

【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 0 7 D 211/22 (2006.01)

C 0 7 D 265/30 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/22 C S P

C 0 7 D 265/30

C 0 7 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

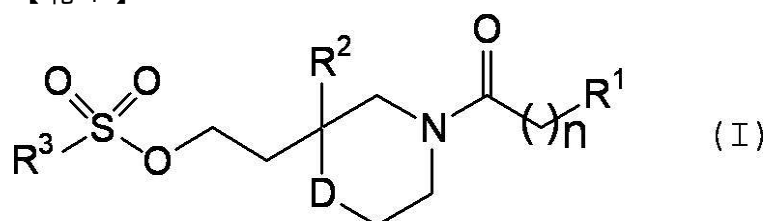
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 (I)

【化 1】



(式中、

R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ及び C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 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、

R<sup>2</sup> 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、

R<sup>3</sup> 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】

R<sup>1</sup> 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】

R<sup>1</sup> 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】

R<sup>2</sup> 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】

R<sup>2</sup> 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】

R<sup>1</sup> 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】

R<sup>3</sup> 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】

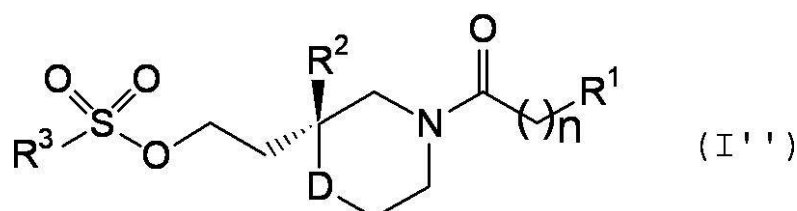
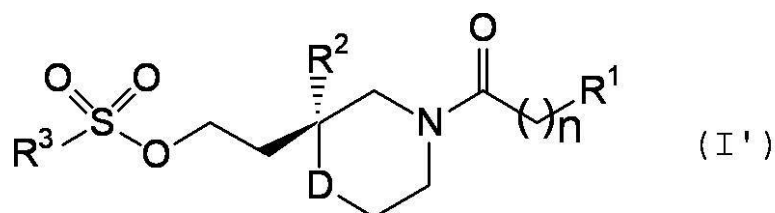
請求項 1 において、下記から選択されるいずれか 1 つの化合物：

- ・ 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 - [ 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、

R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ及び C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 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、

R<sup>2</sup> 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、

R<sup>3</sup> 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 13】

R<sup>1</sup> 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 14】

R<sup>1</sup> 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 15】

R<sup>2</sup> 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 から選択されるいずれか 1 項に記載された化合物。

## 【請求項 16】

R<sup>2</sup> が、3, 4 - ジクロロフェニルである、請求項 12 乃至 14 から選択されるいずれか 1 項に記載された化合物。

## 【請求項 17】

D が、酸素原子である、請求項 12 乃至 16 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 18】

n が 0 である、請求項 12 乃至 17 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 19】

R<sup>1</sup> 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 20】

R<sup>3</sup> 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 から選択されるいずれか 1 項に記載された化合物。

## 【請求項 21】

一般式 (I') を有する、請求項 12 乃至 20 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 22】

請求項 12 において、下記から選択されるいずれか 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)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)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 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、

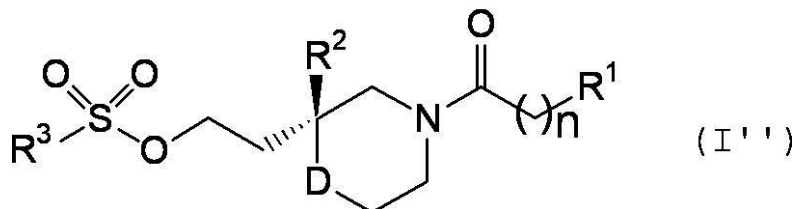
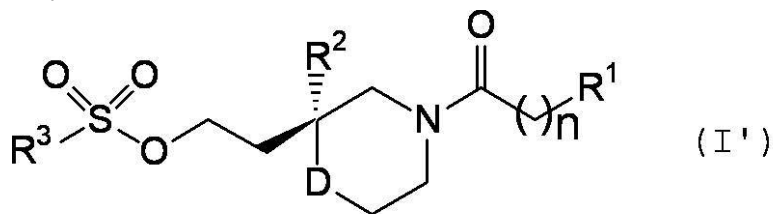
・ ( + ) - 2 - [ 3 - [ 3 , 5 - ビス ( トリフルオロメチル ) ベンゾイル ] - 1 - ( 3 ,  
4 - ジクロロフェニル ) ピペリジン - 3 - イル ] エチル 4 - クロロベンゼン  
スルホナート、及び

・ ( + ) - 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、

$R^1$  は、 $C_1 - C_4$  アルコキシ及び  $C_1 - C_4$  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、

$R^2$  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、

$R^3$  は、 $C_1 - C_4$  アルキル基、フェニル基、又は  $C_1 - C_4$  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】

$R^1$  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】

$R^1$  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】

$R^2$  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 から選択されるいずれか 1 項に記載された方法。

## 【請求項 28】

$R^2$  が、3, 4 - ジクロロフェニルである、請求項 24 乃至 26 から選択されるいずれか 1 項に記載された方法。

## 【請求項 29】

$R^3$  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 から選択されるいずれか 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 から選択されるいずれか 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 から選択されるいずれか 1 項に記載された方法。

## 【請求項 32】

$R^1$  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<sup>3</sup> 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 36】

請求項 24 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、

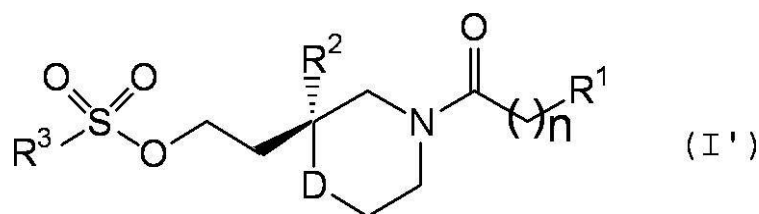
・ ( + ) - 2 - [ 1 - [ 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイル ] - 3 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) ピペリジン - 3 - イル ] エチル 4 - クロロベンゼンスルホナート、及び

・ ( + ) - 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 37】

一般式 ( I ' )

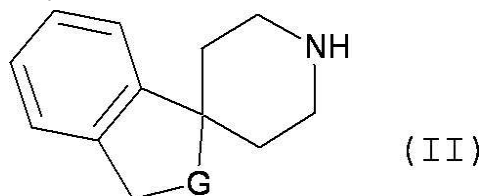
【化 4】



( 式中、 $R^1$  は、 $C_1 - C_4$  アルコキシ及び  $C_1 - C_4$  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、 $R^2$  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、 $R^3$  は、フェニル基又は、 $C_1 - C_4$  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 ( I I )

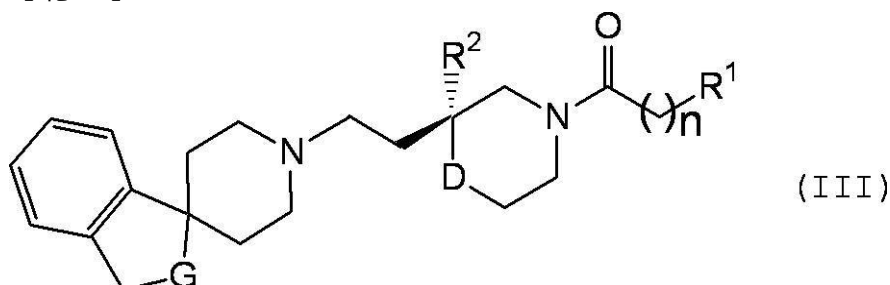


## 【化 5】



(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、 $R^1$ 、 $R^2$ 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】

$R^1$ 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】

$R^1$ 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】

$R^2$ 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から選択されるいずれか1項に記載された方法。

## 【請求項 41】

$R^2$ が、3,4-ジクロロフェニルである、請求項37乃至39から選択されるいずれか1項に記載された方法。

## 【請求項 42】

$R^3$ 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から選択されるいずれか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から選択されるいずれか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から選択されるいずれか1項に記載された方法。

## 【請求項 45】

$R^1$ 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】

$R^3$ 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から選択されるいずれか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ずれか1つの化合物である、請求項37に記載された方法：

- [illegible]

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、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 ベンゼンスルホナート。

【請求項 48】

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：

・ ( 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。