

【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 0 7 F 7/08 (2006.01)**

**C 0 7 C 29/38 (2006.01)**

**C 0 7 C 33/14 (2006.01)**

**C 0 7 C 33/20 (2006.01)**

**C 0 7 C 41/56 (2006.01)**

**C 0 7 C 43/178 (2006.01)**

**C 0 7 C 241/02 (2006.01)**

**C 0 7 C 243/32 (2006.01)**

**C 0 7 F 7/10 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 F 7/08 S

C 0 7 C 29/38

C 0 7 C 33/14

C 0 7 C 33/20

C 0 7 C 41/56

C 0 7 C 43/178 A

C 0 7 C 241/02

C 0 7 C 243/32

C 0 7 F 7/10 S

C 0 7 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

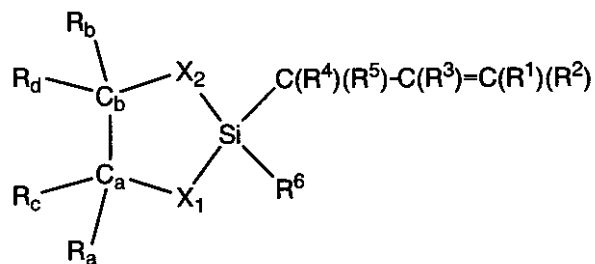
【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

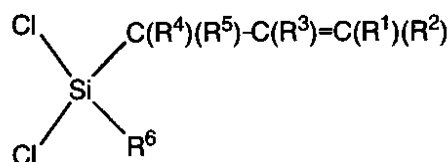
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

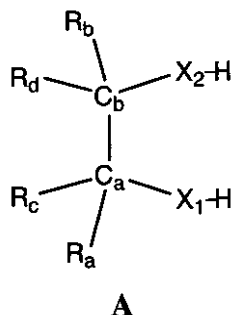
【請求項1】



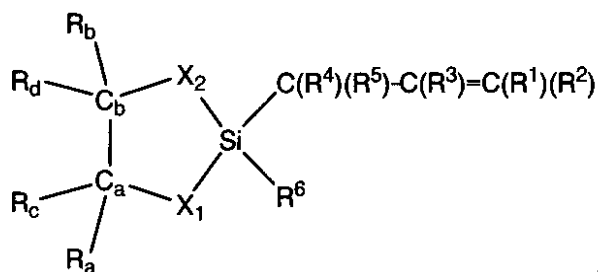
の化学式を有する化合物の作製方法であって、該方法は、



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、

$\text{X}_1$ と $\text{X}_2$ は独立に酸素およびN-Rからなる群から選択され；

$\text{C}_a$ と $\text{C}_b$ 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；

$\text{R}_a$ と $\text{R}_b$ は(i)それぞれ独立に $\text{C}_{1-10}$ アルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、および $\text{C}_{3-9}$ 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)一つにまとめて共に $\text{C}_3$ - $\text{C}_4$ アルキレン鎖を形成し、それらは $\text{C}_a$ と $\text{C}_b$ と共に5員環および6員環の脂肪族環の一つを形成し；

$\text{R}_c$ と $\text{R}_d$ はそれぞれ独立に水素、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、および $\text{C}_{3-9}$ ヘテロアリールからなる群から選択され；

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

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、および $\text{R}^5$ はそれぞれ独立に水素、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、 $\text{C}_{3-9}$ ヘテロアリール、 $\text{C}_{1-10}$ アルコキシ、 $\text{C}_{6-10}$ アリールオキシ、 $\text{C}_{1-10}$ ジアルキルアミノ、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル- $\text{C}_{6-10}$ アリールアミノ、 $\text{C}_{6-10}$ 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】

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

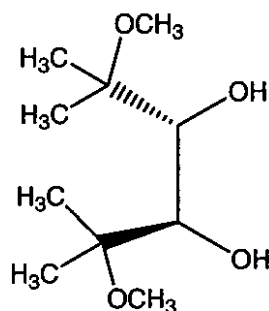
法。

【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】

$X_1 = NR$  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

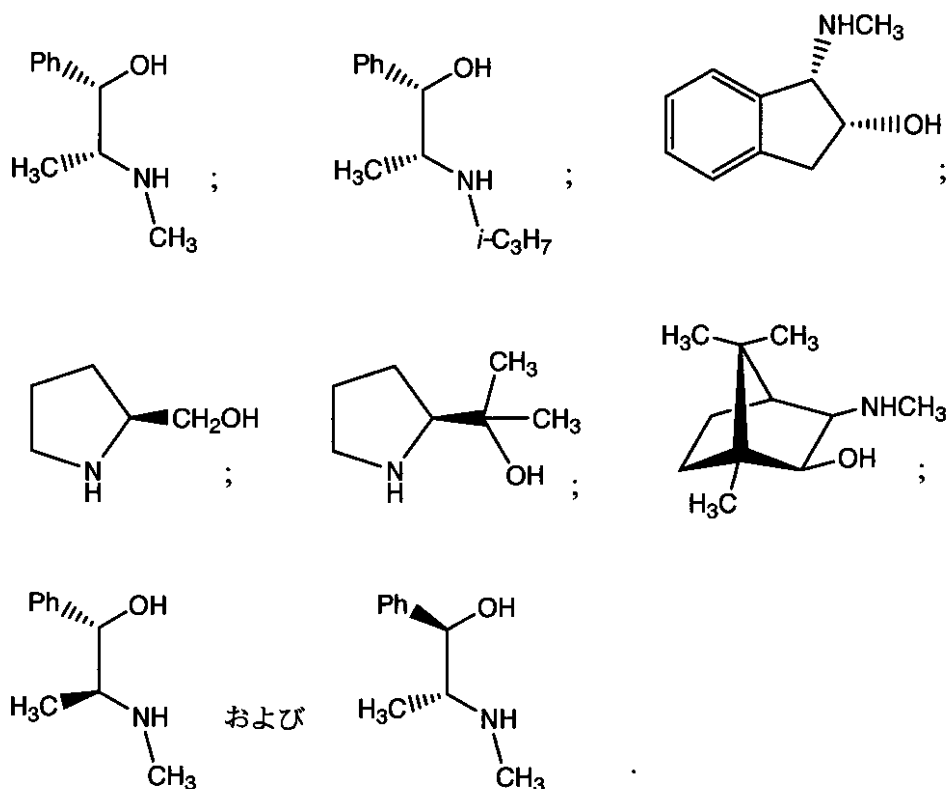
。

【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】

$X_1 = X_2 = NR$ 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】

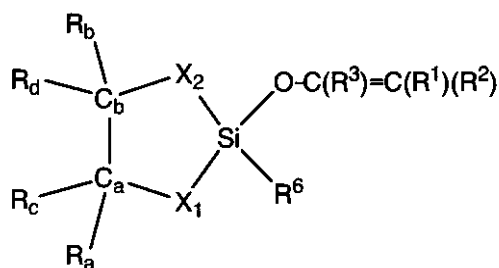
$R_a$ と $R_b$ は一つにまとまって共に $C_4$ アルキレン鎖を形成し、それらは $C_a$ と $C_b$ と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 7】

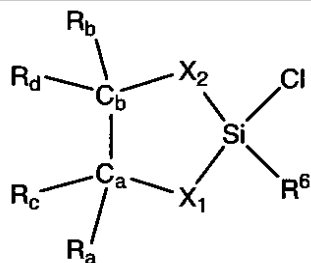
化学式 A の化合物は、(1R,2R)-N,N-ジベンジル-シクロヘキサン-1,2-ジアミン、(1R,2R)-N,N-ジ(p-プロモベンジル)-シクロヘキサン-1,2-ジアミン、および(1R,2R)-N,N-ジ(p-メトキシベンジル)-シクロヘキサン-1,2-ジアミンからなる群から選択される、請求項 1 6 記載の方法。

【請求項 1 8】

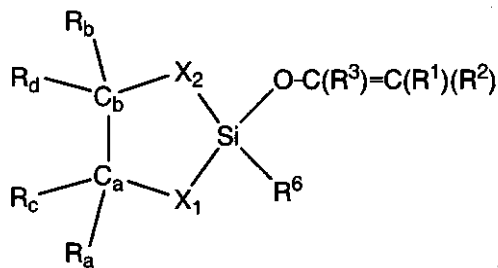
下記の化学式



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  $\text{Li}-\text{O}-\text{C}(\text{R}^3)=\text{C}(\text{R}^1)(\text{R}^2)$  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、 $\text{X}_1$ と $\text{X}_2$ 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；

$\text{C}_a$ と $\text{C}_b$ 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；

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

(ii)一つにまとめて共に $\text{C}_3-\text{C}_4$ アルキレン鎖を形成し、それらは $\text{C}_a$ と $\text{C}_b$ と共に5員環および6員環の脂肪族環の一つを形成し；

$\text{R}_c$ と $\text{R}_d$ はそれぞれ独立に水素、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、および $\text{C}_{3-9}$ ヘテロアリールからなる群から選択され；

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

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

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ および $\text{R}^3$ はそれぞれ独立に水素、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、 $\text{C}_{3-9}$ ヘテロアリール、 $\text{C}_{1-10}$ アルコキシ、 $\text{C}_{6-10}$ アリールオキシ、 $\text{C}_{1-10}$ ジアルキルアミノ、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル- $\text{C}_{6-10}$ アリールアミノ、 $\text{C}_{6-10}$ 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 19】

$R^1$ ,  $R^2$  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 18 記載の方法。

【請求項 20】

$X_1 = X_2 = O$  (酸素) である、請求項 18 記載の方法。

【請求項 21】

$R_c = R_d = H$  (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 20 記載の方法。

【請求項 22】

$X_1 = NR$  であり且つ  $X_2 = O$  (酸素) である、請求項 18 記載の方法。

【請求項 23】

$C_a$  と  $C_b$  はそれぞれ (S)キラル中心である、請求項 22 記載の方法。

【請求項 24】

$C_a$  と  $C_b$  はそれぞれ (R)キラル中心である、請求項 22 記載の方法。

【請求項 25】

$R$  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 22 記載の方法。

【請求項 26】

$R_a$  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 25 記載の方法。

【請求項 27】

$R_c$  と  $R_d$  はそれぞれ水素である、請求項 26 記載の方法。

【請求項 28】

$X_1 = X_2 = NR$  である、請求項 18 記載の方法。

【請求項 29】

$C_a$  と  $C_b$  はそれぞれ (S)キラル中心である、請求項 28 記載の方法。

【請求項 30】

$C_a$  と  $C_b$  はそれぞれ (R)キラル中心である、請求項 28 記載の方法。

【請求項 31】

$R$  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 28 記載の方法。

【請求項 32】

$R_a$  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 31 記載の方法。

【請求項 33】

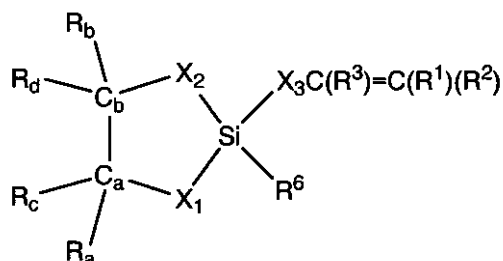
$R_a$  と  $R_b$  は一つにまとまって共に  $C_4$  アルキレン鎖を形成し、それは  $C_a$  と  $C_b$  と共に 6 員環の脂肪族環を形成する、請求項 28 記載の方法。

【請求項 34】

$R$  はベンジル、p-プロモベンジル、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 33 記載の方法。

【請求項 35】

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)一つにまとめて共に $C_3-C_4$ 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36】

$X_3=0$ (酸素)である、請求項35記載の化合物。

【請求項37】

$X_3=C(R^4)(R^5)$ である、請求項35記載の化合物。

【請求項38】

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ 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35記載の化合物。

【請求項39】

$X_1=X_2=0$ (酸素)である、請求項35記載の化合物。

【請求項40】

$R_c$ 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39記載の化合物。

【請求項41】

$X_1=NR$ であり、 $X_2=0$ (酸素)である、請求項35記載の化合物。

【請求項42】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項41記載の化合物。

【請求項43】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項41記載の化合物。

【請求項44】

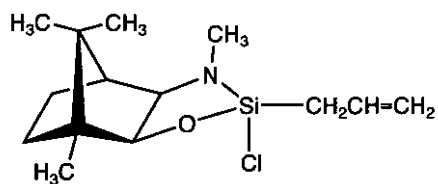
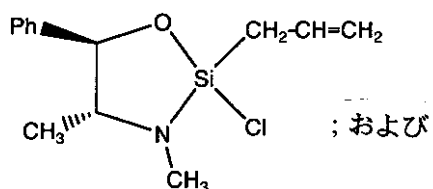
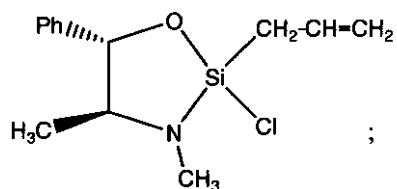
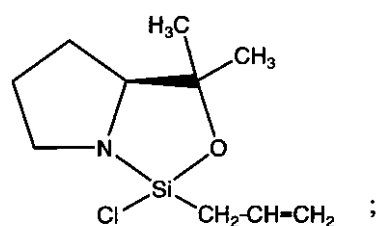
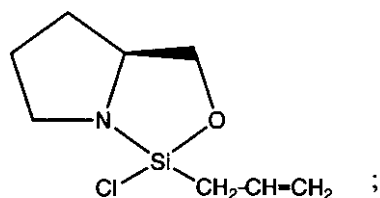
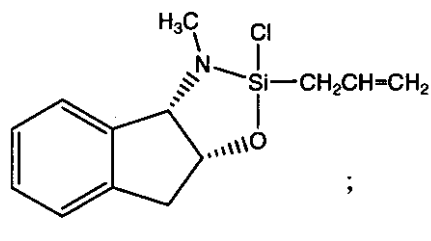
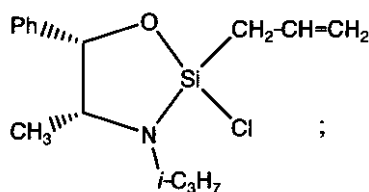
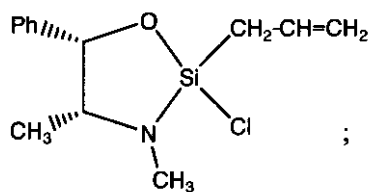
Rはメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項41記載の化合物。

【請求項45】

$R_a$ 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44記載の化合物。

【請求項46】

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 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 7】

$X_1 = X_2 = NR$ である、請求項 3 5 記載の化合物。

【請求項 4 8】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項 4 7 記載の化合物。

【請求項 4 9】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項 4 7 記載の化合物。

【請求項 5 0】

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 7 記載の化合物。

【請求項 5 1】



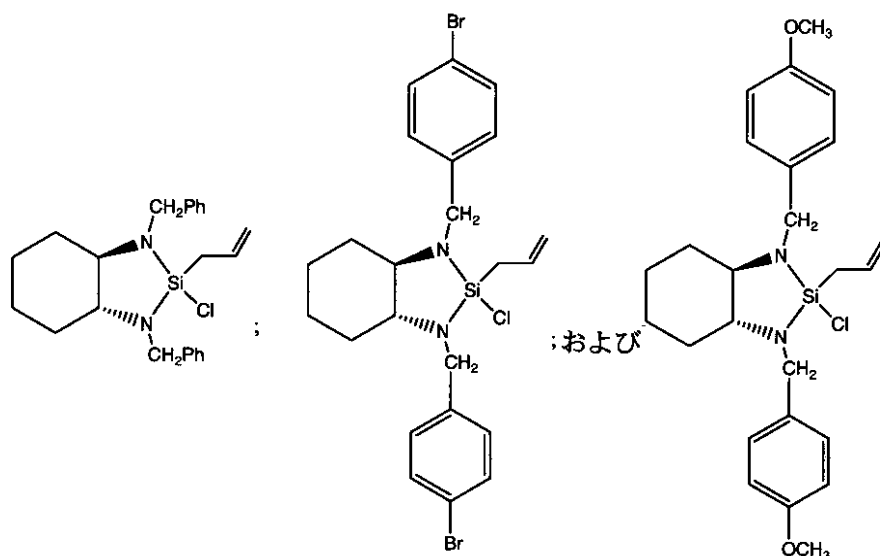
$R_a$ と $R_b$ はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 $C_c$ と $C_d$ のそれぞれは水素である、請求項50記載の化合物。

【請求項52】

$R_a$ と $R_b$ は一つにまとめて共に $C_4$ 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47記載の化合物。

【請求項53】

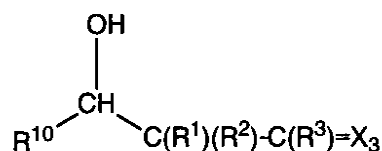
下記の化学式



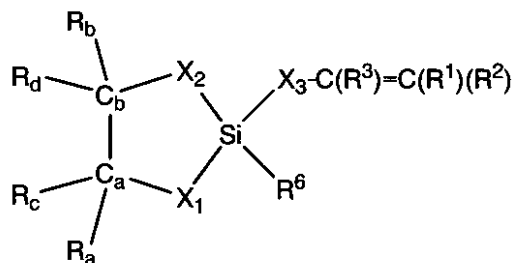
を有する化合物からなる群から選択される、請求項52記載の化合物。

【請求項54】

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 $\text{R}^{10}\text{CHO}$ 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 $O$ (酸素)および $C(R^4)(R^5)$ からなる群から選択され；

$X_1$ と $X_2$ 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 $C_b$ 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<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>アルキレン鎖を形成し、それらはC<sub>a</sub>とC<sub>b</sub>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<sub>c</sub>とR<sub>d</sub>はそれぞれ独立に水素、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>アリール、およびC<sub>3-9</sub>ヘテロアリールからなる群から選択され；

R<sup>6</sup>は、ハロゲン、水素、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>3-9</sub>ヘテロアリール、C<sub>1-10</sub>アルコキシ、C<sub>6-10</sub>アリールオキシ、C<sub>1-10</sub>ジアルキルシアミノ、C<sub>1-10</sub>アルキル-C<sub>6-10</sub>アリールアミノ、C<sub>6-10</sub>ジアリールアミノ、OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>およびSRからなる群から選択され；

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

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>はそれぞれ独立に水素、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>3-9</sub>ヘテロアリール、C<sub>1-10</sub>アルコキシ、C<sub>6-10</sub>アリールオキシ、C<sub>1-10</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-10</sub>アルキル-C<sub>6-10</sub>アリールアミノ、C<sub>6-10</sub>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<sup>10</sup>はC<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>アリールおよびC<sub>3-9</sub>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55】

X<sub>3</sub>=O(酸素)である、請求項54記載の方法。

【請求項56】

X<sub>3</sub>=C(R<sup>4</sup>)(R<sup>5</sup>)である、請求項54記載の方法。

【請求項57】

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のそれぞれは水素であり、R<sup>6</sup>は塩素である、請求項54記載の方法。

【請求項58】

X<sub>1</sub>=X<sub>2</sub>=O(酸素)である、請求項54記載の方法。

【請求項59】

R<sub>c</sub>とR<sub>d</sub>はそれぞれ水素であり、R<sub>a</sub>とR<sub>b</sub>はそれぞれ2-メトキシ-2-プロピルであり、C<sub>a</sub>とC<sub>b</sub>はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項58記載の方法。

【請求項60】

X<sub>1</sub>=NRであり、X<sub>2</sub>=O(酸素)である、請求項54記載の方法。

【請求項61】

C<sub>a</sub>とC<sub>b</sub>はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項60記載の方法。

【請求項62】

C<sub>a</sub>とC<sub>b</sub>はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項60記載の方法。

【請求項63】

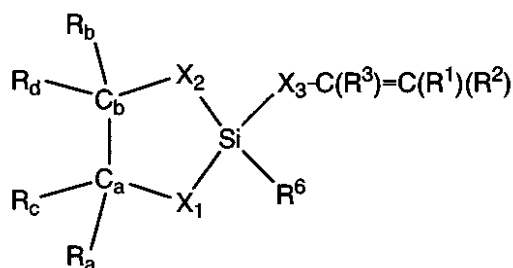
Rはメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項60記載の方法。

【請求項64】

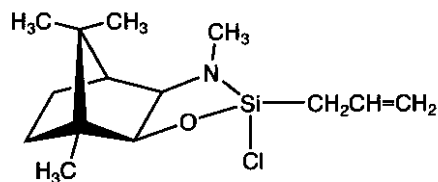
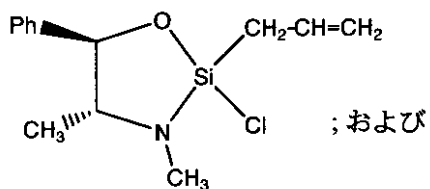
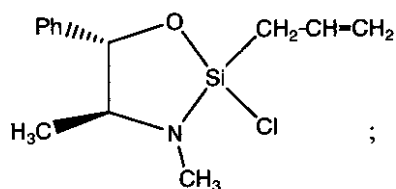
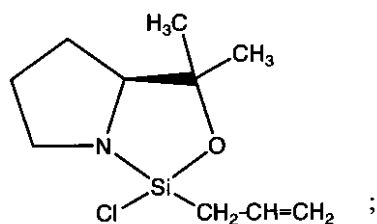
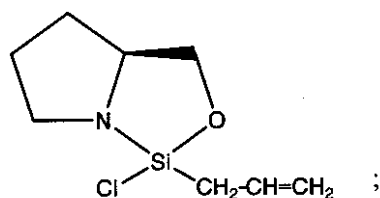
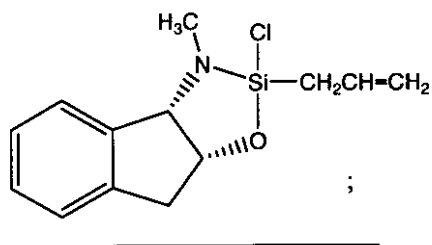
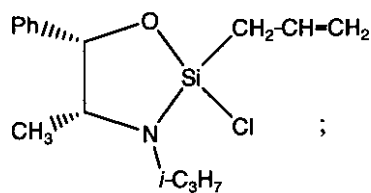
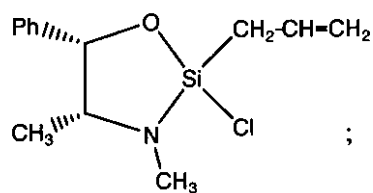
R<sub>a</sub>とR<sub>b</sub>はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、R<sub>c</sub>とR<sub>d</sub>はそれぞれ独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項63記載の方法。

【請求項65】

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66記載の方法。

【請求項70】

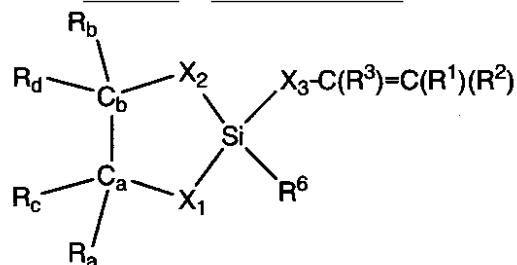
$R_a$ と $R_b$ はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 $R_c$ と $R_d$ はそれぞれ水素である、請求項66記載の方法。

【請求項71】

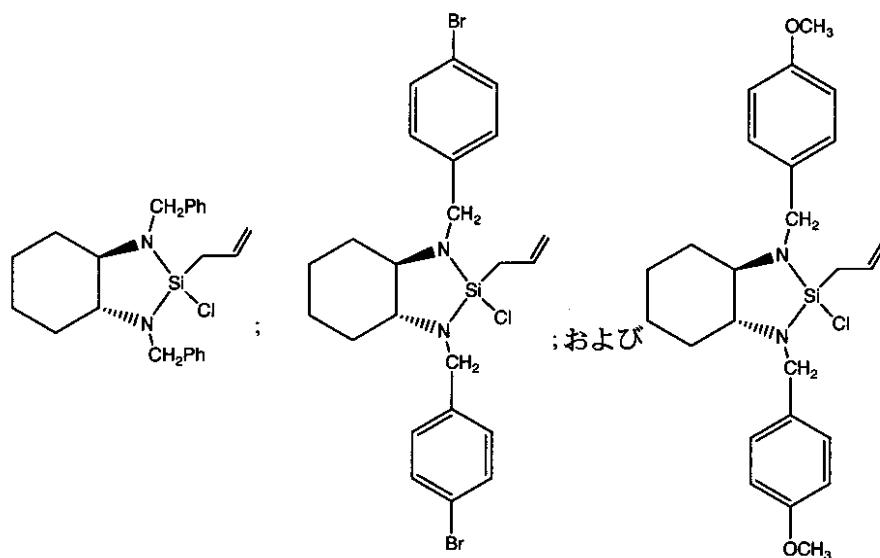
$R_a$ と $R_b$ は一つにまとまって共に $C_4$ アルキレン鎖を形成し、それらは $C_a$ と $C_b$ と共に6員環の脂肪族環を形成する、請求項66記載の方法。

【請求項72】

前記化合物は下記の化学式



の化合物であって、下記



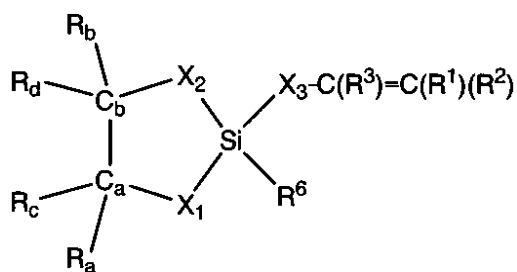
からなる群から選択される、請求項71記載の方法。

【請求項73】

$R^{10}$ はメチル、*t*-ブチル、フェニル、2-フェニルエチル、(E)-2-フェニルエチニル、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54記載の方法。

【請求項74】

下記の化学式の



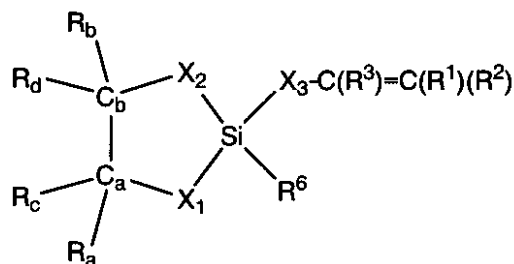
前記化合物は化学式 $R^{10}CHO$ のアルデヒドと溶媒中で反応し、該溶媒はトルエン、テトラヒドロフラン、*N,N*-ジメチルフォルムアミド、酢酸エチル、ジクロロメタン、ヘキサン、*t*-ブチルメチルエーテル、ジエチルエーテル、アセトニトリル、およびベンゼンからなる群から選択される、請求項54記載の方法。

【請求項75】

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74記載の方法。

【請求項76】

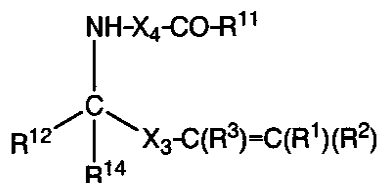
下記の化学式の



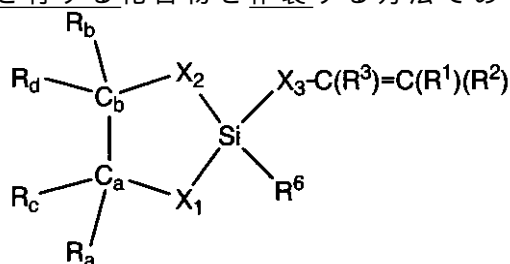
前記化合物は溶媒の非存在下でアルデヒドと反応する、請求項54記載の方法。

【請求項77】

下記の化学式



を有する化合物を製する方法であって、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)一つにまとめて共に $C_3-C_4$ 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78】

$X_3=0$  (酸素) である、請求項77記載の方法。

【請求項79】

$X_3=C(R^4)(R^5)$  である、請求項77記載の方法。

【請求項80】

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  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77記載の方法。

【請求項81】

$X_1=X_2=0$  (酸素) である、請求項77記載の方法。

【請求項82】

$R_c$ 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81記載の方法。

【請求項83】

$X_1=NR$  であり、 $X_2=0$  (酸素) である、請求項81記載の方法。

【請求項84】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(S)キラル中心である、請求項83記載の方法。

【請求項85】

$C_a$ と $C_b$ はそれぞれ(R)キラル中心である、請求項83記載の方法。

【請求項86】

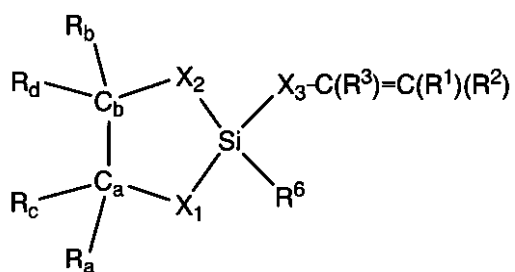
$R$ はメチル、ベンジル、およびフェニルからなる群から選択される、請求項83記載の方法。

【請求項87】

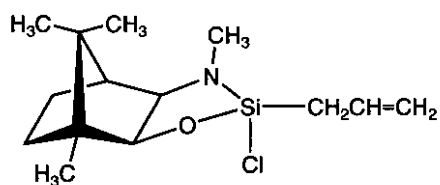
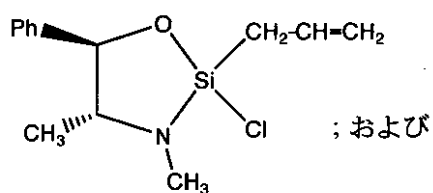
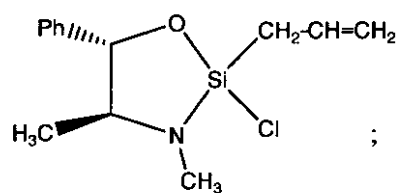
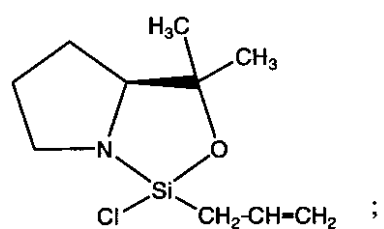
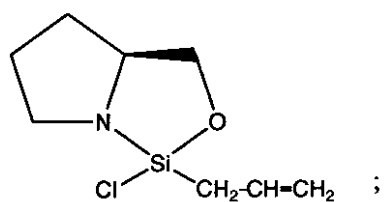
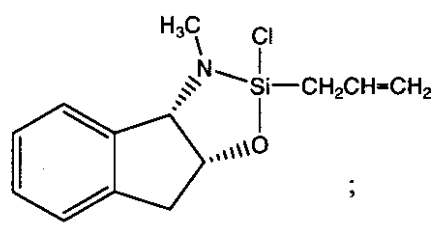
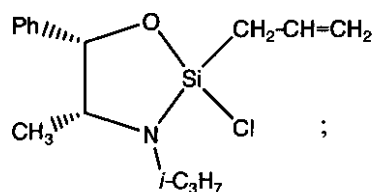
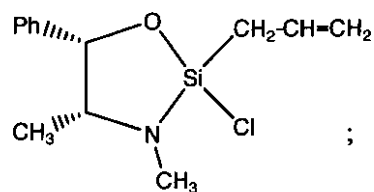
$R_a$ と $R_b$ はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、 $R_c$ と $R_d$ はそれぞれ独立にメチルおよび水素からなる群から選択される、請求項86記載の方法。

【請求項88】

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】

【請求項 9 0】

【請求項 9 1】

【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89記載の方法。

【請求項 9 3】

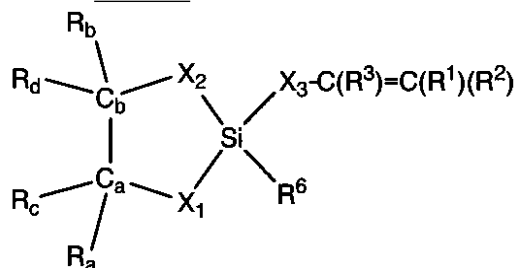
R<sub>a</sub>とR<sub>b</sub>はそれぞれ独立にメチルおよびフェニルからなる群から選択され、R<sub>c</sub>とR<sub>d</sub>はそれぞれ水素である、請求項92記載の方法。

【請求項 9 4】

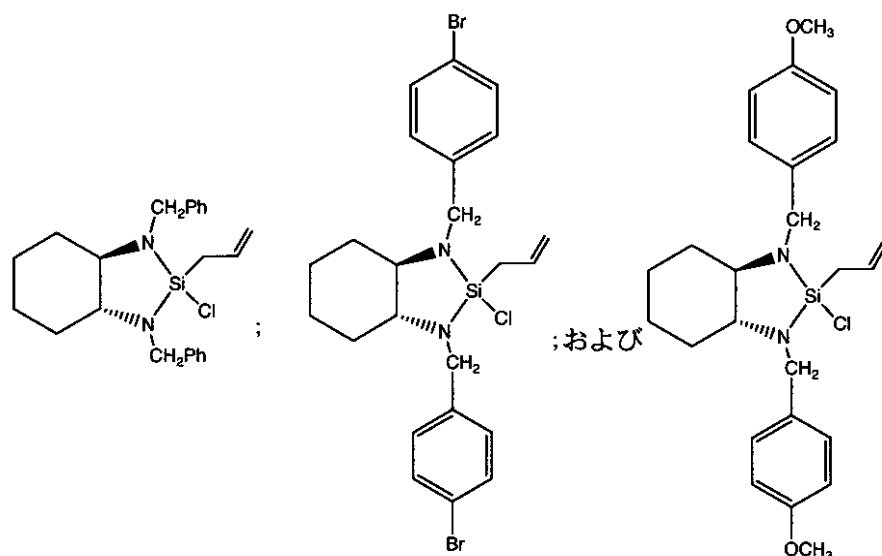
R<sub>a</sub>とR<sub>b</sub>は一つにまとまって共にC<sub>4</sub>アルキレン鎖を形成し、それらはC<sub>a</sub>とC<sub>b</sub>と共に6員環の脂肪族環を形成する、請求項89記載の方法。

【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 94 記載の方法。

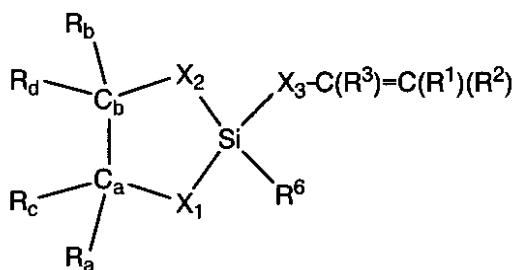
【請求項 9 6】

R<sup>11</sup>とR<sup>12</sup>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-フェニルエチニル、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77記載の方法。

【請求項 9 7】

下記の化学式の

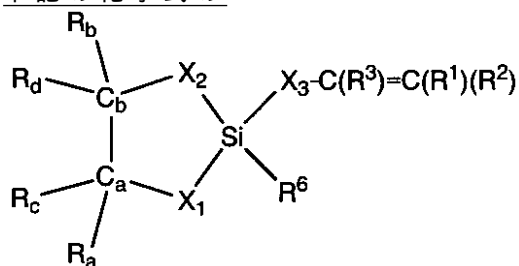




前記化合物は化学式  $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$  の化合物と溶媒中で反応し、該溶媒は、トルエン、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルフォルムアミド、酢酸エチル、ジクロロメタン、ヘキサン、t-ブチルメチルエーテル、ジエチルエーテル、アセトニトリル、およびベンゼンからなる群から選択される、請求項 77 記載の方法。

【請求項 98】

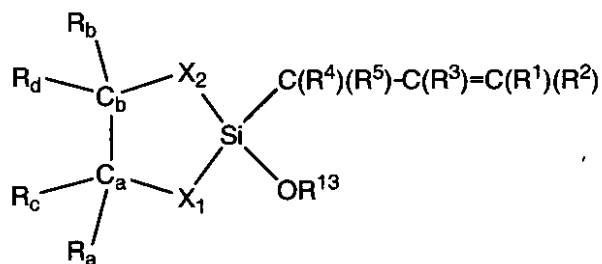
下記の化学式の



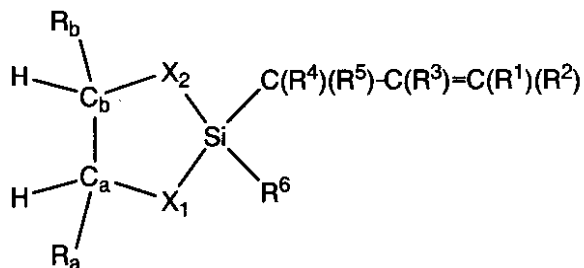
前記化合物は化学式  $R^{12}C(R^{14})=N-X_4-CO-R^{11}$  の化合物と溶媒の非存在下で反応する、請求項 77 記載の方法。

【請求項 99】

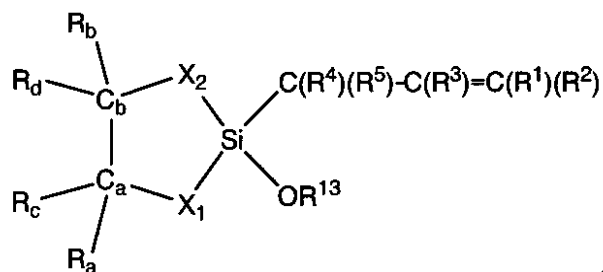
下記の化学式



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；

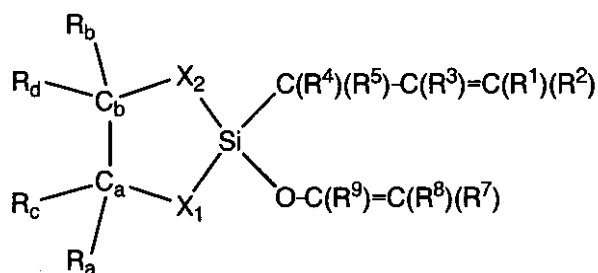
R は  $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、および  $C_{3-9}$  ヘテロアリールからなる群から選択され；

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  はそれぞれ独立に水素、 $C_1-C_{10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  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、

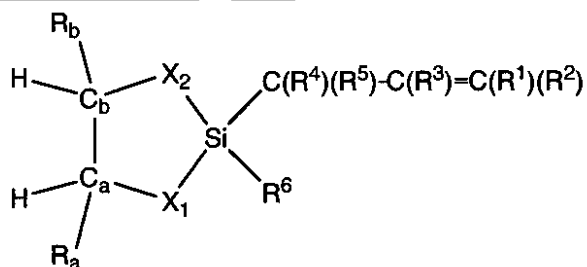
$R^{13}$  は  $C_1-C_{10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリールおよび  $C_{3-9}$  ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 100】

下記の化学式

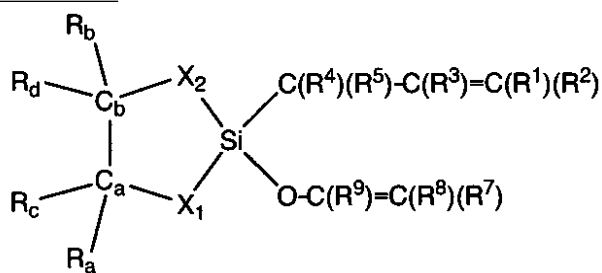


を有する化合物を作製する方法であって、該方法は、



の化学式の化合物を化学式  $Li-O-C(R^9)=C(R^7)(R^8)$  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  $C_3-C_4$  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；

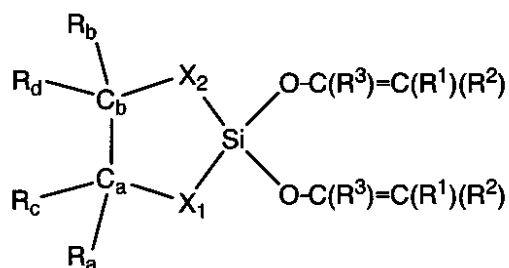
$R^6$  は、ハロゲンおよび  $OSO_2CF_3$  の一つであり；

$R$  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；且つ、

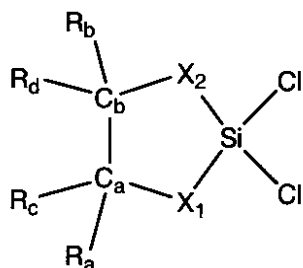
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  および  $R^9$  はそれぞれ独立に水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{3-9}$  ヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-10}$  アリールオキシ、 $C_{1-10}$  ジアルキルアミノ、 $C_{1-10}$  アルキル- $C_{6-10}$  アリールアミノ、 $C_{6-10}$  ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 101】

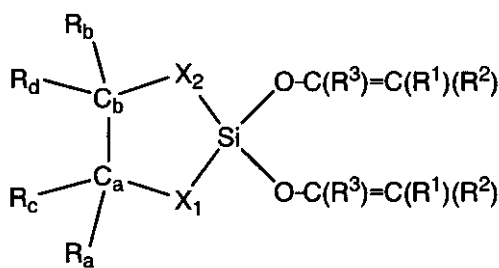
下記の化学式



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  $Li-O-C(R^3)=C(R^1)(R^2)$  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  $C_3-C_4$  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；

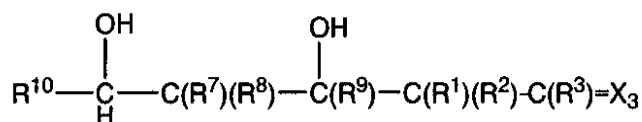
$R_c$  と  $R_d$  はそれぞれ独立に水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、および  $C_{3-9}$  ヘテロアリールからなる群から選択され；

$R$  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；且つ、

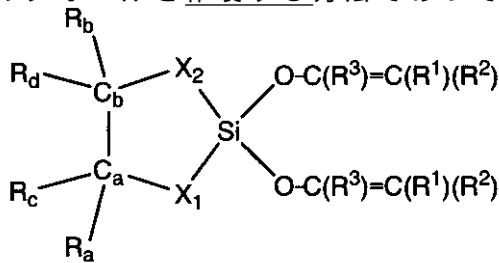
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  はそれぞれ独立に水素、 $C_{1-10}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{3-9}$  ヘテロアリール、 $C_{1-10}$  アルコキシ、 $C_{6-10}$  アリールオキシ、 $C_{1-10}$  ジアルキルアミノ、 $C_{1-10}$  アルキル- $C_{6-10}$  アリールアミノ、 $C_{6-10}$  ジアリールアミノ、およびハロゲンからなる群から選択される、上記方法。

【請求項 102】

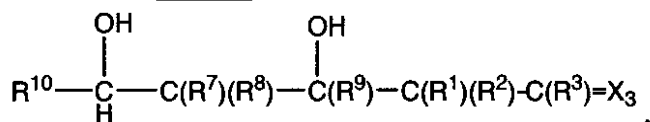
下記の化学式



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；

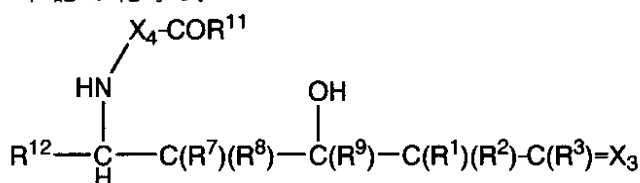
Rは、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、および $C_{3-9}$ ヘテロアリールからなる群から選択され；

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ 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、

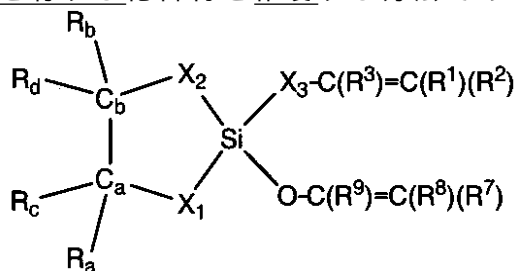
$R^{10}$ は $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{3-9}$ ヘテロアリールからなる群から選択される、上記方法。

【請求項103】

下記の化学式



を有する化合物を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 $\text{R}^{12}\text{C(R}^{14}\text{)=N-X}_4\text{-CO-R}^{11}$ 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、 $C_{6-10}$ 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。