

【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8日(2005.12.8)

【公表番号】特表2002-502385(P2002-502385A)

【公表日】平成14年1月22日(2002.1.22)

【出願番号】特願平11-500267

【国際特許分類第7版】

C 07C 235/32

A 61K 31/136

A 61K 31/167

A 61K 31/343

A 61K 31/366

A 61K 31/381

A 61K 31/4245

A 61K 31/536

A 61P 5/26

A 61P 5/34

A 61P 15/00

A 61P 15/18

C 07D 237/28

C 07D 249/18

C 07D 265/02

C 07D 271/08

C 07D 285/14

C 07D 307/88

C 07D 311/76

C 07D 333/72

C 07D 409/12

【F I】

C 07C 235/32

A 61K 31/136

A 61K 31/167

A 61K 31/343

A 61K 31/366

A 61K 31/381

A 61K 31/4245

A 61K 31/536

A 61P 5/26

A 61P 5/34

A 61P 15/00

A 61P 15/18

C 07D 237/28

C 07D 249/18

C 07D 265/02

C 07D 271/08

C 07D 285/14

C 07D 307/88

C 07D 311/76

C 07D 333/72

C 0 7 D 409/12

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月2日(2005.6.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書



平成 17 年 6 月 2 日

特 許 庁 長 官 殿

1. 事件の表示

平成 11 年 特 許 願 第 500267 号

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 シエーリング アクチエンゲゼルシャフト

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内 1 丁目 6 番 2 号
新丸の内センタービルディング
ゾンデルホフ & アインゼル法律特許事務所
電話 03 (5220) 6500 (代表)

氏 名 (6181) 弁理士 矢 野 敏 雄



4. 補正により増加する請求項の数 0

5. 補正の対象書類名

請求の範囲

6. 補正対象項目名

請求の範囲

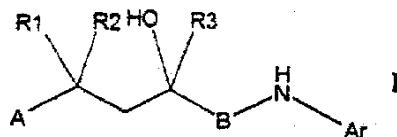
7. 補正の内容

別紙の通り



請求の範囲

1. 一般式 I



[式中、

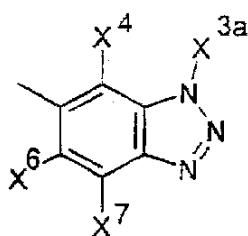
R¹及びR²は同じ又は異なり、水素原子、C₁～C₅アルキル基又はハロゲン原子、さらに鎖のC原子と一緒にになって合計で3～7員の環を表し、

R³はC₁～C₅アルキル基又は部分的に又は完全にフッ素化されたC₁～C₅アルキル基を表し、

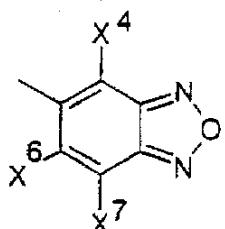
Aは、ハロゲン原子、C₁～C₅アルキル基、C₂～C₅アルケニル基、-CR⁵=CR⁶R⁷（式中、R⁵、R⁶及びR⁷は同じ又は異なり、相互に独立して水素原子又はC₁～C₅アルキル基を表す）、ヒドロキシ基、ヒドロキシ基（前記ヒドロキシ基はC₁～C₁₀アシル基、C₃～C₁₀カルバルコキシアルキル基、C₂～C₅シアノアルキル基、置換又は非置換のC₃～C₁₀アリル基、置換又は非置換のC₃～C₁₀プロパルギル基、C₂～C₅アルコキシアルキル基、部分的に又は完全にフッ素原子により置換されたC₁～C₅アルキル基を有する）、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₅アルコキシ基、C₁～C₅アルキルチオ基、一置換又は二置換のC₁～C₁₀アミノ基又は部分的に又は完全にフッ素化されたC₁～C₅アルキル基から選択される1以上の基により置換されていてもよい单環式又は二環式の炭素環式及び複素環式の芳香環を表し、

Bはカルボニル基又はCH₂-基を表し、

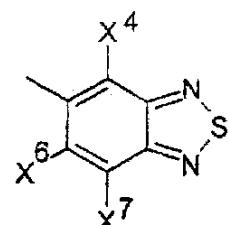
Arは部分式2～11



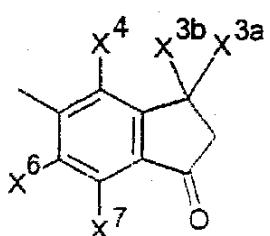
2



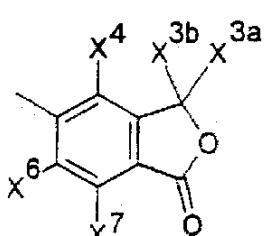
3



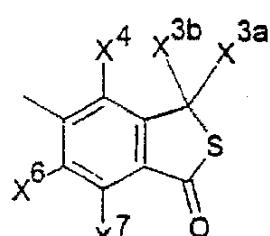
4



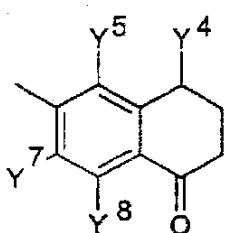
5



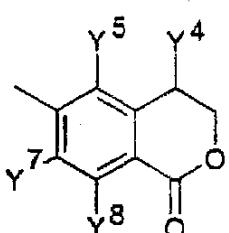
6



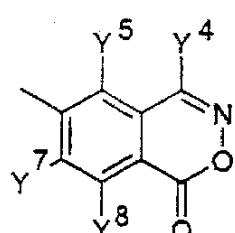
7



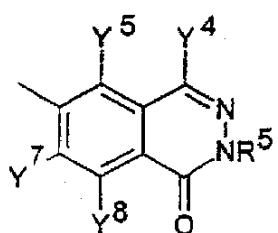
8



9



10



11

(式中、

部分式2においてX^{3a}、X⁴、X⁶、X⁷、部分式3及び4においてX⁴、X⁶、X⁷、部分式5、6及び7においてX^{3a}、X^{3b}、X⁴、X⁶、X⁷又は部分式8、9、10及び11においてY⁴、Y⁵、Y⁷、Y⁸は同じ又は異なり、水素原子、C₁～C₅アルキル基（前記アルキル基は付加的にお場合によりC₁～C₅アルキル基でエーテル化されるか又はC₁～C₅アルカノイル基でエス

テル化されたヒドロキシ基を有していてもよい) 部分的に又は完全にフッ素化されたC₁～C₅アルキル基、C₂～C₅アルケニル基—CR⁵=CR⁶R⁷(式中、R⁵、R⁶及びR⁷は上記の意味を表す)、アルキニル基—C≡CR⁵(式中、R⁵は上記の意味を表す)から選択され、基X^{3a}及びX^{3b}はさらに、ベンゾ縮合した環系5、6又は7のC原子と一緒にになって、合計で3～7員の環を形成し、並びにさらに部分式2、3、4、5、6及び7において基X⁴、X⁶、X⁷又は部分式8、9、10及び11においてY⁴、Y⁵、Y⁷、Y⁸はハロゲン原子、ヒドロキシ基、C₁～C₅アルコキシ基又はC₁～C₅アルカノイル基から選択される)のグループから選択される環系を表す]で示される化合物並びにBがCH₂—基を表す場合、一般式Iの化合物と酸との生理学的に認容性の塩。

2. ラセミ体又はジアステレオマー混合物の形の請求項1記載の一般式Iの化合物。
3. 分離された光学異性体の形の請求項1記載の一般式Iの化合物。
4. R¹及びR²が同じ又は異なり、水素原子、メチル基又はエチル基、さらに鎖のC原子と一緒にになってシクロプロピル環を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
5. R³はC₁～C₅ペルフルオロアルキル基を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
6. Aはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチル基、ビニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、エトキシ基により置換されていてもよいベンゼン環、ナフタレン環又はチオフェン環を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
7. X^{3a}が水素又はC₁～C₅アルキル基を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
8. X^{3a}及びX^{3b}は同じ又は異なり、水素原子又はC₁～C₅アルキル基を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
9. X⁴、X⁶及びX⁷は同じ又は異なり、相互に独立して水素原子又はハロゲン原子を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。

10. Y^4 は $C_1 \sim C_5$ アルキル基又は $C_1 \sim C_5$ ペルフルオロアルキル基を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
11. Y^5 、 Y^7 及び Y^8 は同じ又は異なり、相互に独立して水素原子又はハロゲン原子を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
12. R^1 及び R^2 は同じ又は異なり、水素原子、メチル基又はエチル基、さらに鎖のC原子と一緒にになってシクロプロピル環を表し、 R^3 は $C_1 \sim C_5$ ペルフルオロアルキル基を表し、Aはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチル基、ビニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、エトキシ基により置換されていてもよいベンゼン環、ナフタレン環又はチオフェン環を表し、 X^{3a} は水素原子又は $C_1 \sim C_5$ アルキル基を表すか、又は X^{3a} 及び X^{3b} は同じ又は異なり水素原子又は $C_1 \sim C_5$ アルキル基を表し、 X^4 、 X^6 及び X^7 は同じ又は異なり相互に独立して水素原子、又はハロゲン原子を表すか又は Y^4 は $C_1 \sim C_5$ アルキル基又は $C_1 \sim C_5$ ペルフルオロアルキル基を表し、 Y^5 、 Y^7 及び Y^8 は同じ又は異なり相互に独立して水素原子又はハロゲン原子を表し、他の置換基は全て式Iに記載された意味を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
13. A_r は部分式6の環系を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
14. A_r は部分式7の環系を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
15. A_r は部分式10の環系を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
16. A_r は部分式11の環系を表す、請求項1記載の一般式Iの化合物。
17. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり
- 4-ブロモ-5-(2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-ト
リフルオロメチル-バレオイルアミノ)-フタリド、
- 6-ブロモ-5-(2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-ト
リフルオロメチル-バレオイルアミノ)-フタリド、
- 5-(2-ヒドロキシ-4-メチル-ペンタフルオロエチル-4-フェニ
ル-バレオイルアミノ)-フタリド、
- 5-[2-ヒドロキシ-4-(3-メトキシフェニル)-4-メチル-2
-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-(4-メトキシフェニル)-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシフェニル)-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(2-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(4-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(4-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(4-ブロモフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-メチル-4-(4-トリル)-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-メチル-4-(3-トリル)-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(4-シアノフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(3, 4-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-(2-メトキシ-5-メチルフェニル)-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(5-クロロ-2-ヒドロキシフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(5-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ]-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)-

4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(5-フルオロ-2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-

4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-

4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-

4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-(2-ヒドロキシ-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-バレオ
イルアミノ)-フタリド、

5-[2-ヒドロキシ-4-(2-メトキシフェニル)-4-メチル-2
-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(5-クロロ-2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-4
-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-(2-ヒドロキシ-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-ペンチ
ルアミノ)-フタリド、

5-(2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-トリフルオロメ
チル-ペンチルアミノ)-フタリド、

5-[4-(4-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2
-トリフルオロメチル-ペンチルアミノ]-フタリド、

5-[4-(5-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)-2-ヒドロキシ
-4-メチル-2-トリフルオロメチル-ペンチルアミノ]-フタリド、

6-アセチル-5-(2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-
トリフルオロメチル-バレオイルアミノ)-フタリド、

5-[4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-ヒドロキシ
-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

5-[4-(3-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-4-メチル-2
-トリフルオロメチル-バレオイルアミノ]-フタリド、

6-(3-ヒドロキシ-3-メチル-1-ブチニル)-5-(2-ヒドロ
キシ-4-メチル-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-バレオイルア

ミノ) - フタリド、

6 - (2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ) - 4-メチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

6 - (2-ヒドロキシ-4-メチル-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ) - 4-トリフルオロメチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

4-エチル-6 - (2-ヒドロキシ-4-フェニル-2-トリフルオロメチル-ベンチルアミノ) - 2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

4-エチル-6 - [2-ヒドロキシ-4 - (2-メトキシフェニル) - 4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

6 - [2-ヒドロキシ-4 - (2-メトキシフェニル) - 4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 4-メチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

4-エチル-6 - [2-ヒドロキシ-4-メチル-4 - (4-メチルフェニル) - 2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

6 - [4 - (4-ブロモフェニル) - 2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 4-エチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

4-エチル-6 - [4 - (5-フルオロ-2-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

6 - [4 - (5-フルオロ-2-メトキシフェニル) - 2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] - 4-メチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

1 - (4-ニトロ-3-トリフルオロメチルアニリノ) - 4-フェニル-2-トリフルオロメチル-2-ベンタノール、

5- (2-ヒドロキシ-4, 4-ジメチル-2-トリフルオロメチル-5-ヘキセノイルアミノ) -フタリド、

5- [2-ヒドロキシ-3- (1-フェニル-シクロプロピル) -2-トリフルオロメチル-プロピオニルアミノ] -フタリド、

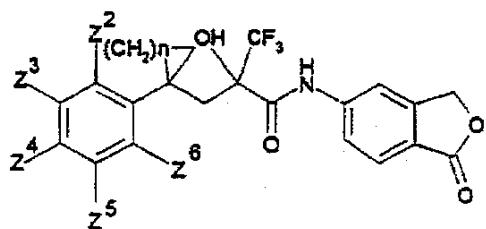
5- [2-ヒドロキシ-3- (1-フェニル-シクロプロピル) -2-トリフルオロメチル-プロピオニルアミノ] -フタリド、

5- [2-ヒドロキシ-3- (1-フェニル-シクロヘキシル) -2-トリフルオロメチル-プロピオニルアミノ] -フタリド、

6- (2-ヒドロキシ-2, 4-ジメチル-4-フェニル-バレロイルアミノ) -4-メチル-2, 3-ベンゾオキサジン-1-オン、

5- [4- (3-クロロ-4-メトキシフェニル) -2-ヒドロキシ-4-メチル-2-トリフルオロメチル-バレロイルアミノ] -フタリド。

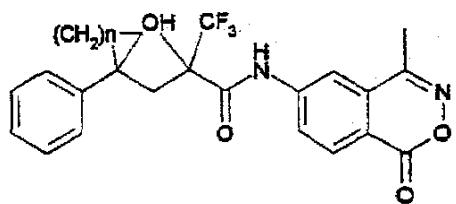
18. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



n	Z ⁿ (≠ H)	異性
1		ラセミ体
1		(+)-鏡像体
1		(-)-鏡像体
1	3-F	ラセミ体
1	2-Cl	ラセミ体
1	4-Cl	ラセミ体
1	4-Cl	(+)-鏡像体
1	4-Cl	(-)-鏡像体
1	2-Br	ラセミ体

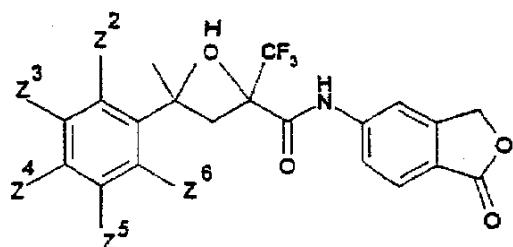
1	3-Br	ラセミ体
1	2,4-Cl ₂	ラセミ体
1	2-OCH ₃	(+)-鏡像体
1	2-OCH ₃	(-)-鏡像体
1	3-OCH ₃	ラセミ体
1	3-CF ₃	ラセミ体
2		ラセミ体
2		(+)-鏡像体
2		(-)-鏡像体
3		(+)-鏡像体
3	4-CH ₃	ラセミ体
4		ラセミ体
4		(+)-鏡像体
4		(-)-鏡像体

19. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



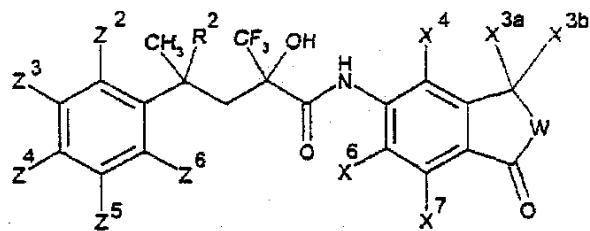
n	異性
1	ラセミ体
1	(+)-鏡像体
	(-)-鏡像体
2	ラセミ体
4	ラセミ体
4	(+)-鏡像体
4	(-)-鏡像体

20. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



Z ¹
(≠ H)
Z ² = I
Z ³ = Cl
Z ³ = Br
Z ³ = I

21. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



R ²	W	X ^a (≠H)	Z ^a (≠H)	異性
H	O	X ^{3a} /X ^{3b} =H/CH ₃		ジアステレオマー 混合物
H	O	X ^{3a} =H, X ^{3b} =CH ₃		(+)-形
H	O	X ^{3a} =H, X ^{3b} =CH ₃		(-)-形
H	O	X ^{3a} =CH ₃ , X ^{3b} =H		(+)-形
H	O	X ^{3a} =CH ₃ , X ^{3b} =H		(-)-形
H	O	X ^{3a} =C ₂ H ₅		
H	O	X ^{3a} =CH=CH ₂		
H	O	X ^{3a} =CH=CH ₂ - CH ₃		

H	O	$X^{3a} = CF_3$		
H	O	$X^{3a} = X^{3b} = CH_3$		
H	O	$X^{3a} = X^{3b} = C_2H_5$		
H	O	$X^{3a} = X^{3b} = (CH_2)_4$		
H	O	$X^4 = Br$		
CH ₃	O			
CH ₃	O	$X^4 = Br$		
CH ₃	O		$Z^2 = CH_3$	ラセミ体
CH ₃	O		$Z^2 = CH_3$	(+)-形
CH ₃	O		$Z^2 = CH_3$	(-)-形
CH ₃	O		$Z^4 = CH_3$	

R^2	W	X^n (≠H)	Z^n (≠H)	異性
CH ₃	O		$Z^3 = Z^4 = CH_3$	ラセミ体
CH ₃	O		$Z^3 = Z^4 = CH_3$	(+)-形
CH ₃	O		$Z^3 = Z^4 = CH_3$	(-)-形
CH ₃	O		$Z^3 = Z^5 = CH_3$	ラセミ体
CH ₃	O		$Z^3 = Z^5 = CH_3$	(+)-形
CH ₃	O		$Z^3 = Z^5 = CH_3$	(-)-形
CH ₃	O		$Z^3/Z^4 = (CH_2)_3$	
CH ₃	O		$Z^3/Z^4 = -CH=CH-$ $CH=CH-$	
CH ₃	O		$Z^4 = F$	
CH ₃	O		$Z^4 = Cl$	
CH ₃	O		$Z^4 = Br$	
CH ₃	O		$Z^2 = OCH_3$	ラセミ体

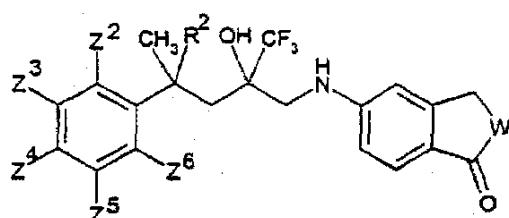
CH ₃	O		Z ⁴ =OCH ₃	
CH ₃	O		Z ² =Z ⁵ =OCH ₃	
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =CH ₃	(+)-形
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =CH ₃	(-)-形
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁴ =F	
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	
CH ₃	O		Z ⁴ =OCH ₃ , Z ² =F	
CH ₃	O		Z ⁴ =OCH ₃ , Z ³ =F	
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	ラセミ体
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	(+)-形

R ²	W	X ⁿ (≠H)	Z ⁿ (≠H)	異性
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	(-)-形
H	S			
CH ₃	S			
H	CH ₂			
H	O-CH ₂ (3)			

R ²	W	X ⁿ (≠H)	Z ⁿ (≠H)	異性
CH ₃	O		Z ⁴ =CH=CH ₂	ラセミ体
CH ₃	O		Z ⁴ =CN	ラセミ体
CH ₃	O		Z ⁴ =COCH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		Z ⁴ =CONH ₂	ラセミ体
CH ₃	O		Z ² =OCH ₃ , Z ⁴ =Br	ラセミ体

CH ₃	O		Z ² = OCH ₃ , Z ⁴ = Br	(+)-鏡像体
CH ₃	O		Z ² = OCH ₃ , Z ⁴ = Br	(-)-形
CH ₃	O		Z ² = Br, Z ⁴ = OCH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		Z ² = OCH ₃ , Z ⁴ = CN	ラセミ体
CH ₃	O		Z ³ = NO ₂ , Z ⁴ = OCH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		Z ² = COCH ₃ , Z ⁴ = CH(CH ₃) ₂	ラセミ体
CH ₃	O		Z ³ = COCH ₃ , Z ⁴ = OCH ₃	ラセミ体

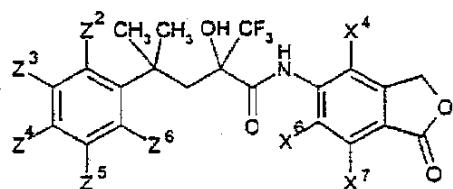
22. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



R ²	W	Z ⁴ (≠H)	異性
H	O		ラセミ体
H	O		(+)-形
H	O		(-)-形
CH ₃	O		ラセミ体
CH ₃	O		(+)-形
CH ₃	O		(-)-形
CH ₃	O	Z ⁴ = F	ラセミ体
CH ₃	O	Z ⁴ = F	(+)-形
CH ₃	O	Z ⁴ = F	(-)-形

CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	
H	CH ₂		
H	OCH ₂ (3)		

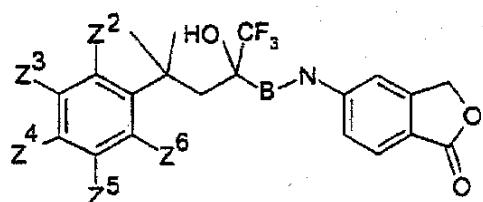
23. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



X ⁴ (≠H)	Z ⁶ (≠H)
X ⁴ =CH=CH ₂	
X ⁶ =CH=CH ₂	
X ⁶ =C(OC ₂ H ₅)=CH ₂	
X ⁶ =C≡C-CH ₂ OH	
X ⁶ =C ₆ H ₅	
X ⁶ = 	
X ⁶ =C ₆ H ₄ OCH ₃ (p-)	

	$Z^3=CH=CH_2$
	$Z^3=C_2H_5$
	$Z^3=COCH_3$
	$Z^3=CN$
	$Z^4=CH=CH_2$
	$Z^4=COCH_3$

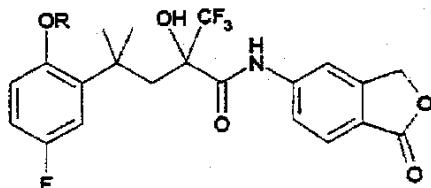
24. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



B	Z^n (*H)	異性
C=O	$Z^2=OH$	
C=O	$Z^4=OH$	
C=O	$Z^2=Z^5=OH$	
C=O	$Z^2=OH, Z^5=CH_3$	ラセミ体
C=O	$Z^2=OH, Z^5=CH_3$	(+)-形
C=O	$Z^2=OH, Z^5=CH_3$	(-)-形
C=O	$Z^2=OH, Z^4=F$	

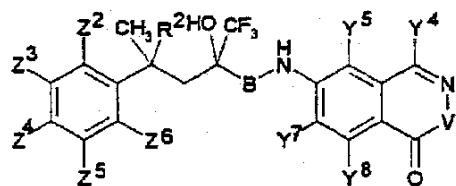
C=O	Z ² =OH, Z ⁵ =F	
C=O	Z ⁴ =OH, Z ² =F	
C=O	Z ² =OH, Z ⁵ =Cl	
CH ₂	Z ² =OH, Z ⁵ =F	ラセミ体
CH ₂	Z ² =OH, Z ⁵ =F	(+)-形
CH ₂	Z ² =OH, Z ⁵ =F	(-)-形
C=O	Z ² =OH, Z ⁴ =Br	ラセミ体
C=O	Z ³ =NO ₂ , Z ⁴ =OH	ラセミ体
C=O	Z ³ =Cl, Z ⁴ =OH	ラセミ体
C=O	Z ³ =Br, Z ⁴ =OH	ラセミ体

25. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



R	異性
CH(CH ₃) ₂	ラセミ体
CH ₂ CH=CH ₂	ラセミ体
CH ₂ CH=CH ₂	ラセミ体
CH ₂ CN	ラセミ体
CH ₂ COOC(CH ₃) ₃	ラセミ体
CH ₂ COOC(CH ₃) ₃	(-)-形
CH ₂ COOC(CH ₃) ₃	(+)-形

26. 請求項1記載の一般式Iの化合物、つまり次の化合物



R ²	V	Z ⁿ (≠H)	B	Y ⁿ (≠H)	異性
H	O		C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
H	O		C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)-形
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)-形
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(+)-形
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(-)-形

R ²	V	Z ⁿ (≠H)	B	Y ⁿ (≠H)	異性
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)-形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)-形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(+)-形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(-)-形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)-形

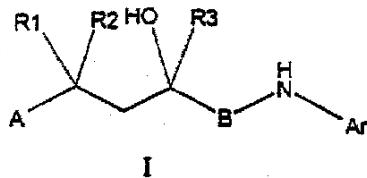
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(-)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(+)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁵ =Cl	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)形
CH ₃	O	Z ² =OCH ₃ , Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)形
CH ₃	O	Z ⁴ =CH ₃	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ⁴ =CH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体
CH ₃	O	Z ⁴ =CH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(-)形
CH ₃	O	Z ⁴ =CH ₃	C=O	Y ⁴ =C ₂ H ₅	(+)形
CH ₃	O	Z ⁴ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)形
CH ₃	O	Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)形
CH ₃	O		C=O	Y ⁴ =CF ₃	
CH ₃	NH		C=O	Y ⁴ =CH ₃	
CH ₃	NCH ₃		C=O	Y ⁴ =CH ₃	
CH ₃	O	Z ² =OH, Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O	Z ² =OH, Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(+)形
CH ₃	O	Z ² =OH, Z ⁵ =F	C=O	Y ⁴ =CH ₃	(-)形
CH ₃	O	Z ² =OH, Z ⁴ =Br	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体

CH ₃	O	Z ³ =NO ₂ , Z ⁴ =OCH ₃	C=O	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
H	O		CH ₂	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		CH ₂	Y ⁴ =CH ₃	ラセミ体
CH ₃	O		CH ₂	Y ⁴ =C ₂ H ₅	ラセミ体

27. 請求項1記載の一般式Iの化合物少なくとも1種並びに調剤学的に認容性の担持剤を含有する医薬品。

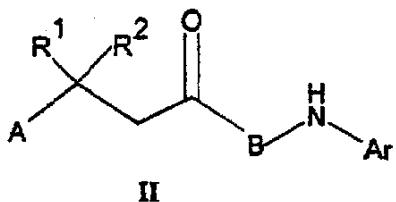
28. 医薬品の製造のための請求項1記載の一般式Iの化合物の使用。

29. 一般式I



[式中、

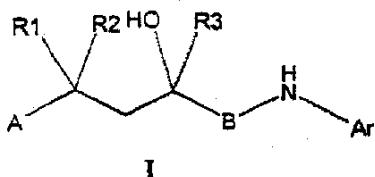
A、B、Ar、R¹、R²並びにR³は請求項1記載の意味を表す]の化合物を製造するにあたり、一般式II



[式中、A、B、Ar、R¹及びR²は一般式Iに記載した意味を表す]のカルボニル化合物を、一般式R³—SiMe₃（式中、R³は一般式Iに記載された意味を表す）の化合物と、触媒の存在で又はアルキル金属化合物、例えばグリニャール試薬又はリチウムアルキルと反応させて、一般式Iの化合物にする、一般式Iの化合物の製造方法。

30. 触媒がフッ化物一塩又はアルカリ金属炭酸塩である、請求項29記載の方法。

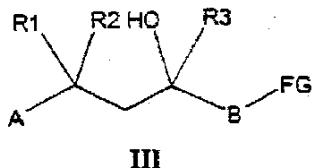
31. 一般式I



[式中、

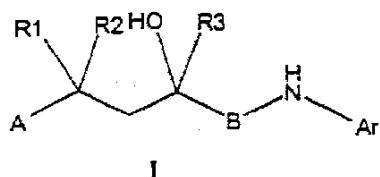
A、B、Ar、R¹、R²並びにR³は請求項1記載の意味を表す]の化合物

を製造するにあたり、一般式 I I I



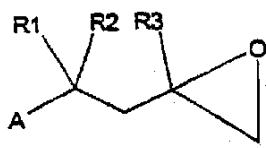
[式中、A、B、R¹、R²及びR³は一般式 I に記載した意味を表し、FGは脱離基を表す] の化合物を、式A_r—NH—R¹¹（式中、R¹¹は水素原子又はC₁～C₅アルカノイル基を表し、A_rは一般式 I に記載した意味を表す）の化合物と反応させ、場合により引き続き基R¹¹を分離させる、一般式 I の化合物の製造方法。

32. 一般式 I I I の化合物中の脱離基FGが塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子、トシレート基又はメシレート基又はC₁～C₄ペルフルオロアルキルスルホニルオキシ基である、請求項3 1記載の方法。
33. 一般式 I I I の化合物が相応するカルボン酸から中間的に形成された酸塩化物である、請求項3 2記載の方法。
34. 一般式 I



[式中、

A、A_r、R¹、R²並びにR³は請求項1記載の意味を表し、Bは—CH₂—基を表す] の化合物を製造するにあたり、一般式 I V



IV

[式中、A、R¹、R²及びR³は式 I に記載された意味を表す] の化合物を

、式 $A_r - NH - R^{11}$ (式中、 R^{11} 及び A_r は請求項 2 3 に記載された意味を表す) の化合物と反応させ、引き続き R^{11} を場合により分離させる、一般式 I の化合物の製造方法。