

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-521741(P2005-521741A)

【公表日】平成17年7月21日(2005.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-028

【出願番号】特願2003-582115(P2003-582115)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 59/135

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 31/353

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4168

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 C 27/02

C 0 7 C 51/09

C 0 7 C 315/04

C 0 7 C 317/22

C 0 7 C 319/20

C 0 7 C 323/20

C 0 7 C 323/21

C 0 7 D 209/10

C 0 7 D 211/14

C 0 7 D 211/18

C 0 7 D 213/30

C 0 7 D 213/32

C 0 7 D 233/68

C 0 7 D 261/08

C 0 7 D 271/10

C 0 7 D 311/58

C 0 7 D 333/54

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 405/10

C 0 7 D 413/04

【 F I 】

C 0 7 C	59/135	C S P
A 6 1 K	31/192	
A 6 1 K	31/353	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4168	
A 6 1 K	31/4178	
A 6 1 K	31/42	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/44	
A 6 1 K	31/4402	
A 6 1 K	31/445	
A 6 1 K	31/4525	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 C	27/02	
C 0 7 C	51/09	
C 0 7 C	315/04	
C 0 7 C	317/22	
C 0 7 C	319/20	
C 0 7 C	323/20	
C 0 7 C	323/21	
C 0 7 D	209/10	
C 0 7 D	211/14	
C 0 7 D	211/18	
C 0 7 D	213/30	
C 0 7 D	213/32	
C 0 7 D	233/68	
C 0 7 D	261/08	
C 0 7 D	271/10	
C 0 7 D	311/58	
C 0 7 D	333/54	
C 0 7 D	405/06	
C 0 7 D	405/10	
C 0 7 D	413/04	

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年4月11日(2005.4.11)

## 【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

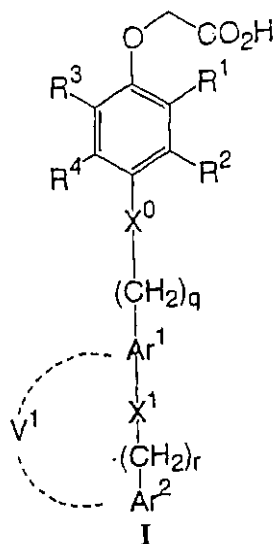
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 (I) :

【化 1】

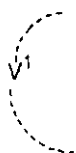


{ 上記式中、

$X^0$  及び  $X^1$  は独立して、存在しないか、或いは、O、S、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CHCH}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、又は  $-\text{S}(\text{O})-$  であり；

$\text{Ar}^1$  及び  $\text{Ar}^2$  はそれぞれ独立して 非置換型 又は 置換型フェニル 又は ピリジニル であり；

【化 2】



は存在せず；

$R^1$  及び  $R^2$  は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $\text{O}-(\text{CH}_2)_m\text{CF}_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p$ アルキル、 $\text{S}(\text{O})_p$ アリール、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^6\text{R}^7$ 、 $-\text{COR}^5$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^5$ 、又は  $-\text{NR}^6\text{R}^7$  から選択されるか、又はこれらが結合されている原子と一緒に5～8員環を形成し；

$R^3$  及び  $R^4$  は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $\text{O}-(\text{CH}_2)_m\text{CF}_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p$ アルキル、 $\text{S}(\text{O})_p$ アリール、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^6\text{R}^7$ 、 $-\text{COR}^5$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^5$ 、又は  $-\text{NR}^6\text{R}^7$  から選択され；

但し、 $R^1 \sim R^4$  の内の少なくとも1はH、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $\text{O}-(\text{CH}_2)_m\text{CF}_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p$ アルキル、 $\text{S}(\text{O})_p$ アリール、 $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$ 、 $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^6\text{R}^7$  又は  $\text{NR}^6\text{R}^7$  であるものとし；

$R^5$  は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル又はアリールであり；

$R^6$  及び  $R^7$  はそれぞれ独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-\text{CO}$ アルキル

、-COアリール、シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>アルキル、-CO<sub>2</sub>アリールであるか、或いはR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、これらが結合されている原子と一緒にヘテロ原子数1～3の4～7員環を形成し；

mは0～5であり；

pは0、1、又は2であり；

qは0～6であり；そして

rは0～6である。}により表される化合物又は該化合物の製薬上許容可能な塩。

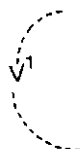
【請求項2】

式中、X<sup>0</sup>はSであり；

X<sup>1</sup>は存在せず；

Ar<sup>1</sup>及びAr<sup>2</sup>はそれぞれ独立して非置換型又は置換型アリールであり；

【化3】



は存在せず；

R<sup>1</sup>は水素であり；

R<sup>2</sup>は低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CF<sub>3</sub>、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-CF<sub>3</sub>、-S(O)<sub>p</sub>アルキル、S(O)<sub>p</sub>アリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OR<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、-COR<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、又は-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>であり；

R<sup>3</sup>は低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CF<sub>3</sub>、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-CF<sub>3</sub>、-S(O)<sub>p</sub>アルキル、S(O)<sub>p</sub>アリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OR<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、-COR<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、又は-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>であり；

R<sup>4</sup>は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CF<sub>3</sub>、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-CF<sub>3</sub>、-S(O)<sub>p</sub>アルキル、S(O)<sub>p</sub>アリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OR<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、-COR<sup>5</sup>、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、又は-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>であり；

R<sup>5</sup>は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル又はアリールであり；

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>はそれぞれ独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、-COアルキル、-COアリール、シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>アルキル、-CO<sub>2</sub>アリールであるか、或いはR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、これらが結合された原子と一緒にヘテロ原子数1～3の4～7員環を形成し；

mは0～5であり；

pは0、1、又は2であり；

qは1であり；そして

rは0である

、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

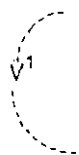
式中、X<sup>0</sup>はSであり；

X<sup>1</sup>は存在せず；

Ar<sup>1</sup>はフェニルであり；

Ar<sup>2</sup>は置換型フェニルであり；

## 【化 4】



は存在せず；

$R^1$  は水素であり；

$R^2$  は低級アルコキシであり；

$R^3$  は低級アルキルであり；

$R^4$  は水素であり；

$q$  は1であり；そして

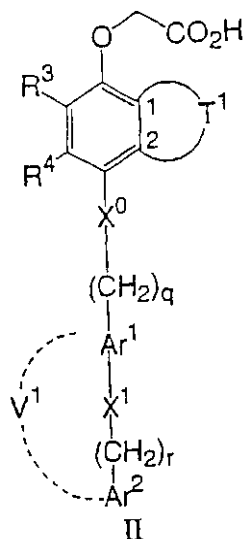
$r$  は0である

、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 4】

以下の式(II)：

## 【化 5】

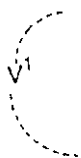


{ 上記式中、

$X^0$  及び  $X^1$  は独立して、存在しないか、或いは、O、S、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CHCH}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、又は  $-\text{S}(\text{O})-$  であり；

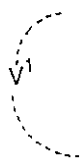
$\text{Ar}^1$  及び  $\text{Ar}^2$  はそれぞれ独立して非置換型又は置換型アリール又はヘテロアリールであり、但し  $\text{Ar}^1$  はチアゾリル又はオキサゾリルではなく；

## 【化 6】



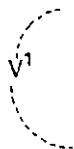
は存在しないか；或いは存在する場合には

## 【化 7】



は置換型又は非置換型である飽和型又は不飽和型炭化水素鎖であり、前記鎖の原子数が1～4であることにより、

## 【化 8】



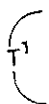
、 $Ar^1$ 、 $X^1$ 、 $(CH_2)_r$ 及び $Ar^2$ と一緒に4～8員環を形成するようになっており；

$R^3$ 及び $R^4$ は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $-O-(CH_2)_mCF_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CF_3$ 、 $-S(O)_p$ アルキル、 $S(O)_p$ アリアル、 $-(CH_2)_mOR^5$ 、 $-(CH_2)_mNR^6R^7$ 、 $-COR^5$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R^5$ 、又は $-NR^6R^7$ から選択され；

$R^5$ は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル又はアリアルであり；

$R^6$ 及び $R^7$ はそれぞれ独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-CO$ アルキル、 $-CO$ アリアル、シクロアルキル、 $-CO_2$ アルキル、 $-CO_2$ アリアル、 $-SO_2$ アルキル、 $-SO_2$ アリアルであるか、或いは $R^6$ 及び $R^7$ は、これらが結合されている原子と一緒にヘテロ原子数1～3の4～7員環を形成し；

## 【化 9】



は、原子数3～6の飽和型又は不飽和型の置換型又は非置換型炭化水素鎖又は炭化水素-ヘテロ原子鎖であり、位置2の炭素原子は位置3の炭素原子に結合されることにより、5～8員環を形成し；

mは0～5であり；

pは0～2であり；

qは0～6であり；そして

rは0～6である。}により表される化合物又は該化合物の製薬上許容可能な塩。

## 【請求項 5】

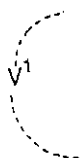
式中、 $X^0$ はSであり；

$X^1$ は0であり；

$Ar^1$ はフェニルであり；

$Ar^2$ は4-トリフルオロメチルフェニルであり；

## 【化 10】



は存在せず；

$R^3$ は水素、低級アルキル、低級アルコキシであり；

$R^4$ は水素、低級アルキル、低級アルコキシであり；

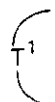
mは0～5であり；

pは0、1、又は2であり；

qは1であり、

rは1であり；そして

## 【化 11】



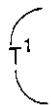
は、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-HC=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-HC=CH-$ 、 $-CH_2CH_2-NR^4-CH_2-$ 、 $COCH=CH-O-$ 、 $-O-CH=CH-CO-$ 、 $-CH=CH-NR^4-$ 、 $-NR^4-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-NR^4-$ 、 $-NR^4-CH_2-CH_2-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-NR^4-$ 、 $-NR^4-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-$ である、

、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

式中、

【化12】



は、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{HC}=\text{CH}-\text{HC}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-\text{HC}=\text{CH}-$ 、 $-\text{HC}=\text{N}-\text{HC}=\text{CH}-$ 、 $-\text{HC}=\text{CH}-\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{HC}=\text{CH}-\text{HC}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{HC}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{HC}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NR}^4-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{COCH}=\text{CH}-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{NR}^4-$ 、 $-\text{NR}^4-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NR}^4-$ 、 $-\text{NR}^4-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NR}^4-$ 、 $-\text{NR}^4-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^4-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{NR}^4\text{CO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NR}^4-\text{CO}-$ 、又は $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NR}^4-$ である、請求項4に記載の化合物。

【請求項7】

以下の：

- [4-(ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-5-メトキシ-2-メチル-フェノキシ]-酢酸；
- [5-メトキシ-2-メチル-4-(4'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；
- [4-(2',4'-ジクロロ-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-5-メトキシ-2-メチル-フェノキシ]-酢酸；
- [5-メトキシ-2-メチル-4-(3'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；
- [4-(4'-フルオロ-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-5-メトキシ-2-メチル-フェノキシ]-酢酸；
- [7-(4'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-インダン-4-イルオキシ]-酢酸；
- {5-メトキシ-2-メチル-4-[4-(4-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-ベンジルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；
- [5-メトキシ-2-メチル-4-(3'-トリフルオロメトキシ-ピフェニル-3-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；
- {5-メトキシ-2-メチル-4-[4-(5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；
- {5-メトキシ-2-メチル-4-[6-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-ピリジン-3-イルメチルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；
- [3-メトキシ-4-(4'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；
- {5-メトキシ-2-メチル-4-[2-(4'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イル)-エチルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；
- (4-{4-[2-(3-フルオロ-フェニル)-ビニル]-ベンジルスルファニル}-5-メトキシ-2-メチル-フェノキシ)-酢酸；
- [5-メトキシ-2-メチル-4-(3-メチル-4'-トリフルオロメチル-ピフェニル-4-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；
- {4-[5-(4-クロロ-フェニル)-イソキサゾル-3-イルメチルスルファニル]-5-メトキシ-2-メチル-フェノキシ}-酢酸；

{5-メトキシ-2-メチル-4-[5-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-イソキサゾル-3-イルメチルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；

{5-メトキシ-2-メチル-4-[3-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-イソキサゾル-5-イルメチルスルファニル]-フェノキシ}-酢酸；

[5-メトキシ-2-メチル-4-(4'-トリフルオロメチル-ビフェニル-3-イルメチルスルファニル)-フェノキシ]-酢酸；

{7-[4-(4-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-ベンジルスルファニル]-インダン-4-イルオキシ}-酢酸；

[5-メチル-7-[4-(5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ}-酢酸；

及びこれらの製薬上許容可能な塩から選択される化合物。

【請求項 8】

担体、希釈剤又は賦形剤と混合されて請求項1に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 9】

哺乳動物のインスリン非依存性糖尿病を治療、予防又は制御するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を含む前記組成物。

【請求項 10】

哺乳動物の肥満を治療、予防又は制御するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を含む前記組成物。

【請求項 11】

哺乳動物のレプチン・レベルを調節するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を含む前記組成物。

【請求項 12】

哺乳動物の異常脂質血症を治療、予防又は制御するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を含む前記組成物。

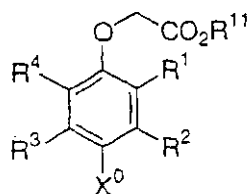
【請求項 13】

哺乳動物の高コレステロール血症を治療、予防又は制御するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を含む前記組成物。

【請求項 14】

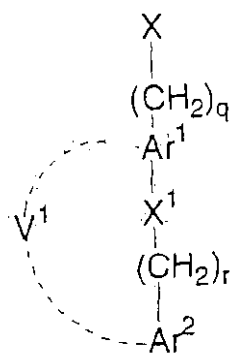
請求項1に記載の化合物又はその製薬上許容可能な塩の製造方法であって、以下の：

【化 13】



を、

## 【化 1 4】



と、反応させることを含み、

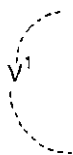
上記式中、

$X^0$  は OH 又は SH であり；

$X^1$  は存在しないか、或いは O 又は S であり；

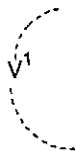
$Ar^1$  及び  $Ar^2$  はそれぞれ独立して 非置換型 又は 置換型 アリール又はヘテロアリールであり；

## 【化 1 5】



は存在しないか、或いは、原子数 0 ~ 3 の飽和型又は不飽和型の置換型又は非置換型炭化水素鎖又は炭化水素-ヘテロ原子鎖であり、4 ~ 8 員環が形成されて  $Ar^1$  及び  $Ar^2$  に縮合され、

## 【化 1 6】



が存在せず、且つどちらの「-----」も結合手である場合には、 $Ar^1$  は  $Ar^2$  に直接的に結合され；

$R^1$  及び  $R^2$  は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $O-(CH_2)_pCF_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CF_3$ 、 $-S(O)_p$  アルキル、 $S(O)_p$  アリール、 $-(CH_2)_mOR^8$ 、 $-(CH_2)_mNOR^8$ 、 $-(CH_2)_mNR^9R^{10}$ 、 $-COR^8$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R^8$ 、又は  $-NR^9R^{10}$  から選択されるか、又は一緒に結合されて 5 ~ 8 員環を形成し；

$R^3$  及び  $R^4$  は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、 $O-(CH_2)_pCF_3$ 、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CF_3$ 、 $-S(O)_p$  アルキル、 $S(O)_p$  アリール、 $-(CH_2)_mOR^8$

、 $-(CH_2)_mNR^9R^{10}$ 、 $-COR^8$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R^8$ 、又は $-NR^9R^{10}$ から選択され；

$R^5$ 及び $R^6$ は独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル又はアリールであるか、  
或いは一緒に結合されて3～7員シクロアルキル又はシクロアルケニルを形成し；

$R^7$ 及び $R^8$ は独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル又はアリールであり；

$R^9$ 及び $R^{10}$ はそれぞれ独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、 $-CO$ アルキル、 $-CO$ アリール、シクロアルキル、 $-CO_2$ アルキル、 $-CO_2$ アリール、 $-SO_2$ アルキル、 $-SO_2$ アリールであるか、或いは一緒に結合されてヘテロ原子数1～3の4～7員環を形成し；

$R^{11}$ は低級アルキルであり；

Xはハロゲンであり；

mは0～5であり；

pは0～2であり；

qは0～6であり；そして

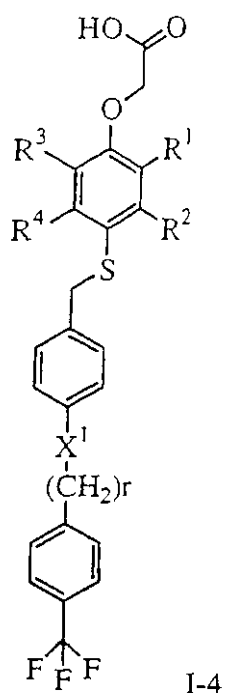
rは0～6である、

前記製造方法。

【請求項15】

以下の式I-4：

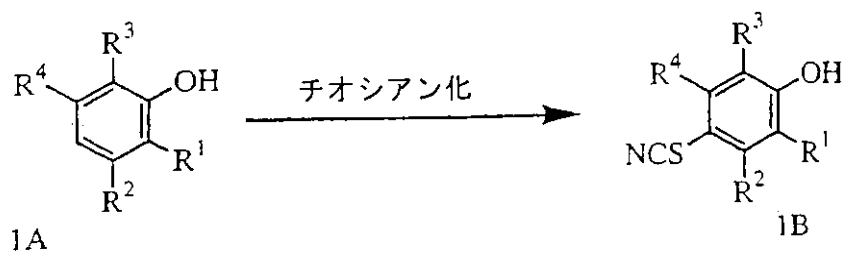
【化17】



である化合物の製造方法であって、以下の：

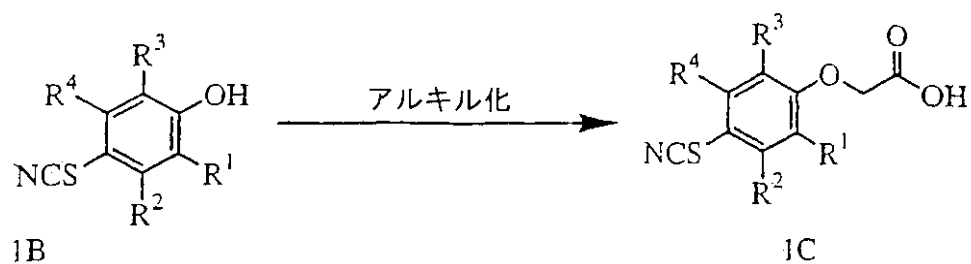
(a)フェノール1Aをチオシアネート1Bに転化し、

## 【化 18】



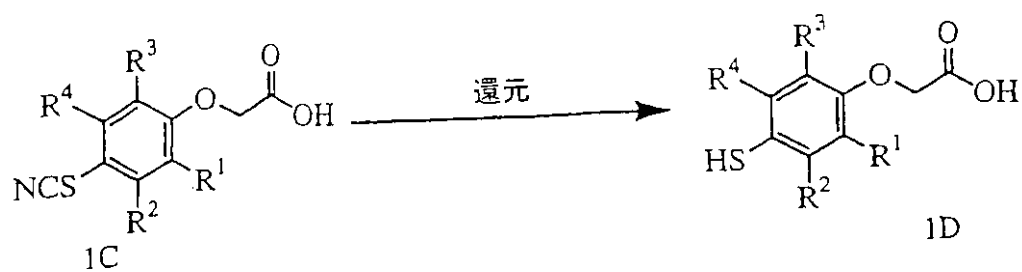
(b) チオシアネート 1B のフェノール部分をアルキル化することによりアセトキシエステル 1C にし、

## 【化 19】



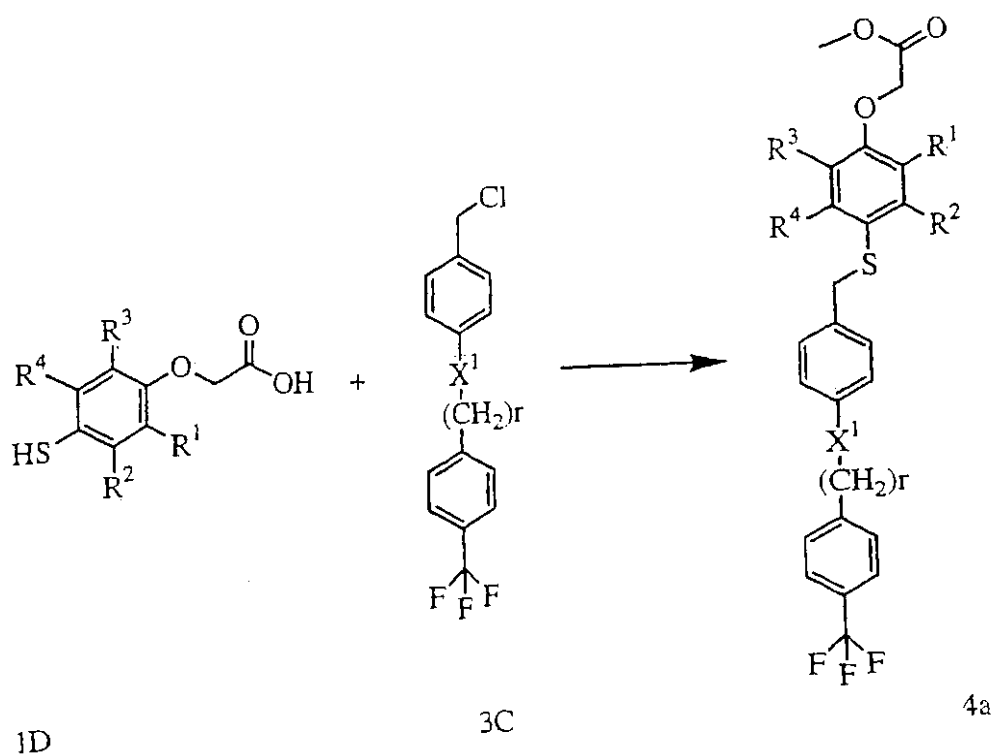
(c) 1C 中のチアシアネート部分を還元することにより、チオール 1D を形成し、

## 【化 20】



(d) 塩化物 3C でチオール 1D をアルキル化することにより、4a を形成し、

## 【化 2 1】



そして

(e) 4a中のエステル部分を鹼化することにより、1-4を形成することを含み、  
上記式中、

R<sup>1</sup>は水素であるか、或いはR<sup>2</sup>とともに5員炭素環を形成し；

R<sup>2</sup>はメトキシであるか、或いはR<sup>1</sup>とともに5員炭素環を形成し；

R<sup>3</sup>は水素又はメチルであり；

R<sup>4</sup>は水素であり；

X<sup>1</sup>は存在しないか、或いは0であり；そして

rは0又は1である、

前記製造方法。