【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16年11月4日(2004.11.4)

【公表番号】特表2000-502348(P2000-502348A)
【公表日】平成12年2月29日(2000.2.29)
【出願番号】特願平9-523790
【国際特許分類第７版】
　Ｃ０７Ｄ 211/22
　Ａ６１Ｐ　37/08
　Ａ６１Ｋ　31/421
　Ａ６１Ｋ　31/445
　Ｃ０７Ｄ 263/10
【ＦＩ】
　Ｃ０７Ｄ 211/22
　Ａ６１Ｋ　31/00　　６３７Ｅ
　Ａ６１Ｋ　31/42　　６０１
　Ａ６１Ｋ　31/445
　Ｃ０７Ｄ 263/10

【手続補正書】
【提出日】平成15年12月16日(2003.12.16)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】補正の内容のとおり
【補正方法】変更
【補正の内容】

手続補正書

平成１５年１２月１６日

特許庁長官殿

１．　事件の表示

適

平成０９年特許願第５２３７９０号

２．　補正をする者

氏名（名称）　オールバニー・モレキュラー・リサーチ・
インコーポレイテッド

３．　代理人

住所　〒540-0001
大阪府大阪市中央区城見１丁目３番７号　ＩＭＰビル
青山特許事務所
電話 06-6949-1261　　ＦＡＸ 06-6949-0361

氏名　弁理士　(6214) 青山　葆

４．　補正対象書類名　明細書、請求の範囲

５．　補正対象項目名　明細書、請求の範囲

特許庁
15.12.17
出願支援課
猫塚

方式審査

６．補正の内容

（１）明細書

a) ２０頁下から１行の「これらの塩は、これらの塩は」を、「これらの塩は」と訂正する。

b) ３２頁４行の「反応さる前に」を、「反応させる前に」と訂正する。

c) ３７頁１０行の「条件下。ハロゲン」を、「条件下、ハロゲン」と訂正する。

d) ４１頁下から１３行の「反られている」を、「知られている」と訂正する。

e) ４５頁下から４行の「記載記した」を、「記載した」と訂正する。

f) ４９頁下から５行の「スラリー化にし」を、「スラリー化し」と訂正する。

g) ５４頁５行の「酢酸エテチル」を、「酢酸エチル」と訂正する。

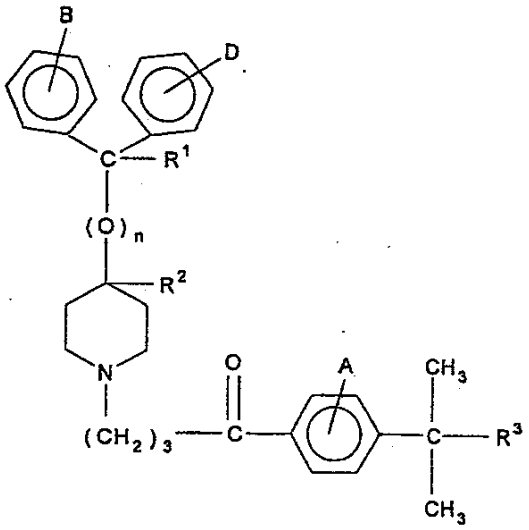
（２）請求の範囲

別紙のとおり。

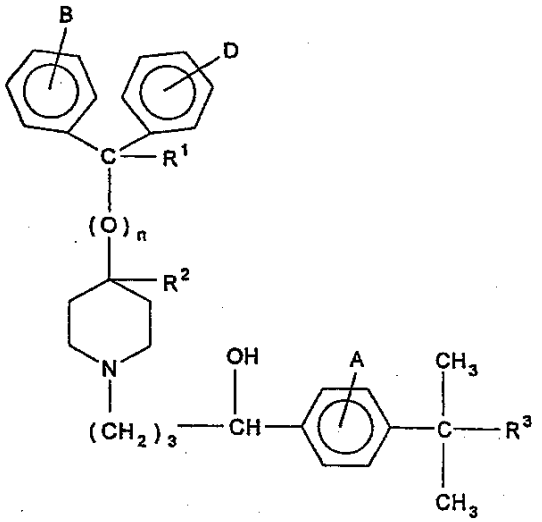
(別紙)

請 求 の 範 囲

1．式：



または



式中、

nは0または1であり；

R^1は水素またはヒドロキシであり；

R^2は水素であるか；

または、nが0であるとき、R^1およびR^2は一緒になってR^1およびR^2が結合している各炭素原子間に1つの第2級結合を形成しており、ただし、n

が１のときはR^1およびR^2はそれぞれ水素であり；

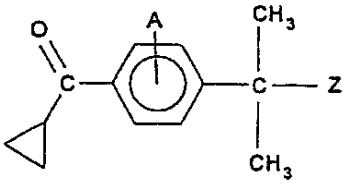
R^3は－ＣＯＯＨまたは－ＣＯＯR^4であり；

R^4はアルキルまたはアリール部分であり；

Ａ、ＢおよびＤは、その環の置換基であり、それぞれは、異なっていても同一でもよく、かつ水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよびその他の置換基からなる群から選択されるものである、

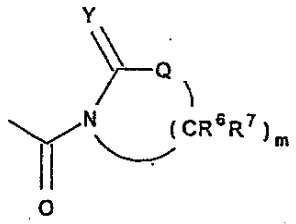
で示されるピペリジン誘導体化合物の製法であって；

下式：

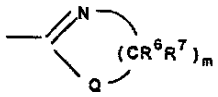


式中、

Ｚは－ＣＧ^{1}Ｇ^{2}Ｇ^3、



または



であり、

ｍは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮR^5からなる群から選択され；

Ｇ^1、Ｇ^{2}およびＧ^{3}は同一かまたは異なっており、ＯR^8、ＳR^8およびＮR^8 R^9

からなる群から選択され；

R^6およびR^7は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリー

ル部分、OR^8、SR^8およびNR^8R^9からなる群から選択され；

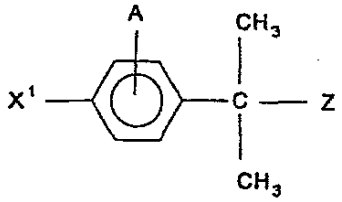
R^5、R^8およびR^9は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである；

で示される位置異性体を提供し、

この位置異性体をピペリジン化合物でピペリジン誘導体化合物に変換する、ことからなる方法。

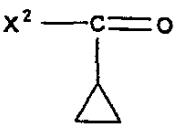
２．該位置異性体が、

式：



式中、

X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有するα，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体を、該位置異性体の生成に有効な条件下、式：



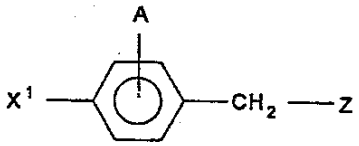
式中、

X^2はハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分、またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

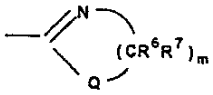
を有する化合物でアシル化することにより提供される、請求の範囲第１項に記載の方法。

３．更に、式：

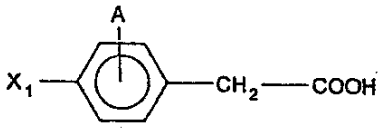


を有するα，α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体を、α，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下でメチル化剤と反応させることを含んでなる、請求の範囲第２項に記載の方法。

４．Ｚが式：



を有し、更に、式：

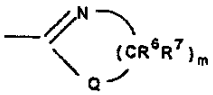


を有するα，α－ジ非置換フェニル酢酸誘導体を、α，α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下で、式：

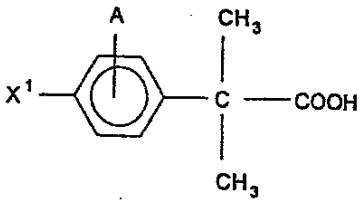
$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第３項に記載の方法。

５．Ｚが式：



を有し、更に、式：



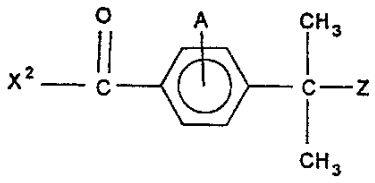
を有するα，α－ジ置換フェニル酢酸誘導体を、α，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下で、式：

$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第２項に記載の方法。

６．該位置異性体が、

式：



式中、

X^2は水素、ハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

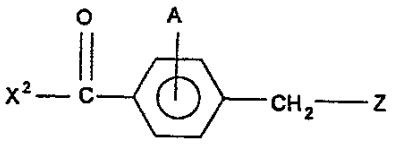
R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択される、を有する４－(α,α－ジ置換)－トルイル酸誘導体を、該位置異性体の生成に有効な条件下、式：



式中、

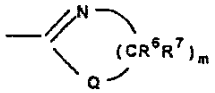
X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有する化合物と反応させることにより提供される、請求の範囲第１項に記載の方法。

７．更に、式：

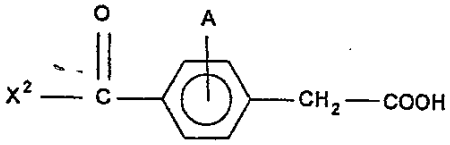


を有する４－(α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下でメチル化剤と反応させることを含んでなる、請求の範囲第６項に記載の方法。

８．Ｚが式：



を有し、更に、式：

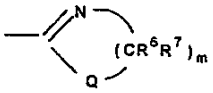


を有する４－(α－カルボキシ－α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下で、式：

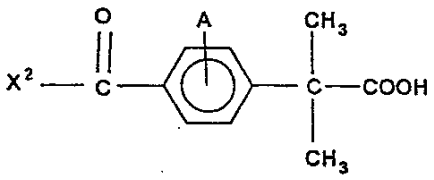
$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第７項に記載の方法。

９．Ｚが式：



を有し、更に、式：



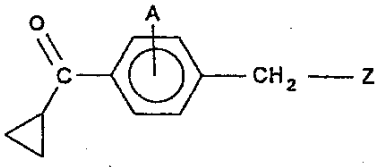
を有する４－(α－カルボキシ－α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下で、式：

$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第６項に記載の方法。

10．該位置異性体が、

式：

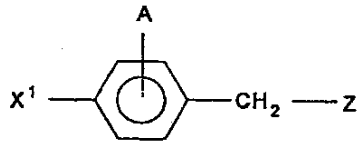


を有するα，α－ジ非置換位置異性体前駆体を提供し、

該位置異性体の生成に有効な条件下で、このα，α－ジ非置換位置異性体前駆体をメチル化することにより提供される、請求の範囲第１項に記載の方法。

11．該α，α－ジ非置換位置異性体前駆体が、

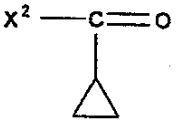
式：



式中、

X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、

を有するα，α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体を、α，α－ジ非置換位置異性体前駆体の生成に有効な条件下、式：



式中、

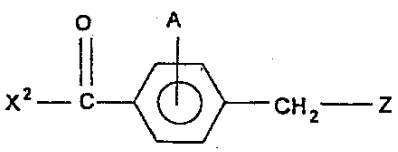
X^2はハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

を有する化合物でアシル化することにより提供される、請求の範囲第１０項に記載の方法。

12．該α，α－ジ非置換位置異性体前駆体が、

式：

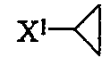


式中、

X^2は水素、ハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

を有する４－(α,α－ジ非置換)－トルイル酸誘導体を、α,α－ジ非置換位置異性体前駆体の生成に有効な条件下、式：

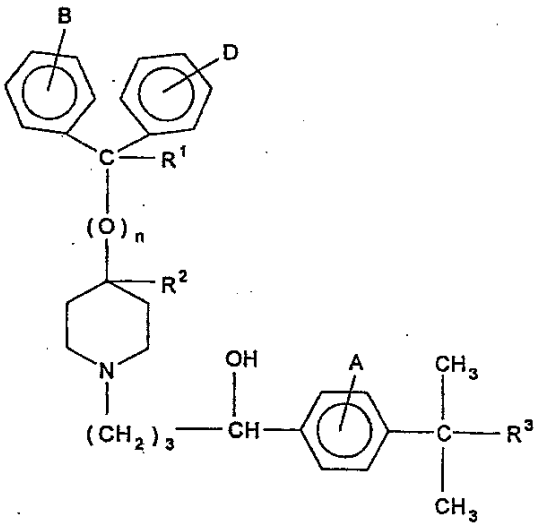


式中、

X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、

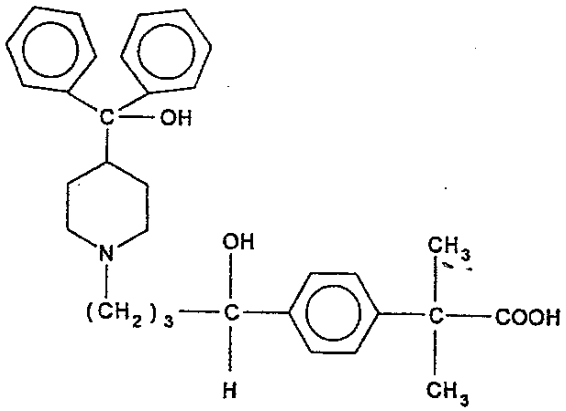
を有する化合物と反応させることにより提供される、請求の範囲第１０項に記載の方法。

13. 更に、式：



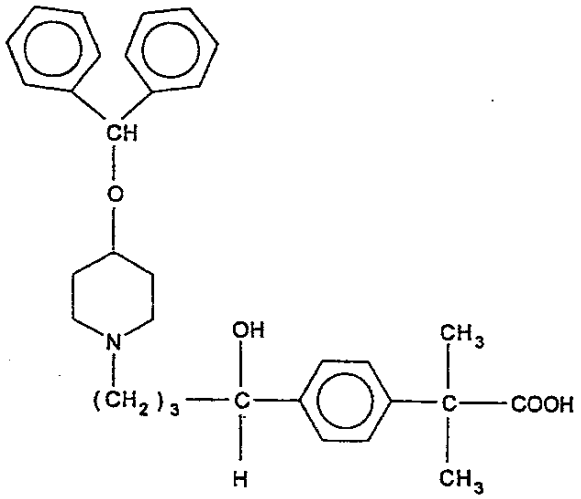
のヒドロキシル化ピペリジン誘導体化合物の形成に有効な条件下で、ピペリジン誘導体化合物を還元することを含んでなる、請求の範囲第１項に記載の方法。

14. ヒドロキシル化ピペリジン誘導体化合物が式：



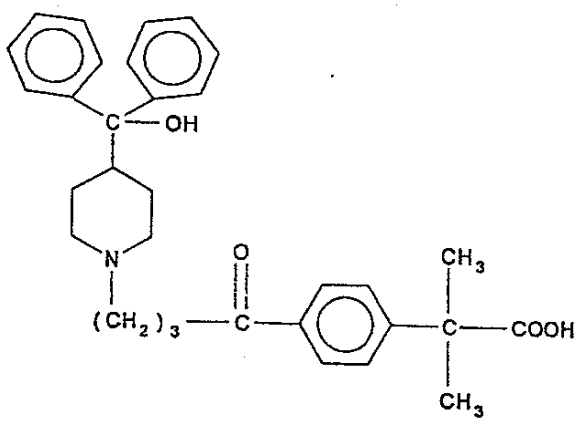
を有する、請求の範囲第１３項に記載の方法。

15．ヒドロキシル化ピペリジン誘導体化合物が式：



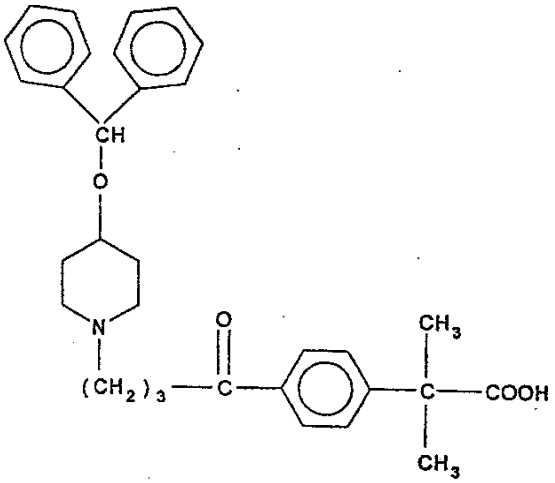
を有する、請求の範囲第１３項に記載の方法。

16．ピペリジン誘導体化合物が式：



を有する、請求の範囲第１項に記載の方法。

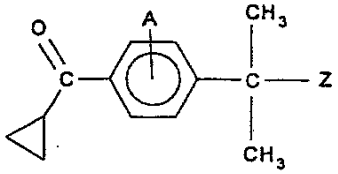
17．ピペリジン誘導体化合物が式：



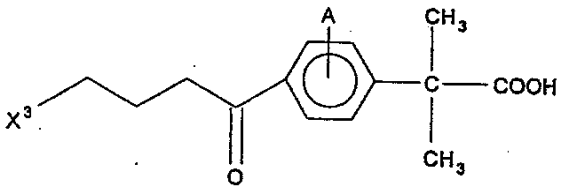
を有する、請求の範囲第１項に記載の方法。

18. 該変換が、

式：



で示される位置異性体を、式：

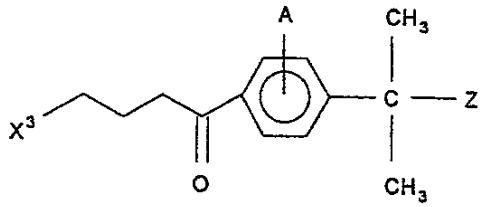


式中、X^3はハロゲンまたはヒドロキシ、アルコキシまたはアリールオキシ部分である、

で示される第１中間体化合物の形成に有効な条件下でハロゲン化することを含んでなる、請求の範囲第１項に記載の方法。

19. 該ハロゲン化が、逐次、

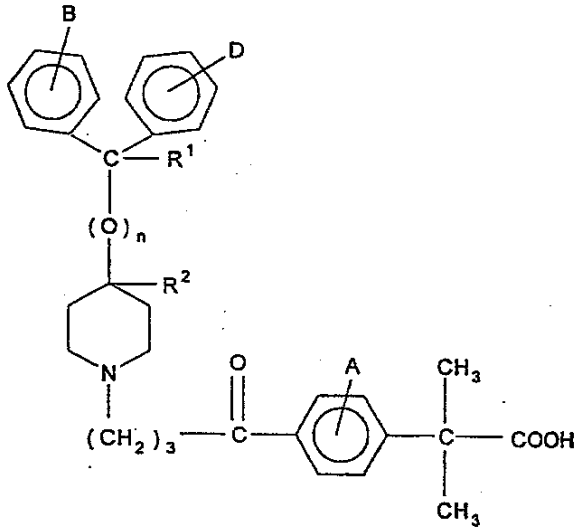
位置異性体を脱環化して式：



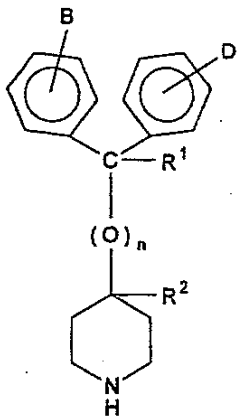
を有するオキソブチル誘導体を生成し、次いでオキソブチル誘導体を第１中間体化合物へと変換することを含んでなる、請求の範囲第１８項に記載の方法。

20．該変換が、更に

第１中間体化合物を式：



で示されるピペリジン誘導体化合物の形成に有効な条件下で式：

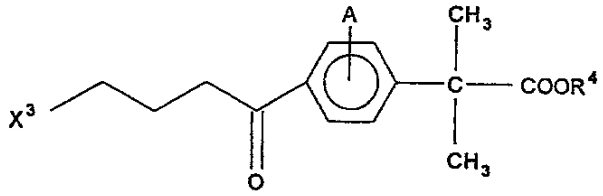


で示されるピペリジン化合物と反応させることを含んでなる、請求の範囲第

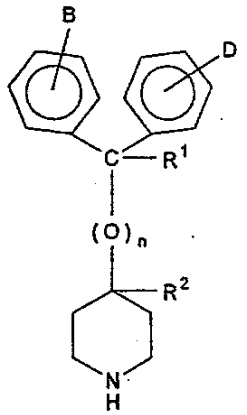
１８項に記載の方法。

21. 該変換が、更に

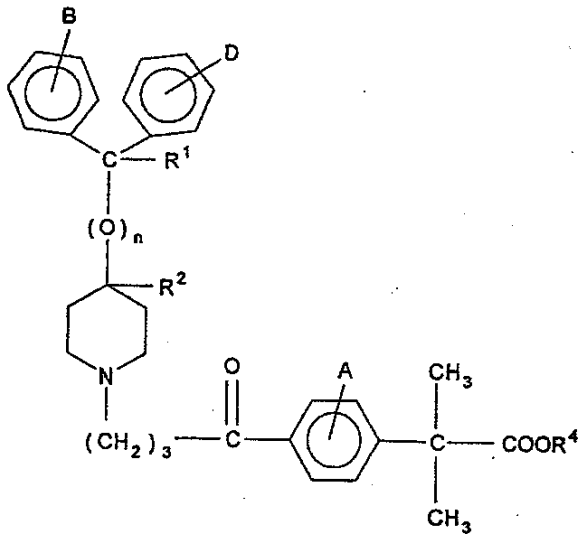
第１中間体化合物をエステル化して、式：



で示されるエステルとし、このエステルと式：

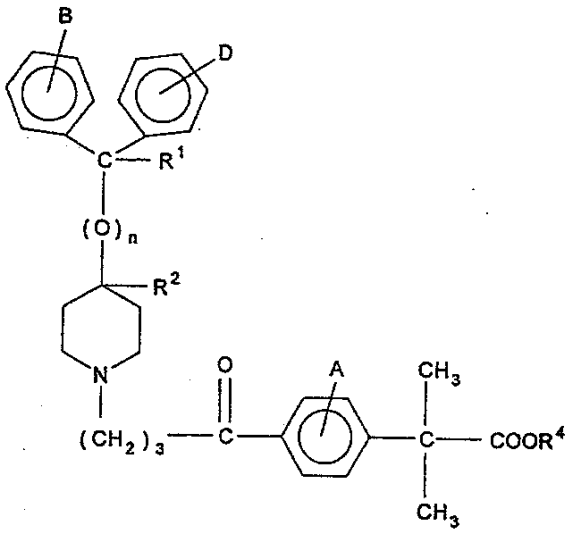


で示されるピペリジン化合物を、式：

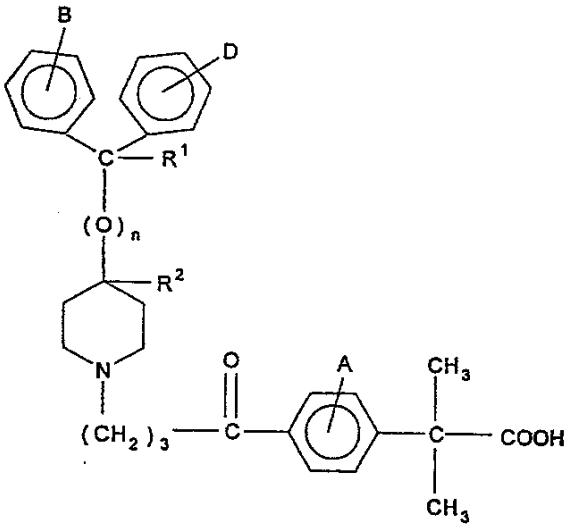


で示されるピペリジン誘導体化合物の形成に有効な条件下で反応させることを含んでなる、請求の範囲第１８項に記載の方法。

22. 更に、式：



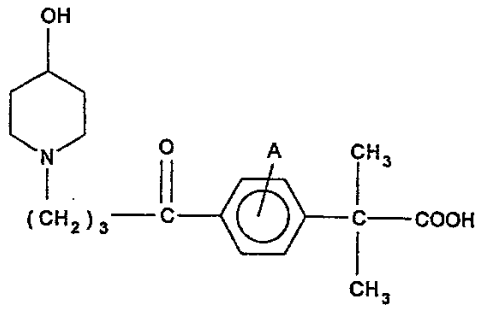
で示されるピペリジン誘導体化合物を加水分解して、式：



で示されるピペリジン誘導体化合物とすることを含んでなる、請求の範囲第２１項に記載の方法。

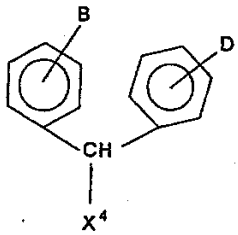
23. ｎが１であり、該変換が、更に

第１中間体化合物を式：



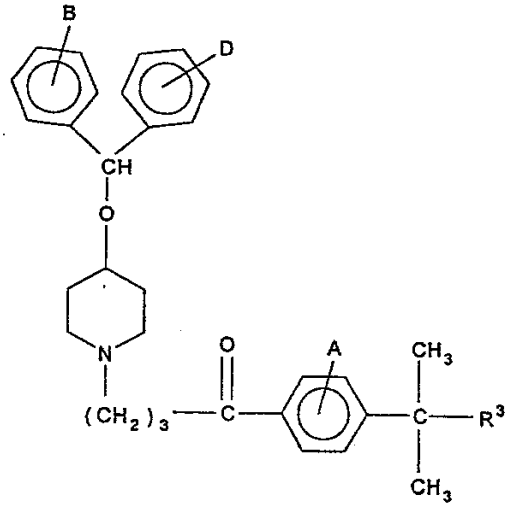
を有するＮ－置換ヒドロキシピペリジンの生成に有効な条件下で４－ヒドロキシピペリジンと反応させ、そして

このＮ－置換ヒドロキシピペリジンを、式：



式中、X_4はハロゲンである、

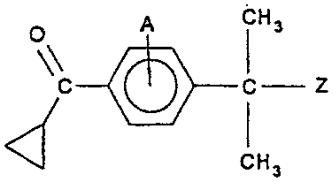
を有するジアリールハロメタンと、式、



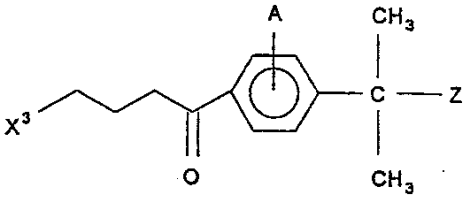
で示されるピペリジン化合物誘導体の形成に有効な条件下で反応させることを含んでなる、請求の範囲第１８項に記載の方法。

24．該変換が、

式：



で示される位置異性体を、式：

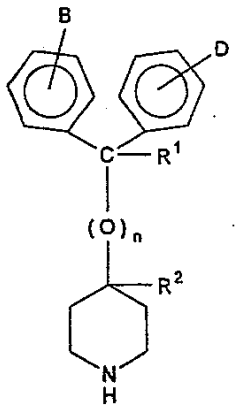


式中、X^3はハロゲンまたはヒドロキシ、アルコキシまたはアリールオキシ部分である、

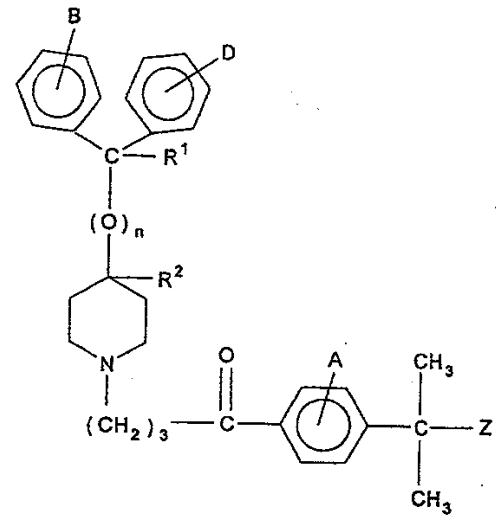
で示されるオキソブチル誘導体の形成に有効な条件下で脱環化することを含んでなる、請求の範囲第１項に記載の方法。

25．該変換が、更に

オキソブチル誘導体を式：

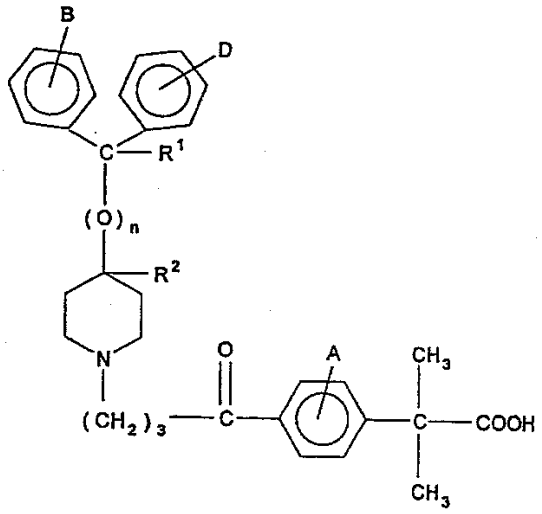


で示されるピペリジン化合物と、式：



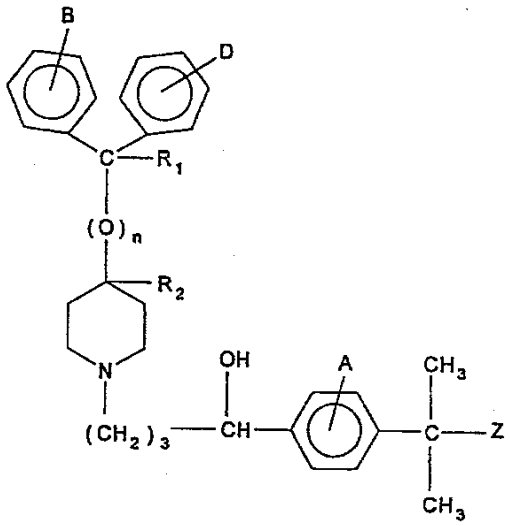
で示されるピペリジン誘導体前駆体の形成に有効な条件下で反応させることを含んでなる、請求の範囲第２４項に記載の方法。

26．更に、ピペリジン誘導体前駆体を式：



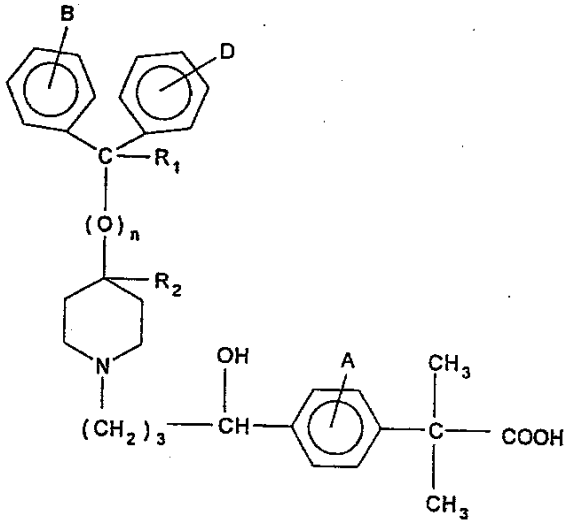
で示されるピペリジン誘導体化合物へと変換させることを含んでなる、請求の範囲第２５項に記載の方法。

27．更に、ピペリジン誘導体前駆体を式：



で示されるヒドロキシル化ピペリジン誘導体前駆体の形成に有効な条件下で還元することを含んでなる、請求の範囲第２５項に記載の方法。

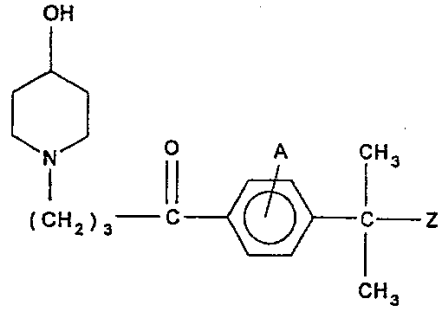
28. 更に、ヒドロキシル化ピペリジン誘導体前駆体を式：



で示されるヒドロキシル化ピペリジン誘導体化合物へと変換させることを含んでなる、請求の範囲第２７項に記載の方法。

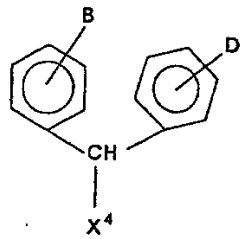
29. ｎが１であり、該変換が、更に

オキソブチル誘導体を、式：



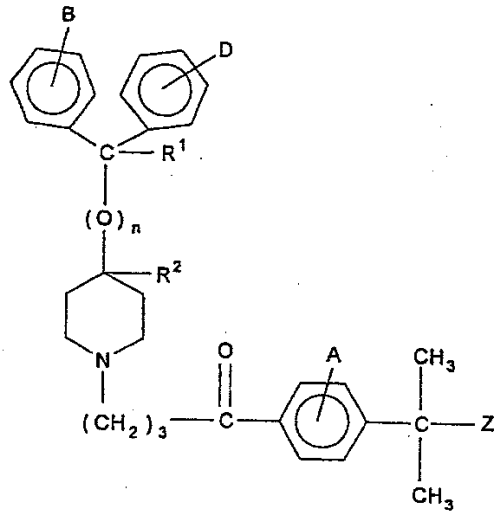
を有するＮ－置換ヒドロキシピペリジンの生成に有効な条件下で４－ヒドロキシピペリジンと反応させ、そして

Ｎ－置換ヒドロキシピペリジンを、式：



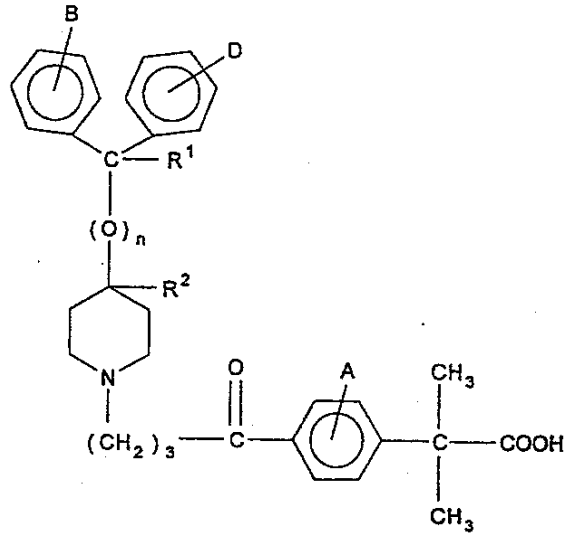
式中、X^4はハロゲンである、

で示されるジアリールハロメタンと、式：



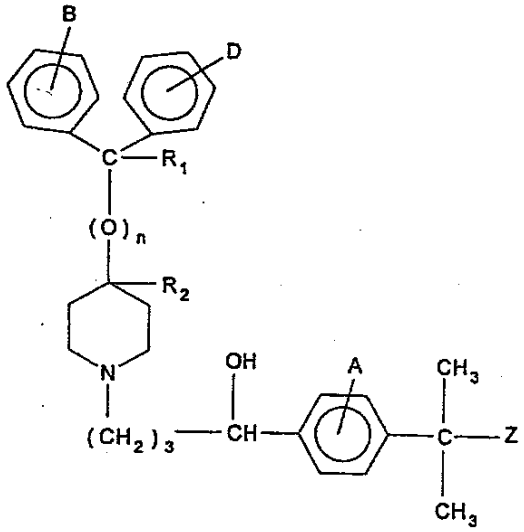
で示されるピペリジン誘導体前駆体の形成に有効な条件下、反応させることを含んでなる、請求の範囲第２４項に記載の方法。

30．更に、ピペリジン誘導体前駆体を式：



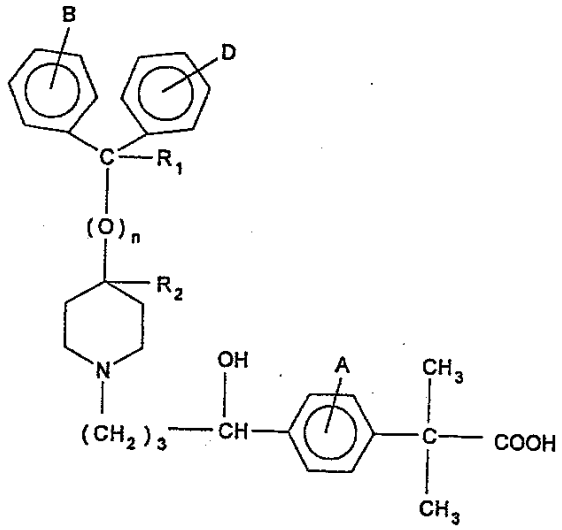
で示されるピペリジン誘導体化合物へと変換することを含んでなる、請求の範囲第２９項に記載の方法。

31．更に、ピペリジン誘導体前駆体を、式：



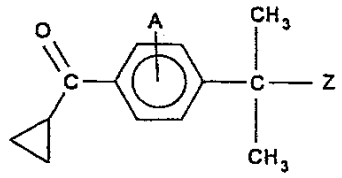
で示されるヒドロキシル化ピペリジン誘導体前駆体の形成に有効な条件下で還元することを含んでなる、請求の範囲第２９項に記載の方法。

32．更に、ヒドロキシル化ピペリジン誘導体前駆体を式：



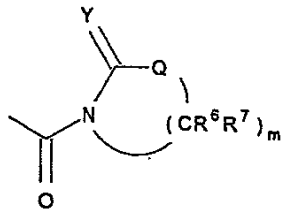
で示されるヒドロキシル化ピペリジン誘導体化合物へと変換することを含んでなる、請求の範囲第３１項に記載の方法。

33．式：

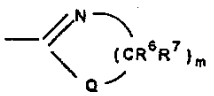


式中、

Ｚは－ＣＧ^{1}Ｇ^{2}Ｇ^{3}、



または



であり、

ｍは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮＲ^{5}からなる群か

ら選択され；

G^1、G^2およびG^3は同一かまたは異なっており、OR^8、SR^8およびNR^8R^9

からなる群から選択され；

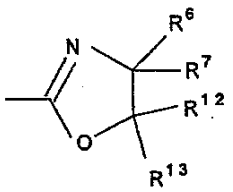
R^6およびR^7は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、OR^8、SR^8およびNR^8R^9からなる群から選択され；

R^5、R^8およびR^9は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；

Aはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものである、

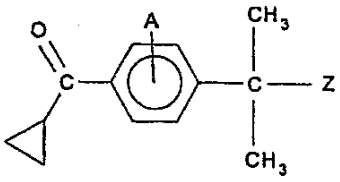
を有する位置異性体。

34. Zが



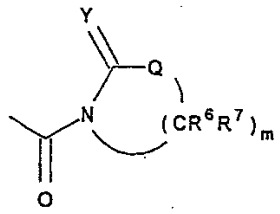
であり、R^6およびR^7がそれぞれメチルであり、R^{12}およびR^{13}がそれぞれ水素である、請求の範囲第３３項に記載の位置異性体。

35. 式：

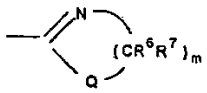


式中、

Zは$-CG^1G^2G^3$、



または



であり、

mは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮＲ[5]からなる群から選択され；

Ｇ[1]、Ｇ[2]およびＧ[3]は同一かまたは異なっており、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]

からなる群から選択され；

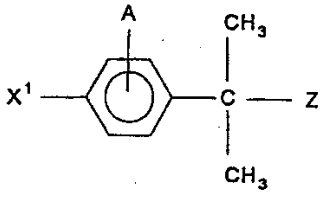
Ｒ[6]およびＲ[7]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]からなる群から選択され；

Ｒ[5]、Ｒ[8]およびＲ[9]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；そして

Ａはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものである、

で示される位置異性体の製法であって、

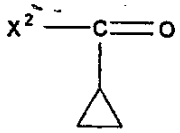
式：



式中、

Ｘ[1]はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキ

ルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有するα,α－ジ置換メチルベンゼン誘導体を、位置異性体の生成に有効な条件下、式：



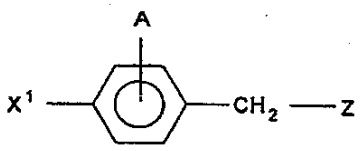
式中、

X^2はハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

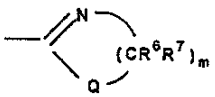
を有する化合物でアシル化することを含んでなる、方法。

36．更に、式：

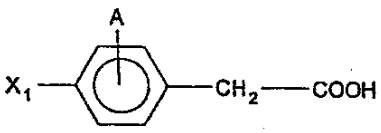


を有するα,α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体をα,α－ジ置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下でメチル化剤と反応させることを含んでなる、請求の範囲第３５項に記載の方法。

37．Ｚが式：



を有し、更に、式：

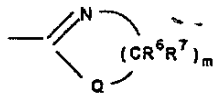


を有するα,α－ジ非置換フェニル酢酸誘導体を、α,α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下で式：

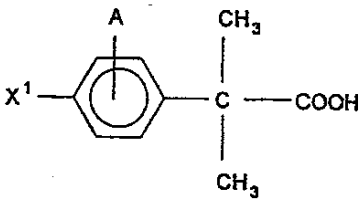
$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第３６項に記載の方法。

38. Ｚが式：



を有し、更に、式：

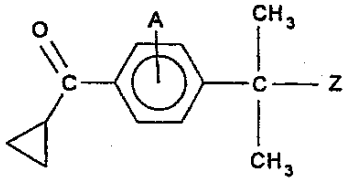


を有するα，α－ジ置換フェニル酢酸誘導体を、α，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体の生成に有効な条件下で式：

$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

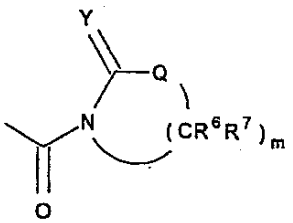
を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第３５項に記載の方法。

39. 式：

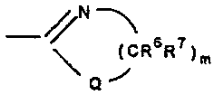


式中、

Ｚは－ＣＧ^{1}Ｇ^{2}Ｇ^3、



または



であり、

mは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮＲ[5]からなる群から選択され；

Ｇ[1]、Ｇ[2]およびＧ[3]は同一かまたは異なっており、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]

からなる群から選択され；

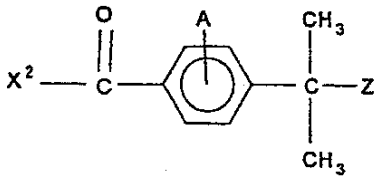
Ｒ[6]およびＲ[7]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]からなる群から選択され；そして

Ｒ[5]、Ｒ[8]およびＲ[9]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；さらに

Ａはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものである、

で示される位置異性体の製法であって、

式：

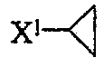


式中、

Ｘ[2]は、水素、ハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－ＯＲ[10]を有する部分、式－ＳＲ[10]を有する部分またはアミンであり、そして

Ｒ[10]は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択される、

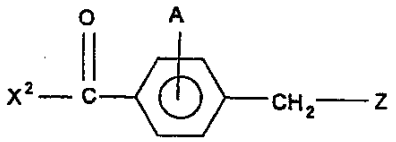
を有する４－(α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体を、位置異性体の生成に有効な条件下、式：



式中、

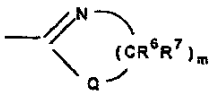
X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有する化合物と反応させることを含む、方法。

40. 更に、式：

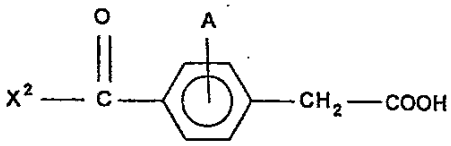


を有する４－(α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下でメチル化剤と反応させることを含んでなる、請求の範囲第３９項に記載の方法。

41. Ｚが式：



を有し、更に、式：

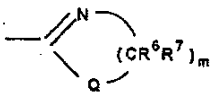


を有する４－(α－カルボキシ－α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ非置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下で式：

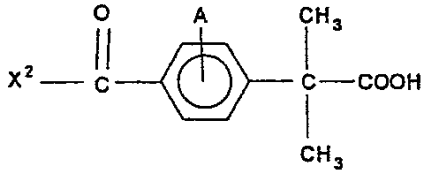
$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含む、請求の範囲第４０項に記載の方法。

42. Ｚが式：



を有し、該方法が更に、式：

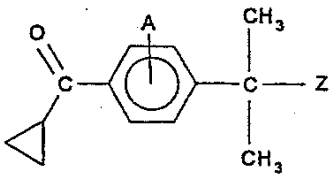


を有する４－(α－カルボキシ－α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体を、４－(α,α－ジ置換)トルイル酸誘導体の生成に有効な条件下で式：

$$H_2N-(CR^6R^7)_m-Q-H$$

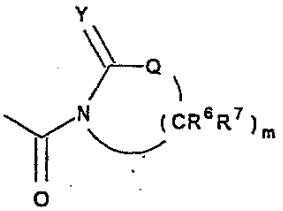
を有するアミノアルキル誘導体と反応させることを含んでなる、請求の範囲第４１項に記載の方法。

43. 式：

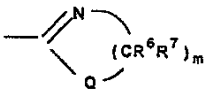


式中、

Ｚは－ＣＧ^{1}Ｇ^{2}Ｇ^3、



または



であり、

ｍは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮＲ^{5}からなる群から選択され；

Ｇ^1、Ｇ^{2}およびＧ^{3}は同一かまたは異なっており、ＯＲ^8、ＳＲ^{8}およびＮＲ^{8}Ｒ^9

からなる群から選択され；

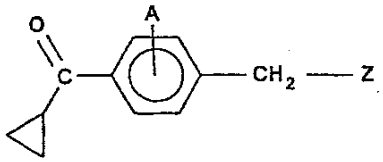
R^6およびR^7は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、OR^8、SR^8およびNR^8R^9からなる群から選択され；

R^5、R^8およびR^9は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；そして

Aはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものである、

で示される位置異性体の製法であって、

式：

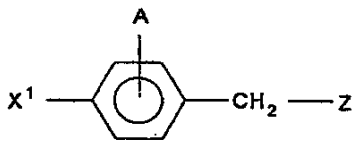


を有するα，α－ジ非置換位置異性体前駆体を提供し、そして

位置異性体の生成に有効な条件下でこのα，α－ジ非置換位置異性体前駆体をメチル化することを含んでなる、方法。

44. 該α，α－ジ非置換位置異性体前駆体が、

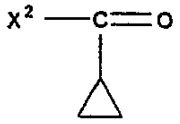
式：



式中、

X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、

を有するα，α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体を、α，α－ジ非置換位置異性体前駆体の生成に有効な条件下、式：



式中、

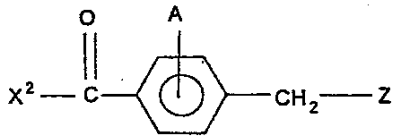
X^2はハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

を有する化合物でアシル化することにより提供される、請求の範囲第４３項に記載の方法。

45．該α，α－ジ非置換位置異性体前駆体が、

式：



式中、

X^2はハロゲン、アルカリ金属酸化物、式－OR^{10}を有する部分、式－SR^{10}を有する部分またはアミンであり、そして

R^{10}は水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択されるものである、

を有する４－(α，α－ジ非置換)－トルイル酸誘導体を、α，α－ジ非置換位置異性体前駆体の生成に有効な条件下、式：

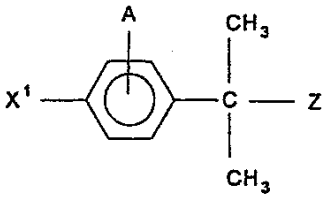


式中、

X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、

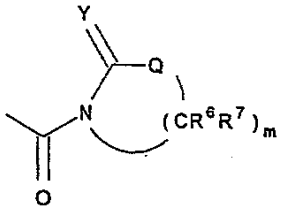
を有する化合物でアシル化することにより提供される、請求の範囲第４４項に記載の方法。

46. 式：

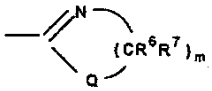


式中、

Zは－CG^{1}G^{2}G^3、



または



であり、

mは１ないし６の整数であり；

QおよびYは、同一かまたは異なっており、O、SおよびNR^{5}からなる群から選択され；

G^1、G^{2}およびG^{3}は同一かまたは異なっており、OR^8、SR^{8}およびNR^{8}R^9

からなる群から選択され；

R^{6}およびR^{7}は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、OR^8、SR^{8}およびNR^{8}R^{9}からなる群から選択され；

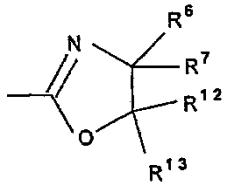
R^5、R^{8}およびR^{9}は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；

Aはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものであり；そして

X^{1}はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキ

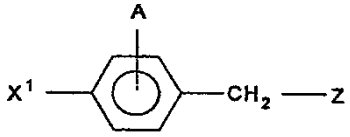
ルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有するα，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体。

47. Zが



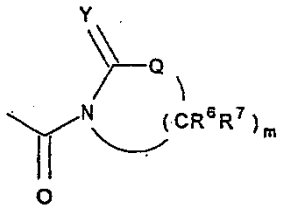
であり、R^6およびR^7がそれぞれメチルであり、R^{12}およびR^{13}がそれぞれ水素であり、X^1が臭素である、請求の範囲第４６項に記載のα，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体。

48. 式：

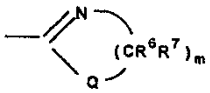


式中、

Zは－$CG^1G^2G^3$、



または



であり、

mは１ないし６の整数であり；

QおよびYは、同一かまたは異なっており、O、SおよびNR^5からなる群から選択され；

G^1、G^2およびG^3は同一かまたは異なっており、OR^8、SR^8およびNR^8

R^9

からなる群から選択され；

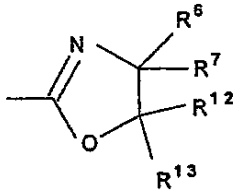
R^6およびR^7は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、OR^8、SR^8およびNR^8R^9からなる群から選択され；

R^5、R^8およびR^9は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；

Aはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものであり；

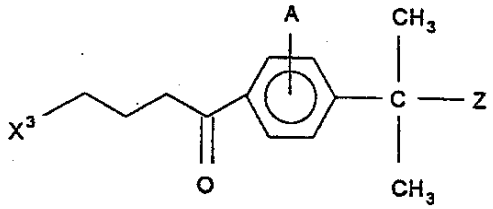
X^1はハロゲン、トリアルキルまたはトリアリールスズ、ホウ酸トリアルキルまたはトリアリール、トリアルキルケイ素、アルキルハロケイ素、置換スルホン酸エステル、または有機金属カップリング反応に有用な置換基である、を有するα，α－ジ非置換メチルベンゼン誘導体。

49．Zが



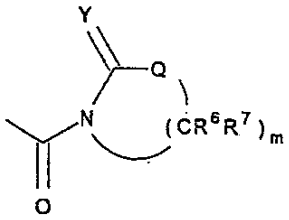
であり、R^6およびR^7がそれぞれメチルであり、R^{12}およびR^{13}がそれぞれ水素であり、X^1が臭素である、請求の範囲第４８項に記載のα，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体。

50．式：

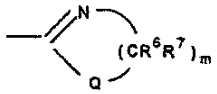


式中、

Zは－$CG^1G^2G^3$、



または



であり、

mは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮＲ[5]からなる群から選択され；

Ｇ[1]、Ｇ[2]およびＧ[3]は同一かまたは異なっており、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]からなる群から選択され；

Ｒ[6]およびＲ[7]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、ＯＲ[8]、ＳＲ[8]およびＮＲ[8]Ｒ[9]からなる群から選択され；

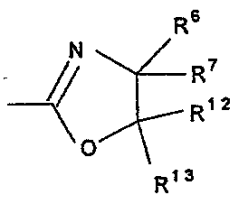
Ｒ[5]、Ｒ[8]およびＲ[9]は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；

Ａはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものであり；そして

Ｘ[3]はハロゲンまたはヒドロキシ、アルコキシまたはアリールオキシ部分である、

を有するオキソブチル誘導体。

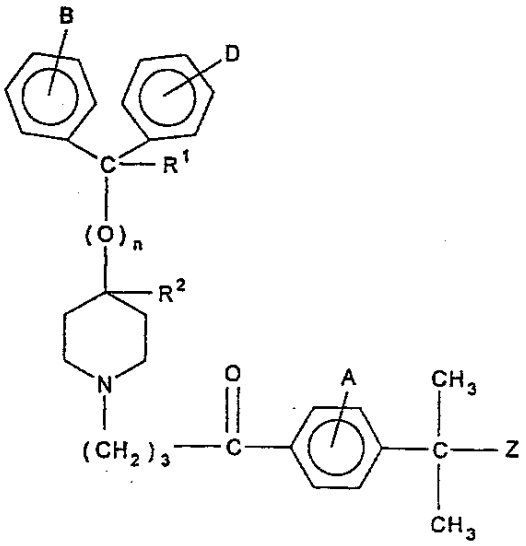
51．Ｚが



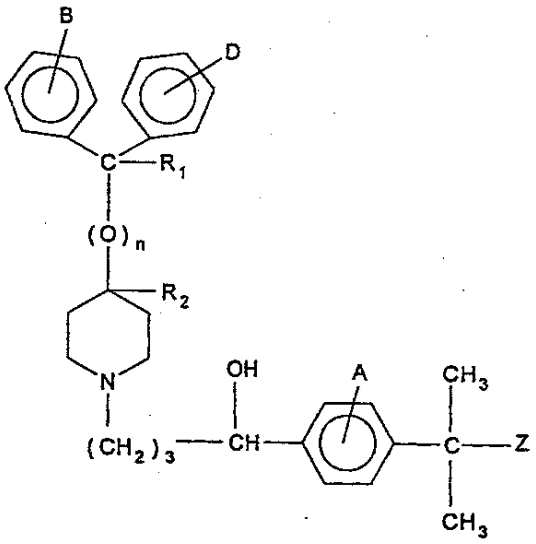
であり、Ｒ[6]およびＲ[7]がそれぞれメチルであり、Ｒ[12]およびＲ[13]がそれぞれ

水素であり、X^3がハロゲンである、請求の範囲第５０項に記載のα，α－ジ置換メチルベンゼン誘導体。

52．式：



または



式中、

ｎは０または１であり；

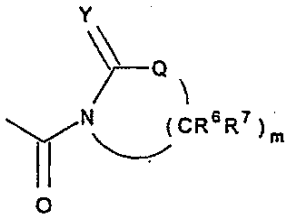
R^1は水素またはヒドロキシであり；

R^2は水素であるか；

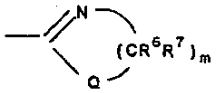
または、ｎが０であるとき、R^1およびR^2は一緒になってR^1およびR^2が

結合している各炭素原子間に１つの第２級結合を形成しており、ただし、ｎが１のときはR^1およびR^2はそれぞれ水素であり；

Ｚは－$CG^1G^2G^3$、



または



であり、

ｍは１ないし６の整数であり；

ＱおよびＹは、同一かまたは異なっており、Ｏ、ＳおよびＮR^5からなる群から選択され；

G^1、G^2およびG^3は同一かまたは異なっており、ＯR^8、ＳR^8およびＮR^8R^9

からなる群から選択され；

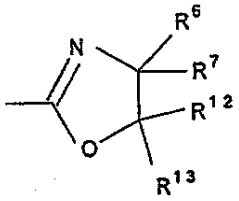
R^6およびR^7は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分、アリール部分、ＯR^8、ＳR^8およびＮR^8R^9からなる群から選択され；

R^5、R^8およびR^9は同一かまたは異なっており、水素、アルキル部分およびアリール部分からなる群から選択され；

Ａ、ＢおよびＤはその環の置換基であり、それぞれ異なっていても同一でもよく、水素、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシおよび他の置換基からなる群から選択されるものである、

を有するピペリジン誘導体前駆体。

53．Ｚが



であり、R^6およびR^7がそれぞれメチルであり、R^{12}およびR^{13}がそれぞれ水素である、請求の範囲第５２項に記載のピペリジン誘導体前駆体。

54．請求の範囲第５３項に記載のピペリジン誘導体前駆体の有効量を患者に投与することを含んでなる、患者のアレルギー反応処置法。

55．請求の範囲第５２項に記載のピペリジン誘導体前駆体の有効量を患者に投与することを含んでなる、患者のアレルギー反応処置法。