

【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23年4月7日(2011.4.7)

【公開番号】特開2010-77116(P2010-77116A)

【公開日】平成22年4月8日(2010.4.8)

【年通号数】公開・登録公報2010-014

【出願番号】特願2009-192755(P2009-192755)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/47 C S P

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 413/12

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月16日(2011.2.16)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

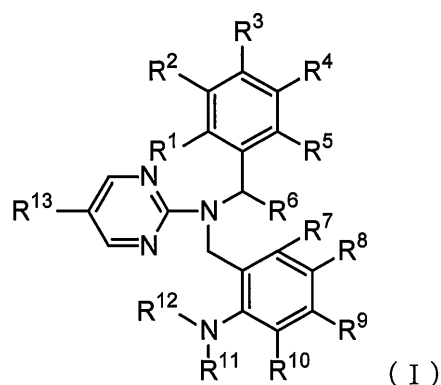
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の一般式 (I)

【化 1】



(式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ハロ低級アルキルスルホニルアミノ基、アリールスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいアミノ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R^6 は、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級シクロアルキル基、又は低級シクロアルキル低級アルキル基を示し、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級シクロアルキル基、低級シクロアルキル低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルコキシ低級アルコキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ハロ低級アルキルスルホニルアミノ基、アリールスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいアミノ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R^{11} 、及び R^{12} は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、置換基を有してもよい低級シクロアルキル低級アルキル基、アリール基、置換基を有してもよいアリール低級アルキル基、若しくは低級シクロアルキル基を示すか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともに置換基を有してもよい含窒素飽和複素環を形成してもよく、

R^{13} は、水素原子、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ低級アルコキシ基、低級アルキルスルフィニル低級アルコキシ基、低級アルキルスルホニル低級アルコキシ基、置換基を有してもよいアリール低級アルコキシ基、水酸基、低級アルキルアミノ基、低級ジアルキルアミノ基、低級アルキルチオ低級アルキルアミノ基、低級アルキルスルフィニル低級アルキルアミノ基、低級アルキルスルホニル低級アルキルアミノ基、アリールアミノ基、環構成原子にヘテロ原子を有してもよい環状アミノ基、低級アルコキシ低級アルコキシ基、低級アルコキシ低級アルキルアミノ基、ヒドロキシ低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキルアミノ基、アシルアミノ基、低級アルキルスルホニルアミノ基、低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、ヒドロキシカルボニル低級アルコキシ基、アミノ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ低級アルコキシ基、又は低級ジアルキルアミノ低級アルコキシ基を示し、

さらに一般式 (I) は個々の鏡像異性体、及びその混合物の両方を示す。))

で表される化合物、若しくはその塩、又はそれらの溶媒和物を有効成分とする医薬。

【請求項 2】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1 - C_6$

$_6$ アルコキシ基、又はシアノ基であり、

R^6 が、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、又は C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基であり、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、又は C_1-C_6 アルコキシ基であり、

R^{11} 、及び R^{12} が、それぞれ同一又は異なって、 C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基（当該 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基は、そのシクロアルキル基上に置換基としてヒドロキシカルボニル C_1-C_6 アルキル基若しくは C_2-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキル基を有してもよい）、若しくはアリール環上に置換基として C_1-C_6 アルコキシ基を有してもよい C_6-C_{10} アリール C_1-C_6 アルキル基を示すか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともに置換基として C_1-C_6 アルキル基を有してもよい 5～8 員の含窒素飽和複素環（当該複素環は、 R^{11} と R^{12} が隣接する窒素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる 1 種以上のヘテロ原子を 1～2 個有してもよい）を形成するものであり、

R^{13} が、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、水酸基、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、ヒドロキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_6-C_{10} アリール C_1-C_6 アルコキシ基（当該 C_6-C_{10} アリール C_1-C_6 アルコキシ基は、そのアリール環上に置換基としてハロゲン原子、ハロ C_1-C_6 アルキル基、若しくはシアノ基を有してもよい）、モルホリニル基、又はピペリジニル基、

である請求項 1 記載の医薬。

【請求項 3】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロ C_1-C_6 アルキル基、又はシアノ基であり、

R^6 が、 C_1-C_6 アルキル基であり、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、又は C_1-C_6 アルコキシ基であり、

R^{11} 、及び R^{12} が、それぞれ同一又は異なって、 C_1-C_6 アルキル基、若しくは C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基（当該 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基は、そのシクロアルキル基上に置換基としてヒドロキシカルボニル C_1-C_6 アルキル基若しくは C_2-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキル基を 1 個有してもよい）であるか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともにモルホリノ基、若しくはピペリジノ基（当該モルホリノ基、若しくはピペリジノ基は、置換基として C_1-C_6 アルキル基を 1～2 個有してもよい）を形成するものであり、

R^{13} が、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、水酸基、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、又はヒドロキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、

である請求項 1 記載の医薬。

【請求項 4】

一般式 (I) で表される化合物が、

$N-\{1-[3, 5\text{-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$

$N-\{1-[3, 5\text{-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルフィニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$

$N-\{1-[3, 5\text{-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}]エチル\}-N-(\{2-[($

[illegible]

N- { 1 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - N - { [2 - (ピペリジノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5 - [2 - (メチルスル

ホニル) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (モ
 ルホリノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5- [2- (メチルチオ
) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (モ
 ルホリノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5- [2- (メチルスル
 ホニル) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (4
 -メチルピペリジノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5- [2- (メ
 チルチオ) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (4
 -メチルピペリジノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5- [2- (メ
 チルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (cis-2,
 6-ジメチルモルホリノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } -
 5- [2- (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- { [2- (cis-2,
 6-ジメチルモルホリノ) - 5- (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } -
 5- [2- (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 trans- { 4- [({ 2- [({ 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
 エチル } { 5- [2- (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2-イル } アミノ) メチル
] - 4- (トリフルオロメチル) フェニル } (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル
 } 酢酸エチル、
 trans- { 4- [({ 2- [({ 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
 エチル } { 5- [2- (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2-イル } アミノ) メチル
] - 4- (トリフルオロメチル) フェニル } (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル
 } 酢酸、
 trans- { 4- [({ 2- [({ 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
 エチル } { 5- [2- (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2-イル } アミノ)
 メチル] - 4- (トリフルオロメチル) フェニル } (エチル) アミノ) メチル] シクロヘ
 キシル } 酢酸エチル、
 trans- { 4- [({ 2- [({ 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
 エチル } [5- (ヒドロキシ) ピリミジン-2-イル] アミノ) メチル] - 4- (トリフ
 ルオロメチル) フェニル } (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル } 酢酸、
 trans- { 4- [({ 2- [({ 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
 エチル } { 5- [2- (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2-イル } アミノ)
 メチル] - 4- (トリフルオロメチル) フェニル } (エチル) アミノ) メチル] シクロヘ
 キシル } 酢酸、
 N- ({ 2- [ビス (シクロプロピルメチル) アミノ] - 3, 5-ジフルオロフェニル }
 メチル) -N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 5-
 [2- (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- ({ 2- [ビス (シクロプロピルメチル) アミノ] - 3, 5-ジフルオロフェニル }
 メチル) -N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 5-
 [2- (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- ({ 2- [(シ
 クロペンチルメチル) (エチル) アミノ] - 5- (トリフルオロメチル) フェニル } メ
 チル) - 5-メトキシピリミジン-2-アミン、
 N- { 1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } -N- ({ 2- [(シ
 クロペンチルメチル) (エチル) アミノ] - 5- (トリフルオロメチル) フェニル } メ
 チル) - 5-ヒドロキシピリミジン-2-アミン、

4- (2- { [{1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} ({2- [(シクロペンチルメチル) (エチル) アミノ] -5- (トリフルオロメチル) フェニル} メチル)] アミノ} ピリミジン-5-イル) 酪酸エチル、又は
 4- (2- { [{1- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} ({2- [(シクロペンチルメチル) (エチル) アミノ] -5- (トリフルオロメチル) フェニル} メチル)] アミノ} ピリミジン-5-イル) 酪酸、
 である請求項1記載の医薬。

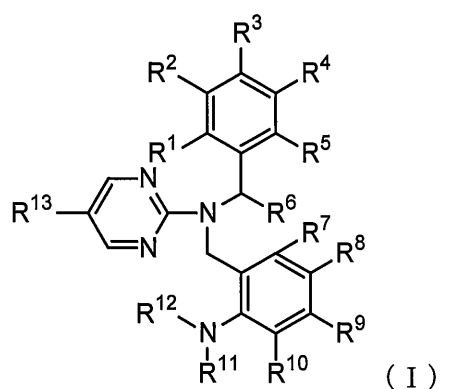
【請求項5】

脂質異常症、動脈硬化症、アテローム性動脈硬化症、末梢血管疾患、高LDL血症、低HDL血症、高コレステロール血症、高トリグリセリド血症、家族性高コレステロール血症、心臓血管障害、狭心症、虚血、心虚血、血栓症、心筋梗塞、再灌流障害、血管形成性再狭窄、又は高血圧の疾患の治療又は予防剤である請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬。

【請求項6】

下記的一般式 (I)

【化2】



(式中、

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ハロ低級アルキルスルホニルアミノ基、アリールスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいアミノ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R^6 は、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級シクロアルキル基、又は低級シクロアルキル低級アルキル基を示し、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級シクロアルキル基、低級シクロアルキル低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルコキシ低級アルコキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ハロ低級アルキルスルホニルアミノ基、アリールスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいアミノ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、又は低級アルコキシカルボニル基を示し、

R^{11} 、及び R^{12} は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、置換基を有してもよい低級シクロアルキル低級アルキル基、アリール基、置換基を有してもよいアリール低級アルキル基、若しくは低級シクロアルキル基を示すか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともに置換基を有してもよい含窒素飽和複素環を形成してもよく、

R^{13} は、水素原子、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ低級アルコキシ基、低級アルキルスルフィニル低級アルコキシ基、低級アルキルスルホニル低級アルコキシ

シ基、置換基を有してもよいアリール低級アルコキシ基、水酸基、低級アルキルアミノ基、低級ジアルキルアミノ基、低級アルキルチオ低級アルキルアミノ基、低級アルキルスルフィニル低級アルキルアミノ基、低級アルキルスルホニル低級アルキルアミノ基、アリールアミノ基、環構成原子にヘテロ原子を有してもよい環状アミノ基、低級アルコキシ低級アルコキシ基、低級アルコキシ低級アルキルアミノ基、ヒドロキシ低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキルアミノ基、アシルアミノ基、低級アルキルスルホニルアミノ基、低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、ヒドロキシカルボニル低級アルコキシ基、アミノ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ低級アルコキシ基、又は低級ジアルキルアミノ低級アルコキシ基を示し、

さらに一般式 (I) は個々の鏡像異性体、及びその混合物の両方を示す。))

で表される化合物、若しくはその塩、又はそれらの溶媒和物、及び製薬上許容される担体からなる医薬組成物。

【請求項 7】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1 - C_6$ アルコキシ基、又はシアノ基であり、

R^6 が、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル基、又は $C_3 - C_8$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル基であり、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、又は $C_1 - C_6$ アルコキシ基であり、

R^{11} 、及び R^{12} が、それぞれ同一又は異なって、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル基 (当該 $C_3 - C_8$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル基は、そのシクロアルキル基上に置換基としてヒドロキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルキル基若しくは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルキル基を有してもよい)、若しくはアリール環上に置換基として $C_1 - C_6$ アルコキシ基を有してもよい $C_6 - C_{10}$ アリール $C_1 - C_6$ アルキル基を示すか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともに置換基として $C_1 - C_6$ アルキル基を有してもよい5～8員の含窒素飽和複素環 (当該複素環は、 R^{11} と R^{12} が隣接する窒素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる1種以上のヘテロ原子を1～2個有していてもよい) を形成するものであり、

R^{13} が、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル $C_1 - C_6$ アルコキシ基、水酸基、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ヒドロキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_6 - C_{10}$ アリール $C_1 - C_6$ アルコキシ基 (当該 $C_6 - C_{10}$ アリール $C_1 - C_6$ アルコキシ基は、そのアリール環上に置換基としてハロゲン原子、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、若しくはシアノ基を有してもよい)、モルホリニル基、又はピペリジニル基、

である請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、及び R^5 が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、又はシアノ基であり、

R^6 が、 $C_1 - C_6$ アルキル基であり、

R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロ $C_1 - C_6$ アルキル基、又は $C_1 - C_6$ アルコキシ基であり、

R^{11} 、及び R^{12} が、それぞれ同一又は異なって、 $C_1 - C_6$ アルキル基、若しくは $C_3 - C_8$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル基 (当該 $C_3 - C_8$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル基は、そのシクロアルキル基上に置換基としてヒドロキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルキル基若しくは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 - C_6$ アルキル基を1個有してもよい) であるか、又は R^{11} 、及び R^{12} が一緒になって隣接する窒素原子とともにモルホリノ基、若しくはピペリジノ基 (当該モルホリノ基、若しくはピペリジノ基は、置換基としてC

$1-C_6$ アルキル基を 1～2 個有してもよい）を形成するものであり、
 R^{13} が、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、水酸基、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、又はヒドロキシカルボニル C_1-C_6 アルコキシ基、
 である請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

一般式 (I) で表される化合物が、
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルフィニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-メトキシフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-メトキシフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-3, 5-ジフルオロフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-3, 5-ジフルオロフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-メチルフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-5-メチルフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-4-フルオロフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-4-フルオロフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-4-メトキシフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-4-メトキシフェニル\}メチル)-5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$
 $N-\{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル\}-N-(\{2-[(シクロペンチルメチル)(エチル)アミノ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル\}メチル)-5-[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、$

[illegible]

ル} アミノ] エチル} - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾニトリル、
 3 - { 1 - [({ 2 - [(シクロペンチルメチル) (エチル) アミノ] - 5 - トリフルオ
 ロメチルフェニル} メチル) { 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-
 2 - イル} アミノ] エチル} - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾニトリル、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] プロピル} - N - ({ 2 - [(シクロペンチルメチル) (エチル) アミノ] - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル} メチル) - 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] プロピル} - N - ({ 2 - [(シクロペンチルメチル) (エチル) アミノ] - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル} メチル) - 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (ピペリジノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (ピペリジノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (モルホリノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (モルホリノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (4 - メチルピペリジノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (4 - メチルピペリジノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (cis - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 N - { 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - N - { [2 - (cis - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル} - 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - アミン、
 trans - { 4 - [({ 2 - [({ 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} { 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - イル} アミノ) メチル] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル} (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル} 酢酸エチル、
 trans - { 4 - [({ 2 - [({ 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} { 5 - [2 - (メチルチオ) エトキシ] ピリミジン-2 - イル} アミノ) メチル] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル} (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル} 酢酸、
 trans - { 4 - [({ 2 - [({ 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} { 5 - [2 - (メチルスルホニル) エトキシ] ピリミジン-2 - イル} アミノ) メチル] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル} (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル} 酢酸エチル、
 trans - { 4 - [({ 2 - [({ 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} [5 - (ヒドロキシ) ピリミジン-2 - イル] アミノ) メチル] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル} (エチル) アミノ) メチル] シクロヘキシル} 酢酸、
 trans - { 4 - [({ 2 - [({ 1 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル]

エチル} {5-[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-イル}アミノ)
メチル]-4-(トリフルオロメチル)フェニル} (エチル)アミノ)メチル]シクロヘ
キシル} 酢酸、
N-({2-[ビス(シクロプロピルメチル)アミノ]-3, 5-ジフルオロフェニル}
メチル)-N-{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-5-
[2-(メチルチオ)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、
N-({2-[ビス(シクロプロピルメチル)アミノ]-3, 5-ジフルオロフェニル}
メチル)-N-{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-5-
[2-(メチルスルホニル)エトキシ]ピリミジン-2-アミン、
N-{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-N-({2-[(
シクロペンチルメチル) (エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル}メ
チル)-5-メトキシピリミジン-2-アミン、
N-{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-N-({2-[(
シクロペンチルメチル) (エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニル}メ
チル)-5-ヒドロキシピリミジン-2-アミン、
4-(2-{ [{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル} ({2
- [(シクロペンチルメチル) (エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニ
ル}メチル)] アミノ}ピリミジン-5-イル) 酪酸エチル、又は
4-(2-{ [{1-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル} ({2
- [(シクロペンチルメチル) (エチル)アミノ]-5-(トリフルオロメチル)フェニ
ル}メチル)] アミノ}ピリミジン-5-イル) 酪酸、
である請求項6記載の医薬組成物。

【請求項10】

脂質異常症、動脈硬化症、アテローム性動脈硬化症、末梢血管疾患、高LDL血症、低HDL血
症、高コレステロール血症、高トリグリセリド血症、家族性高コレステロール血症、心臓
血管障害、狭心症、虚血、心虚血、血栓症、心筋梗塞、再灌流障害、血管形成性再狭窄、
又は高血圧の疾患の治療又は予防に用いられるものである、請求項6～9のいずれか1項
に記載の医薬組成物。