

【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20年3月27日(2008.3.27)

【公開番号】特開2005-272450(P2005-272450A)

【公開日】平成17年10月6日(2005.10.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-039

【出願番号】特願2005-46713(P2005-46713)

【国際特許分類】

C 07 D 211/22 (2006.01)

C 07 D 265/30 (2006.01)

【F I】

C 07 D 211/22 C S P

C 07 D 265/30

C 07 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月6日(2008.2.6)

【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

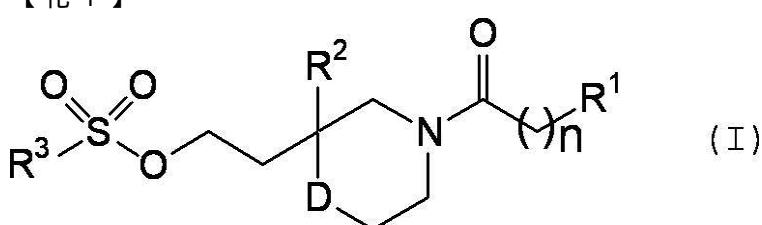
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式(I)

【化1】



(式中、

R¹は、C₁ - C₄アルコキシ及びC₁ - C₄ハロゲン化アルキルから選択される1乃至3個の基で置換されたフェニル基を示し、

R²は、1乃至3個のハロゲン原子で置換されたフェニル基を示し、

R³は、ハロゲン原子又はニトロ基で置換されたフェニル基を示し、

Dは、酸素原子又はメチレン基を示し、

nは、0又は1を示す。)

を有する化合物。

【請求項2】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項1に記載された化合物。

【請求項3】

R¹が、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項1に記載された化合物。

【請求項4】

R²が、1若しくは2個のフッ素原子又は塩素原子で置換されたフェニル基である、請求

項1乃至3から選択されるいずれか1項に記載された化合物。

【請求項5】

R²が、3,4-ジクロロフェニルである、請求項1乃至3から選択されるいずれか1項に記載された化合物。

【請求項6】

Dが、酸素原子である、請求項1乃至5から選択されるいずれか1項に記載された化合物。

【請求項7】

nが0である、請求項1乃至6から選択されるいずれか1項に記載された化合物。

【請求項8】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニルであり、Dがメチレン基であり、nが1である、請求項1に記載された化合物。

【請求項9】

R³が、塩素原子又はニトロ基で置換されたフェニル基である、請求項1乃至8から選択されるいずれか1項に記載された化合物。

【請求項10】

請求項1において、下記から選択されるいずれか1つの化合物：

- ・ 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、

- ・ 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、及び
- ・ 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート。

【請求項 1 1】

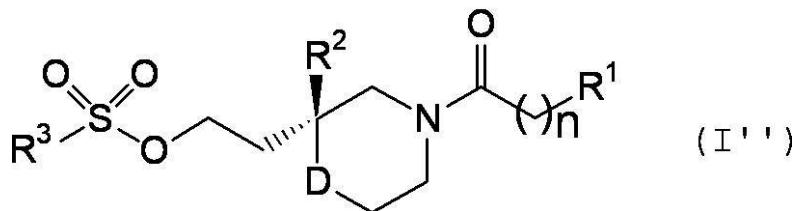
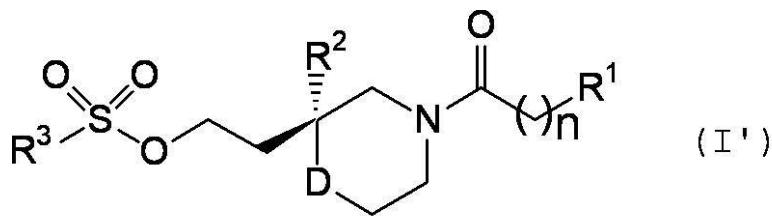
請求項 1 において、下記から選択されるいづれか 1 つの化合物：

- ・ 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び
- ・ 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート。

【請求項 1 2】

エナンチオマー過剰率が実質的に 100 % である、下記一般式 (I') 又は (I'')

【化 2】



(式中、

R¹ は、 C₁ - C₄ アルコキシ及び C₁ - C₄ ハロゲン化アルキルから選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたフェニル基を示し、

R² は、 1 乃至 3 個のハロゲン原子で置換されたフェニル基を示し、

R³ は、 ハロゲン原子又はニトロ基で置換されたフェニル基を示し、

D は、 酸素原子又はメチレン基を示し、

n は、 0 又は 1 を示す。)

を有する化合物。

【請求項 1 3】

R¹が、3 - イソプロピルオキシフェニル、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル又は3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項12に記載された化合物。

【請求項 1 4】

R¹が、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル又は3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項12に記載された化合物。

【請求項 1 5】

R²が、1若しくは2個のフッ素原子又は塩素原子で置換されたフェニル基である、請求項12乃至14から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 1 6】

R²が、3 , 4 - ジクロロフェニルである、請求項12乃至14から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 1 7】

Dが、酸素原子である、請求項12乃至16から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 1 8】

nが0である、請求項12乃至17から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 1 9】

R¹が、3 - イソプロピルオキシフェニルであり、Dがメチレン基であり、nが1である、請求項12に記載された化合物。

【請求項 2 0】

R³が、塩素原子又はニトロ基で置換されたフェニル基である、請求項12乃至19から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 2 1】

一般式(I')を有する、請求項12乃至20から選択されるいづれか1項に記載された化合物。

【請求項 2 2】

請求項12において、下記から選択されるいづれか1つの化合物：

- ・ (2R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル} - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル} - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル} - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、

- 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル } エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、及び
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート。

【請求項 2 3】

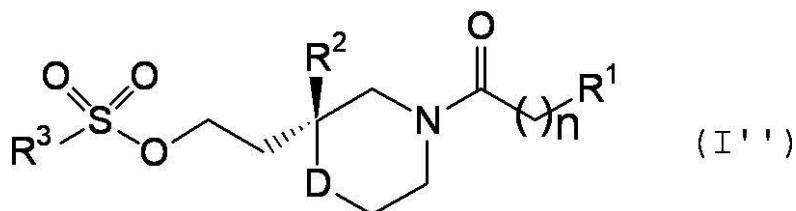
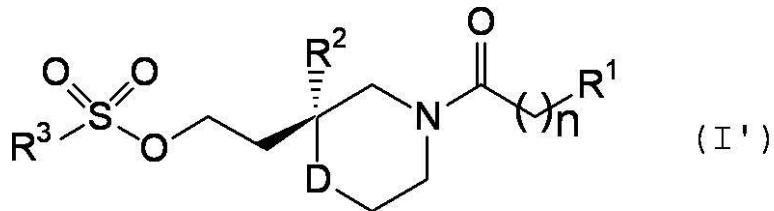
請求項 1 2 において、下記から選択されるいずれか 1 つの化合物：

- (2 R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (2 R) - 2 - [4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (2 R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [3 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 1 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート。

【請求項 2 4】

下記一般式 (I ') を有する化合物と、下記一般式 (I ' ') を有する化合物

【化3】



(一般式(I')及び(I'')中、

R¹は、C₁-C₄アルコキシ及びC₁-C₄ハロゲン化アルキルから選択される1乃至3個の基で置換されたフェニル基を示し、

R²は、1乃至3個のハロゲン原子で置換されたフェニル基を示し、

R³は、C₁-C₄アルキル基、フェニル基、又はC₁-C₄アルキル基、ハロゲン原子若しくはニトロ基で置換されたフェニル基を示し、

Dは、酸素原子又はメチレン基を示し、

nは、0又は1を示す。)

との混合物を、溶媒を用いて1乃至3回結晶化することにより、エナンチオマー過剰率が実質的に100%一般式(I')を有する化合物若しくは一般式(I'')を有する化合物を得る方法。

【請求項25】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項24に記載された方法。

【請求項26】

R¹が、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項24に記載された方法。

【請求項27】

R²が、1若しくは2個のフッ素原子又は塩素原子で置換されたフェニル基である、請求項24乃至26から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項28】

R²が、3,4-ジクロロフェニルである、請求項24乃至26から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項29】

R³が、メチル基、フェニル基、又はメチル、塩素原子若しくはニトロ基で置換されたフェニル基である、請求項24乃至28から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項30】

Dが、酸素原子である、請求項24乃至29から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項31】

nが0である、請求項24乃至30から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項32】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニルであり、Dがメチレン基であり、nが1である、請求項24に記載された方法。

【請求項33】

R^3 が、塩素原子又はニトロ基で置換されたフェニル基である、請求項 2 4 乃至 3 2 から選択されるいずれか1項に記載された方法。

【請求項 3 4】

請求項 2 4 乃至 3 3 から選択されるいずれか1項に記載された、エナンチオマー過剰率が実質的に 100 % の一般式 (I') を有する化合物を得る方法。

【請求項 3 5】

請求項 2 4 において、下記から選択されるいずれか 1 つの化合物を得る方法：

- ・ (2R) - 2 - [2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル ベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (2R) - 2 - [4 - { [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、

ト、

- ・ (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル ベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、及び
- ・ (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート。

【請求項 3 6】

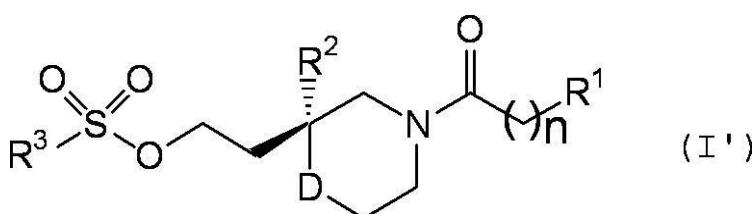
請求項 2 4 において、下記から選択されるいずれか 1 つの化合物を得る方法：

- ・ (2 R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2 R) - 2 - [4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (2 R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- ・ (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び
- ・ (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート。

【請求項 3 7】

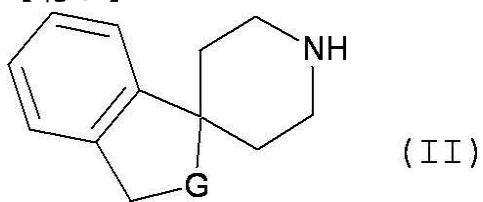
一般式 (I')

【化 4】



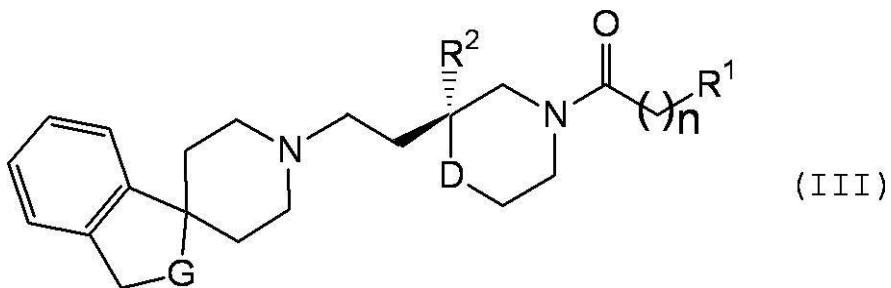
(式中、 R¹ は、 C₁ - C₄ アルコキシ及び C₁ - C₄ ハロゲン化アルキルから選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたフェニル基を示し、 R² は、 1 乃至 3 個のハロゲン原子で置換されたフェニル基を示し、 R³ は、フェニル基又は、 C₁ - C₄ アルキル基、ハロゲン原子又はニトロ基で置換されたフェニル基を示し、 D は、酸素原子又はメチレン基を示し、 n は、 0 又は 1 を示す。) を有する化合物と、一般式 (II)

【化5】



(式中、Gは、>C-OH又は>S-Oを示す。)を有する化合物とを反応させることを特徴とする、一般式(III)

【化6】



(式中、D、G、R¹、R²及びnは前記と同意義を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩の製造方法。

【請求項38】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項37に記載された方法。

【請求項39】

R¹が、3,4,5-トリメトキシフェニル又は3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルである、請求項37に記載された方法。

【請求項40】

R²が、1若しくは2個のフッ素原子又は塩素原子で置換されたフェニル基である、請求項37乃至39から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項41】

R²が、3,4-ジクロロフェニルである、請求項37乃至39から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項42】

R³が、フェニル基、又はメチル、塩素原子若しくはニトロ基で置換されたフェニル基である、請求項37乃至41から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項43】

Dが、酸素原子である、請求項37乃至42から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項44】

nが0である、請求項37乃至43から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項45】

R¹が、3-イソプロピルオキシフェニルであり、Dがメチレン基であり、nが1である、請求項37に記載された方法。

【請求項46】

R³が、塩素原子又はニトロ基で置換されたフェニル基ある、請求項37乃至45から選択されるいづれか1項に記載された方法。

【請求項47】

一般式(I')を有する化合物が下記から選択されるいづれか1つの化合物である、請求項37に記載された方法：

4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 ,
 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 ,
 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 ,
 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 ,
 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル ベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 2 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - メチルベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - ニトロベンゼンスルホナート、
 • (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } -
 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル ベンゼンスルホナート。

【請求項 4 8】

一般式(I')を有する化合物が下記から選択されるいずれか1つの化合物である、請求項37に記載された方法：

- (2R) - 2 - [2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- (2R) - 2 - [4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び
- (2R) - 2 - [4 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 2 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) モルホリン - 2 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- (+) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾイル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、
- (+) - 2 - [1 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル] - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び
- (+) - 2 - [1 - { [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] アセチル } - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン - 3 - イル] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート。