трифторметильную группу; а R^9 и R^{10} в формуле (10) представляют собой метильную группу.

4. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.1, где R^9 и R^{10} в формуле (11) представляют собой метильную группу.

5. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.1, где каждый из R^{14} , R^{15} и R^{16} в формуле (s) независимо представляет собой атом водорода, атом галогена или C_{1-6} алкильную группу (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена, C_{1-6} алкоксигруппой (алкоксигруппа может быть необязательно замещена атомом галогена), аминогруппой, гидроксигруппой, C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, ди- C_{1-6} алкиламинокарбонильной группой, C_{1-6} алкилкарбонилоксигруппой, C_{1-6} алкилкарбонильной группой (алкилкарбонилоксигруппа и алкилкарбонильная группа могут быть необязательно замещены атомом галогена), C_{1-6} алкилкарбониламиногруппой, C_{3-8} циклоалкилкарбонильной группой или C_{1-6} алкоксикарбонильной группой).

6. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.1, где R^1 в формуле (2), формуле (2'), формуле (4) и в формуле (4') представляет собой C_{6-22} арильную группу (арильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), C_{1-7} алкоксигруппой или бензилоксигруппой, и является оптически активным или оптически неактивным);

R^2 представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу или C_{1-4} алкоксигруппу;

R^3 представляет собой C_{1-4} алкильную группу или двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

каждый из R^4 независимо представляет собой атом водорода, атом галогена, C_{1-4} алкильную группу, C_{1-4} алкоксигруппу, нитрогруппу или цианогруппу; и

M представляет собой TiJ^1J^2 (где Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляет собой атом галогена или C_{1-4} алкоксид, или J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, или J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)

(где, в неполной структуре O-E-O, O представляет собой атом кислорода, а группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (7), соответствующей формуле (2); группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (9'), соответствующей формуле (4'));

b представляет собой целое число 1, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как они были определены выше).

7. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.6, где R^1 в формуле (2), формуле (2'), формуле (4) и формуле (4') представляет собой

фенильную группу (фенильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена), бензилоксигруппой или C_{1-4} алкоксигруппой) или нафтильную группу (нафтильная группа может быть необязательно замещена C_{1-4} алкильной группой (алкильная группа может быть необязательно замещена атомом галогена) или C_{1-7} алкоксигруппой);

R^2 представляет собой атом водорода;

R^3 представляет собой двухвалентную C_{3-5} группу, где два R^3 , взятые вместе, образуют кольцо;

R^4 представляет собой атом водорода, и

M представляет собой TiJ^1J^2 (где Ti представляет собой атом титана, а каждый из J^1 и J^2 независимо представляет собой атом галогена или C_{1-4} алкоксид, или J^1 и J^2 , взятые вместе, представляют собой атом кислорода, либо J^1 и J^2 , взятые вместе, образуют кольцо, представленное двухвалентной группой формулы (5)

(где, в неполной структуре O-E-O, O представляет собой атом кислорода, а группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (7), соответствующей формуле (2); группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (7'), соответствующей формуле (2'); группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (9), соответствующей формуле (4); и группа O-E-O представлена приведенной выше формулой (9'), соответствующей формуле (4'); b представляет собой целое число 1, а R^1 , R^2 , R^3 и R^4 являются такими, как они были определены выше)).

8. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где количество используемого оптически активного комплекса титана по отношению к количеству соединения хрома, представленного формулой (10) или формулой (11), составляет 0,001-100 мол. %.

9. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где растворителем, используемым для асимметрического эпоксицирования, является галогеновый растворитель, ароматический углеводородный растворитель, сложноэфирный растворитель, эфирный растворитель, нитриловый растворитель, спиртовой растворитель или их смеси.

10. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где окислителем, используемым в асимметрической реакции эпоксицирования, является иодозобензол, гипохлорит натрия, м-хлорпербензойная кислота, смесь пероксимоносульфата калия, дисульфата калия и сульфата калия, водный раствор пероксида водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (УНР), оксазиридин, N-метилморфолиноксид (NMO), трет-бутилгидропероксид (ТВНР), гидропероксид кумола (СНР) или их смеси.

11. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.10, где окислителем, используемым для асимметрической реакции эпоксицирования, является водный раствор пероксида водорода, продукт присоединения мочевины-пероксида водорода (УНР) или их смеси.

12. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.11, где окислителем, используемым для асимметрической реакции эпоксицирования, является водный раствор пероксида водорода в концентрации 1-100 мас. %.

13. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где количество окислителя, используемого для

асимметрического эпоксицирования, по отношению к количеству соединения хрома, представленного формулой (10) и формулой (11), составляет 1-10 эквивалентов.

5 14. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.13, где способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой постадийное или непрерывное добавление.

15 15. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.14, где способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой непрерывное добавление, скорость которого
10 составляет от 0,01 до 40000 эквивалентов в час.

16. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по п.14, где способ добавления окислителя, используемого для асимметрического эпоксицирования, представляет собой постадийное добавление, где число стадий
15 составляет в пределах от 2 до 100.

17. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где температура реакции асимметрического эпоксицирования составляет от 0°C до температуры перегонки используемого
20 растворителя.

18. Способ получения оптически активного соединения оксида хрома по любому одному из пп.1-7, где давление в реакционной системе асимметрического эпоксицирования составляет от 10 кПа до 1100 кПа.

25

30

35

40

45

50