

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-501012(P2005-501012A)

【公表日】平成17年1月13日(2005.1.13)

【年通号数】公開・登録公報2005-002

【出願番号】特願2003-503168(P2003-503168)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/192	(2006.01)
A 6 1 K	31/16	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	31/198	(2006.01)
A 6 1 K	31/216	(2006.01)
A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)
A 6 1 K	31/4402	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)
C 0 7 C	59/54	(2006.01)
C 0 7 C	59/90	(2006.01)
C 0 7 C	69/738	(2006.01)
C 0 7 C	235/34	(2006.01)
C 0 7 C	259/06	(2006.01)
C 0 7 C	323/47	(2006.01)
C 0 7 C	323/52	(2006.01)
C 0 7 C	323/60	(2006.01)
C 0 7 D	213/30	(2006.01)
C 0 7 D	249/12	(2006.01)
C 0 7 D	257/04	(2006.01)
C 0 7 D	333/16	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/192
A 6 1 K	31/16
A 6 1 K	31/165
A 6 1 K	31/198
A 6 1 K	31/216
A 6 1 K	31/27
A 6 1 K	31/381
A 6 1 K	31/41

A 6 1 K 31/4196  
 A 6 1 K 31/4402  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 7/00  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 9/10 1 0 1  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 27/12  
 C 0 7 C 59/54  
 C 0 7 C 59/90  
 C 0 7 C 69/738 Z  
 C 0 7 C 235/34  
 C 0 7 C 259/06  
 C 0 7 C 323/47  
 C 0 7 C 323/52  
 C 0 7 C 323/60  
 C 0 7 D 213/30  
 C 0 7 D 249/12 5 1 2  
 C 0 7 D 257/04 B  
 C 0 7 D 333/16

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年6月10日(2005.6.10)

## 【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

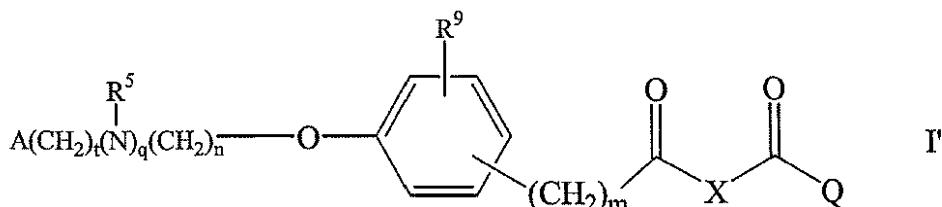
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

## 【化1】



の化合物、またはR<sup>1</sup>が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで、

nは、1または2であり；

mは、0または1であり；

qは、0または1であり；

tは、0または1であり；

$R^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$R^9$  は、水素、ハロ、または1～3個の炭素原子を有するアルコキシであり；

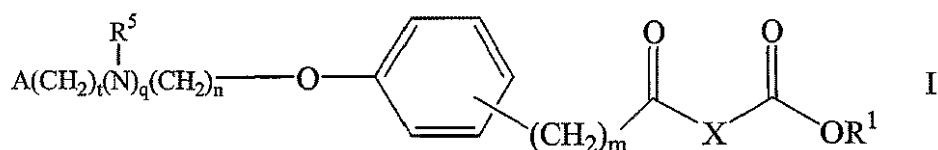
Aは、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1もしくは2個の基で置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルは、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素原子が、独立して、メチルもしくはエチルで一置換されている、シクロアルキルであるか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式I'の化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている、ヘテロ芳香族環であり；そして

Xは $-CH_2-$ であり、Qは $-OR^1$ であり、そして $R^1$ はエチルであるか；Xは $-CH_2CR^{1\ 2}CR^{1\ 3}$ または $CH_2CH(NHAc)$ であって、 $R^{1\ 2}$ および $R^{1\ 3}$ の各々が、独立して、水素またはメチルであり、Qは $OR^1$ であり、そして $R^1$ は水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであるか；あるいは、Xは $-CH_2CH_2-$ であり、Qは $NR^{1\ 0}R^{1\ 1}$ であって、 $R^{1\ 0}$ および $R^{1\ 1}$ の一方が水素、1～3個の炭素原子を有するアルキルまたはヒドロキシであり、他方は水素または1～3個の炭素原子を有するアルキルである、薬剤。

### 【請求項2】

請求項1に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

### 【化2】



の化合物、または $R^1$ が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

nは、1または2であり；

mは、0または1であり；

qは、0または1であり；

tは、0または1であり；

$R^5$ は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

Aは、非置換フェニルであるか、または、以下：

ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1もしくは2個の基で置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルは、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルもしくはエチルで一置換されている、シクロアルキルであるか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式Iの化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている、ヘテロ芳香族環であり；そして

Xは $-CH_2-$ であり、 $R^1$ はエチルであるか；またはXは $-CH_2CH_2-$ もしくは $CH_2CH(NHAc)$ であり、 $R^1$ は水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルである、薬剤。

### 【請求項3】

$R^1$ が水素またはエチルである、請求項2に記載の薬剤。

### 【請求項4】

qが0である、請求項2に記載の薬剤。

## 【請求項 5】

X が - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> - である、請求項 2 に記載の薬剤。

## 【請求項 6】

A が、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1 もしくは 2 個の基で置換されたフェニルである、請求項 2 に記載の薬剤。

## 【請求項 7】

各ハロが、独立して、フルオロまたはクロロである、請求項 6 に記載の薬剤。

## 【請求項 8】

フェニル環 A 上の各ハロ置換基がフルオロである、請求項 7 に記載の薬剤。

## 【請求項 9】

フェニル環 A が、2 個のフルオロ基で置換される、請求項 8 に記載の薬剤。

## 【請求項 10】

前記アルキルまたはアルコキシが、1 個の炭素原子を有する、請求項 6 に記載の薬剤。

## 【請求項 11】

A が、3 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルが非置換であるか、または 1 もしくは 2 個の環炭素が、独立して、メチルもしくはエチルにより一置換されている、請求項 2 に記載の薬剤。

## 【請求項 12】

前記シクロアルキルが非置換であるか、または式 I の化合物の残りの部分に共有結合された前記環炭素に隣接する 1 つもしくは両方の環炭素が、独立して、メチルもしくはエチルにより一置換されている、請求項 11 に記載の薬剤。

## 【請求項 13】

A が非置換シクロプロピルである、請求項 12 に記載の薬剤。

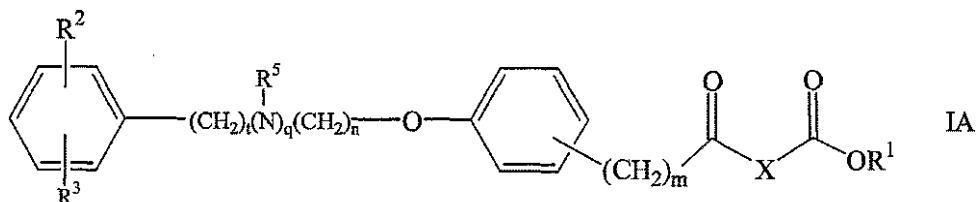
## 【請求項 14】

q が 1 であり、そして R<sup>5</sup> がメチルである、請求項 2 に記載の薬剤。

## 【請求項 15】

請求項 2 に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

## 【化 3】



の化合物、または R<sup>1</sup> が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

n は、1 または 2 であり；

m は、0 または 1 であり；

q は、0 または 1 であり；

t は、0 または 1 であり；

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、各々独立して、水素、ハロ、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択され；

R<sup>5</sup> は、1 ~ 3 個の炭素原子を有するアルキルであり；そして

X は - C H<sub>2</sub> - であり、R<sup>1</sup> はエチルであるか；または X は - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> - もしくは - C H<sub>2</sub> C H (N H A c) - であり、R<sup>1</sup> は水素または 1 ~ 7 個の炭素原子を有するアル

キルである、薬剤。

【請求項 1 6】

R<sup>1</sup> が水素またはエチルである、請求項 1 5 に記載の薬剤。

【請求項 1 7】

前記化合物が、4 - [ 4 - ( 2 - ( N - ( 2 - フルオロベンジル ) - N - メチルアミノ ) エトキシ ) フェニル ] - 4 - オキソ酪酸である、請求項 1 6 に記載の薬剤。

【請求項 1 8】

前記化合物が、( 2 R S ) 2 - ( N - アセチル ) - 4 - ( 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 1 6 に記載の薬剤。

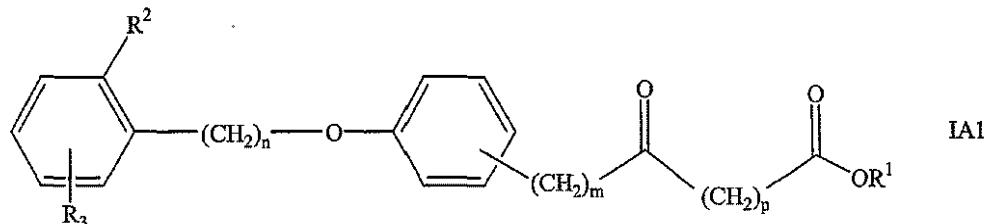
【請求項 1 9】

前記化合物が、4 - ( 3 - ( 4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 1 6 に記載の薬剤。

【請求項 2 0】

請求項 1 5 に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

【化 4】



の化合物、または R<sup>1</sup> が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

n は、1 または 2 であり；

m は、0 または 1 であり；

p は 1 あり、R<sup>1</sup> はエチルであるか；または、p は 2 あり、R<sup>1</sup> は水素もしくは 1 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、各々独立して、水素、ハロ、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、薬剤。

【請求項 2 1】

R<sup>1</sup> が水素またはエチルである、請求項 2 0 に記載の薬剤。

【請求項 2 2】

前記化合物が、4 - [ 3 - ( 2 , 6 - ( ジメトキシベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 1 に記載の薬剤。

【請求項 2 3】

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> のうちの一方が水素またはハロであり、そして他方がハロである、請求項 2 0 に記載の薬剤。

【請求項 2 4】

前記化合物が、4 - ( 4 - ( 3 - フルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 3 に記載の薬剤。

【請求項 2 5】

前記化合物が、4 - ( 4 - ( 4 - フルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 3 に記載の薬剤。

【請求項 2 6】

前記化合物が、4 - ( 4 - ( 2 - クロロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 3 に記載の薬剤。

【請求項 2 7】

$R^2$  がフルオロであり、そして  $R^3$  が水素である、請求項 2 3 に記載の薬剤。

【請求項 2 8】

前記化合物が、4 - (4 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 7 に記載の薬剤。

【請求項 2 9】

前記化合物が、4 - (4 - (2 - (2 - フルオロフェニル)エトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 7 に記載の薬剤。

【請求項 3 0】

前記化合物が、エチル 4 - (4 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチレートである、請求項 2 7 に記載の薬剤。

【請求項 3 1】

前記化合物が、エチル 4 - (3 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチレートである、請求項 2 7 に記載の薬剤。

【請求項 3 2】

$R^2$  がフルオロであり、そして  $R^3$  がフルオロである、請求項 2 1 に記載の薬剤。

【請求項 3 3】

前記化合物が、4 - (4 - (2, 5 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 3 2 に記載の薬剤。

【請求項 3 4】

前記化合物が、4 - (4 - (2, 4 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 3 2 に記載の薬剤。

【請求項 3 5】

前記化合物が、エチル 4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 3 - オキソブチレートである、請求項 3 2 に記載の薬剤。

【請求項 3 6】

$R^2$  がメチルである、請求項 2 1 に記載の薬剤。

【請求項 3 7】

前記化合物が、4 - (3 - (2 - フルオロ - 6 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 3 6 に記載の薬剤。

【請求項 3 8】

前記化合物が、エチル 4 - (3 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチレートである、請求項 3 6 に記載の薬剤。

【請求項 3 9】

前記化合物が、4 - (4 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 3 6 に記載の薬剤。

【請求項 4 0】

前記化合物が、4 - ((シクロブチル) - メトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 2 に記載の薬剤。

【請求項 4 1】

$A$  が 2, 6 - ジメチルフェニルであり； $t$  が 0 であり、 $q$  が 0 であり、 $n$  が 1 であり、 $m$  が 0 であり、 $x$  が  $-CH_2CR^{1/2}R^{1/3}$  - であり、 $R^{1/2}$  が水素であり、そして  $R^{1/3}$  が水素である、請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 4 2】

前記化合物が、4 - (3 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ - 2, 2 - ジメチル酪酸である、請求項 4 1 に記載の薬剤。

【請求項 4 3】

前記化合物が、4 - [(4 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ) - 3 - メトキシ)フェニル] - 4 - オキソ酪酸である、請求項 4 1 に記載の薬剤。

【請求項 4 4】

前記化合物が、4 - (3 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ

ブタンカルボヒドロキサム酸である、請求項 1 に記載の薬剤。

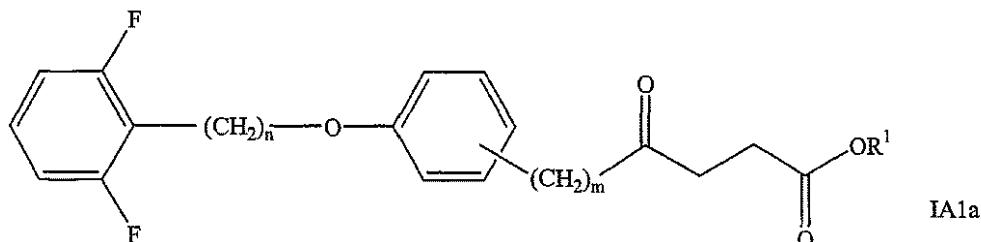
**【請求項 4 5】**

前記化合物が、4 - (3 - (2, 6 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチルアミドである、請求項 1 に記載の薬剤。

**【請求項 4 6】**

請求項 3 2 に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

**【化 5】**



の化合物、または R<sup>1</sup> が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

n は、1 または 2 であり；

m は、0 であり；

R<sup>1</sup> は、H または 1 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキルである、薬剤。

**【請求項 4 7】**

前記化合物が、4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 4 6 に記載の薬剤。

**【請求項 4 8】**

前記化合物が、エチル 4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチレートである、請求項 4 6 に記載の薬剤。

**【請求項 4 9】**

前記化合物が、4 - (3 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 4 6 に記載の薬剤。

**【請求項 5 0】**

前記化合物が、4 - (2 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 4 6 に記載の薬剤。

**【請求項 5 1】**

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> のうちの一方がメチル、メトキシ、またはペルフルオロメチルであり、そして他方が水素またはメチルである、請求項 2 1 に記載の薬剤。

**【請求項 5 2】**

R<sup>2</sup> がメチル、メトキシ、またはペルフルオロメチルであり、そして R<sup>3</sup> が水素である、請求項 5 1 に記載の薬剤。

**【請求項 5 3】**

前記化合物が、4 - (4 - (2 - メチルオキシベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 5 2 に記載の薬剤。

**【請求項 5 4】**

前記化合物が、4 - (4 - (2 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 5 2 に記載の薬剤。

**【請求項 5 5】**

前記化合物が、4 - (3 - (2 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸である、請求項 5 2 に記載の薬剤。

**【請求項 5 6】**

前記化合物が、エチル 4 - (4 - (2 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソブチレートである、請求項 5 2 に記載の薬剤。

**【請求項 5 7】**

前記化合物が、4-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項52に記載の薬剤。

**【請求項 5 8】**

R<sup>2</sup>がメチルであり、そしてR<sup>3</sup>がメチルである、請求項51に記載の薬剤。

**【請求項 5 9】**

前記化合物が、4-(4-(2,5-ジメチルベンジルオキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項58に記載の薬剤。

**【請求項 6 0】**

前記化合物が、4-(3-(2,6-ジメチルベンジルオキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項58に記載の薬剤。

**【請求項 6 1】**

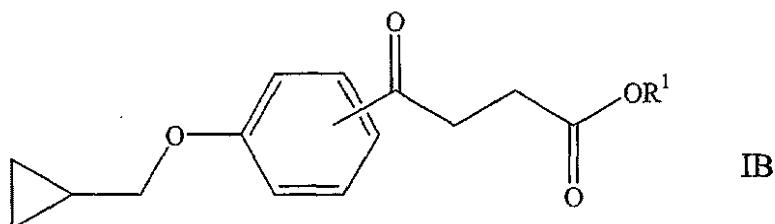
R<sup>2</sup>が水素であり、そしてR<sup>3</sup>が水素である、請求項21に記載の薬剤。

**【請求項 6 2】**

前記化合物が、4-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項61に記載の薬剤。

**【請求項 6 3】**

請求項2に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

**【化6】**

の化合物、またはR<sup>1</sup>が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

R<sup>1</sup>は、Hまたは1~7個の炭素原子を有するアルキルである、薬剤。

**【請求項 6 4】**

R<sup>1</sup>が水素またはエチルである、請求項63に記載の薬剤。

**【請求項 6 5】**

前記化合物が、4-(4-((シクロプロピル)-メトキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項64に記載の薬剤。

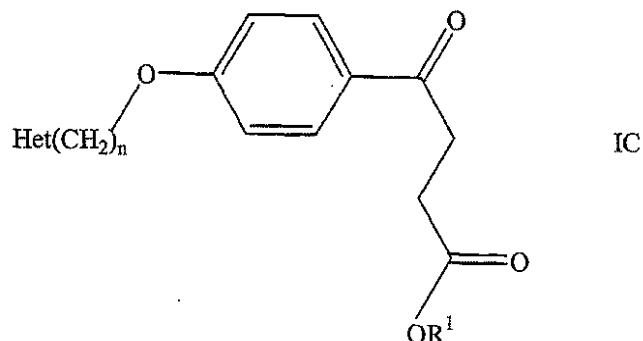
**【請求項 6 6】**

前記化合物が、4-(3-((シクロプロピル)-メトキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項64に記載の薬剤。

**【請求項 6 7】**

請求項2に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤が、以下の式：

## 【化7】



の化合物であって、ここで、

nは、1または2であり；

R<sup>1</sup>は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；そして

Hetは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式ICの化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている、薬剤。

## 【請求項68】

R<sup>1</sup>が水素またはエチルである、請求項67に記載の薬剤。

## 【請求項69】

前記化合物が、4-(4-(2-ピリジニル)-メトキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項68に記載の薬剤。

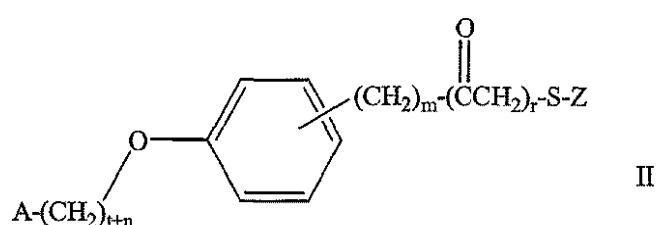
## 【請求項70】

前記化合物が、4-(4-(2-(2-チエニル)エトキシ)フェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項68に記載の薬剤。

## 【請求項71】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

## 【化8】



の化合物、またはR<sup>1</sup>が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

nは、1または2であり；

tは、0または1であり；

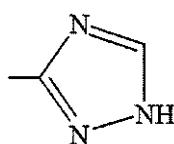
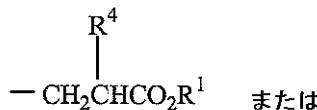
mは0であり、rが1であるか、またはmが1であり、rが0であり；

Aは、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1もしくは2個の基で置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルは、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素原子が、メチルもしくはエチルで置換されている、シクロアルキルであるか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式IIの化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている

、ヘテロ芳香族環であり；

Zは、

【化9】



であり；

R<sup>1</sup>は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、水素；-NHCOOC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；-NHCH<sub>3</sub>；または-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>である、薬剤。

【請求項72】

Aが、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルが非置換であるか、または式IIの化合物の残りの部分に隣接する1つもしくは両方の環炭素が、メチルもしくはエチルにより一置換されている、請求項71に記載の薬剤。

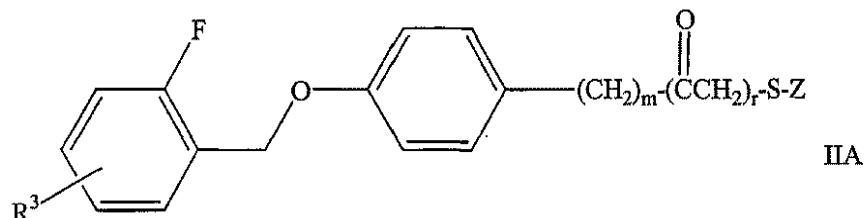
【請求項73】

Aが、非置換フェニルであるか、あるいは、以下：フルオロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1または2個の基で置換されたフェニルである、請求項71に記載の薬剤。

【請求項74】

請求項73に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

【化10】



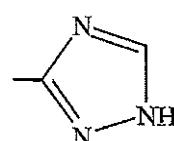
の化合物、またはR<sup>1</sup>が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

mは、0または1であり；

rは、0または1であり；

Zは、

【化11】



であり；

R<sup>1</sup>は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、水素；-NHCOOC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；-NHCH<sub>3</sub>；または-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>である；

R<sup>3</sup>は、水素またはハロである、薬剤。

【請求項75】

$R^1$  が水素またはエチルである、請求項 7 4 に記載の薬剤。

【請求項 7 6】

前記化合物が、3 - [ (4 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチルチオ]プロピオン酸である、請求項 7 5 に記載の薬剤。

【請求項 7 7】

前記化合物が、3 - [ (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチルチオ]プロピオン酸である、請求項 7 5 に記載の薬剤。

【請求項 7 8】

前記化合物が、3 - (2 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 2 - オキソエチル)チオ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾールである、請求項 7 5 に記載の薬剤。

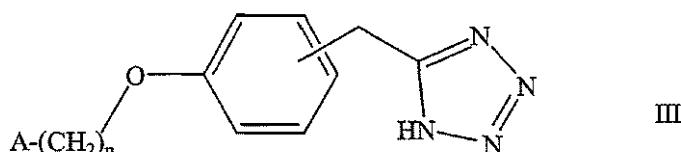
【請求項 7 9】

前記化合物が、(2R S) 2 - (N - Boc) - 3 - [2 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 2 - オキソエチル]チオプロピオン酸である、請求項 7 5 に記載の薬剤。

【請求項 8 0】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

【化 1 2】



の化合物であって、ここで、

$n$  は、1 または 2 であり；

A は、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1 もしくは 2 個の基で置換されたフェニルであるか；あるいは、1 つまたは両方の環炭素が、独立して、メチルもしくはエチルで一置換されている、3 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキルであるか；あるいは、N、S、およびO から選択される 1 もしくは 2 個の環ヘテロ原子を有する 5 もしくは 6 員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式 I II の化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、薬剤。

【請求項 8 1】

A が、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 もしくは 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1 または 2 個の基で置換されたフェニルである、請求項 8 0 に記載の薬剤。

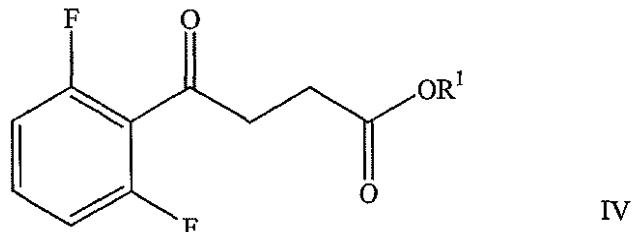
【請求項 8 2】

前記化合物が、5 - [ (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチル] - 1H - テトラゾールである、請求項 8 1 に記載の薬剤。

【請求項 8 3】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

## 【化13】



の化合物、またはR<sup>1</sup>が水素の場合、該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

R<sup>1</sup>は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルである、薬剤。

## 【請求項84】

R<sup>1</sup>が水素またはエチルである、請求項83に記載の薬剤。

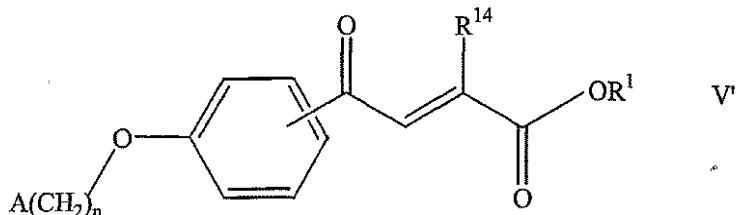
## 【請求項85】

前記化合物が、4-(2,6-ジフルオロフェニル)-4-オキソ酪酸である、請求項84に記載の薬剤。

## 【請求項86】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

## 【化14】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで、

nは、1または2であり；

R<sup>1</sup>は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

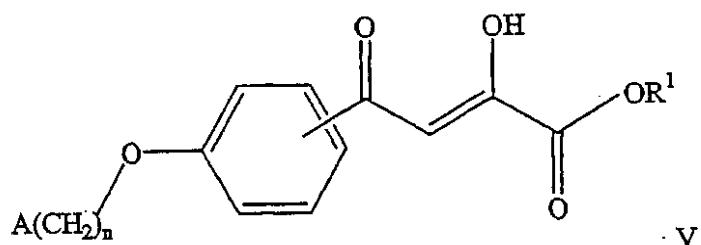
R<sup>1</sup><sup>4</sup>は、ヒドロキシまたは水素であり；そして

Aは、非置換フェニルであるか、または、以下：ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される、1もしくは2個の基で置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、該シクロアルキルは、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素原子が、独立して、メチルもしくはエチルで一置換されている、シクロアルキルであるか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5もしくは6員のヘテロ芳香族環であって、該ヘテロ芳香族環が、式V'の化合物の残りの部分に環炭素により共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、薬剤。

## 【請求項87】

請求項86に記載の生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式：

## 【化15】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

$n$ は、1または2であり；

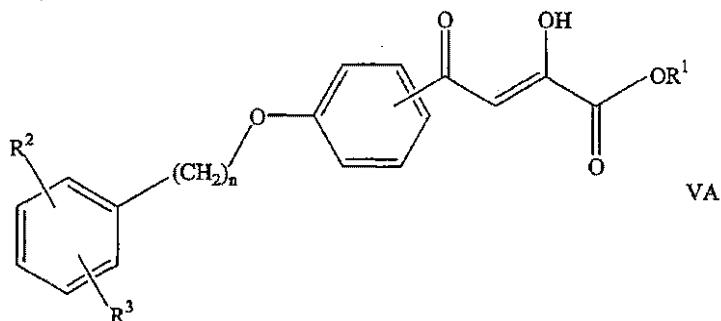
$R^1$ は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって式Vの化合物の残部に共有結合される、薬剤。

## 【請求項88】

請求項87に記載の生物学的に活性な薬剤であって該薬剤は、以下の式：

## 【化16】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

$n$ は、1または2であり；

$R^1$ は、水素または1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

$R^2$ および $R^3$ は、水素、ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシからそれぞれ独立して選択される、薬剤。

## 【請求項89】

請求項88に記載の薬剤であって、 $R^1$ は、水素またはエチルである、薬剤。

## 【請求項90】

請求項89に記載の薬剤であって、前記化合物は、エチル2-ヒドロキシ-4-オキソ-4-(4-(2,6-ジフルオロベンジルオキシ)フェニル)ブト-2-エノエートである、薬剤。

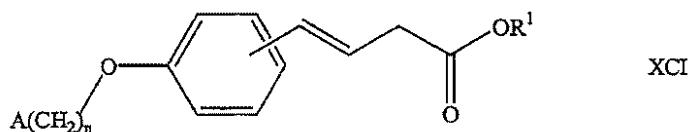
## 【請求項91】

請求項86に記載の薬剤であって、前記化合物は、4-(3-(2,6-ジメチルベンジルオキシ)フェニル)-4-オキソ-2-ブテン酸である、薬剤。

## 【請求項92】

生物学的に活性な薬剤、該薬剤は、以下の式；

## 【化17】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

$n$ は、1または2であり；

$R^1$ は、水素または1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって式XCIの化合物の残部に共有結合される、薬剤。

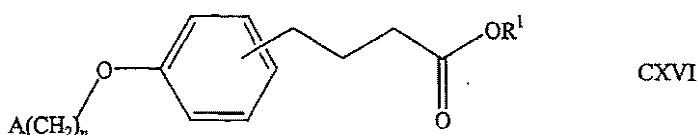
## 【請求項93】

請求項92に記載の薬剤であって、ここで前記化合物は、4-(3-(2,6-ジメチルベンジルオキシ)フェニル)-3-ブテン酸である、薬剤。

## 【請求項94】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式；

## 【化18】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

$n$ は、1または2であり；

$R^1$ は、水素または1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって式CXVの化合物の残部に共有結合される、薬剤。

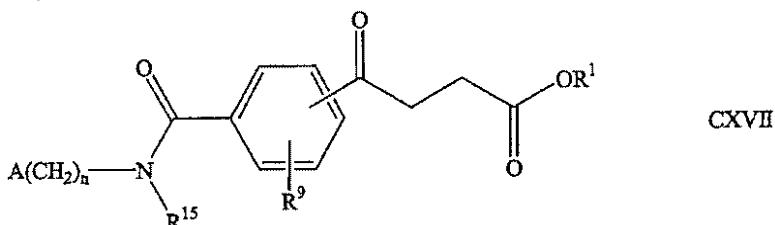
## 【請求項95】

請求項94に記載の薬剤であって、ここで前記化合物は、4-(3-(2,6-ジメチルベンジルオキシ)フェニル)ブテン酸である、薬剤。

## 【請求項96】

生物学的に活性な薬剤であって、該薬剤は、以下の式；

## 【化19】



の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩であって、ここで

$n$ は、0、1または2であり；

$R^1$ は、水素または1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$R^{15}$ は、水素または1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$R^9$ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、または1～3個の炭素原子を有するアルコキシであり；

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって式C X V I Iの化合物の残部に共有結合される、薬剤。

#### 【請求項97】

請求項96に記載の薬剤であって、ここで前記化合物は、4-[3-[4-トリフルオロメチルベンジルアミノ]-カルボニル]-4-メトキシ]フェニル}-4-オキソ酪酸である、薬剤。

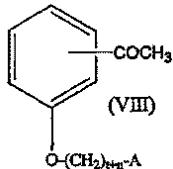
#### 【請求項98】

請求項96に記載の薬剤であって、ここで前記化合物は、4-[3-[2,6-ジメチルベンジルアミノ]-カルボニル]-4-メトキシ]フェニル}-4-オキソ酪酸である、薬剤。

#### 【請求項99】

以下の式：

#### 【化20】



の化合物であって、ここで

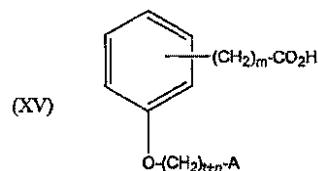
$n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

#### 【請求項100】

以下の式：

#### 【化21】



の化合物であって、ここで

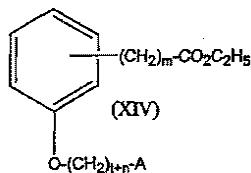
$m$ は、1であり； $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項101】

以下の式：

## 【化22】



の化合物であって、ここで

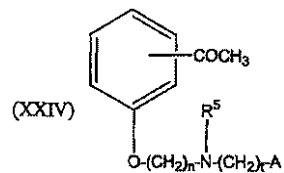
mは、1であり；nは、1または2であり；tは、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項102】

以下の式：

## 【化23】



の化合物であって、ここで

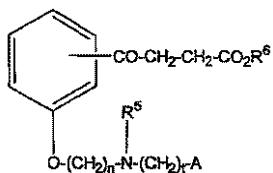
R<sup>5</sup>は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；nは、1または2であり；tは、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項103】

以下の式：

## 【化24】



(XXV)

の化合物であって、ここで

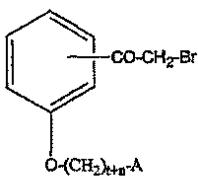
$\text{R}^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり； $\text{R}^6$  は、1～7の炭素原子を有するアルキルであり； $n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

$\text{A}$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項104】

以下の式：

## 【化25】



(XXVI)

の化合物であって、ここで

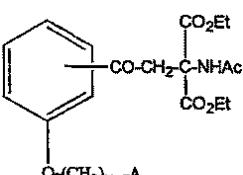
$n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

$\text{A}$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項105】

以下の式：

## 【化26】



(XXVII)

の化合物であって、ここで

$n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

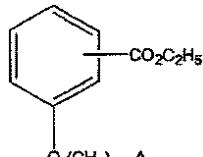
$\text{A}$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1も

しくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項106】

以下の式：

## 【化27】



(LXI)

の化合物であって、ここで

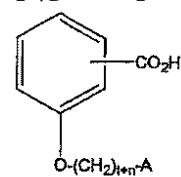
 $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項107】

以下の式：

## 【化28】



(LXII)

の化合物であって、ここで

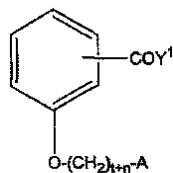
 $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項108】

以下の式：

## 【化29】



(LXIII)

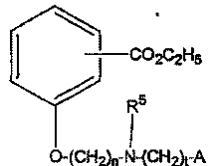
の化合物であって、ここで

$\text{Y}^1$ は、クロロであり； $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして  
Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項109】

以下の式：

## 【化30】



(LXVI)

の化合物であって、ここで

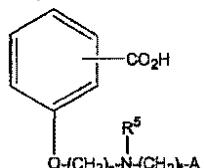
$\text{R}^5$ は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり； $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項110】

以下の式：

## 【化31】



(LXVII)

の化合物であって、ここで

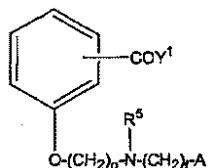
$\text{R}^5$ は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり； $n$ は、1または2であり； $t$ は、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項111】

以下の式：

## 【化32】



(LXVIII)

の化合物であって、ここで

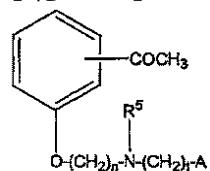
R<sup>5</sup>は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；Y<sup>1</sup>は、クロロであり；nは、1または2であり；tは、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項112】

以下の式：

## 【化33】



(XXIV)

の化合物であって、ここで

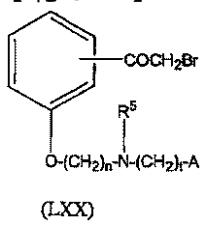
R<sup>5</sup>は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；nは、1または2であり；tは、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項113】

以下の式：

## 【化34】



の化合物であって、ここで

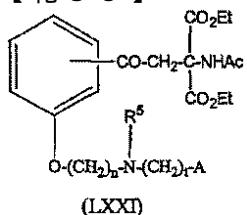
$R^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり； $n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

$A$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項114】

以下の式：

## 【化35】



の化合物であって、ここで

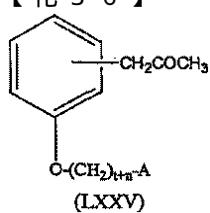
$R^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり； $n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

$A$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項115】

以下の式：

## 【化36】



の化合物であって、ここで

$n$  は、1または2であり； $t$  は、0または1であり；そして

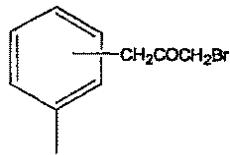
$A$  は、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1も

しくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項116】

以下の式：

## 【化37】



(LXXVI)

の化合物であって、ここで

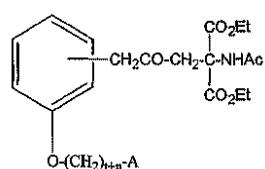
nは、1または2であり；tは、0または1であり；そして

Aは、ハロ、1もしくは2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1もしくは2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1または2個の基で置換されていないかまたは置換されたフェニルであるか；あるいは、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルは置換されていないか、または1もしくは2個の環炭素が、独立してメチルもしくはエチルで一置換されているか；あるいは、N、S、およびOから選択される1もしくは2個の環ヘテロ原子を有する5員または6員の複素環式芳香環であって、該複素環式芳香環は、環炭素によって該化合物の残部に共有結合される、化合物。

## 【請求項117】

以下の式：

## 【化38】



(LXXVII)

の化合物であって、ここで、

nは、1または2であり；

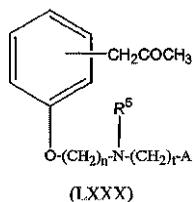
tは、0または1であり；そして

Aは、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【請求項118】

以下の式：

## 【化39】



(LXXX)

の化合物であって、ここで、

$\text{R}^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は、1または2であり；

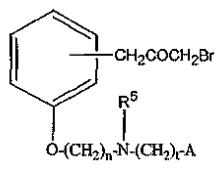
$t$  は、0または1であり；そして

$\text{A}$  は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【請求項119】

以下の式：

## 【化40】



(LXXXI)

の化合物であって、ここで、

$\text{R}^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

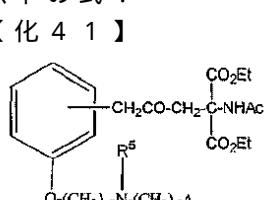
$n$  は、1または2であり；

$t$  は、0または1であり；そして

$\text{A}$  は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【化41】

以下の式：



(LXXXII)

の化合物であって、ここで、

$R^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は、1または2であり；

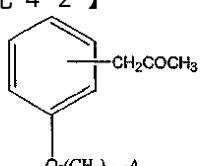
$t$  は、0または1であり；そして

A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

#### 【請求項 1 2 1】

以下の式：

#### 【化 4 2】



(LXXXV)

の化合物であって、ここで、

$n$  は、1または2であり；

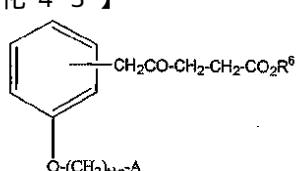
$t$  は、0または1であり；そして

A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

#### 【請求項 1 2 2】

以下の式：

#### 【化 4 3】



(LXXXV)

の化合物であって、ここで、

$R^6$  は、1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は、1または2であり；

$t$  は、0または1であり；そして

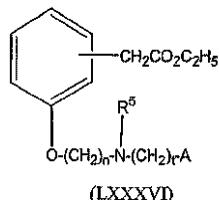
A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環

炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【請求項123】

以下の式：

## 【化44】



の化合物であって、ここで、

R<sup>5</sup>は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

nは、1または2であり；

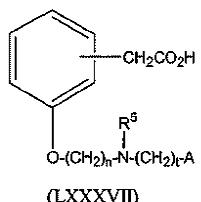
tは、0または1であり；そして

Aは、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【請求項124】

以下の式：

## 【化45】



の化合物であって、ここで、

R<sup>5</sup>は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

nは、1または2であり；

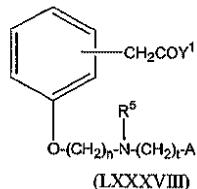
tは、0または1であり；そして

Aは、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、化合物。

## 【請求項 1 2 5】

以下の式：

## 【化 4 6】



の化合物であって、ここで、

R<sup>5</sup> は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

Y<sup>1</sup> は、クロロであり；

n は、1または2であり；

t は、0または1であり；そして

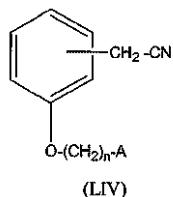
A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、S およびO から選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、

化合物。

## 【請求項 1 2 6】

以下の式：

## 【化 4 7】



の化合物であって、ここで、

n は、1または2であり；そして

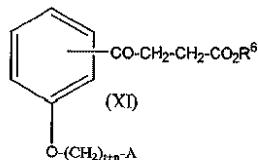
A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、S およびO から選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によつて該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環である、

化合物。

## 【請求項 1 2 7】

以下の式：

## 【化48】



の化合物を生成するためのプロセスであって、ここで、

$R^6$  は、1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

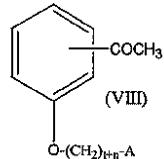
$n$  は、1または2であり；

$t$  は、0または1であり；そして

$A$  は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合され；

該プロセスは、以下：

## 【化49】



の式の化合物を、塩基の存在下で、式  $B_r C H_2 C O_2 R^6$  の化合物と反応させて、対応する式 XI の化合物を生成する工程を包含し、ここで、 $R^6$ 、 $n$ 、 $t$  および  $A$  は、上記の通りである、

プロセス。

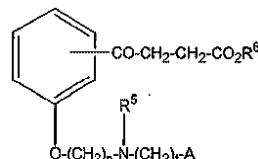
## 【請求項128】

前記式 XI の化合物を加水分解して、 $R^6$  を除去し、対応する酸を生成する工程をさらに包含する、請求項106に記載のプロセス。

## 【請求項129】

以下の式：

## 【化50】



(XXV)

の化合物を生成するためのプロセスであって、ここで、

$R^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$R^6$  は、1～7個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は、1または2であり；

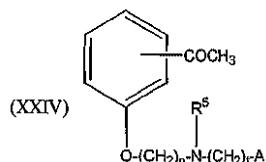
$t$  は、0または1であり；そして

$A$  は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロ

メトキシ；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下の式：

【化51】



の化合物を、アルカリ金属シリルアミドの存在下で、式  $B_r C H_2 C O_2 R^6$  の化合物と反応させて、対応する式 XXV の化合物を生成する工程を包含し、ここで、 $R^6$ 、n、t および A は、上記の通りである、

プロセス。

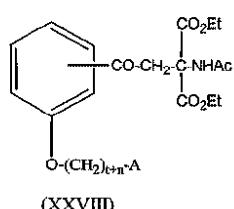
【請求項130】

前記式 XXV の化合物を加水分解して、 $R^6$  を除去し、対応する酸を生成する工程をさらに包含する、請求項129に記載のプロセス。

【請求項131】

以下の式：

【化52】



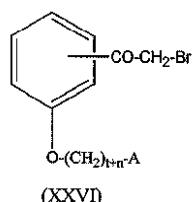
の化合物を生成するためのプロセスであって、ここで、

n は、1または2であり；

t は、0または1であり；そして

A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1または2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合され；該プロセスは、以下：

【化53】



の式の化合物を、ジエチルアセトアミドマロエートのナトリウム塩と反応させて、対応す

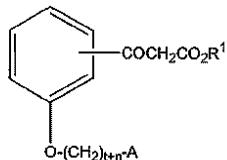
る式 X X V I I の化合物を生成する工程を包含し、n、t および A は、上記の通りである。

プロセス。

【請求項 1 3 2】

以下の式：

【化 5 4】



(LXV)

の化合物を生成するためのプロセスであって、ここで、

R<sup>1</sup> は、エチルであり；

n は、1 または 2 であり；

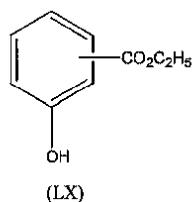
t は、0 または 1 であり；そして

A は、非置換であるかまたは以下：ハロ、1 または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 または 2 個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される 1 ~ 2 個の基により置換されたフェニル；または、3 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または 1 もしくは 2 個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5 または 6 員のヘテロ芳香族環であって、N、S および O から選択される 1 または 2 個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

a ) 以下の式：

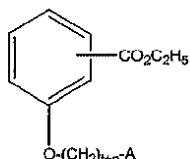
【化 5 5】



(LX)

の化合物を、i ) M i t s u n o b u 条件下で、式 A ( C H<sub>2</sub> )<sub>t + n</sub> - O H の化合物、または ii ) 式 A ( C H<sub>2</sub> )<sub>t + n</sub> - Y の化合物のいずれかと反応させて、対応する以下の式：

【化 5 6】



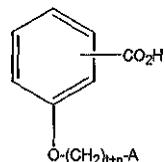
(LXI)

の化合物を生成する工程であって、

ここで、n、t および A は、上記の通りであり、そして Y は、脱離基である、工程；

b ) 該式 L X I の化合物を加水分解して、対応する以下の式：

## 【化57】

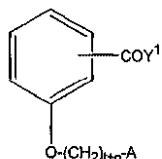


(LXII)

の化合物を生成する工程；

c ) 該式 L X I I の化合物を塩化チオニルと反応させて、対応する以下の式：

## 【化58】



(LXIII)

の化合物を生成する工程であって、

ここで、 $\text{Y}^1$  は、クロロである、工程；

d )  $\text{EtOCOCH}_2\text{COOH}$  を約2当量のブチルリチウムで処理する工程；ならびに

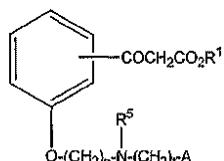
e ) 該式 L X I I の化合物を、工程 d ) で生じた生成物と反応させて、式 L X V の化合物を生成する工程、

を包含する、プロセス。

## 【請求項133】

以下の式：

## 【化59】



(LXIX)

の化合物を生成するためのプロセスであって、ここで、

$\text{R}^1$  は、エチルであり；

$\text{R}^5$  は、1～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は、1または2であり；

$t$  は、0または1であり；そして

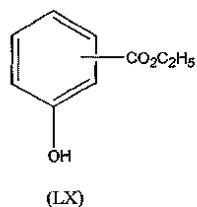
$A$  は、非置換であるかまたは以下：

ハロ、1または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1または2個の炭素原子を有するアルコキシ、およびペルフルオロメトキシから選択される1～2個の基により置換されたフェニル；または、3～6個の環炭素原子を有するシクロアルキルであって、ここで該シクロアルキルが、非置換であるか、または1もしくは2個の環炭素が、独立して、メチルまたはエチルにより一置換されている、シクロアルキル；または、5または6員のヘテロ芳香族環であって、N、SおよびOから選択される1または2個の環ヘテロ原子を有し、該ヘテロ芳香族環が、環炭素によって該化合物の残部に共有結合されている、ヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

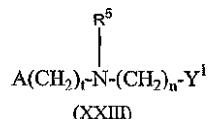
a ) 以下の式：

## 【化60】



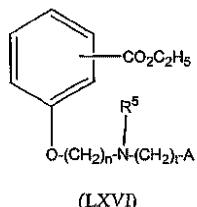
の化合物を、以下の式：

## 【化61】



の化合物と反応させて、対応する以下の式：

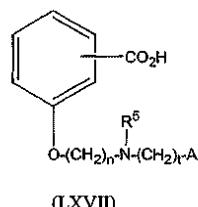
## 【化62】



の化合物を生成する工程であって、ここで  $\text{Y}^1$  が、ハロであり、  $\text{R}^5$ 、  $n$  および  $t$  が上記の通りである、工程；

b) 式 LXVII の化合物を加水分解して、対応する以下の式：

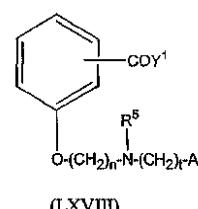
## 【化63】



の化合物を生成する工程；

c) 該式 LXVII の化合物を塩化チオニルと反応させて、対応する以下の式：

## 【化64】



の化合物を生成する工程であって、ここで、  $\text{Y}^1$  は、クロロである、工程；

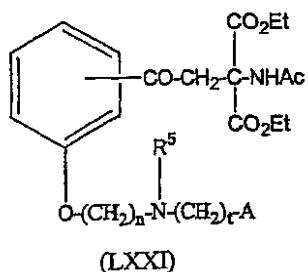
d)  $\text{EtO}_2\text{CH}_2\text{COOH}$  を約2当量のブチルリチウムで処理する工程；ならびに

e) 該式 LXVII の化合物を、工程 d) で生じた生成物と反応させて、式 LXIV の化合物を生成する工程、を包含する、プロセス。

## 【請求項134】

以下の式：

【化65】



の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

$\text{R}^5$  は 1 個 ~ 3 個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は 1 または 2 であり；

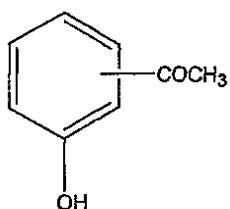
$t$  は 0 または 1 であり；そして

$A$  は、置換されないか、またはハロ、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または 1 つもしくは 2 つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより 1 置換される、3 個 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、 $N$ 、 $S$  および  $O$  から選択される 1 つまたは 2 つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5 員または 6 員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

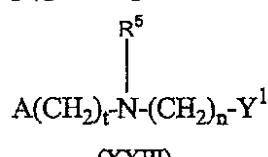
a ) 以下の式

【化66】



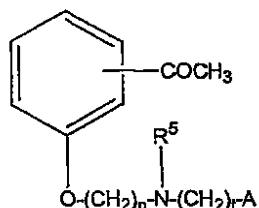
の化合物と、 $Y^1$  がハロ、そして  $R^5$ 、 $n$ 、 $t$  および  $A$  が上記のようである、以下の式

【化67】



の化合物とを反応させて、以下の式

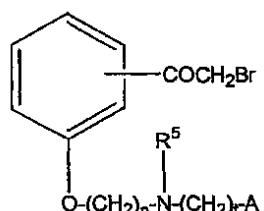
## 【化68】



の対応する化合物を得る工程；

b) 選択的臭素化条件下で式XXIVの化合物をCuBr<sub>2</sub>処理し、以下の式

## 【化69】



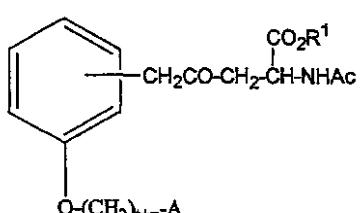
の化合物を得る工程；

c) アセトアミドマロン酸ジエチルのナトリウム塩と式LXXの化合物を反応させ、式LXXIの化合物を得る工程；  
を含む、プロセス。

## 【請求項135】

以下の式：

## 【化70】



の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

R<sup>1</sup>は水素であり；

nは1または2であり；

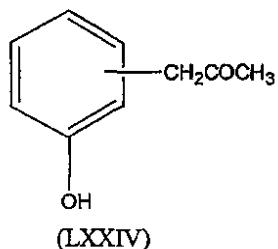
tは0または1であり；そして

Aは、置換されないか、またはハロ、1個または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1個または2個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される1つまたは2つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または1つもしくは2つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより1置換される、3個～6個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、N、SおよびOから選択される1つまたは2つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5員または6員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

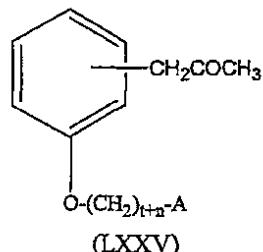
a) 以下の式

## 【化71】



の化合物と： i ) M i t s u n o b u 条件下での、式 A ( C H <sub>2</sub> ) <sub>t + n</sub> - O H の化合物、または ii ) 式 A ( C H <sub>2</sub> ) <sub>t + n</sub> - Y の化合物の、いずれかを反応させて、n、t および A が上記のようであり、そして Y が脱離基である、以下の式

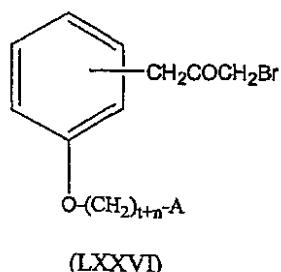
## 【化72】



の対応する化合物を得る工程；

b ) 式 L X X V の化合物と H B r とを反応させて、以下の式

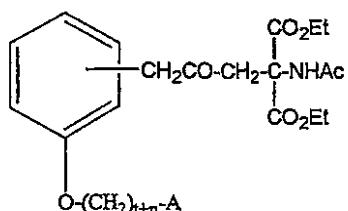
## 【化73】



の対応する化合物を得る工程；

c ) 式 L X X V I の化合物とアセトアミドマロン酸ジエチルのナトリウム塩とを反応させて、以下の式

## 【化74】



の対応する化合物を得る工程；

d ) 式 L X X V I I の化合物を脱エステル化して、式 L X X V I I I の化合物を得る工程；

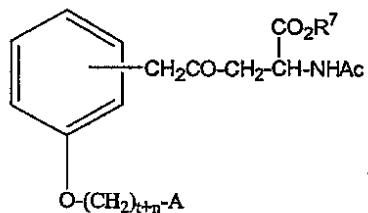
を含む、プロセス。

## 【請求項136】

請求項135に記載のプロセスであって、式 L X X V I I I の化合物と、R<sup>7</sup> が1個～7

個の炭素原子を有するアルキルである  $R^7$  - OH とを反応させ、n、t、 $R^7$  および A が上記のようである、式

## 【化 7 5】



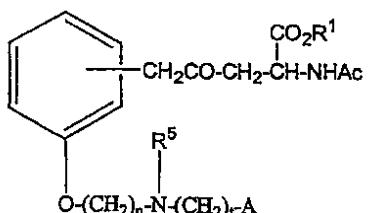
(LXXIX)

の対応する化合物を得る工程をさらに含む、プロセス。

## 【請求項 1 3 7】

以下の式：

## 【化 7 6】



(LXXXIII)

の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

$R^1$  は水素であり；

$R^5$  は 1 個～3 個の炭素原子を有するアルキルであり；

n は 1 または 2 であり；

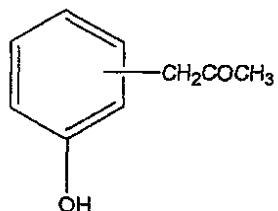
t は 0 または 1 であり；そして

A は、置換されないか、またはハロ、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または 1 つもしくは 2 つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより 1 置換される、3 個～6 個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、N、S および O から選択される 1 つまたは 2 つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5 員または 6 員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

a) 以下の式

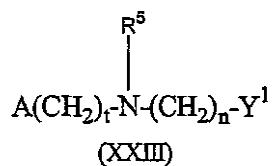
## 【化 7 7】



(LXXIV)

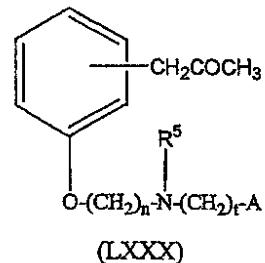
の化合物と、 $R^5$ 、n、t および A が上記のようであり、そして Y<sup>1</sup> がクロロである、以下の式

## 【化78】



の化合物とを反応させて、以下の式

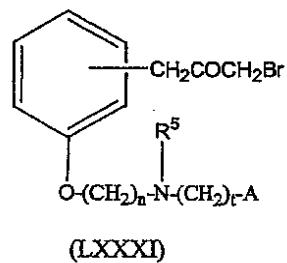
## 【化79】



の対応する化合物を得る工程；

b) 式 LXXX の化合物と HBr とを反応させて、以下の式

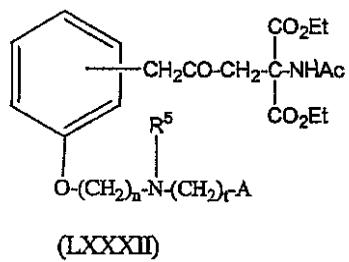
## 【化80】



の対応する化合物を得る工程；

c) 式 LXXXI の化合物とアセトアミドマロン酸ジエチルのナトリウム塩とを反応させて、以下の式

## 【化81】



の対応する化合物を得る工程；

d) 式 LXXXII の化合物を脱エステル化して、式 LXXXIII の化合物を得る工程

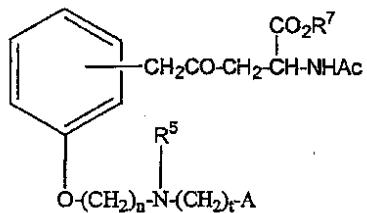
；

を含む、プロセス。

## 【請求項138】

請求項137に記載のプロセスであって、式 LXXXIII の化合物と、R<sup>7</sup> が1個～7個の炭素原子を有するアルキルである R<sup>7</sup>-OH を反応させ、n、t、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup> および A が上記のようである、以下の式

## 【化82】



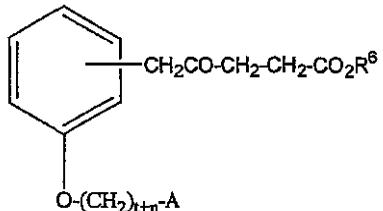
(LXXXIV)

の対応する化合物を得る工程をさらに含む、プロセス。

## 【請求項139】

以下の式：

## 【化83】



(LXXXV)

の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

$\text{R}^6$  は 1 個 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキルであり；

$n$  は 1 または 2 であり；

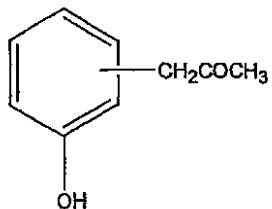
$t$  は 0 または 1 であり；そして

$A$  は、置換されないか、またはハロ、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または 1 つもしくは 2 つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより 1 置換される、3 個 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、 $N$ 、 $S$  および  $O$  から選択される 1 つまたは 2 つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5 員または 6 員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

a) 以下の式

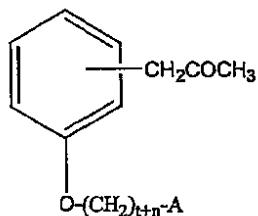
## 【化84】



(LXXXIV)

の化合物と：i) Mitsuobu 条件下での、式  $\text{A}(\text{CH}_2)_{t+n}-\text{OH}$  の化合物、または ii) 式  $\text{A}(\text{CH}_2)_{t+n}-\text{Y}$  の化合物の、いずれかとを反応させて、 $n$ 、 $t$  および  $A$  が上記のようであり、そして  $Y$  が脱離基である、以下の式

## 【化85】



(LXXV)

の対応する化合物を得る工程；

b ) 式 LXXXV の化合物と、 $\text{R}^6$  が上記のようである  $\text{Br}-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{R}^6$  とを反応させて、式 LXXXV の化合物を得る工程；

を含む、プロセス。

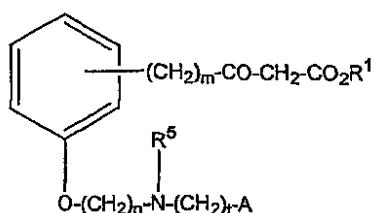
## 【請求項140】

請求項139に記載のプロセスであって、式 LXXXV の化合物をさらに脱エステル化して、 $\text{R}^6$  を除去し、対応する酸を得る工程をさらに含む、プロセス。

## 【請求項141】

以下の式：

## 【化86】



(LXXXIX)

の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

$\text{R}^1$  はエチルであり；

$\text{R}^5$  は1個～3個の炭素原子を有するアルキルであり；

$m$  は1であり；

$n$  は1または2であり；

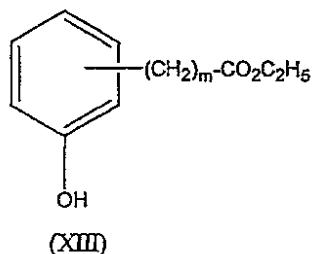
$t$  は0または1であり；および

$A$  は、置換されないか、またはハロ、1個または2個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1個または2個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される1つまたは2つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または1つもしくは2つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより1置換される、3個～6個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、N、S およびO から選択される1つまたは2つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5員または6員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

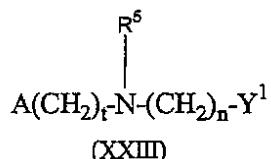
a ) 以下の式

## 【化87】



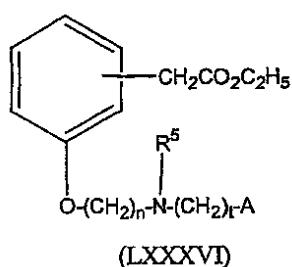
の化合物と、Y<sup>1</sup> がクロロ、そして m、n、t、R<sup>5</sup> および A が上記のようである、以下の式

## 【化88】



の化合物とを反応させて、以下の式

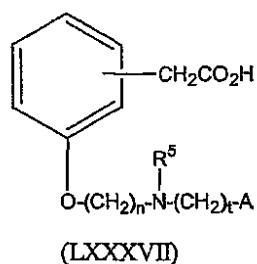
## 【化89】



の対応する化合物を得る工程；

b ) 式 LXXXV I の化合物を加水分解して、以下の式

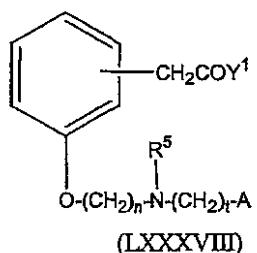
## 【化90】



の対応する化合物を得る工程；

c ) 式 LXXXV II の化合物と塩化チオニルとを反応させて、Y<sup>1</sup> がクロロである、以下の式

## 【化91】



の対応する化合物を得る工程；

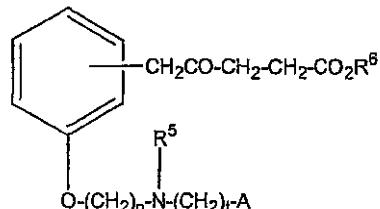
d) 酸ハロゲン化物とメルドラム酸とを反応させて、式 LXXXIX の化合物を得る工程；

を含む、プロセス。

【請求項 142】

以下の式：

【化92】



(XC)

の化合物を生成するためのプロセスであって、

ここで、

R<sup>5</sup> は 1 個 ~ 3 個の炭素原子を有するアルキルであり；

R<sup>6</sup> は 1 個 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキルであり；

n は 1 または 2 であり；

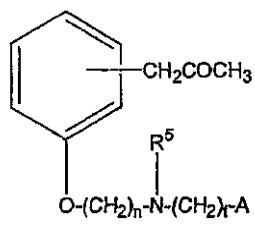
t は 0 または 1 であり；および

A は、置換されないか、またはハロ、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または 1 つもしくは 2 つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより 1 置換される、3 個 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、N、S および O から選択される 1 つまたは 2 つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5 員または 6 員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、以下：

a) 以下の式

【化93】



(LXXX)

の化合物と、Br - CH<sub>2</sub> - CO<sub>2</sub> R<sup>6</sup>

の化合物とを反応させ、式 XC の化合物を得る工程であって、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、n、t および A が上記のようである、工程；

を含む、プロセス。

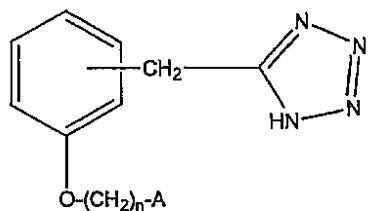
【請求項 143】

請求項 142 に記載のプロセスであって、式 XC の化合物を脱エステル化して、R<sup>6</sup> を除去し、対応する酸を得る工程をさらに含む、プロセス。

【請求項 144】

以下の式：

## 【化94】



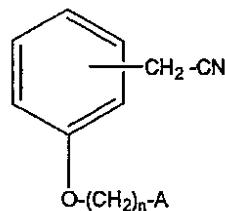
の化合物を生成するためのプロセスであって、  
ここで、

$n$  は 1 または 2 ; および

A は、置換されないか、またはハロ、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルキル、ペルフルオロメチル、1 個または 2 個の炭素原子を有するアルコキシおよびペルフルオロメトキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で置換されるフェニル；あるいは、シクロアルキルが置換されないか、または 1 つもしくは 2 つの環炭素が独立して、メチルもしくはエチルにより 1 置換される、3 個 ~ 6 個の環炭素原子を有するシクロアルキル；あるいは、N、S および O から選択される 1 つまたは 2 つの環ヘテロ原子を有し、ヘテロ芳香族環が環炭素により該化合物の残りの部分と共有結合される、5 員または 6 員のヘテロ芳香族環であり；

該プロセスは、 $n$  および A が上記のようである、以下の式

## 【化95】

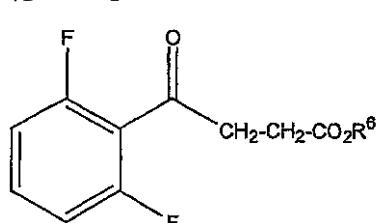


の化合物と、アジ化ナトリウムとを、ジメチルホルムアミド中で、塩化アンモニウム存在下で反応させ、式 I II の対応する化合物を得る工程を含む、プロセス。

## 【請求項145】

$R^6$  が 1 個から 7 個の炭素原子を有するアルキルである、以下の式

## 【化96】



の化合物を生成するためのプロセスであって、2'、6' -ジフルオロアセトフェノンと、 $R^6$  が上記のようである  $B_r - C H_2 - C O_2 R^6$  とを反応させ、式 L VI の化合物を得る工程を含む、プロセス。

## 【請求項146】

請求項145に記載のプロセスであって、式 L VI の化合物を脱エステル化して、 $R^6$  を除去し、対応する酸を得る工程をさらに含む、プロセス。

## 【請求項 147】

インスリン耐性症候群、ならびにⅠ型糖尿病およびⅡ型糖尿病を含む糖尿病からなる群から選択される状態の処置のため；あるいはアテローム性動脈硬化症、動脈硬化症、肥満症、高血圧、高脂血症、脂肪肝疾患、ネフロパシー、神経障害、網膜症、足の潰瘍（foot ulceration）または糖尿病と関連した白内障の処置または進行機会の減少のため；あるいは高脂血症、悪液質および肥満症からなる群から選択される状態の処置のための医薬の製造における、請求項1～請求項98のいずれか1項に記載の、生物学的に活性な薬剤の使用。

## 【請求項 148】

請求項147に記載された使用であって、前記薬剤が、以下：

4 - (4 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2 - メトキシベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 3 - [(4 - (2 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチルチオ]プロピオン酸；  
 4 - (4 - (3 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (4 - フルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - ((2 - ピリジニル) - メトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (ベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2 - クロロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸  
 4 - (4 - (2 - (2 - フルオロフェニル)エトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 エチル 4 - (4 - (2 - フルオロベンジルオキシル)フェニル) - 4 - オキソブチレート；  
 4 - (4 - (2 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - [(4 - (2 - (N - (2 - フルオロベンジル) - N - メチルアミノ)エトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (3 - (2 - メチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 エチル 4 - (3 - (2 - フルオロベンジルオキシル)フェニル) - 4 - オキソブチレート；  
 エチル 4 - (4 - (2 - メチルベンジルオキシル)フェニル) - 4 - オキソブチレート；  
 エチル 4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシル)フェニル) - 4 - オキソブチレート；  
 4 - (4 - (2 - (2 - チエニル)エトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2, 5 - ジメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2, 5 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2, 4 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (3 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - ((シクロプロピル) - メトキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 4 - (4 - (2 - トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 3 - [(4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチルチオ]プロピオン酸；  
 4 - (2 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 4 - オキソ酪酸；  
 エチル 4 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 3 - オキソブチレート；  
 3 - (2 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 2 - オキソエチル)チオ - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール；  
 5 - [(4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - メチル] - 1H - テトラゾール；  
 ((2RS)2 - (N - Boc) - 3 - [2 - (4 - (2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ)フェニル) - 2 - オキソエチル]チオプロピオン酸；

エチル 2 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 4 - ( 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンジルオキシ ) フェニル ) ブタ - 2 - エノアート ;  
 ( 2 R S ) 2 - ( N - アセチル ) - 4 - ( 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( ( シクロプロピル ) - メトキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 - フルオロ - 6 - メチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 エチル 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシル ) フェニル ) - 4 - オキソブチレート ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸ナトリウム塩 ;  
 4 - ( 4 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸カリウム塩 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメトキシベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ - 2 , 2 - ジメチル酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( ( シクロブチル ) - メトキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) 酪酸 ;  
 4 - [ [ 4 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) - 3 - メトキシ ] フェニル ] - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - { 3 - [ ( ( 4 - トリフルオロメチルベンジルアミノ ) - カルボニル ) - 4 - メトキシ ] フェニル } - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - { 3 - [ ( ( 2 , 6 - ジメチルベンジルアミノ ) - カルボニル ) - 4 - メトキシ ] フェニル } - 4 - オキソ酪酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソブタンカルボヒドロキサム酸 ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソブチルアミド ;  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ - 2 - プテン酸 ; および  
 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 3 - プテン酸  
 からなる群から選択される、使用。

**【請求項 1 4 9】**

請求項 1 4 8 に記載の使用であって、前記薬剤が 4 - ( 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、使用。

**【請求項 1 5 0】**

請求項 1 4 8 に記載の使用であって、前記薬剤が 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、使用。

**【請求項 1 5 1】**

請求項 1 4 8 に記載の使用であって、前記薬剤が 4 - ( 3 - ( 2 , 6 - ジメチルベンジルオキシ ) フェニル ) - 4 - オキソ酪酸である、使用。

**【請求項 1 5 2】**

請求項 1 4 7 ~ 1 5 1 のいずれか 1 項に記載の使用であって、前記医薬が経口投与向けに処方される、使用。

**【請求項 1 5 3】**

インスリン耐性症候群、糖尿病、高脂血症、脂肪肝疾患、悪質液、肥満症、アテローム性動脈硬化症および動脈硬化からなる群から選択される状態の処置に有効な適当な量の、請求項 1 ~ 9 8 のいずれか 1 項に記載の生物学的に活性な薬剤を含む、該状態にある哺乳動物の被験体を処置するための組成物。

**【請求項 154】**

請求項153に記載の組成物であって、薬剤が経口で投与するために処方される、組成物。

**【請求項 155】**

請求項153に記載の組成物であって、前記被験体がヒトである、組成物。

**【請求項 156】**

請求項155に記載の組成物であって、1日あたり1m gから400m gまでの量の投与のために薬剤が処方される、組成物。

**【請求項 157】**

請求項153に記載の組成物であって、前記状態がインスリン耐性症候群またはⅡ型糖尿病である、組成物。

**【請求項 158】**

請求項153に記載の組成物であって、前記状態がⅠ型糖尿病である、組成物。

**【請求項 159】**

請求項153に記載の組成物であって、該組成物が糖尿病の症状または糖尿病の症状が進行する機会を減少させるためのものであり、ここで、該症状は、糖尿病と関連した、アテローム性動脈硬化症、肥満症、高血圧、高脂血症、脂肪肝疾患、ネフロパシー、神経障害、網膜症、足の腫瘍および白内障からなる群から選択される、組成物。

**【請求項 160】**

インスリン耐性症候群、糖尿病、高脂血症、脂肪肝疾患、悪液質、肥満症、アテローム性動脈硬化症、動脈硬化からなる群から選択された状態の処置に用いる、請求項1から請求項98のいずれか1項に記載される薬剤を、1m gから400m gまでを含有する、経口投与に適応させた、薬学的組成物。

**【請求項 161】**

以下からなる群より選択される治療剤と組み合わせての、請求項147～152のいずれか1項に記載の使用：メトホルミン；グリブリド；G L U C O V A N C E（メトホルミンとグリブリドの混合処方物）；アトルバスタチン；ロバスタチン；プラバスタチン；シンバスタチン；クロフィブレート；ゲムフィブロジル；ロシグリタゾン；ピオグリタゾン；アカルボーズ；およびレパグリニド。