

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年3月16日(2006.3.16)

【公表番号】特表2005-519118(P2005-519118A)

【公表日】平成17年6月30日(2005.6.30)

【年通号数】公開・登録公報2005-025

【出願番号】特願2003-573002(P2003-573002)

【国際特許分類】

C 07 F	7/08	(2006.01)
C 07 C	29/38	(2006.01)
C 07 C	33/14	(2006.01)
C 07 C	33/20	(2006.01)
C 07 C	41/56	(2006.01)
C 07 C	43/178	(2006.01)
C 07 C	241/02	(2006.01)
C 07 C	243/32	(2006.01)
C 07 F	7/10	(2006.01)

【F I】

C 07 F	7/08	S
C 07 C	29/38	
C 07 C	33/14	
C 07 C	33/20	
C 07 C	41/56	
C 07 C	43/178	A
C 07 C	241/02	
C 07 C	243/32	
C 07 F	7/10	S
C 07 F	7/10	T

【手続補正書】

【提出日】平成18年1月27日(2006.1.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

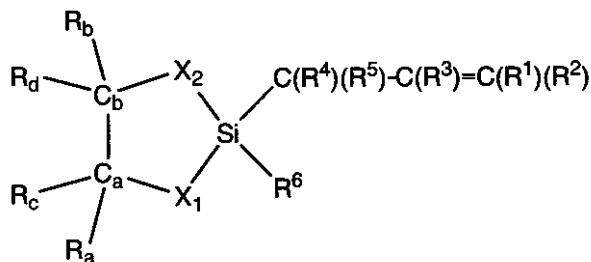
【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

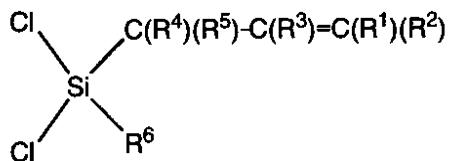
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

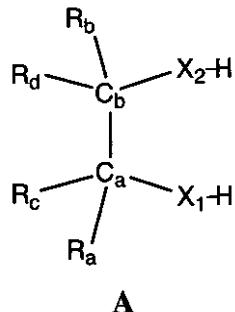
【請求項1】



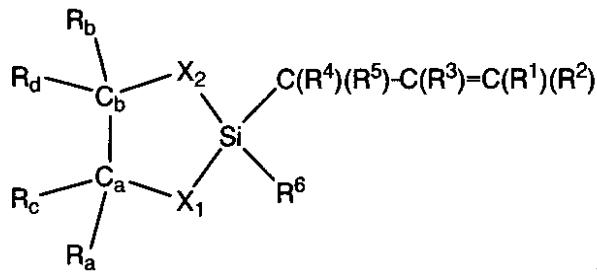
の化学式を有する化合物の作製方法であって、該方法は、



の化学式の化合物を、化学式A



の化合物と反応させ、



の化学式を有する化合物を作製する事からなり、ここで、

X_1 と X_2 は独立に酸素およびN-Rからなる群から選択され；

C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は (i) それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から独立に選択されるか、または、

(ii) 一つにまとまって共に C_3 - C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され：

R^6 はハロゲン、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびSRからなる群から選択され；

RはC₁₋₁₀アルキル、C₆₋₁₀アリール、およびC₃₋₉ヘテロアリールからなる群から選択され
：且つ、

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , および R^5 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される。

上記方法。

【請求項2】

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , および R^5 のそれぞれは水素であり、 R^6 は塩素である、請求項1記載の方

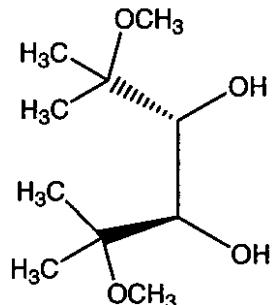
法。

【請求項3】

$X_1 = X_2 = 0$ (酸素) である、請求項1記載の方法。

【請求項4】

化学式Aの化合物は



である、請求項3記載の方法。

【請求項5】

$X_1 = \text{NR}$ であり且つ $X_2 = 0$ である、請求項1記載の方法。

【請求項6】

C_a と C_b は (S) キラル中心である、請求項5記載の方法。

【請求項7】

C_a と C_b は (R) キラル中心である、請求項5記載の方法。

【請求項8】

R はメチル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択された、請求項5記載の方法

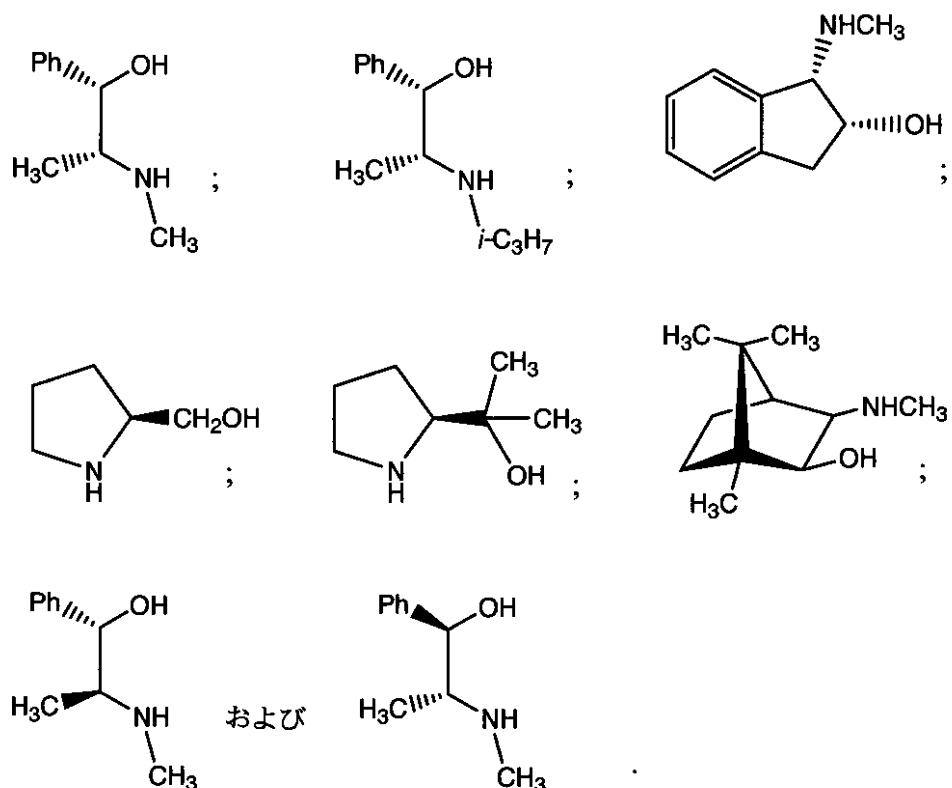
。

【請求項9】

R_a と R_b のそれぞれは独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d のそれぞれは独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項8記載の方法。

【請求項10】

化学式Aの化合物は、



なる群から選択される、請求項 5 記載の方法。

【請求項 1 1】

$X_1 = X_2 = \text{NR}$ である、請求項 1 記載の方法。

【請求項 1 2】

C_a と C_b は (S) キラル中心である、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 3】

C_a と C_b は (R) キラル中心である、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 4】

R はメチル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択された、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 5】

R_a と R_b のそれぞれは独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ水素である、請求項 1 4 記載の方法。

【請求項 1 6】

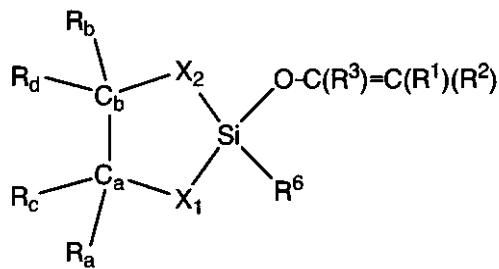
R_a と R_b は一つにまとまって共に C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 7】

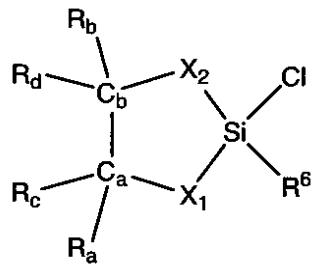
化学式 A の化合物は、(1R,2R)-N,N-ジベンジル-シクロヘキサン-1,2-ジアミン、(1R,2R)-N,N-ジ(p-ブロモベンジル)-シクロヘキサン-1,2-ジアミン、および(1R,2R)-N,N-ジ(p-メトキシベンジル)-シクロヘキサン-1,2-ジアミンからなる群から選択される、請求項 1 6 記載の方法。

【請求項 1 8】

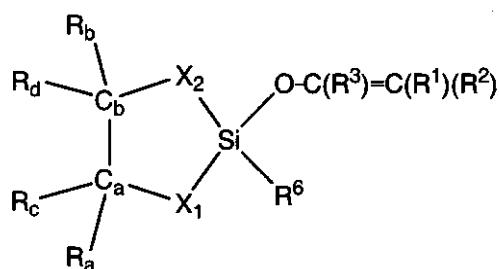
下記の化学式



を有する化合物を作製するための方法であって、該方法は下記の化学式



の化合物を、化学式 $\text{Li-O-C(R}^3\text{)=C(R}^1\text{)(R}^2\text{)}$ のリチウムエノラート1当量と反応させて下記の化学式



,

を有する化合物を作製する事からなり、

ここで、 X_1 と X_2 のそれぞれは独立に O(酸素) と N-R からなる群から選択され；

C_a と C_b のそれぞれは独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は (i) それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは

(ii) 一つにまとまって共に C_{3-4} アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^6 はハロゲン、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルコキシアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、および $O-C(R^3)=C(R^2)(R^1)$ 、および SR からなる群から選択され；

R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

R^1 、 R^2 および R^3 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される。

上記方法。

【請求項 1 9】

R^1 , R^2 および R^3 はそれぞれ水素であり、 R^6 は塩素である、請求項 1 8 記載の方法。

【請求項 2 0】

$X_1=X_2=0$ (酸素) である、請求項 1 8 記載の方法。

【請求項 2 1】

$R_c=R_d=H$ (水素) であり且つ $R_a=R_b=2$ -メトキシ-2-プロピルである、請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 2】

$X_1=NR$ であり且つ $X_2=0$ (酸素) である、請求項 1 8 記載の方法。

【請求項 2 3】

C_a と C_b はそれぞれ (S) キラル中心である、請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 2 4】

C_a と C_b はそれぞれ (R) キラル中心である、請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 2 5】

R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 2 6】

R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d のそれぞれはメチルと水素の一つである、請求項 2 5 記載の方法。

【請求項 2 7】

R_c と R_d はそれぞれ水素である、請求項 2 6 記載の方法。

【請求項 2 8】

$X_1=X_2=NR$ である、請求項 1 8 記載の方法。

【請求項 2 9】

C_a と C_b はそれぞれ (S) キラル中心である、請求項 2 8 記載の方法。

【請求項 3 0】

C_a と C_b はそれぞれ (R) キラル中心である、請求項 2 8 記載の方法。

【請求項 3 1】

R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 2 8 記載の方法。

【請求項 3 2】

R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ水素である、請求項 3 1 記載の方法。

【請求項 3 3】

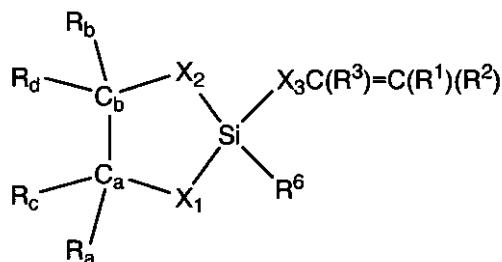
R_a と R_b は一つにまとまって共に C_4 アルキレン鎖を形成し、それは C_a と C_b と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 2 8 記載の方法。

【請求項 3 4】

R はベンジル、p-ブロモベンジル、および p-メトキシベンジルからなる群から選択される、請求項 3 3 記載の方法。

【請求項 3 5】

下記の化学式



を有する化合物であって、

ここで X_3 は 0 (酸素) および $C(R^4)(R^5)$ からなる群から選択され；

X_1 と X_2 のそれぞれは独立に 0 (酸素) および $N-R$ からなる群から選択され；

C_a と C_b のそれぞれは独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は (i) それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii) 一つにまとまって共に C_3-C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^6 はハロゲン、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、 $-O-C(R^9)=C(R^7)(R^8)$ 、 OSO_2CF_3 および SR からなる群から選択され；

R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノおよびハロゲンからなる群から選択される、

上記化合物。

【請求項 3 6】

$X_3=0$ (酸素) である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 3 7】

$X_3=C(R^4)(R^5)$ である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 3 8】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 のそれぞれは水素であり、 R^6 は塩素である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 3 9】

$X_1=X_2=0$ (酸素) である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 4 0】

R_c と R_d はそれぞれ水素であり、 R_a と R_b はそれぞれ 2-メトキシ-2-プロピルであり、 C_a と C_b はそれぞれ (R)キラル中心である、請求項 3 9 記載の化合物。

【請求項 4 1】

$X_1=NR$ であり、 $X_2=0$ (酸素) である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 4 2】

C_a と C_b はそれぞれ (S)キラル中心である、請求項 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 3】

C_a と C_b はそれぞれ (R)キラル中心である、請求項 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 4】

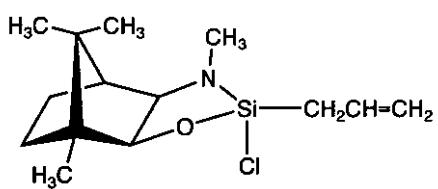
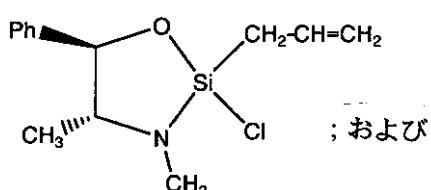
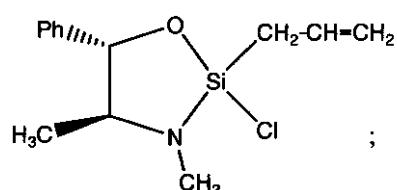
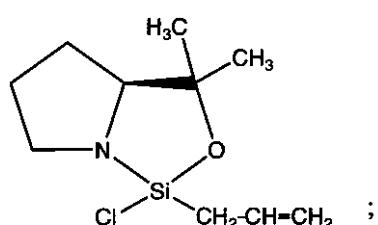
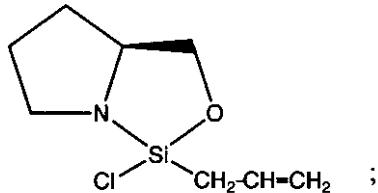
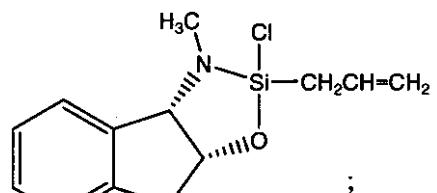
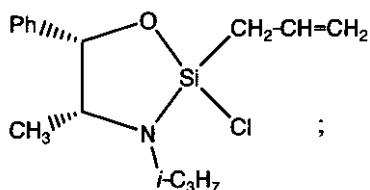
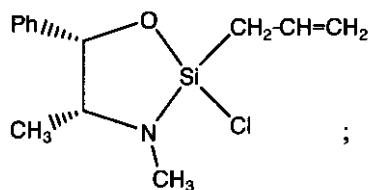
R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 5】

R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項 4 4 記載の化合物。

【請求項 4 6】

下記の化学式



を有する化合物からなる群から選択される、請求項41記載の化合物。

【請求項47】

$X_1 = X_2 = NR$ である、請求項35記載の化合物。

【請求項48】

C_a と C_b はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項47記載の化合物。

【請求項49】

C_a と C_b はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項47記載の化合物。

【請求項50】

Rはメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項47記載の化合物。

【請求項51】

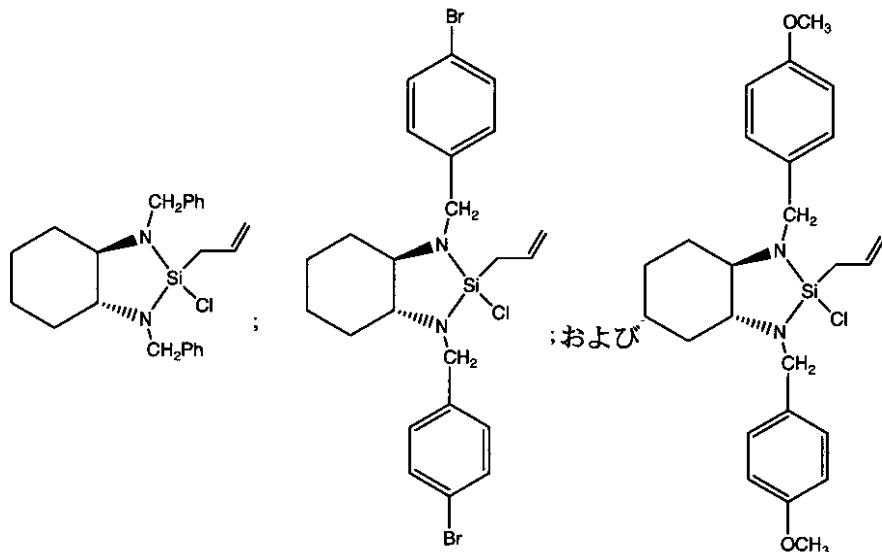
R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 C_c と C_d のそれぞれは水素である、請求項 5 0 記載の化合物。

【請求項 5 2】

R_a と R_b は一つにまとまって共に C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 4 7 記載の化合物。

【請求項 5 3】

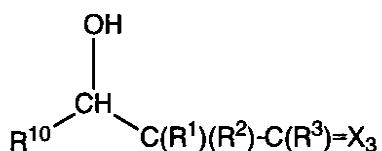
下記の化学式



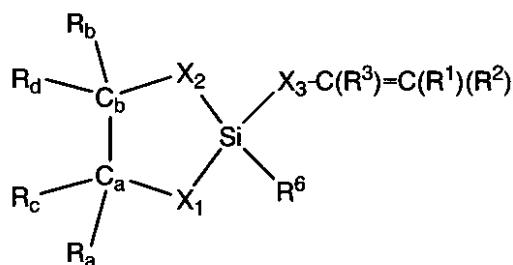
を有する化合物からなる群から選択される、請求項 5 2 記載の化合物。

【請求項 5 4】

下記の化学式



のホモアリリックアルコールを作製する方法であって、該方法は、



の化学式の化合物を、化学式 R^{10}CHO のアルデヒドと反応させて該ホモアリリックアルコールを作製することからなり、ここで：

X_3 は 0 (酸素) および $\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)$ からなる群から選択され；

X_1 と X_2 はそれぞれ独立に 0 (酸素) および $\text{N}-\text{R}$ からなる群から選択され；

C_a と C_b のそれぞれは独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は (i) それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii) 一つにまとまって共に C_3 - C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^6 は、ハロゲン、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルシアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、 OSO_2CF_3 および SR からなる群から選択され；

R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択され；且つ

R^{10} は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択される。

上記方法。

【請求項 5 5】

$X_3=0$ (酸素) である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 5 6】

$X_3=C(R^4)(R^5)$ である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 5 7】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 のそれぞれは水素であり、 R^6 は塩素である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 5 8】

$X_1=X_2=0$ (酸素) である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 5 9】

R_c と R_d はそれぞれ水素であり、 R_a と R_b はそれぞれ 2-メトキシ-2-プロピルであり、 C_a と C_b はそれぞれ (R) キラル中心である、請求項 5 8 記載の方法。

【請求項 6 0】

$X_1=NR$ であり、 $X_2=0$ (酸素) である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 6 1】

C_a と C_b はそれぞれ (S) キラル中心である、請求項 6 0 記載の方法。

【請求項 6 2】

C_a と C_b はそれぞれ (R) キラル中心である、請求項 6 0 記載の方法。

【請求項 6 3】

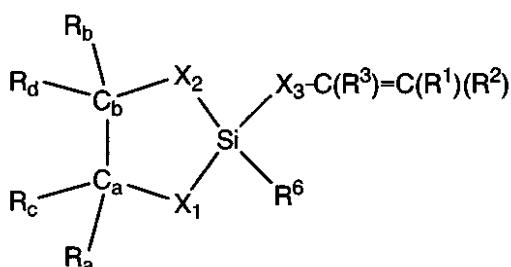
R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 6 0 記載の方法。

【請求項 6 4】

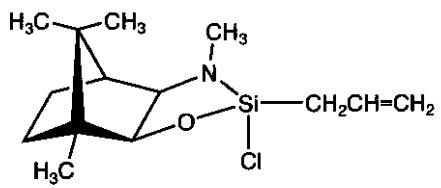
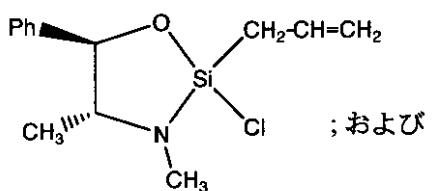
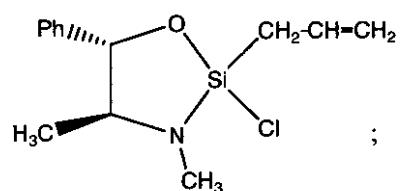
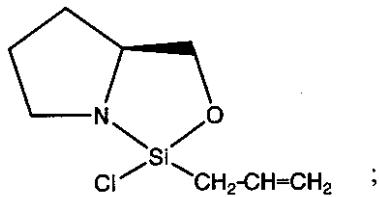
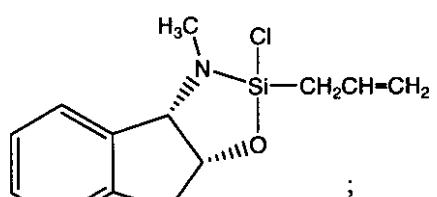
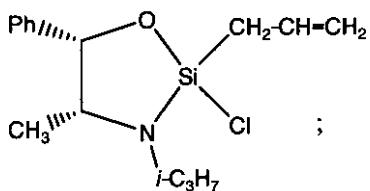
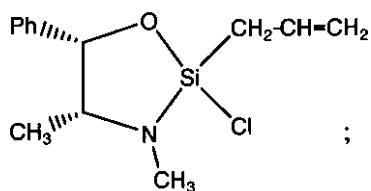
R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項 6 3 記載の方法。

【請求項 6 5】

前記化合物は下記の化学式



の化合物であって、下記



からなる群から選択される、請求項 6 0 記載の方法。

【請求項 6 6】

$X_1 = X_2 = NR$ である、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 6 7】

C_a と C_b はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項 6 6 記載の方法。

【請求項 6 8】

C_a と C_b はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項 6 6 記載の方法。

【請求項 6 9】

Rはメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項6 6記載の方法。

【請求項7 0】

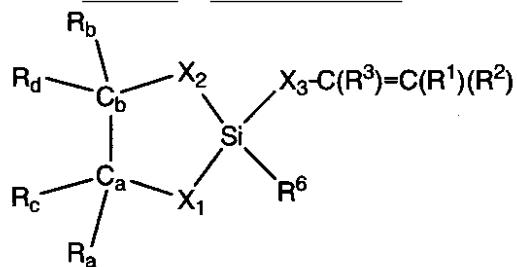
R_aとR_bはそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、R_cとR_dはそれぞれ水素である、請求項6 6記載の方法。

【請求項7 1】

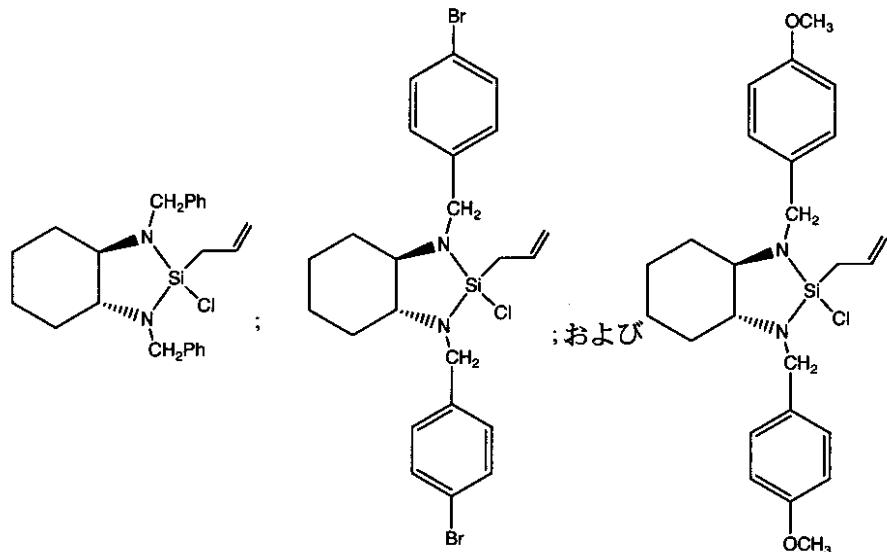
R_aとR_bは一つにまとまって共にC₄アルキレン鎖を形成し、それらはC_aとC_bと共に6員環の脂肪族環を形成する、請求項6 6記載の方法。

【請求項7 2】

前記化合物は下記の化学式



の化合物であって、下記



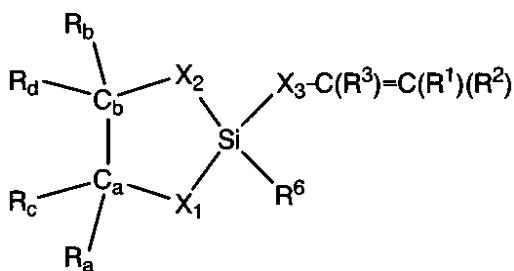
からなる群から選択される、請求項7 1記載の方法。

【請求項7 3】

R¹⁰はメチル、t-ブチル、フェニル、2-フェニルエチル、(E)-2-フェニルエテニル、ベンジルオキシメチル、シクロヘキシル、iso-ブチル、およびトリブチルシリルオキシメチルからなる群から選択される、請求項5 4記載の方法。

【請求項7 4】

下記の化学式の



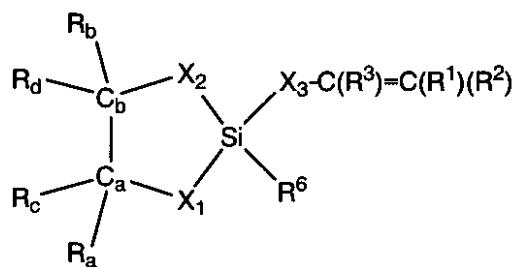
前記化合物は化学式 $R^{10}CHO$ のアルデヒドと溶媒中で反応し、該溶媒はトルエン、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルフォルムアミド、酢酸エチル、ジクロロメタン、ヘキサン、t-ブチルメチルエーテル、ジエチルエーテル、アセトニトリル、およびベンゼンからなる群から選択される、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 7 5】

溶媒中におけるアルデヒドの濃度は約 0.2M である、請求項 7 4 記載の方法。

【請求項 7 6】

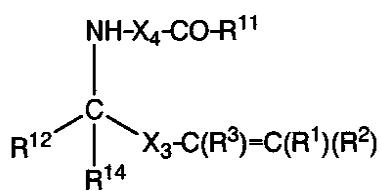
下記の化学式の



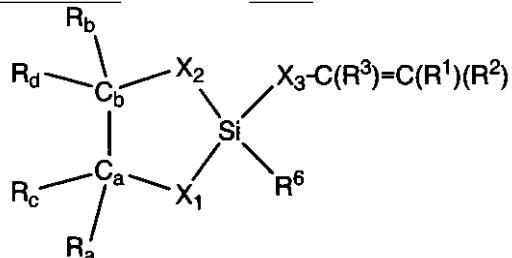
前記化合物は溶媒の非存在下でアルデヒドと反応する、請求項 5 4 記載の方法。

【請求項 7 7】

下記の化学式



を有する化合物を作製する方法であつて、該方法は化学式



の化合物を、化学式 $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$ の化合物と反応させる事からなり、ここで：

X_3 は O (酸素) および $(R^4)(R^5)$ からなる群から選択され；

X_4 は O (酸素) および NH からなる群から選択され；

X_1 と X_2 のそれぞれは独立に O (酸素) および N-R からなる群から選択され；

C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群

から選択され；

R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii)一つにまとまって共に C_{3-4} アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に5員環および6員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^6 はハロゲン、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルコキシアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、 OSO_2CF_3 およびSRからなる群から選択され；

R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択され；

R^{10} は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^{11} は水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールの一つであり；

R^{12} は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

R^{14} は水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 7 8】

$X_3=0$ （酸素）である、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 7 9】

$X_3=C(R^4)(R^5)$ である、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 8 0】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 のそれぞれは水素であり、 R^6 は塩素である、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 8 1】

$X_1=X_2=0$ （酸素）である、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 8 2】

R_c と R_d はそれぞれ水素であり、 R_a と R_b はそれぞれ2-メトキシ-2-プロピルであり、 C_a と C_b はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項 8 1 記載の方法。

【請求項 8 3】

$X_1=NR$ であり、 $X_2=0$ （酸素）である、請求項 8 1 記載の方法。

【請求項 8 4】

C_a と C_b はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項 8 3 記載の方法。

【請求項 8 5】

C_a と C_b はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項 8 3 記載の方法。

【請求項 8 6】

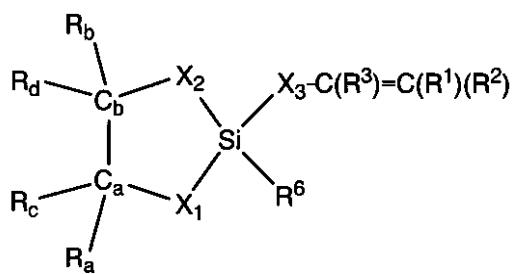
R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 8 3 記載の方法。

【請求項 8 7】

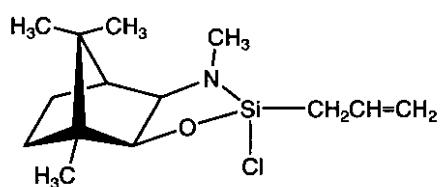
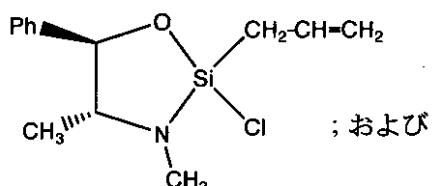
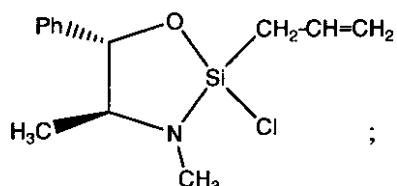
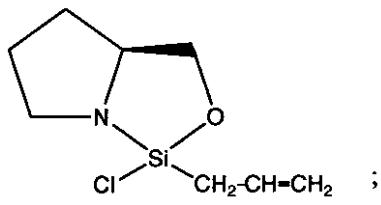
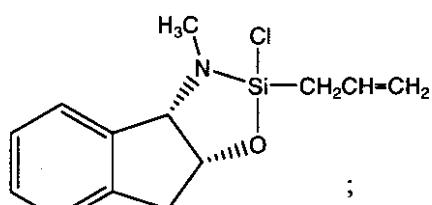
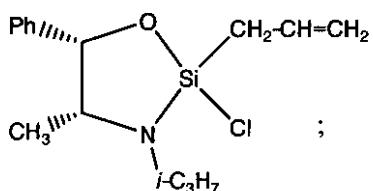
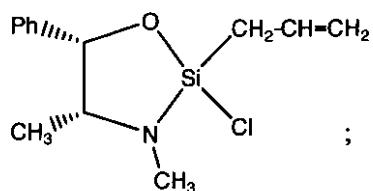
R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項 8 6 記載の方法。

【請求項 8 8】

前記化合物は下記の化学式



の化合物であって、下記



からなる群から選択される、請求項 8 3 記載の方法。

【請求項 8 9】

$X_1 = X_2 = NR$ である、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 9 0】

C_a と C_b はそれぞれ (S) キラル中心である、請求項 8 9 記載の方法。

【請求項 9 1】

C_a と C_b はそれぞれ (R) キラル中心である、請求項 8 9 記載の方法。

【請求項 9 2】

R はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項 8 9 記載の方法。

【請求項 9 3】

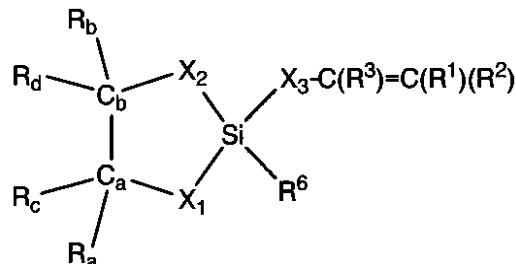
R_a と R_b はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 R_c と R_d はそれぞれ水素である、請求項 9 2 記載の方法。

【請求項 9 4】

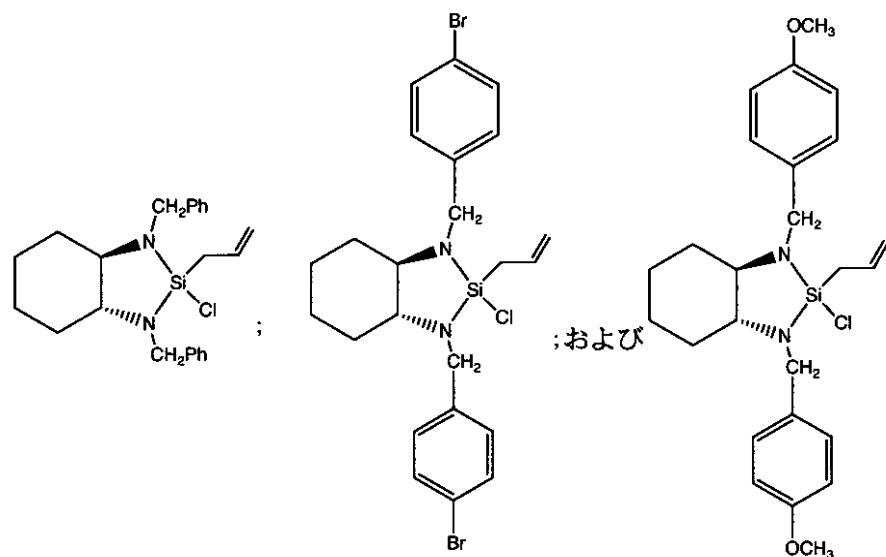
R_a と R_b は一つにまとまって共に C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 8 9 記載の方法。

【請求項 9 5】

前記化合物は下記の化学式



の化合物であって、下記



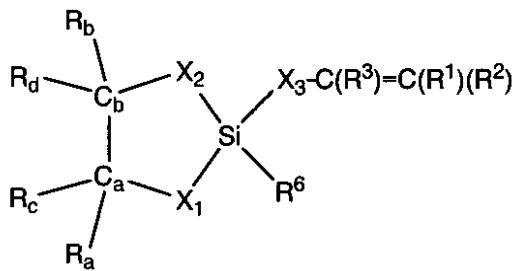
からなる群から選択される、請求項 9 4 記載の方法。

【請求項 9 6】

R^{11} と R^{12} はそれぞれ独立にメチル、t-ブチル、フェニル、2-フェニルエチル、(E)-2-フェニルエテニル、ベンジルオキシメチル、シクロヘキシリル、iso-ブチル、およびトリブチルシリルオキシメチルからなる群から選択される、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 9 7】

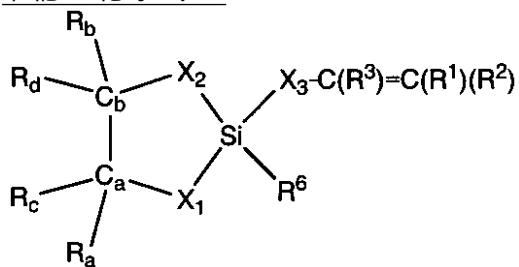
下記の化学式の



前記化合物は化学式 $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$ の化合物と溶媒中で反応し、該溶媒は、トルエン、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルフォルムアミド、酢酸エチル、ジクロロメタン、ヘキサン、t-ブチルメチルエーテル、ジエチルエーテル、アセトニトリル、およびベンゼンからなる群から選択される、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 9 8】

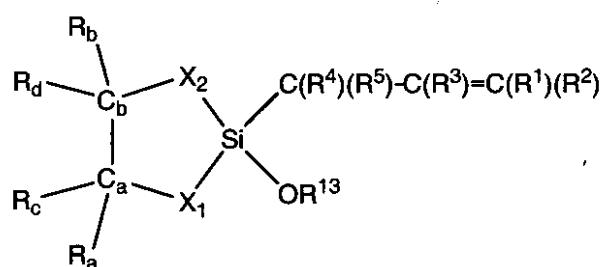
下記の化学式の



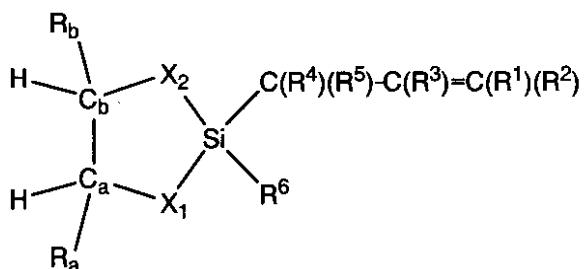
前記化合物は化学式 $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$ の化合物と溶媒の非存在下で反応する、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 9 9】

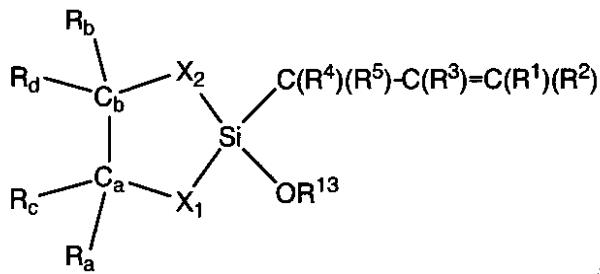
下記の化学式



を有する化合物を作製する方法であって、該方法は、



の化学式の化合物を、塩基の存在下で化学式 HOR^{13} のアルコールと反応させて下記の化学式



,

を有する化合物を作製する事よりなり、ここで：

X_1 と X_2 はそれぞれ独立に O (酸素) および N-R からなる群から選択され；

C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii)一つにまとまって共に C_3-C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^6 はハロゲンおよび OSO_2CF_3 の一つであり；

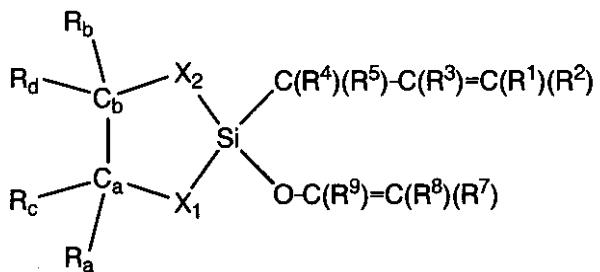
R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 はそれぞれ独立に水素、 $C_{1-C_{10}}$ アルキル、 $C_{6-C_{10}}$ アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 $C_{1-C_{10}}$ アルコキシ、 $C_{6-C_{10}}$ アリールオキシ、 $C_{1-C_{10}}$ ジアルキルアミノ、 $C_{1-C_{10}}$ アルキル- $C_{6-C_{10}}$ アリールアミノ、 $C_{6-C_{10}}$ ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択され；且つ、

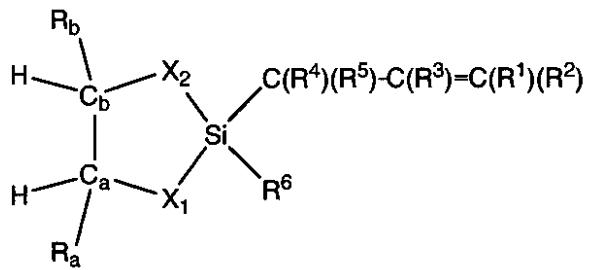
R^{13} は $C_{1-C_{10}}$ アルキル、 $C_{6-C_{10}}$ アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 100】

下記の化学式

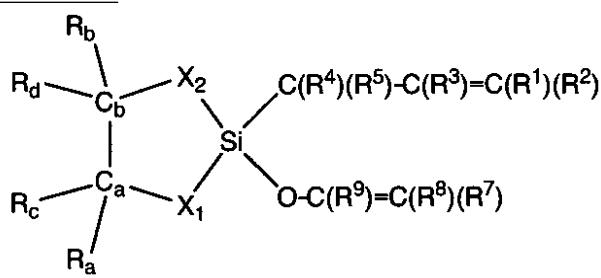


を有する化合物を作製する方法であつて、該方法は、



の化学式の化合物を化学式 $Li-O-C(R^9)=C(R^7)(R^8)$ のリチウムエノラートと反応させて下記

の化学式



,

を有する化合物を作製する事からなり、ここで：

X_1 と X_2 はそれぞれ独立に O(酸素) および N-R からなる群から選択され；

C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii)一つにまとまって共に C_{3-4} アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

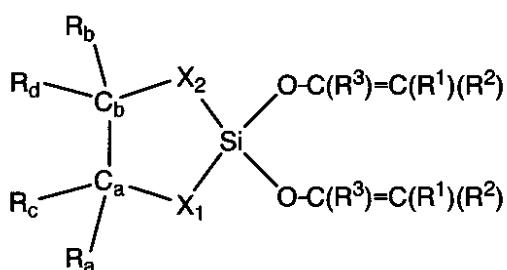
R^6 は、ハロゲンおよび OSO_2CF_3 の一つであり；

R は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

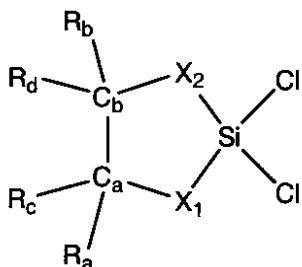
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 101】

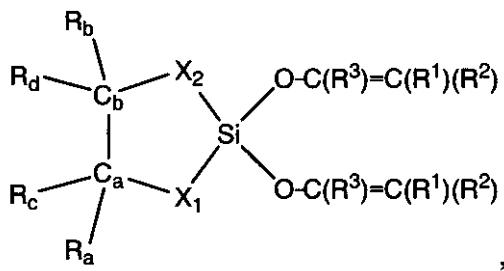
下記の化学式



を有する化合物を作製する方法であつて、該方法は、



の化学式の化合物を化学式 $Li-O-C(R^3)=C(R^1)(R^2)$ のリチウムエノラート 2 当量と反応させて、下記の化学式



,

を有する化合物を作製する事からなり、ここで：

X_1 と X_2 はそれぞれ独立に O (酸素) および N-R からなる群から選択され；

C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；

R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、

(ii)一つにまとまって共に C_{3-4} アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；

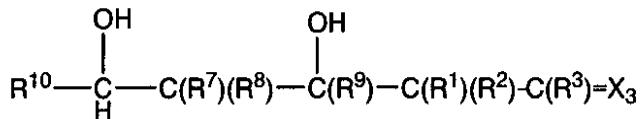
R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R は、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ、

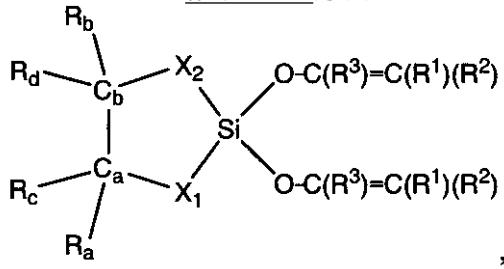
R^1 、 R^2 、 R^3 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 1 0 2】

下記の化学式

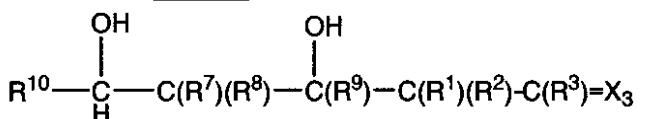


のジオールを作製する方法であって、該方法は、



,

の化学式の化合物を化学式 $R^{10}CHO$ のアルデヒドと反応させて下記の化学式



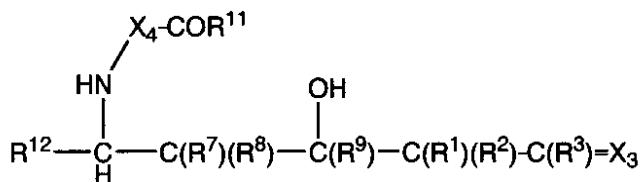
を有するジオールを作製する事からなり、ここで：

X_3 は O (酸素) および $(R^4)(R^5)$ からなる群から選択され；

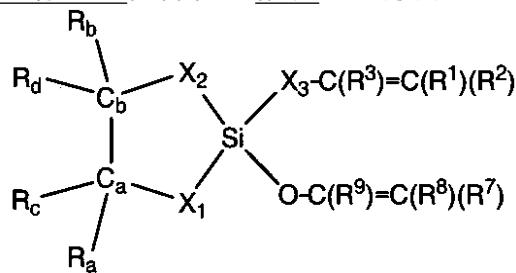
X_1 と X_2 はそれぞれ独立に O(酸素) および N-R からなる群から選択され；
 C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；
 R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、
(ii)一つにまとまって共に C_3-C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；
 R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；
R は、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；
 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^7, R^8$ および R^9 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択され；且つ、
 R^{10} は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 1 0 3】

下記の化学式



を有する化合物を作製する方法であって、該方法は、



の化学式の化合物を化学式 $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$ の化合物と反応させる事からなり、ここで：

X_3 は O(酸素) および $(R^4)(R^5)$ からなる群から選択され；
 X_4 は O(酸素) および NH からなる群から選択され；
 X_1 と X_2 はそれぞれ独立に O(酸素) および N-R からなる群から選択され；
 C_a と C_b はそれぞれ独立に、アキラル中心、(S)キラル中心および(R)キラル中心からなる群から選択され；
 R_a と R_b は(i)それぞれ独立に C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され、あるいは、
(ii)一つにまとまって共に C_3-C_4 アルキレン鎖を形成し、それらは C_a と C_b と共に 5 員環および 6 員環の脂肪族環の一つを形成し；
 R_c と R_d はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；
R は独立に、 C_{1-10} アルキル、 C_6-C_{10} アリール、および C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から

選択され；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立に水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリール、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキル- C_{6-10} アリールアミノ、 C_{6-10} ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択され；

R^{11} は水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^{12} は C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択された一つであり；且つ

R^{14} は水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{3-9} ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。