

【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29年4月20日(2017.4.20)

【公表番号】特表2016-511274(P2016-511274A)

【公表日】平成28年4月14日(2016.4.14)

【年通号数】公開・登録公報2016-023

【出願番号】特願2015-561865(P2015-561865)

【国際特許分類】

C 0 7 K	5/083	(2006.01)
C 1 2 N	9/99	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	5/083	Z N A
C 1 2 N	9/99	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 3

【手続補正書】

【提出日】平成29年3月13日(2017.3.13)

【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

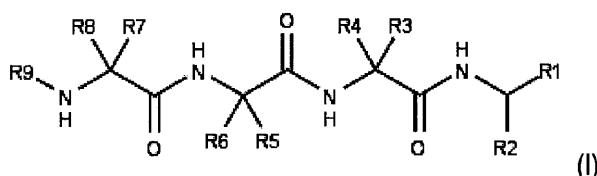
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



式中、

R1は-CH(OH)Raまたは-B(ORb)(ORc)であり；

R2は、-H、-CH<sub>2</sub>Rd、-CHRd(Re)、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)Rj、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)N(Rd)Reまたは-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>n</sub>N(Rd)Reであり；

R3、R4、R5、R6、R7及びR8は同一であるかまたは異なり、独立して、水素、または1以上のC1-6アルキル、C3-8シクロアルキル、C1-6ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-CN、-C(O)N(Rf)Rg、-C(O)ORf、-

$C(R_f)(R_g)OR_h$ 、 $-OR_f$ 、 $-OC(O)OR_f$ 、 $-OC(O)NR_f(R_g)$ 、 $-SR_f$ 、 $-S(O)_nR_f$ 、 $-S(O)_nN(R_f)R_g$ 、 $-S(O)_nN(R_f)C(O)R_g$ 、 $-N(R_f)R_g$ 、 $-N(R_f)C(O)R_g$ 、 $-N(R_f)C(O)OR_g$ 、 $-N(R_f)C(O)N(R_g)(R_h)$ 、 $-N(R_f)S(O)_nR_g$ 、及び $-N(R_f)S(O)N(R_g)R_h$ 置換基で置換されていてもよい、以下の置換基： $C_1 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル、 $C_1 - 6$ チオアルキル、 $C_1 - 6$ アミノアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、及びヘテロアリール基の1つであり；

( $R_3$ 及び $R_4$ )または( $R_5$ 及び $R_6$ )または( $R_7$ 及び $R_8$ )が水素でない場合、括弧の対は、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)N(H)-$ 、 $-C(O)N(R_x)-$ 、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(R_x)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)_n-$ 、 $-S(O)_nN(H)-$ 、 $-S(O)_nN(R_x)-$ ラジカルと結合して環状構造を形成することもでき；

$R_9$ は、 $R_iC(O)-$ 、 $R_iS(O)_n-$ 、 $R_iOC(O)-$ 、 $R_iNHC(O)-$ 、 $R_iNHS(O)_n-$ 、 $R_k(R_1)NC(O)-$ 、 $R_1(R_1)NS(O)_n-$ ； $R_mOR_iC(O)-$ 、 $R_mC(O)R_iC(O)-$ 、または1以上のアミノ酸残基であり；

$R_a$ は、 $C_1 - 3$ アルキル、 $C_1 - 2$ フルオロアルキルまたはシクロプロピルであり；

$R_b$ 及び $R_c$ は、同一であるかまたは異なり、独立して、Hまたは $C_1 - 6$ アルキルであり、または共に結合して環状の5若しくは6員環構造を形成し、または追加の脂肪族若しくは芳香族環系と融合し、環状の5若しくは6員環構造または脂肪族若しくは芳香族環系は、1以上の $C_1 - 6$ アルキル及び/または $C_1 - 6$ ハロアルキル置換基で置換されていてもよく；

$R_d$ 及び $R_e$ は、同一であるかまたは異なり、独立してHまたは以下の置換基： $C_1 - 3$ アルキル、 $C_1 - 3$ ハロアルキル、若しくは $C_3 - 4$ シクロアルキル基であり、または共に直接 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R_x)-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R_x)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)_n-$ 、若しくは $-S(O)_nN(R_x)-$ ラジカルと結合して環状の3~8員環構造を形成し；

$R_f$ 、 $R_g$ 、 $R_h$ 、 $R_k$ 及び $R_1$ は、同一であるかまたは異なり、独立してHまたは以下の置換基： $C_1 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル若しくは $C_3 - 4$ シクロアルキル基の1つであり、または一緒に直接 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R_x)-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R_x)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)_n-$ 、または $-S(O)_nN(R_x)-$ ラジカルと結合して環状の3~8員環構造を形成し；

$R_i$ は、 $C_1 - 10$ アルキル、 $C_1 - 10$ ヘテロアルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 10$ ハロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $C_1 - 10$ アルキル- $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 10$ アルキル-ヘテロシクリル、 $C_1 - 10$ アルキル-アリール、 $C_1 - 10$ アルキル-ヘテロアリール、 $C_1 - 10$ ヘテロアルキル- $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 10$ ヘテロアルキル-ヘテロシクリル、 $C_1 - 10$ ヘテロアルキル-アリール、または $C_1 - 10$ ヘテロアルキル-ヘテロアリール基であり（置換基は、1以上のハロゲン、 $C_1 - 6$ アミノアルキル、 $C_1 - 6$ ヘテロアルキル、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル基で置換されていてもよい）；

$R_m$ は、 $C_1 - 10$ アルキル、 $C_1 - 10$ ヘテロアルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 10$ ハロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリール基であり（置換基は、1以上のハロゲン、 $C_1 - 6$ アミノアルキル、 $C_1 - 6$ ヘテロアルキル、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル基で置換されていてもよい）；

$R_j$ は、 $OR_d$ または $N(R_d)(R_e)$ であり；

$R_x$ は、H、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル、 $C_3 - 4$ シクロアルキル、 $-C(O)R_y$ 、 $-C(O)OR_y$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(R_y)$ または $-C(O)NHS(O)_nR_y$ であり；

$R_y$  は、C 1 - 6 アルキル、C 1 - 6 ハロアルキル、または C 3 - 4 シクロアルキルであり；

m は、数値 0 または 1 の整数であり；

n は、数値 1 または 2 の整数であり、

ただし、

1)  $R_1$  が  $-CH(OH)R_a$  である場合、 $R_2$  は、 $CHR_d(R_e)$ 、 $-CH_2(CH_2)_mC(O)N(R_d)R_e$  または  $-CH_2(CH_2)_mS(O)_nN(R_d)R_e$  であり、

2)  $R_1$  が  $-B(OR_b)(OR_c)$  である場合、 $R_2$  は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CHR_d(R_e)$ 、 $-CH_2(CH_2)_mC(O)R_j$ 、 $-CH_2(CH_2)_mC(O)N(R_d)R_e$  または  $-CH_2(CH_2)_mS(O)_nN(R_d)R_e$  である)の化合物、またはその薬剤として許容される塩、水和物、溶媒和物、若しくはラセミ混合物、または立体異性体。

### 【請求項 2】

#### (A)

a.  $R_1$  が、 $-B(OR_b)(OR_c)$  または  $-CH(OH)R_a$  であり；

b.  $R_2$  が、 $H$  または  $-CH_2(CH_2)_mC(O)R_j$  であり；

c.  $R_3$  が、 $H$ 、または置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキルであり；

d.  $R_4$  が、 $H$ 、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、置換されているか若しくは置換されていないアリール、または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

e.  $R_5$  が  $H$  であり；

f.  $R_6$  が、 $H$ 、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、置換されているか若しくは置換されていないアリール、または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

g.  $R_7$  が  $H$  であり；

h.  $R_8$  が、 $H$ 、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、置換されているか若しくは置換されていないアリール、または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；及び / または

i.  $R_9$  が、 $R_iOC(O)-$ 、 $R_iC(O)-$ 、 $R_mOR_iC(O)-$ 、 $R_mC(O)R_iC(O)-$ 、または  $R_iS(O)_n-$  である；或いは、

#### (B)

a.  $R_1$  が、 $-B(OR_b)(OR_c)$  または  $-CH(OH)R_a$  であり；

b.  $R_2$  が、 $H$  または  $-CH_2(CH_2)_mC(O)R_j$  であり；

c.  $R_3$  が、 $H$  または置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキルであり；

d.  $R_4$  が、 $H$ 、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、置換されているか若しくは置換されていないアリール、または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

e.  $R_5$  が  $H$  であり；

f.  $R_6$  が、 $H$ 、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、置換されているか若しくは置換されていないアリール、または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

g.  $R_7$  が  $H$  であり；

h . R 8 が、 H、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、 置換されているか若しくは置換されていないアリール、 または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

i . R 9 が、 R<sub>i</sub>O C(O) - 、 R<sub>i</sub>C(O) - 、 R<sub>m</sub>O R<sub>i</sub>C(O) - 、 R<sub>m</sub>C(O) R<sub>i</sub>C(O) - 、 または R<sub>i</sub>S(O)<sub>n</sub> - である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

a . R 1 が、 - B(O R<sub>b</sub>)(O R<sub>c</sub>) または - CH(OH)R<sub>a</sub> であり；

b . R 2 が、 H または - CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)R<sub>j</sub> であり；

c . R 3 が、 H、 または置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキルであり；

d . R 4 が、 H、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、 置換されているか若しくは置換されていないアリール、 または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

e . R 6 が、 H、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、 置換されているか若しくは置換されていないアリール、 または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり；

f . R 8 が、 H、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 アルキル、 置換されているか若しくは置換されていない C 1 - 6 チオアルキル、 置換されているか若しくは置換されていないアリール、 または置換されているか若しくは置換されていないシクロアルキルであり； 及び / または

g . R 9 が、 R<sub>i</sub>O C(O) - 、 R<sub>i</sub>C(O) - 、 R<sub>m</sub>O R<sub>i</sub>C(O) - 、 R<sub>m</sub>C(O) R<sub>i</sub>C(O) - 、 または R<sub>i</sub>S(O)<sub>n</sub> - である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

a . R 1 が、

i . - B(O R<sub>b</sub>)(O R<sub>c</sub>) であり、 R<sub>b</sub> 及び R<sub>c</sub> が H であり、 または R<sub>b</sub> 及び R<sub>c</sub> が結合して環状の 5 員環構造を形成し、 または脂肪族環系と融合し、 好ましくは R 1 が 2 , 9 , 9 - トリメチル - 3 , 5 - ジオキサ - 4 - ボラトリシクロ [ 6 . 1 . 1 . 0<sup>2</sup> . 6 ] デカン - 4 - イルであり； 或いは

i i . - CH(OH)R<sub>a</sub> であり、 R<sub>a</sub> が C 1 - 2 フルオロアルキル、 好ましくは - CF<sub>3</sub>、 または - CH<sub>2</sub>F であり； または R<sub>a</sub> が C 1 - 3 アルキル、 好ましくは - CH<sub>3</sub> であり；

b . R 2 が、 - CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)R<sub>j</sub> であり、 R<sub>j</sub> が OR<sub>d</sub> であり、 R<sub>d</sub> が好ましくは CH<sub>3</sub> であり； または R<sub>j</sub> が NH<sub>2</sub> であり；

c . R 3 が、 置換されていない C 1 - 6 アルキル、 好ましくは CH<sub>3</sub> であり；

d . R 4 が、 置換されていない C 1 - 6 アルキル、 好ましくは - CH<sub>3</sub>、 CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub> - または - CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> であり； 置換されている C 1 - 6 アルキル、 好ましくはアリール置換された C 1 - 6 アルキル、 より好ましくはフェニル - CH<sub>2</sub> - 、 または - (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub> であり、 CH<sub>3</sub>S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - であり、 またはフェニルであり；

e . R 6 が、 置換されている C 1 - 6 アルキル、 好ましくはアリール置換された C 1 - 6 アルキル、 より好ましくは - アルキル - フェニルまたは - CH<sub>2</sub>- インドールであり； 置換されていない C 1 - 6 アルキル、 好ましくは - CH<sub>3</sub>、 または - CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> であり； CH<sub>3</sub>S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - であり； フェニルであり； またはベンゾシクロペンチルであり；

f . R 8 が、 置換されていない C 1 - 6 アルキル、 好ましくは - CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> または - CH<sub>3</sub> であり； 置換されている C 1 - 6 アルキル、 好ましくはアリール置換された C 1 - 6 アルキル、 より好ましくは - CH<sub>2</sub> - フェニルであり； CH<sub>3</sub>S(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - で

あり；置換されていないアリール、好ましくはフェニルであり；または置換されていないシクロアルキル、好ましくはシクロペンチルまたはシクロプロピルであり；及び／またはg. R 9 が、

i. R i O C (O) - であり、R<sub>i</sub>が、置換されているか若しくは置換されていないC<sub>1</sub>-10アルキル、好ましくはC<sub>H</sub><sub>3</sub>-またはフェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-であり；

i i . R i C (O) - であり、R<sub>i</sub>が、置換されているか若しくは置換されていないアリールであり；置換されているか若しくは置換されていないヘテロアリールであり；または置換されているか若しくは置換されていないC<sub>1</sub>-10アルキル、好ましくはアリール-C<sub>1</sub>-10アルキル-またはC<sub>H</sub><sub>3</sub>(C<sub>H</sub><sub>2</sub>)<sub>8</sub>-であり；

i i i . R<sub>m</sub>O R<sub>i</sub>C (O) - であり、R<sub>i</sub>が、置換されているか若しくは置換されていないC<sub>1</sub>-10アルキル、好ましくは-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-であり；

i v . R<sub>m</sub>C (O) R<sub>i</sub>C (O) - であり、R<sub>i</sub>がアリール、好ましくはフェニルであり；または

v . R<sub>i</sub>S (O)<sub>n</sub> - であり、R<sub>i</sub>が、置換されているか若しくは置換されていないアリール、好ましくは置換されているアリール、より好ましくは置換されているフェニルである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項5】

a . R 6 が、-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-フェニル、好ましくは-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-ヒドロキシフェニルであり；または-(C<sub>H</sub><sub>2</sub>)<sub>2</sub>-フェニルであり；

b . R 9 が、

i . R i C (O) - であり、R<sub>i</sub>がアリール-フェニル、好ましくはフェニル-フェニル-またはヘテロアリール-フェニル-であり；ヘテロシクリル-フェニル-、好ましくはモルホリン-フェニル-であり；アルキル-フェニル-、好ましくは(C<sub>H</sub><sub>3</sub>)<sub>2</sub>C<sub>H</sub>-フェニル-またはOHC<sub>H</sub><sub>2</sub>-フェニル-であり；フルオロフェニルであり；フェニルであり；アリール-ヘテロアリール-、好ましくはフェニル-ヘテロアリール-であり；ヘテロアリール-ヘテロアリール-、好ましくはピリジン-イソチアゾール-であり；ピリジンであり；ピラジンであり；インドールであり；またはフェニル-C<sub>1</sub>-10アルキル-、好ましくはフェニル-アルキン-、フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-またはフルオロアルキル-ジアジリン-フェニル-(C<sub>1</sub>-10アルキル)-であり；または

i i . R<sub>i</sub>S (O)<sub>n</sub> - であり、R<sub>i</sub>がフェニル-フェニルである、請求項4に記載の化合物。

#### 【請求項6】

R<sub>i</sub>がジアジリン-フェニル-、好ましくはトリフルオロメチル-ジアジリン-フェニル-であり；ピリジン-フェニル-であり；オキサジアゾール-フェニル-であり；フェニル-ピラゾール-であり；フェニル-メチルピラゾール-であり；フェニル-チアゾール-であり；フェニル-ピリジン-であり；フェニル-フラザン-であり；フルオロメトキシ-フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-、好ましくはトリフルオロメトキシ-フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-、より好ましくは4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-であり；またはトリフルオロメチル-ジアジリン-フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-、好ましくは4-[3-(トリフルオロメチル)-3H-ジアジリン-3-イル]フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-または3-[3-(トリフルオロメチル)-3H-ジアジリン-3-イル]フェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-である、請求項5に記載の化合物。

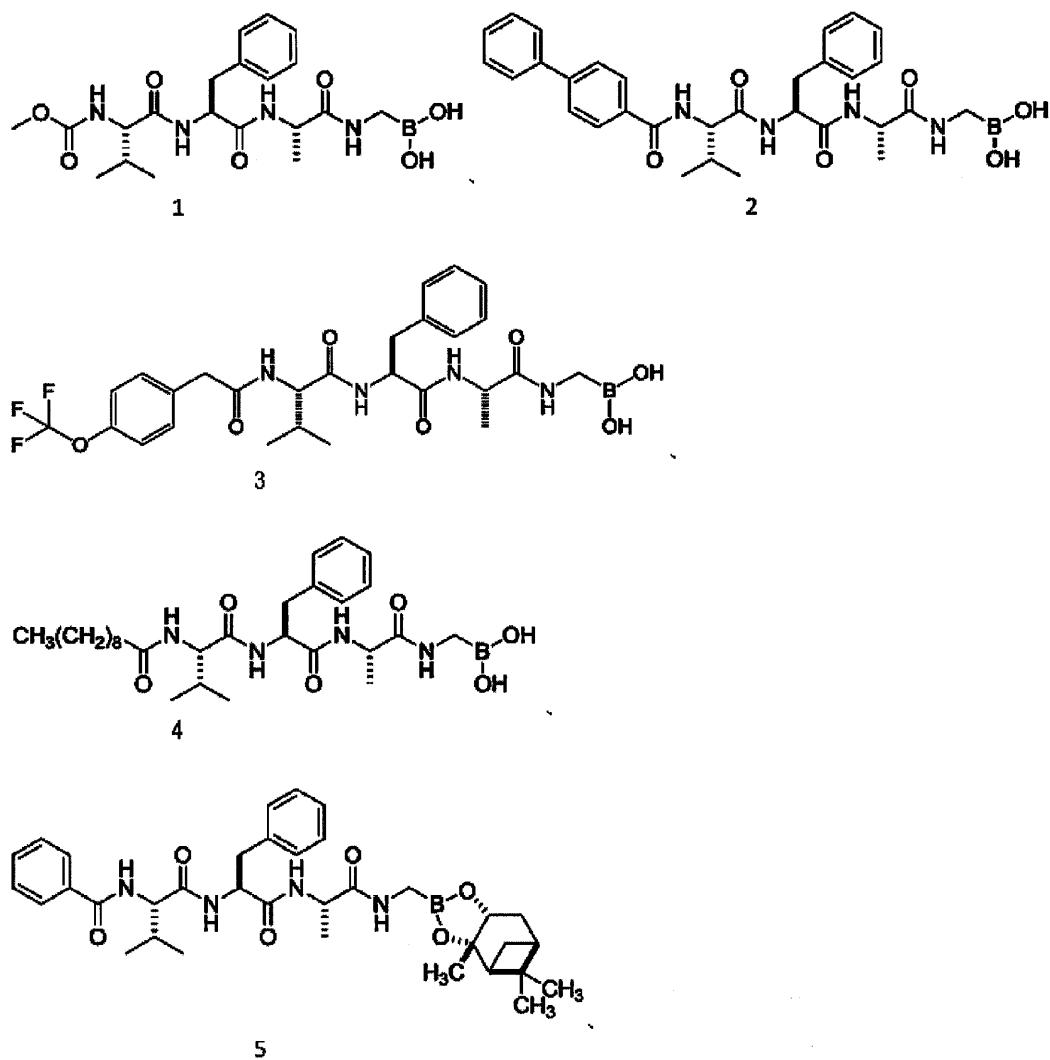
#### 【請求項7】

a . R 9 が R<sub>m</sub>O R<sub>i</sub>C (O) - であり、R<sub>m</sub>が、置換されているか若しくは置換されていないC<sub>1</sub>-10アルキル、好ましくは置換されている-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-、より好ましくはアリール-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-、さらにより好ましくはフェニル-C<sub>H</sub><sub>2</sub>-であり；または置換されているか若しくは置換されていないアリール、好ましくはフェニルであり；

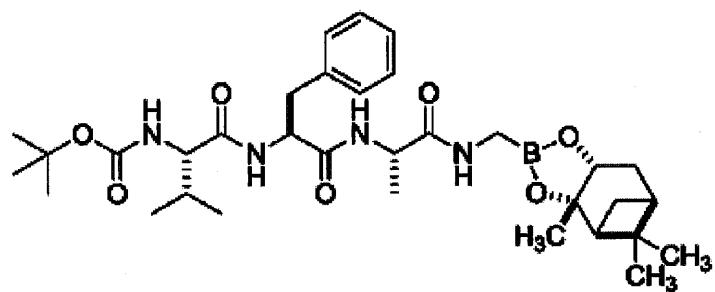
b . R 9 が R<sub>m</sub>C (O) R<sub>i</sub>C (O) - であり、R<sub>m</sub>がヘテロアリールまたはモルホリンである、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

#### 【請求項8】

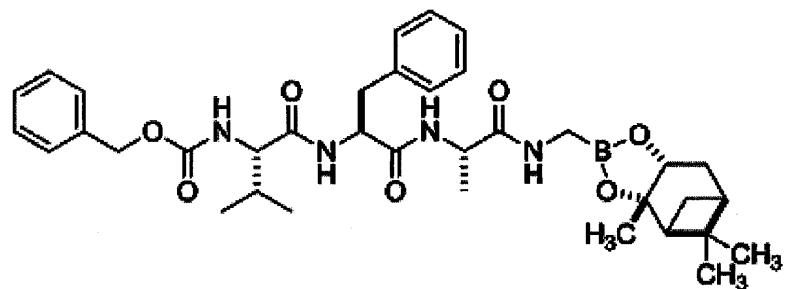
【化 2】



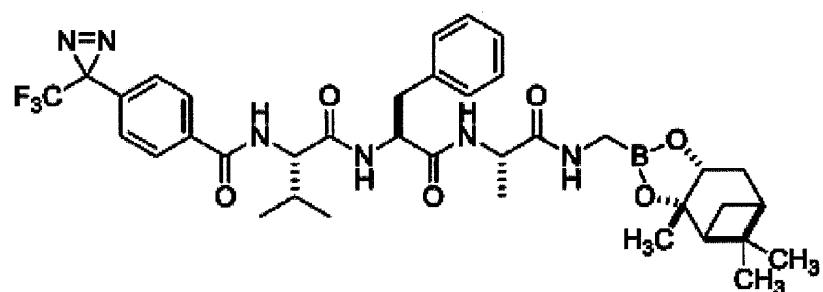
【化 3】



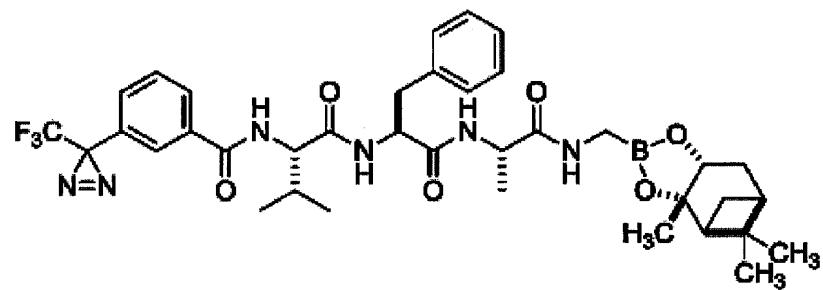
6



7

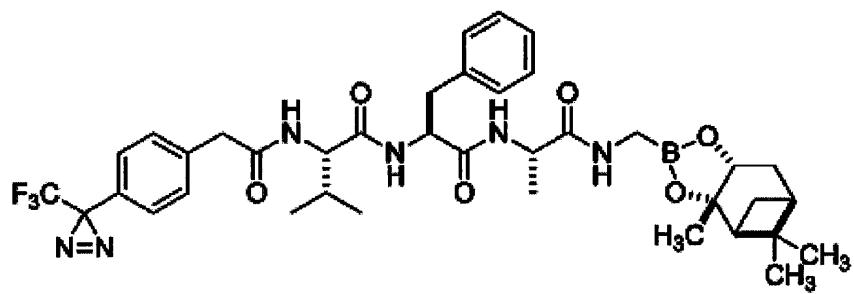


8a

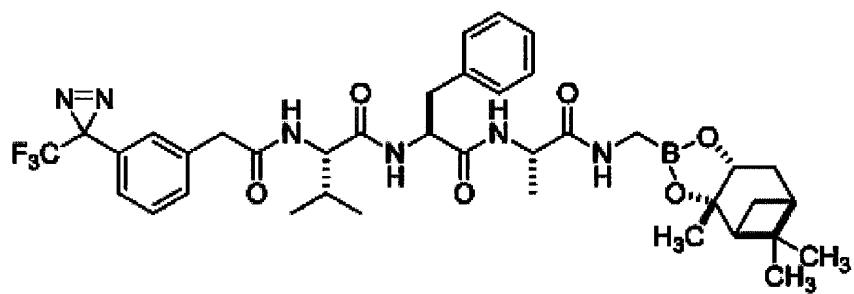


8b

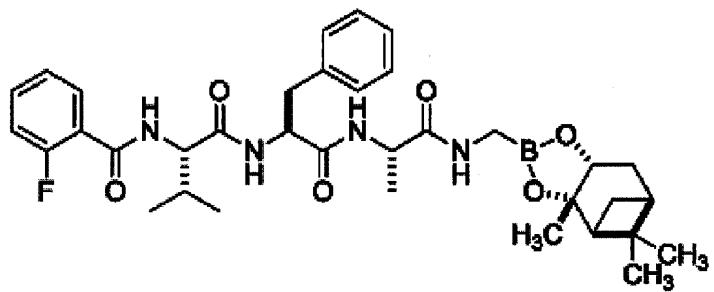
【化 4】



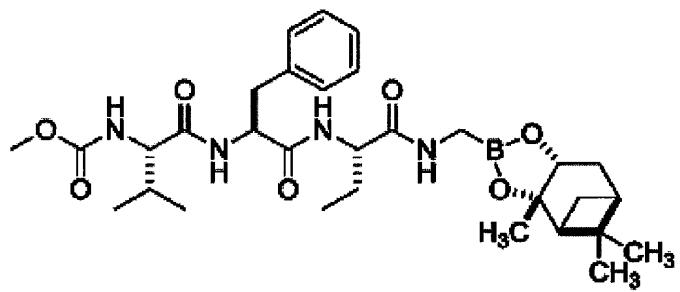
8c



8d

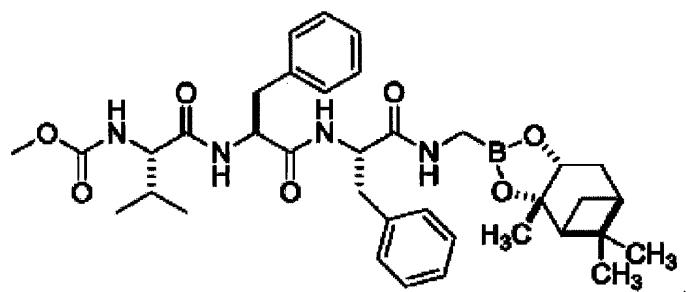


9

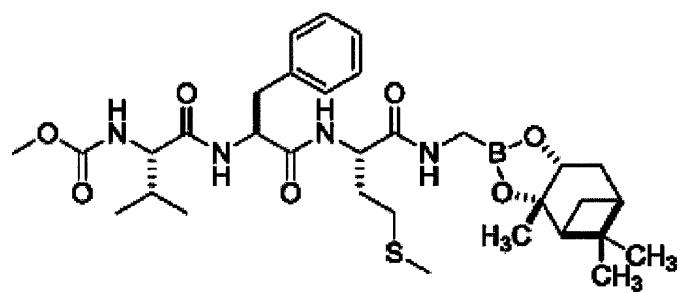


10

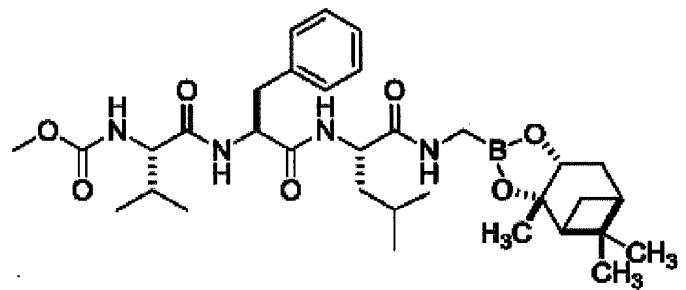
【化5】



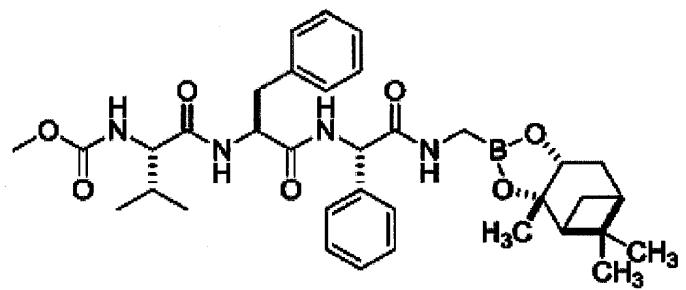
11



12

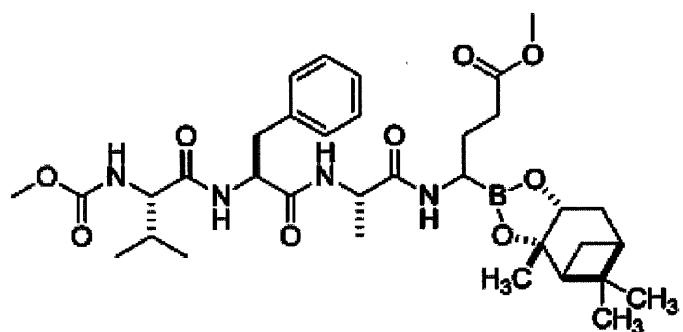


13

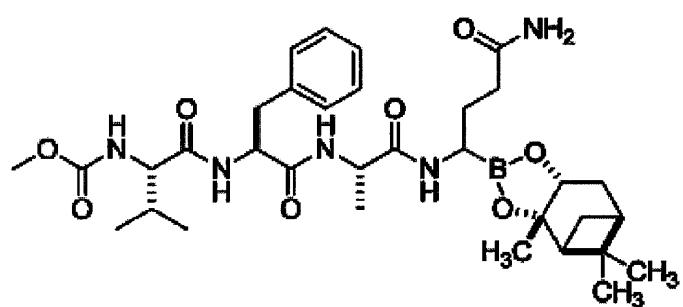


14

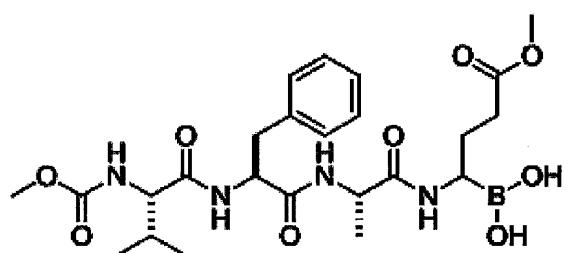
【化 6】



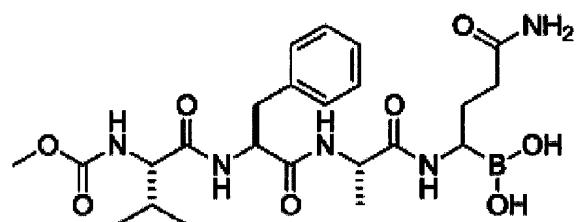
15



16

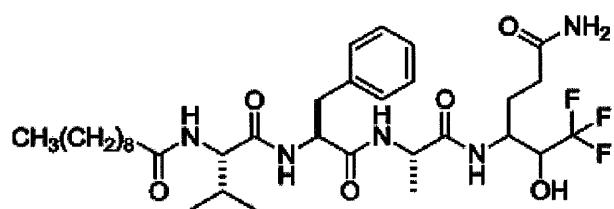


17

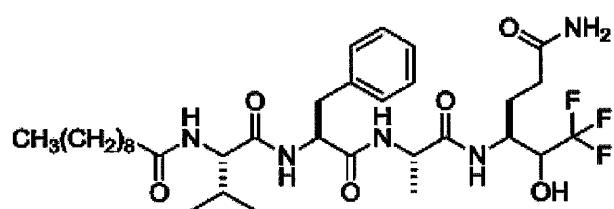


18

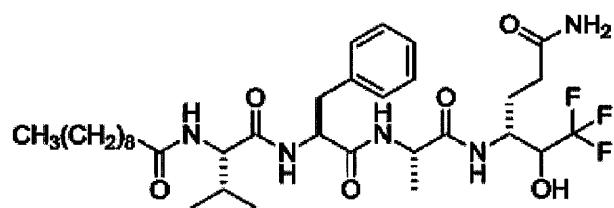
【化7】



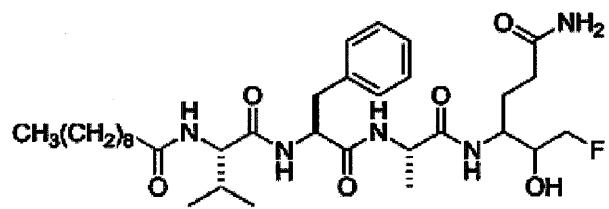
19



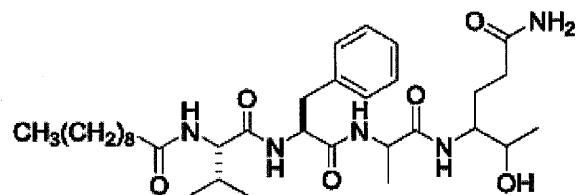
20a



20b

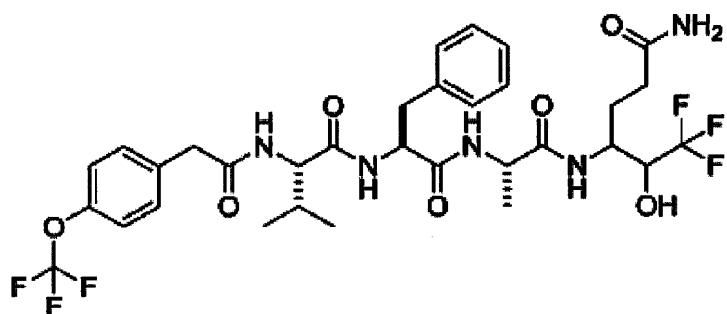


21a 及び 21b

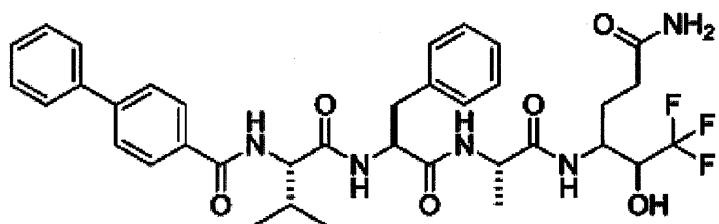


22a 及び 22b

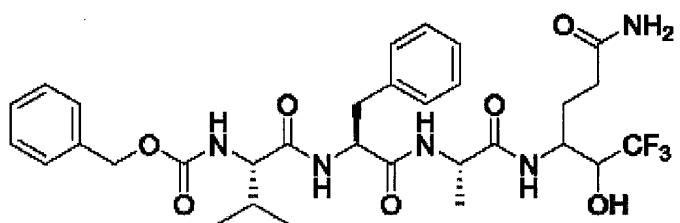
【化 8】



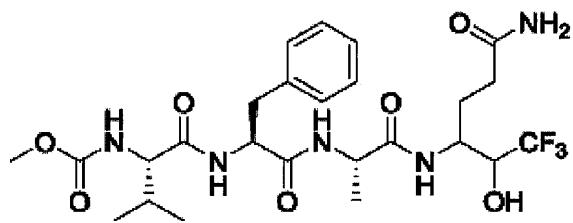
23



24

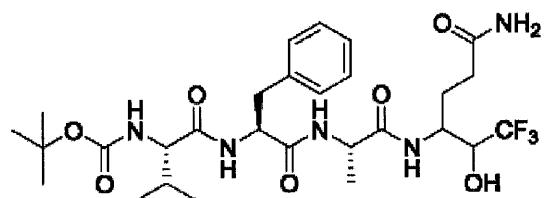


25

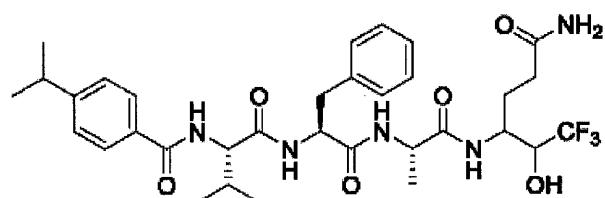


26

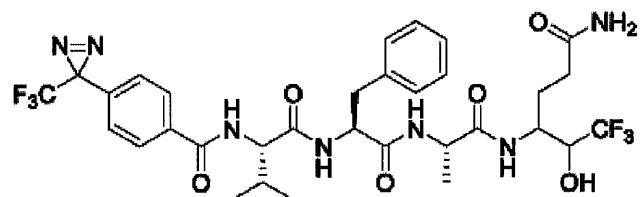
【化9】



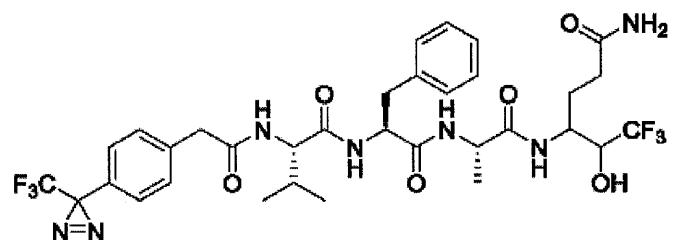
27



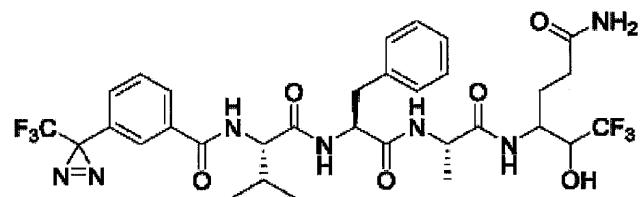
28



29

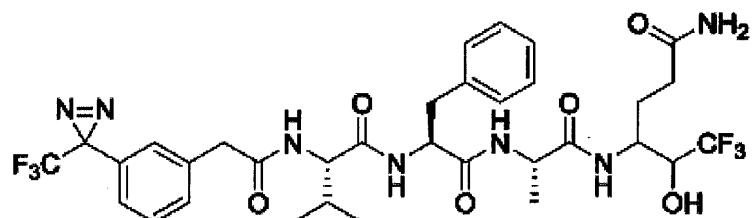


30

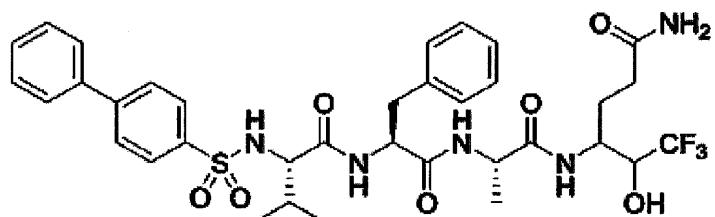


31

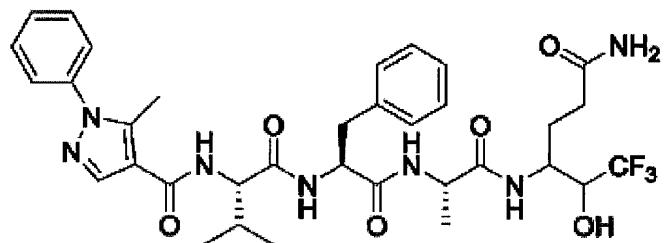
【化 1 0】



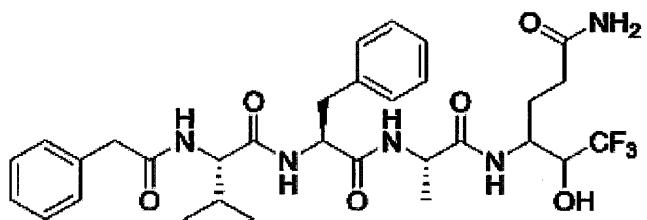
32



33

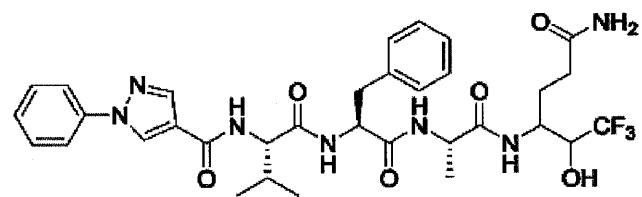
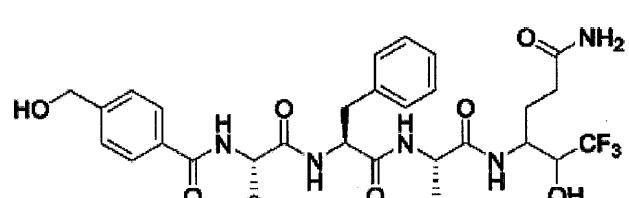
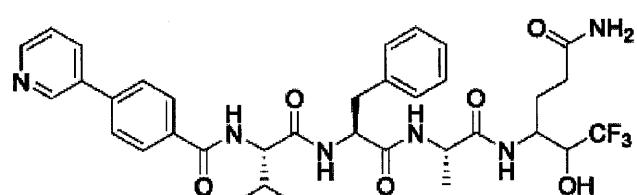
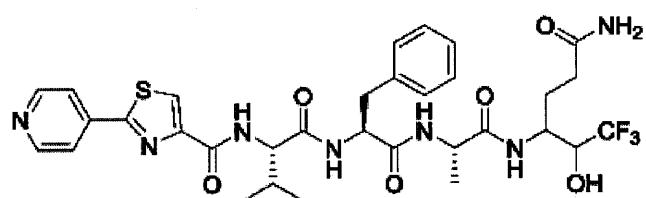
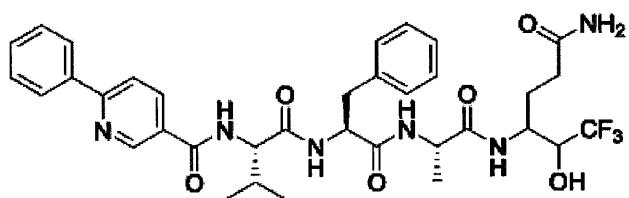


34

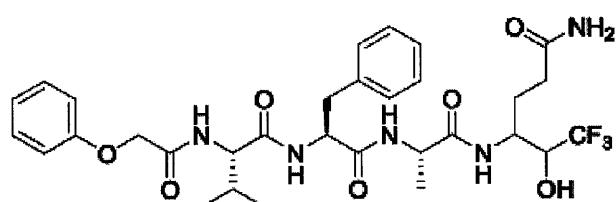
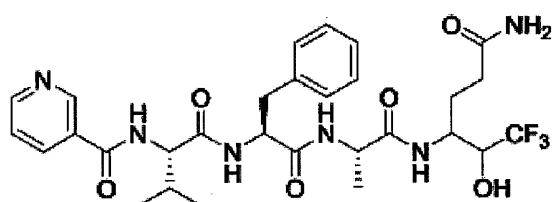
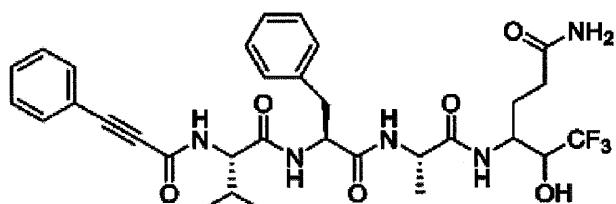
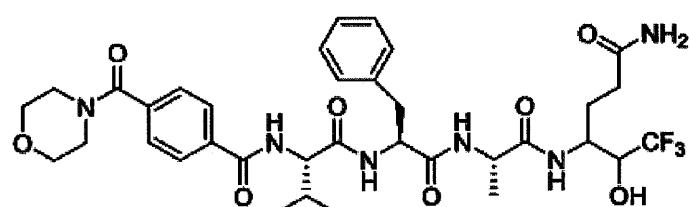
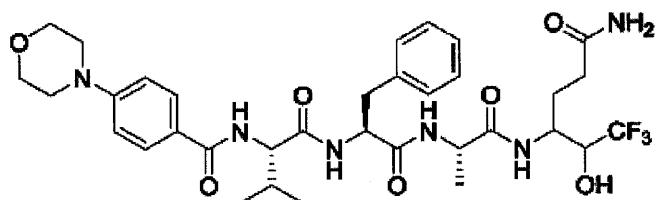


35

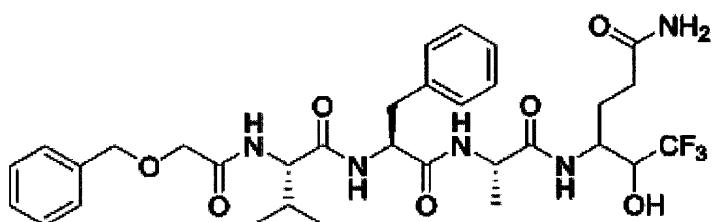
【化 11】



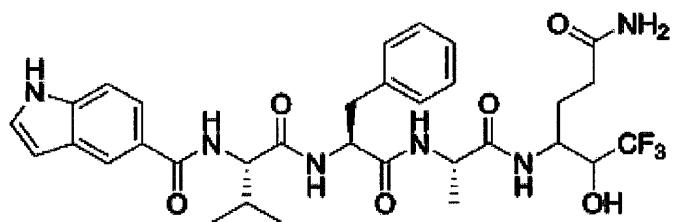
【化 1 2】



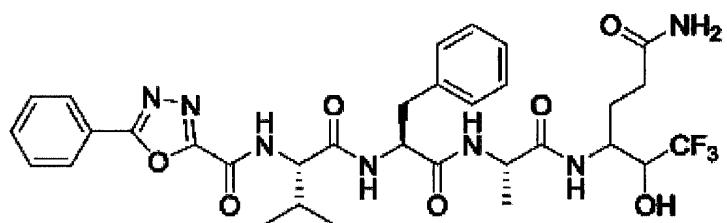
【化 1 3】



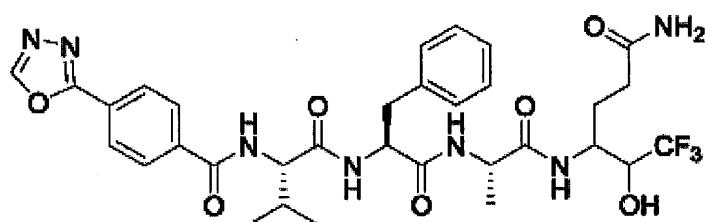
46



47

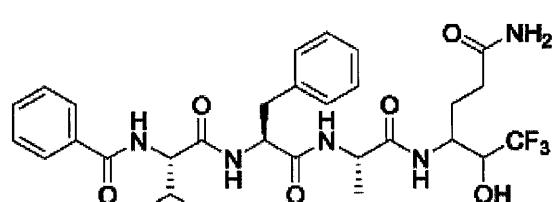
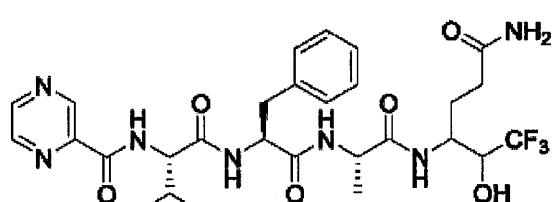
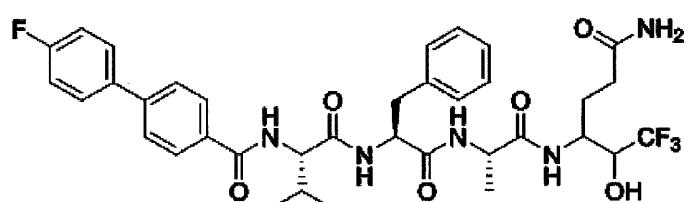
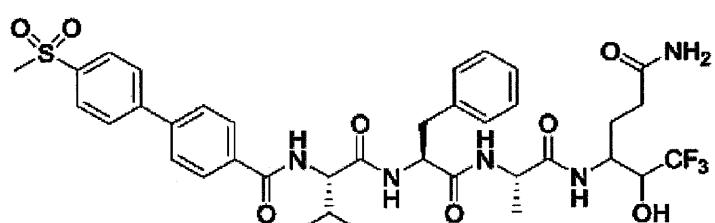
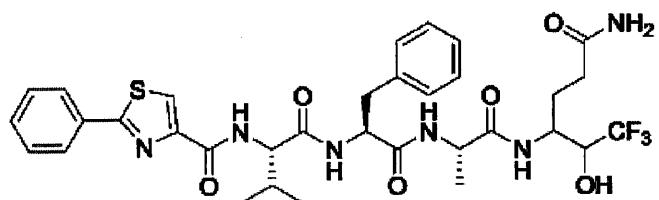


48

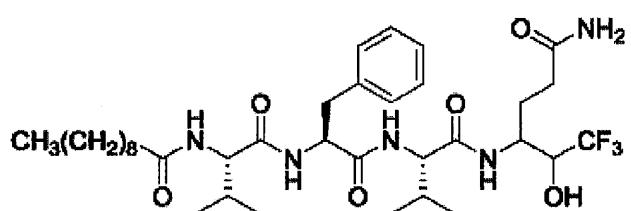
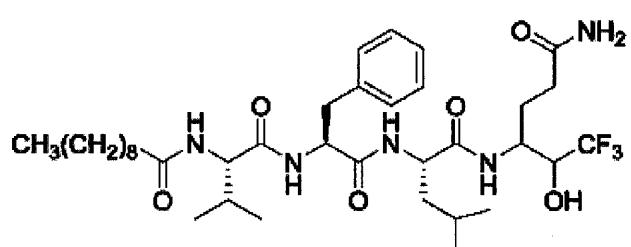
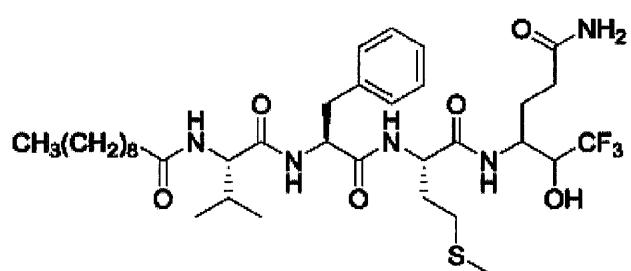
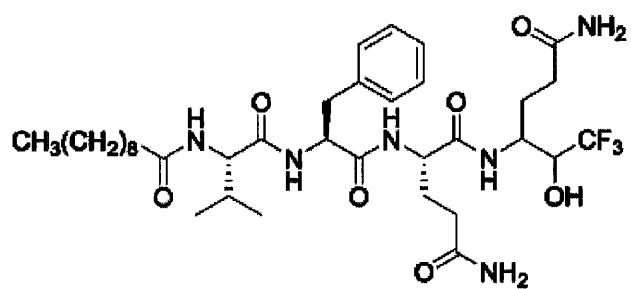


49

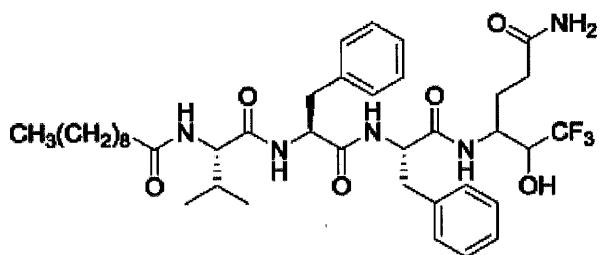
【化14】



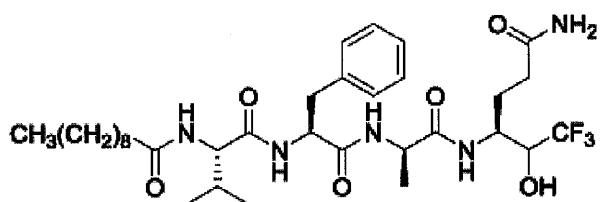
【化 15】



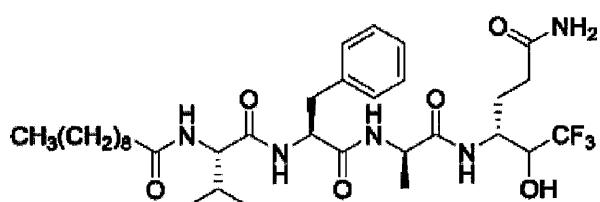
【化 16】



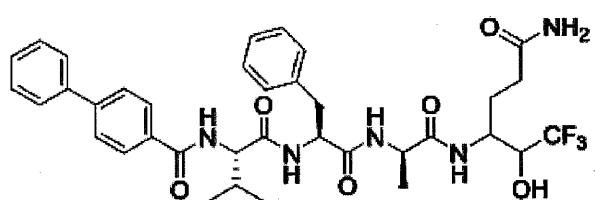
59



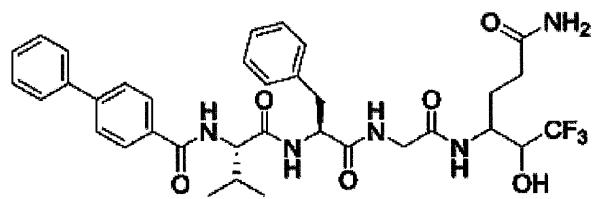
60



61

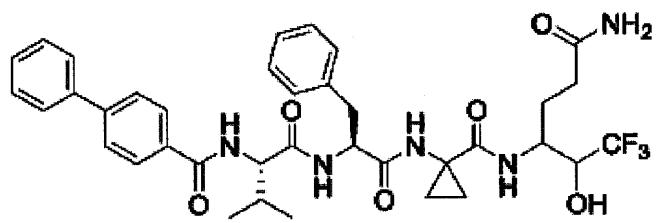


62

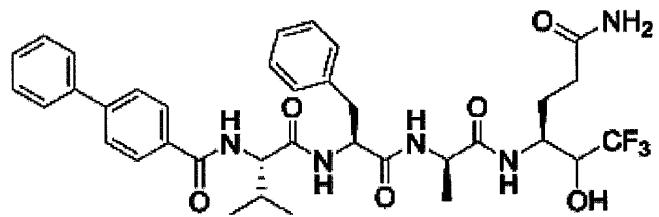


63

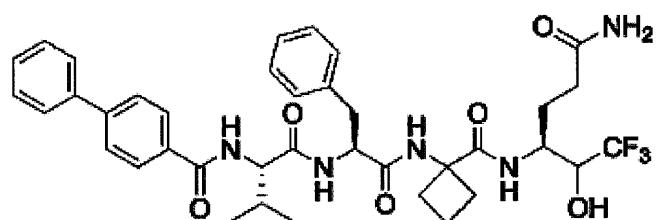
【化 1 7】



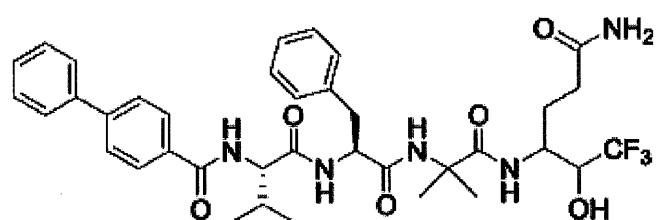
64



65

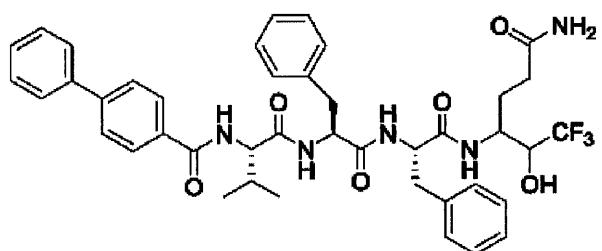


66

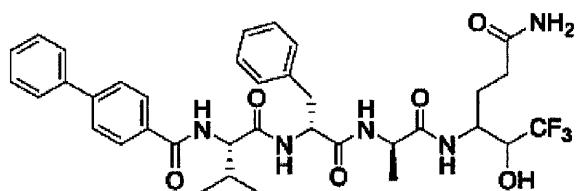


67

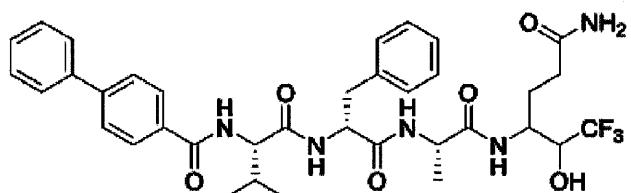
【化18】



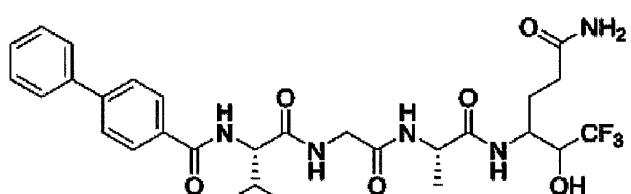
68



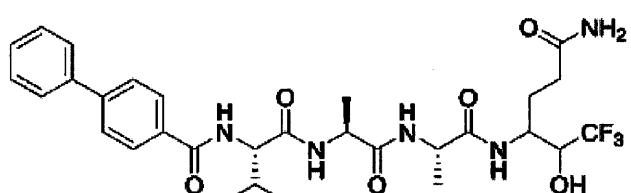
69



70

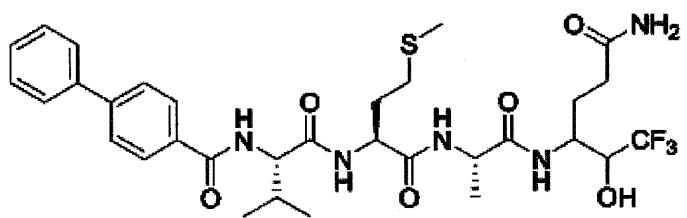


71

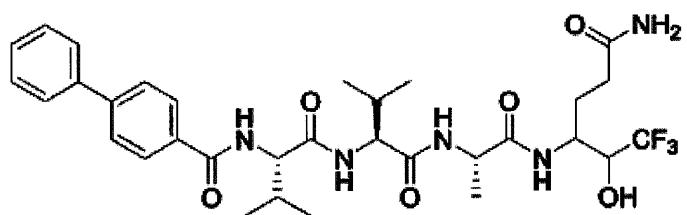


72

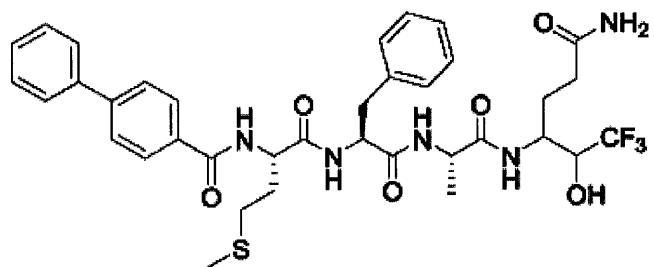
【化19】



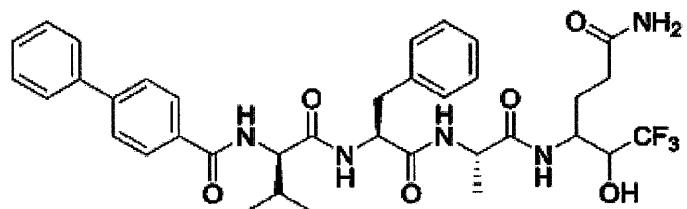
73



74

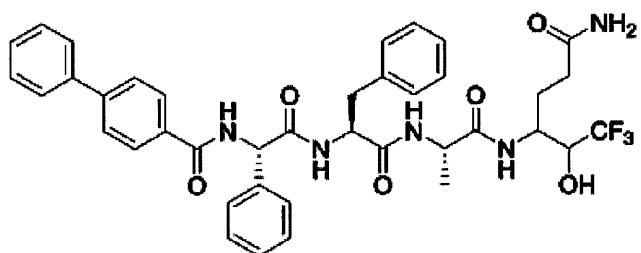


75

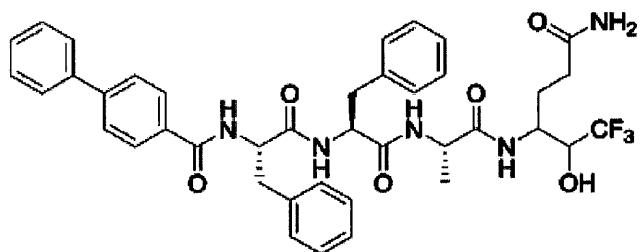


76

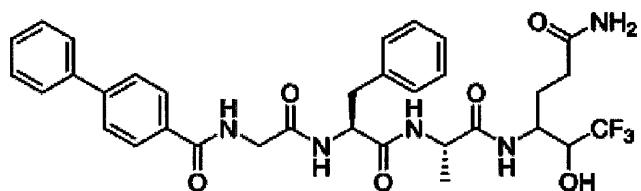
【化 2 0】



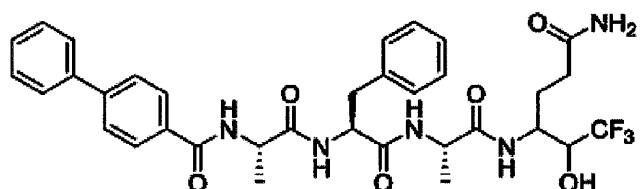
77



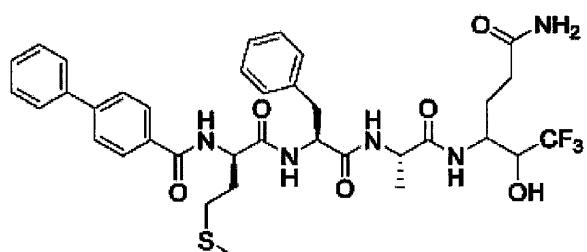
78



79

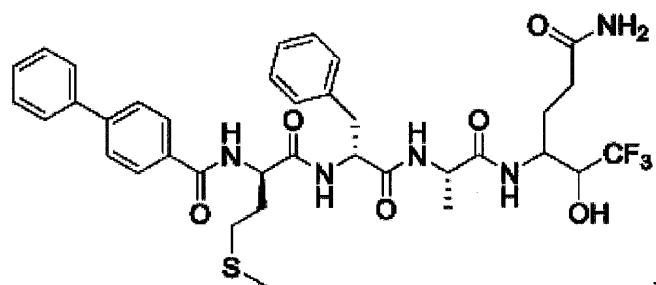


80

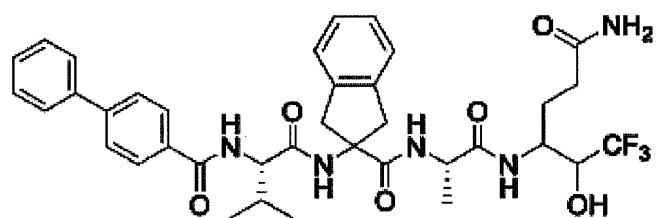


81

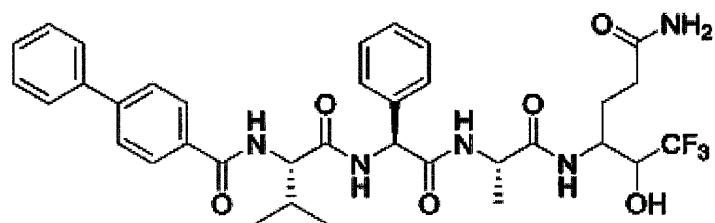
【化 2 1】



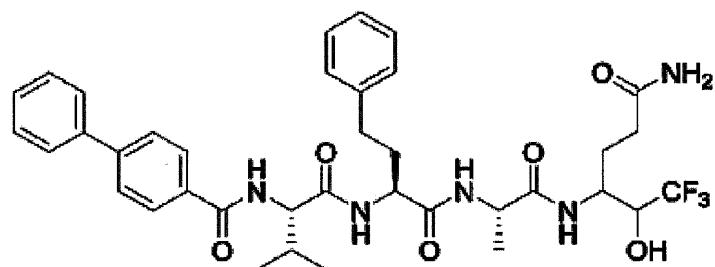
82



83

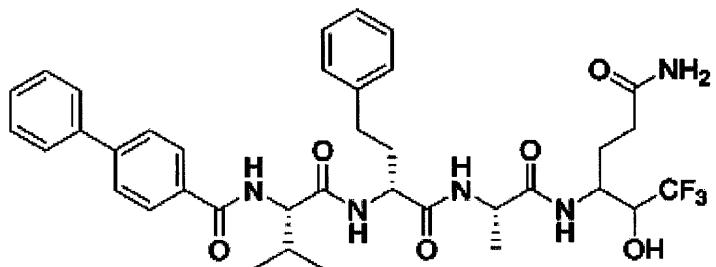


84

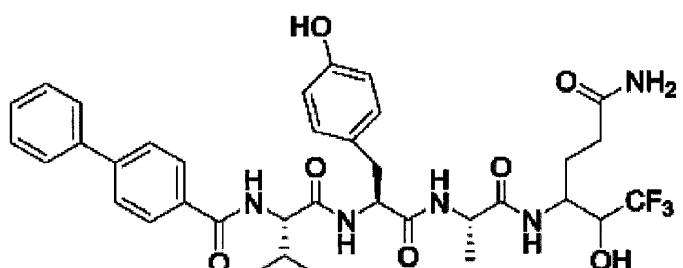


85

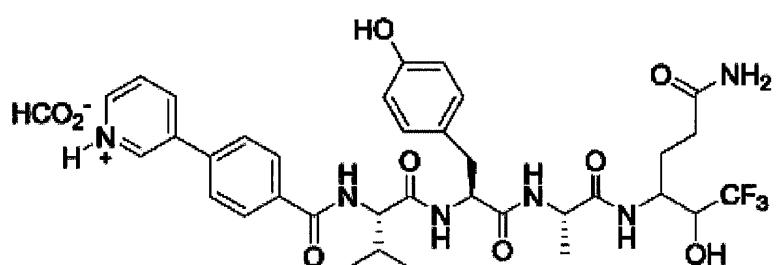
【化 2 2】



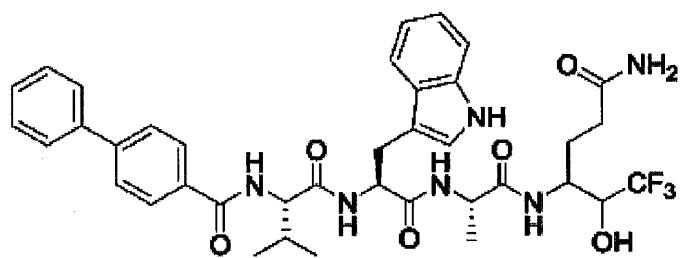
86



87

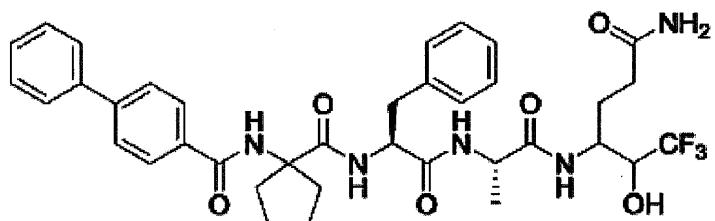


88



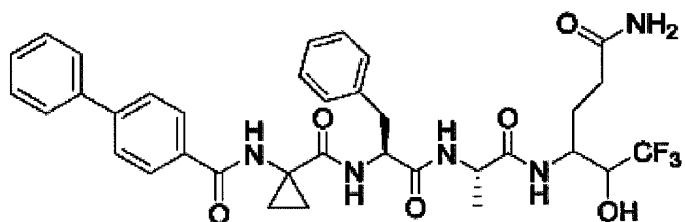
89

## 【化23】



90

もしくは



91

。

である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項9】

請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物の少なくとも1種を含む医薬組成物。

## 【請求項10】

- (a) 請求項1～8のいずれか1項に記載の少なくとも1種の他の化合物；及び／又は
- (b) 患者の脂質プロファイルを改善する、少なくとも1種の他の活性成分；及び／又は
- (c) 薬剤として許容される担体または賦形剤をさらに含む、請求項9に記載の医薬組成物。

## 【請求項11】

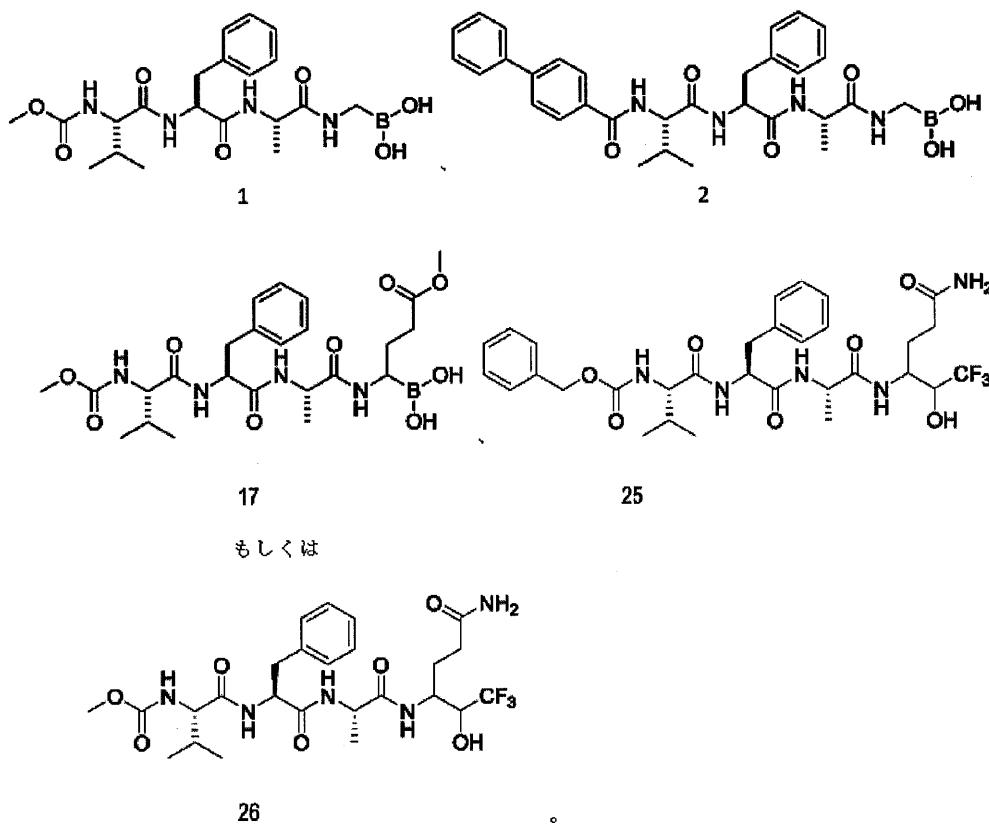
薬剤として使用するための、または薬剤の製造のための、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、または請求項9若しくは10に記載の組成物。

## 【請求項12】

前記薬剤が、患者における、LDL-コレステロール関連疾患または障害の予防または治療のためであり、

ただし、前記化合物が

【化24】



でない、請求項 1 1 に記載の化合物または組成物。

【請求項 1 3】

前記 L D L - コレステロール関連疾患または障害が高コレステロール血症である、請求項 1 2 に記載の化合物または組成物。

【請求項 1 4】

患者における、L D L - コレステロール関連疾患または障害の予防または治療のためのキットであって、

( i ) 請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 9 若しくは 1 0 に記載の組成物と、

( i i ) ( a ) 患者の脂質プロファイルを改善する少なくとも 1 種の他の活性成分；

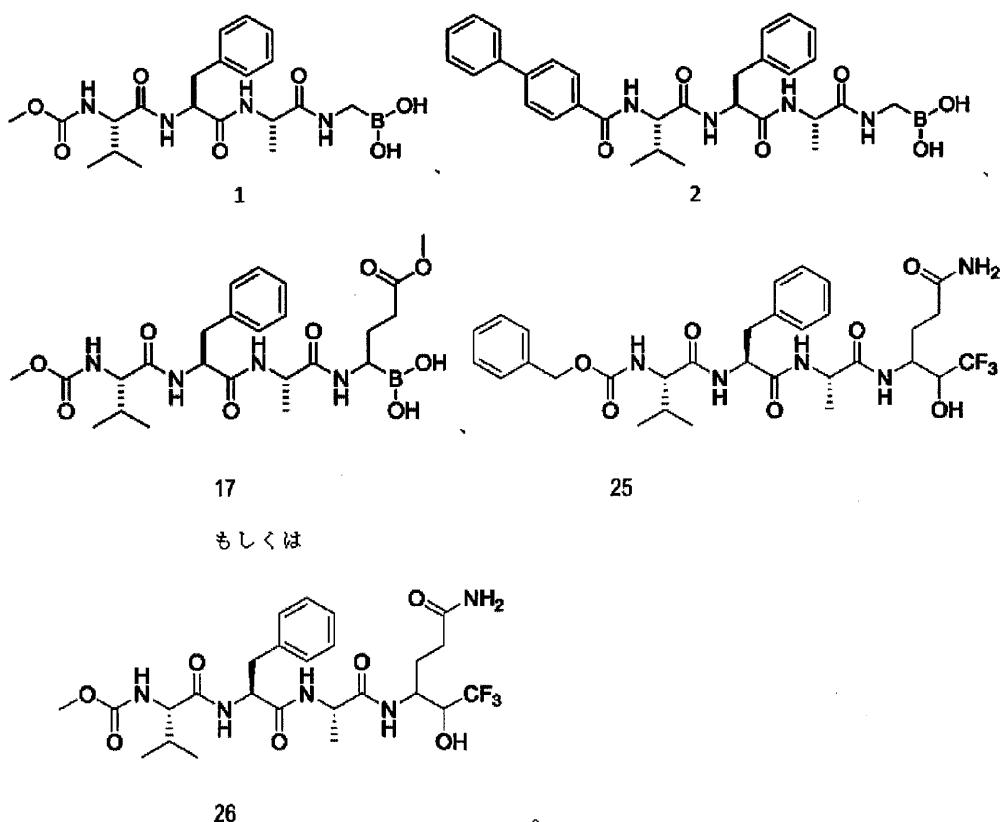
( b ) 請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種の他の化合物、または請求項 9 若しくは 1 0 に記載の少なくとも 1 種の他の組成物；

( c ) 前記化合物及び / または活性成分の容器；及び / または

( d ) 患者における L D L - コレステロール関連疾患または障害の予防または治療ための前記化合物の使用のための説明書とを含み、

ただし、前記化合物が

【化 2 5】

でない、キット。

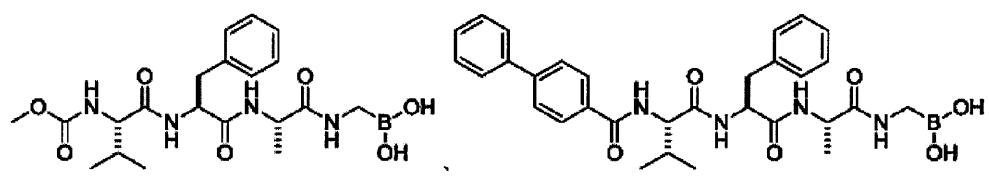
## 【請求項 1 5】

前記 L D L - コレステロール関連疾患または障害が高コレステロール血症である、請求項 1 4 に記載のキット。

## 【請求項 1 6】

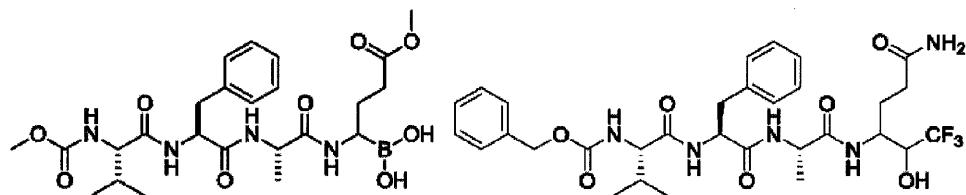
薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 9 若しくは 10 に記載の組成物の使用であって、好ましくは前記薬剤が、患者における、L D L - コレステロール関連疾患または障害の予防または治療のためであり、より好ましくは前記 L D L - コレステロール関連疾患または障害が高コレステロール血症であり、ただし、前記化合物が

【化 2 6】



1

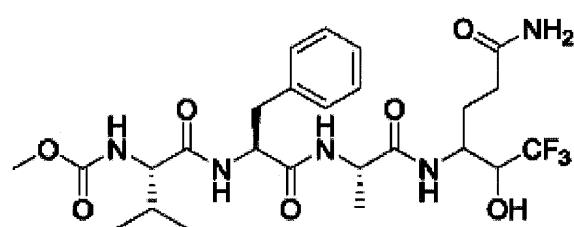
2



17

25

もしくは



26

。

でない、使用。