

【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24年6月21日(2012.6.21)

【公表番号】特表2011-523631(P2011-523631A)

【公表日】平成23年8月18日(2011.8.18)

【年通号数】公開・登録公報2011-033

【出願番号】特願2011-507950(P2011-507950)

【国際特許分類】

C 07 D 307/33	(2006.01)
C 07 D 301/16	(2006.01)
C 07 D 303/48	(2006.01)
C 07 C 67/343	(2006.01)
C 07 C 391/02	(2006.01)
C 07 C 67/31	(2006.01)
C 07 C 67/313	(2006.01)
C 07 C 69/716	(2006.01)
C 07 F 7/18	(2006.01)
C 07 C 69/732	(2006.01)
C 07 C 69/604	(2006.01)
C 07 B 53/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 307/32	C S P T
C 07 D 301/16	
C 07 D 303/48	
C 07 C 67/343	
C 07 C 391/02	
C 07 C 67/31	
C 07 C 67/313	
C 07 C 69/716	Z
C 07 F 7/18	J
C 07 C 69/732	Z
C 07 C 69/604	
C 07 B 53/00	F
C 07 B 53/00	G

【手続補正書】

【提出日】平成24年5月7日(2012.5.7)

【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

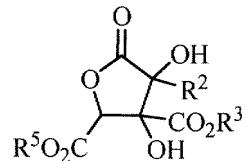
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物を得る方法であつて：

【化1】



(II)

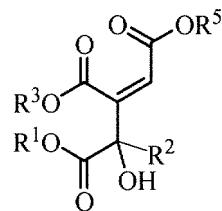
[式中、

 R^2 は $C_{1\sim 0} \sim C_{1\sim 5}$ アルキル基であり；そして R^3 および R^5 は、独立して、置換または未置換 $C_1 \sim C_{2\sim 0}$ アルキル基から選択されるものである]

該方法が、

式(III)の化合物

【化2】



(III)

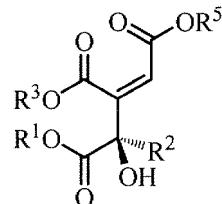
[式中、

 R^2 、 R^3 および R^5 は前記で定義した通りであり；そしてR¹ は置換または未置換 $C_1 \sim C_{2\sim 0}$ アルキル基から選択されるものである] の二重結合を二水酸化することを含んでなることを特徴とする、方法。

【請求項2】

前記式(III)の化合物が、式(IIIa)の化合物またはその鏡像異性体

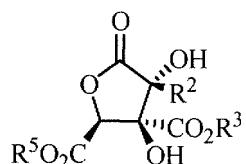
【化3】



(IIIa)

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^5 は請求項1で定義されている通りである] であり、そして得られた前記式(II)の化合物が(IIa)の化合物またはその鏡像異性体

【化4】



(IIa)

[式中、 R^2 、 R^3 および R^5 は請求項1で定義されている通りである]

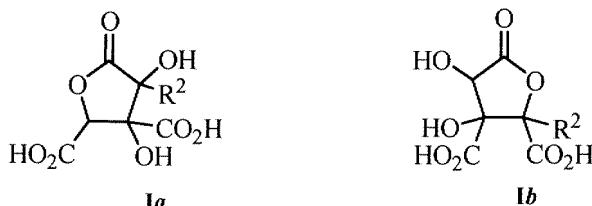
であるか、または

前記二水酸化を、四酸化オスミウム / N - メチルモルホリン - N - オキシドまたは過マンガン酸カリウムの存在下でおこなう、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

式 (Ia) および / または式 (Ib) の化合物、それらの立体異性体もしくはそれらの混合物、または式 (Ia) および式 (Ib) の化合物の混合物もしくはそれらの立体異性体の混合物を調製する請求項 1 に記載の方法であって：

【化 5】



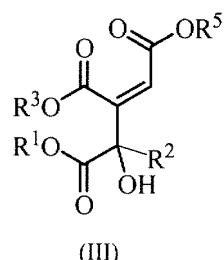
[式中、

R² は C_{1~0} ~ C_{1~5} アルキル基から選択されるものである]

該方法が、

(i) 式 (III) の化合物

【化 6】



[式中、

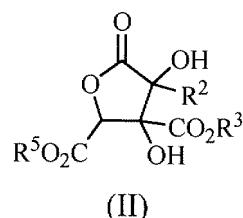
R¹ は置換または未置換 C_{1~0} ~ C_{2~0} アルキル基から選択されるものであり；

R² は前記で定義した通りであり；そして

R³ および R⁵ は、独立して、置換または未置換 C_{1~0} ~ C_{2~0} アルキル基から選択されるものである]

の二重結合を二水酸化して、式 (II) の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物

【化 7】



[式中、R²、R³ および R⁵ は前記定義の通りである]

を得る工程；

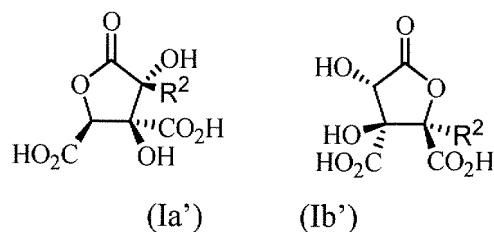
(i i) 前記式 (II) の化合物を、アルカリ水酸化物、アルカリ土類金属水酸化物、アルカリ炭酸塩またはアルカリ土類金属炭酸塩の存在下で加水分解する工程；そして

(i i i) 前記反応媒体を酸性化する工程（ここで、R₃ 基および R₅ 基は工程 (i i) の塩基性条件下で不安定なものである）を含んでなる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

式 (Ia') および式 (Ib') の化合物またはそれらの鏡像異性体

【化 8】



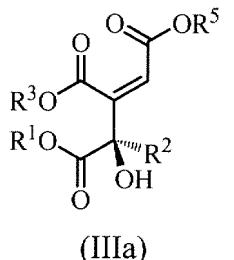
[式中、

R² は請求項 3 で定義されている通りである。】

を調製する請求項 3 に記載の方法であって、

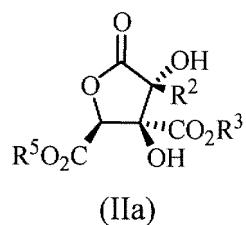
前記式 (I I I) の化合物が式 (I I I a) の化合物またはその鏡像異性体

【化 9】



[式中、R¹、R²、R³およびR⁵は請求項3で定義されている通りである]であり、前記式(I1)の化合物は式(I1a)の化合物またはその鏡像異性体

【化 10】

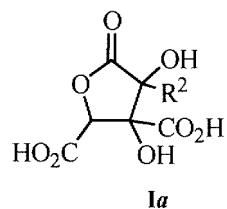


[式中、 R^2 、 R^3 および R^5 は請求項3で定義されている通りである]である、請求項3に記載の方法。

【請求項 5】

式 (Ia) の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物を調製する請求項 1 に記載の方法であって：

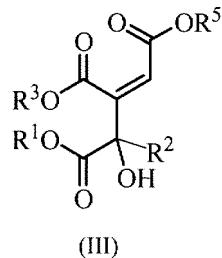
【化 1 1】



[式中、R²はC_{1~0}~C_{1~5}アルキル基である]該方法が、

(i) 式 (I I I) の化合物

【化12】



[式中、

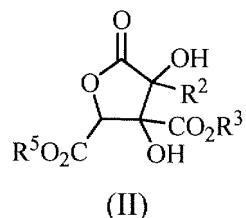
R¹ は置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；

R² は前記で定義した通りであり；そして

R³ および R⁵ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものである]

の二重結合を二水酸化して、式(II)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物

【化13】



[式中、

R²、R³ および R⁵ は前記で定義した通りである]

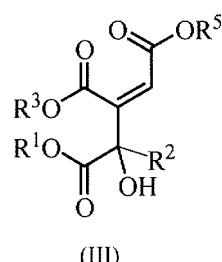
を得ること；そして

(i) 非塩基性条件下で、前記式(II)の化合物のラクトン環のカルボキシエステル基を転換して、対応するカルボン酸基を得ることを含んでなる、請求項1に記載の方法。

【請求項6】

式(III)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物を合成する方法であつて：

【化14】



[式中、

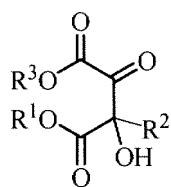
R¹、R³ および R⁵ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；そして

R² は C₁₀ ~ C₁₅ アルキル基である]

該方法が、

(a) 式(V)の化合物

【化15】



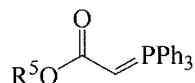
(V)

[式中、

R¹、R²およびR³は前記定義の通りである]

を、式(XII)の化合物

【化16】



(XII)

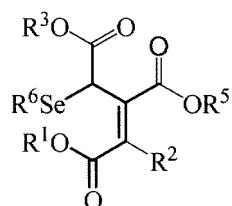
[式中、

R⁵は前記定義の通りである]

の存在下で反応させること；または

(b)過酸化物または過ヨウ素酸ナトリウムにより、式(VI)の化合物

【化17】



(VI)

[式中、

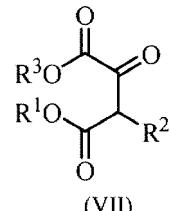
R¹、R²、R³およびR⁵は前記で定義した通りであり；そしてR⁶はC₁～C₃アルキルおよびフェニルからなる群から選択されるものである]を酸化することを含んでなることを特徴とする、方法。

【請求項7】

前記式(VI)化合物の調製が、

(i) 塩基の存在下で、式(VII)の化合物

【化18】



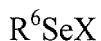
(VII)

[式中、

R¹、R²およびR³は請求項6で定義されている通りである]

を、式(XV)の化合物

【化19】

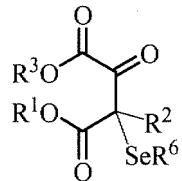


(XV)

[式中、

R^6 は請求項 6 で定義されている通りであり；そして
 X は Cl および Br から選択されるハロゲンである]
と反応させて、式(XIII)の化合物

【化20】



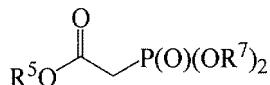
(XIII)

[式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 および R^6 は請求項 6 で定義されている通りである]
を得ること；そして

(i) 前記式(XIII)の化合物を、塩基の存在下で、式(XIV)のホスホン酸
エステル

【化21】



(XIV)

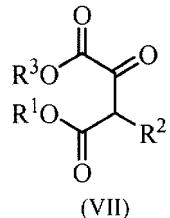
[式中、

R^5 は請求項 6 で定義されている通りであり；そして
 R^7 は $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル基である]
と反応させることにより行われる、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

式(V)の化合物の調製が、
(i) 式(VII)の化合物

【化22】

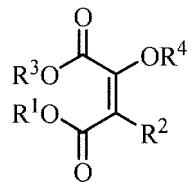


(VII)

[式中、

R^1 、 R^2 および R^3 は請求項 6 で定義されている通りである]
を、塩基の存在下で、ハロゲン化トリアルキルシリルまたはトリアルキルシリルトリフレ
ートと反応させて、式(X)の化合物

【化23】



(X)

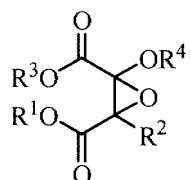
[式中、

R¹、R²およびR³は請求項6で定義されている通りであり；そして
R⁴はトリアルキルシリル基である]

を得ること；

(i) 前記式(X)の化合物をエポキシ化剤と反応させて、式(XI)の化合物

【化24】



(XI)

[式中、

R¹、R²およびR³は請求項6で定義されている通りであり；そして
R⁴は前記定義の通りである]

を得ること；そして

(ii) 前記式(XI)の化合物をフッ化物イオンを生成することができる化合物と
反応させることにより行われる、請求項6に記載の方法。

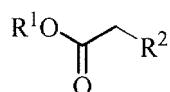
【請求項9】

前記エポキシ化が、非対称エポキシ化である、請求項8に記載の方法。

【請求項10】

前記式(VII)の化合物を、塩基の存在下で、式(VIII)の化合物

【化25】

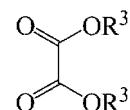


(VIII)

[式中、R¹およびR²は請求項7で定義されている通りである]

と、式(IX)の蔥酸ジエステル

【化26】



(IX)

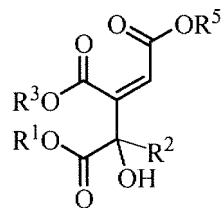
[式中、R³は請求項7で定義されている通りである]

とを反応させることにより調製される、請求項7～9のいずれか一項に記載の方法。

【請求項11】

式(III)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化27】



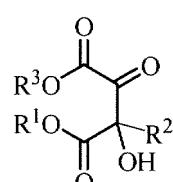
[式中、

R^1 、 R^3 および R^5 は、独立して、置換または未置換 $C_{1\sim C_{20}}$ アルキル基から選択されるものであり；そして

R^2 は $C_{10\sim C_{15}}$ アルキル基から選択されるものである]、

式(V)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化28】



(V)

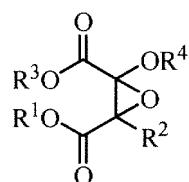
[式中、

R^1 および R^3 は、独立して、置換または未置換 $C_{1\sim C_{20}}$ アルキル基から選択されるものであり；そして

R^2 は $C_{10\sim C_{15}}$ アルキル基から選択されるものである]、

式(XI)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化29】



(XI)

[式中、

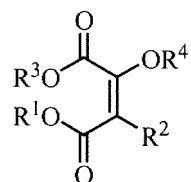
R^1 および R^3 は、独立して、置換または未置換 $C_{1\sim C_{20}}$ アルキル基から選択されるものであり；

R^2 は $C_{10\sim C_{15}}$ アルキル基から選択されるものであり；そして

R^4 はトリアルキルシリル基である]、

式(X)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化30】



(X)

[式中、

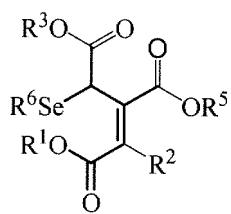
R¹ および R³ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；そして

R² は C₁₀ ~ C₁₅ アルキル基から選択されるものであり；そして

R⁴ はトリアルキルシリル基である]、

式(VI)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化31】



(VI)

[式中、

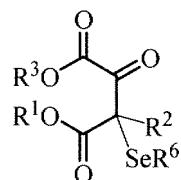
R¹、R³ および R⁵ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；

R² は C₁₀ ~ C₁₅ アルキル基から選択されるものであり；そして

R⁶ は C₁ ~ C₃ アルキルおよびフェニルからなる群から選択されるものである]、および

式(XII)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化32】



(XIII)

[式中、

R¹ および R³ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；

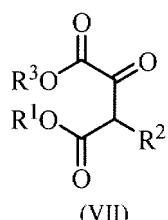
R² は C₁₀ ~ C₁₅ アルキル基から選択されるものであり；そして

R⁶ は C₁ ~ C₃ アルキルおよびフェニルからなる群から選択されるものである]からなる群から選択される化合物。

【請求項12】

式(VII)の化合物、その立体異性体またはそれらの混合物：

【化33】



(VII)

[式中、

R¹ および R³ は、独立して、置換または未置換 C₁ ~ C₂₀ アルキル基から選択されるものであり；

R² は C₁₀ ~ C₁₅ アルキル基から選択されるものであるが、但し、R¹ および R³ がエチルであり、かつ R² が n - デシルである化合物、および R¹ および R³ がエチルで

あり、かつ R² が n - ドデシルである化合物を除く]。

【請求項 1 3】

R¹ および R³ がメチルである、請求項 1 2 に記載の化合物。

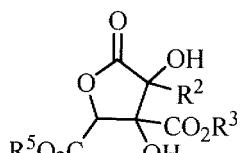
【請求項 1 4】

R¹ および R³ はメチルであり、そして R² は n - ドデシルである、請求項 1 1 または 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

式 (II) の化合物、その立体異性体、とりわけ鏡像異性体またはそれらの混合物：

【化 3 4】



(II)

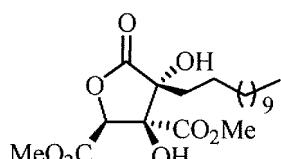
[式中、

R² は C_{1~10} ~ C_{1~5} アルキル基から選択されるものであり；

R³ および R⁵ は、独立して、置換または未置換 C_{1~10} ~ C_{1~5} アルキル基から選択されるものである]

(但し、前記式 (II) の化合物は下記を表さない)。

【化 3 5】



【請求項 1 6】

請求項 1 5 で定義されている式 (II) の化合物の、または、先行する請求項で定義されている式 (III) 、式 (V) 、式 (VI) 、式 (VII) 、式 (X) 、式 (XI) または式 (XII) の少なくとも 1 種の化合物の、式 (Ia) および / もしくは式 (Ib) の化合物、これらの立体異性体またはそれらの混合物、ならびに式 (Ia) および式 (Ib) の化合物の混合物またはこれらの立体異性体の混合物を合成するための使用。