

【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 27 年 8 月 27 日 (2015.8.27)

【公表番号】特表 2014-525929 (P2014-525929A)

【公表日】平成 26 年 10 月 2 日 (2014.10.2)

【年通号数】公開・登録公報 2014-054

【出願番号】特願 2014-525513 (P2014-525513)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

C 07 D 413/12 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 31/435 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P

C 07 D 413/14

C 07 D 401/14

A 61 K 31/506

A 61 K 31/5377

C 07 D 413/12

A 61 P 9/10

A 61 P 3/06

A 61 K 31/4709

A 61 K 31/435

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 7 月 6 日 (2015.7.6)

【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

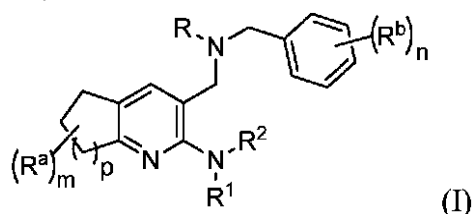
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

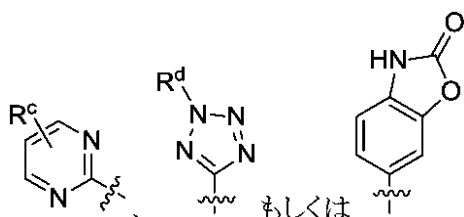
式 (I) を有する化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩：

【化 45】

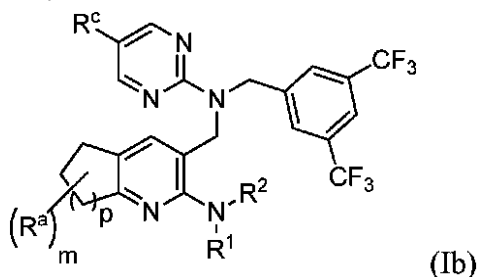


であって、ここで

【化 4 6】



【化 4 7】



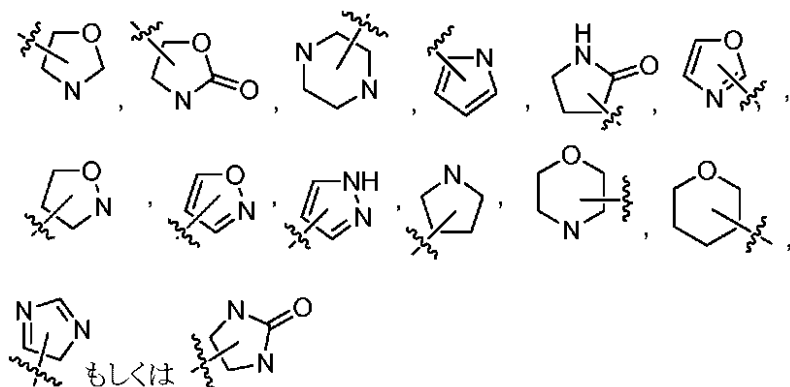
を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩であって；ここで

$R^1$  および  $R^2$  は、水素もしくは  $-(CH_2R^e)_qR^3$ ；から独立して選択され；

$R^3$  は、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルもしくはヘテロアリールを表し；

$R^e$  は、以下：

【化 48】



から選択される必要に応じて置換された複素環式環を表し、ここで該必要に応じた置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキルもしくはハロアルコキシから選択され；

$q$  は、1、2もしくは3を表し；そして

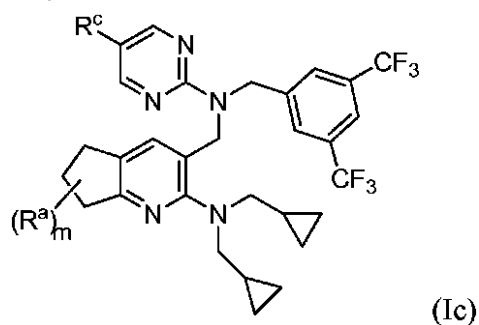
$p$  は、1もしくは2を表す、

化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 3】

式 (Ic)：

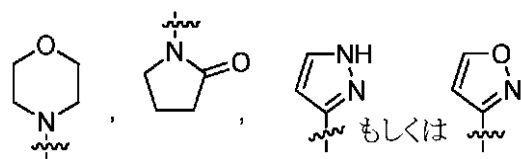
【化 49】



を有する請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩であって；

ここで  $R^e$  は、

【化 50】

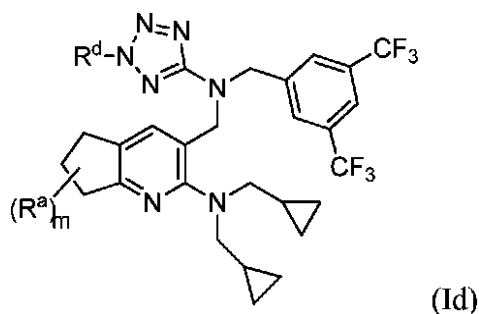


を表す、化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 4】

式 (Id)：

## 【化 5 1】

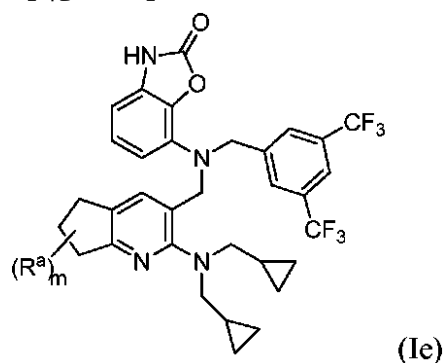


を有する請求項 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 5】

式 (I e) :

## 【化 5 2】



を有する請求項 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 6】

以下からなる群：

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - プロモピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン；

1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) ピロリジン - 2 - オン；

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン；

1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) エタノン；

( E ) - 1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) - 3 - ( ジメチルアミノ ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン；

( E ) - 1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) - 3 - (

ジメチルアミノ)プロパ - 2 - エン - 1 - オン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 5 - (イソオキサゾール - 3 - イル)ピリミジン - 2 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

2 - ( ( ( 2 - (ビス (シクロプロピルメチル)アミノ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル)メチル) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル)アミノ)ピリミジン - 5 - カルボニトリル ;

2 - ( ( ( 2 - (ビス (シクロプロピルメチル)アミノ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル)メチル) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル)アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 - メチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 8 - メチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロキノリン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 - イソプロピル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 - イソブチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 8 , 8 - ジメチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロキノリン - 2 - アミン ;

6 - ( ( ( 2 - (ビス (シクロプロピルメチル)アミノ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル)メチル) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル)アミノ)ベンゾ [ d ] オキサゾール - 2 ( 3 H ) - オン ;

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル) ( 2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 - メチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ; および

3 - ( ( ( 5 - ( 1 H - ピラゾール - 3 - イル)ピリミジン - 2 - イル) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)ベンジル)アミノ)メチル) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン

から選択される、請求項 1 に記載の化合物、

またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の式 ( I ) の少なくとも 1 種の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩および少なくとも 1 種の薬学的に受容可能な賦形剤を含む、薬学的組成物。

【請求項 8】

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質（CETP）を妨げるかもしくは阻害するための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項１に記載の式（I）の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項９】

患者における高密度リポタンパク質（HDL）コレステロールを増大させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項１に記載の式（I）の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１０】

患者における低密度リポタンパク質（LDL）コレステロールを低下させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項１に記載の式（I）の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１１】

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質を結合させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項１に記載の式（I）の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１２】

請求項６に記載の少なくとも１種の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩、および少なくとも１種の薬学的に受容可能な賦形剤を含む、薬学的組成物。

【請求項１３】

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質（CETP）を妨げるかもしくは阻害するための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項６に記載の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１４】

患者における高密度リポタンパク質（HDL）コレステロールを増大させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項６に記載の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１５】

患者における低密度リポタンパク質（LDL）コレステロールを低下させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項６に記載の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項１６】

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質を結合させるための組成物であって、該組成物は、治療上有効な量の、請求項６に記載の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含み、該組成物は、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００１５

【補正方法】変更

【補正の内容】

【００１５】

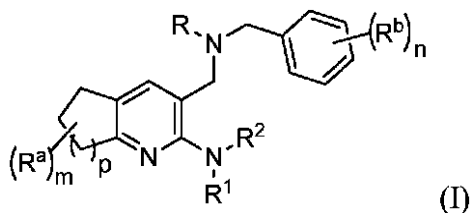
本出願はさらに、式（I）の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩を含む薬学的組成物に関する。

特定の実施形態では、例えば以下が提供される：

(項目 1)

式 (I) を有する化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩：

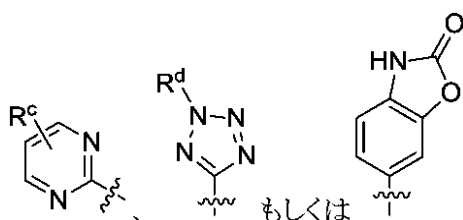
【化 4 5】



であって、ここで

R は、

【化 4 6】



を表し；

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、水素、アシル、ハロアルキル、- (CH R<sup>e</sup>)<sub>q</sub> R<sup>3</sup>、必要に応じて置換された基から独立して選択され、該必要に応じて置換された基は、アルキルもしくはシクロアルキルから選択され、ここで必要に応じた置換基は、各存在において、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキルもしくはアルコキシから独立して選択され；

R<sup>3</sup> は、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルもしくはヘテロアリールから選択される基であり、ここで R<sup>3</sup> は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキルもしくはアルコキシから選択される基で必要に応じて置換され；

R<sup>a</sup> は、各存在において、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、ハロアルキルもしくはアルコキシから独立して選択され；

R<sup>b</sup> は、各存在において、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシもしくはハロアルコキシから独立して選択され；

R<sup>c</sup> は、水素、シアノ、ハロゲン、- C(=O) - R<sup>f</sup>、- CONR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>、- C(=O) - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - NR<sup>i</sup>R<sup>j</sup>、必要に応じて置換された基から独立して選択され、該必要に応じて置換された基は、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールもしくはヘテロシクリル環から選択され、ここで該必要に応じた置換基は、各存在において、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキルもしくはハロアルコキシから独立して選択され；

R<sup>d</sup> は、水素もしくはアルキルであり；

R<sup>e</sup> は、各存在において、水素、アルキルもしくはアルコキシから独立して選択され；

R<sup>f</sup> は、水素もしくはアルキルであり；

R<sup>g</sup>、R<sup>h</sup>、R<sup>i</sup> および R<sup>j</sup> は、独立して水素もしくはアルキルを表し；

m は、0、1 もしくは 2 であり；

n は、0、1、2 もしくは 3 であり；

p は、1 もしくは 2 であり；そして

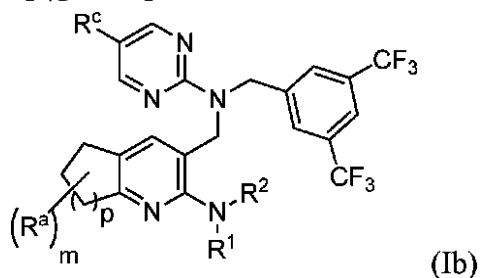
q は、0、1、2、3、4 もしくは 5 である、

化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

( 項目 2 )

式 ( I b ) :

【化 4 7】



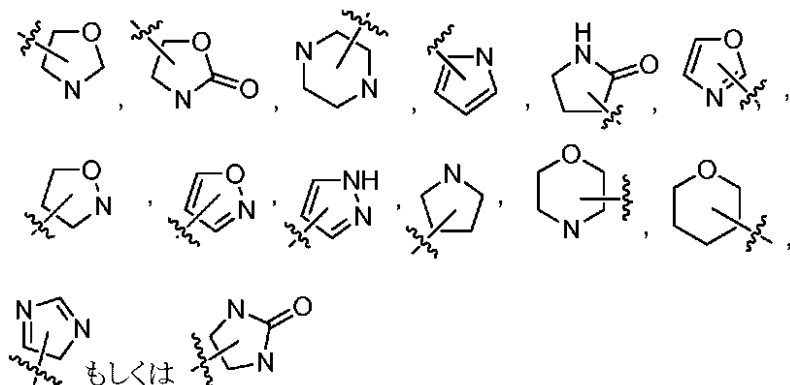
を有する、項目 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩であって；ここで

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、水素もしくは - ( C H R<sup>e</sup> )<sub>q</sub> R<sup>3</sup> ；から独立して選択され；

R<sup>3</sup> は、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルもしくはヘテロアリールを表し；

R<sup>c</sup> は、以下：

【化 4 8】



から選択される必要に応じて置換された複素環式環を表し、ここで該必要に応じた置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキルもしくはハロアルコキシから選択され；

q は、1、2 もしくは 3 を表し；そして

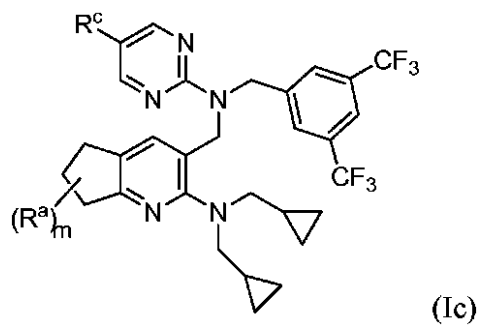
p は、1 もしくは 2 を表す、

化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

( 項目 3 )

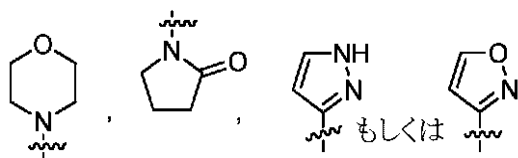
式 ( I c ) :

## 【化 4 9】



を有する項目 2 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩であって；  
 ここで R<sup>c</sup> は、

## 【化 5 0】

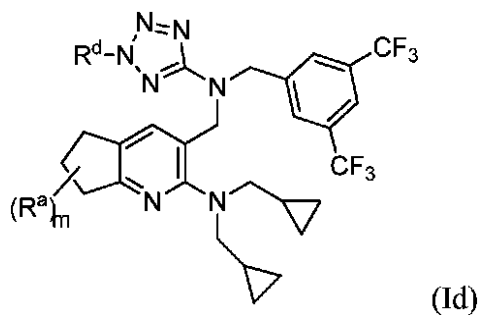


を表す、化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

## (項目 4)

式 (I d) :

## 【化 5 1】

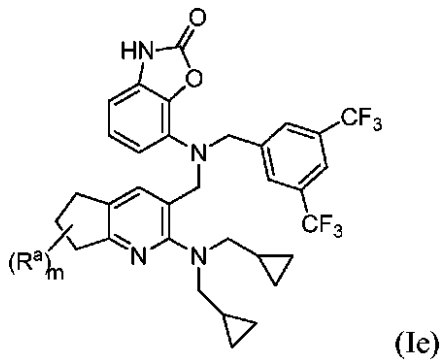


を有する項目 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

## (項目 5)

式 (I e) :

## 【化 5 2】



を有する項目 1 に記載の化合物、またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。

## (項目 6)

以下からなる群：

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - プロモピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン；

1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) ピロリジン - 2 - オン；

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン；

1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) エタノン；

( E ) - 1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) - 3 - ( ジメチルアミノ ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン；

( E ) - 1 - ( 2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - イル ) - 3 - ( ジメチルアミノ ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン；

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - ( イソオキサゾール - 3 - イル ) ピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン；

2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - カルボニトリル；

2 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7 , 7 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

3 - ( ( ( 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 - メチル -

6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 5 - モルホリノピリミジン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 8 - メチル -  
5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン - 2 - アミン ;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 H - テトラゾール - 5 -  
イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7, 7 - ジメチル -  
6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 - メチル - 2 H - テトラ  
ゾール - 5 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7, 7  
- ジメチル - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 - イソプロピル - 2 H -  
テトラゾール - 5 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) -  
7, 7 - ジメチル - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン  
;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 - イソブチル - 2 H - テ  
トラゾール - 5 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7  
, 7 - ジメチル - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン ;  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 - メチル - 2 H - テトラ  
ゾール - 5 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 8, 8  
- ジメチル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン - 2 - アミン ;  
6 - ( ( ( 2 - ( ビス (シクロプロピルメチル) アミノ ) - 7, 7 - ジメチル - 6, 7 -  
ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 3 - イル ) メチル ) ( 3, 5 - ビス (ト  
リフルオロメチル) ベンジル ) アミノ ) ベンゾ [ d ] オキサゾール - 2 ( 3 H ) - オン ;  
および  
3 - ( ( ( 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル ) ( 2 - メチル - 2 H - テトラ  
ゾール - 5 - イル ) アミノ ) メチル ) - N, N - ビス (シクロプロピルメチル) - 7 - メ  
チル - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [ b ] ピリジン - 2 - アミン  
から選択される、項目 1 に記載の化合物、  
またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容可能な塩。  
( 項目 7 )  
項目 1 に記載の式 ( I ) の少なくとも 1 種の化合物および少なくとも 1 種の薬学的に受容  
可能な賦形剤を含む、薬学的組成物。  
( 項目 8 )  
患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質 ( C E T P ) を妨げるかもしくは阻害  
する方法であって、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目 1 に記載の式 ( I ) の  
化合物を投与する工程を包含する、方法。  
( 項目 9 )  
患者における高密度リポタンパク質 ( H D L ) コレステロールを増大させる方法であって  
、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目 1 に記載の式 ( I ) の化合物を投与する  
工程を包含する、方法。  
( 項目 10 )  
患者における低密度リポタンパク質 ( L D L ) コレステロールを低下させる方法であって  
、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目 1 に記載の式 ( I ) の化合物を投与する  
工程を包含する、方法。  
( 項目 11 )  
患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質を結合させる方法であって、該方法は  
、該患者に、治療上有効な量の、項目 1 に記載の式 ( I ) の化合物を投与する工程を包含  
する、方法。  
( 項目 12 )  
項目 6 に記載の少なくとも 1 種の化合物またはその立体異性体もしくはその薬学的に受容

可能な塩、および少なくとも１種の薬学的に受容可能な賦形剤を含む、薬学的組成物。

(項目１３)

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質 (CETP) を妨げるかもしくは阻害する方法であって、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目６に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目１４)

患者における高密度リポタンパク質 (HDL) コレステロールを増大させる方法であって、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目６に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目１５)

患者における低密度リポタンパク質 (LDL) コレステロールを低下させる方法であって、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目６に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目１６)

患者におけるコレステリルエステル転送タンパク質を結合させる方法であって、該方法は、該患者に、治療上有効な量の、項目６に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法

。

【手続補正３】

【補正対象書類名】明細書

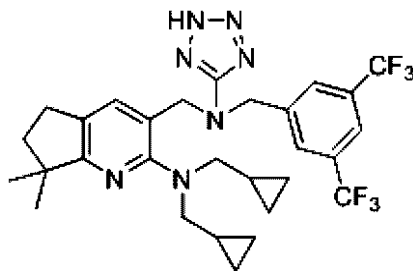
【補正対象項目名】０１９６

【補正方法】変更

【補正の内容】

【０１９６】

【化３６】



【手続補正４】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】０２２４

【補正方法】変更

【補正の内容】

【０２２４】

【化４２】

