

【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19年11月8日(2007.11.8)

【公表番号】特表2007-502265(P2007-502265A)

【公表日】平成19年2月8日(2007.2.8)

【年通号数】公開・登録公報2007-005

【出願番号】特願2006-523069(P2006-523069)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/33 (2006.01)

C 0 7 D 207/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

C 0 7 D 207/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 207/34 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/49 (2006.01)

C 0 7 D 319/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 207/33 C S P

C 0 7 D 207/36

A 6 1 K 31/40

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/541

C 0 7 D 207/48

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/438

C 0 7 D 405/06

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 207/34

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/49

C 0 7 D 319/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月19日(2007.9.19)

【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

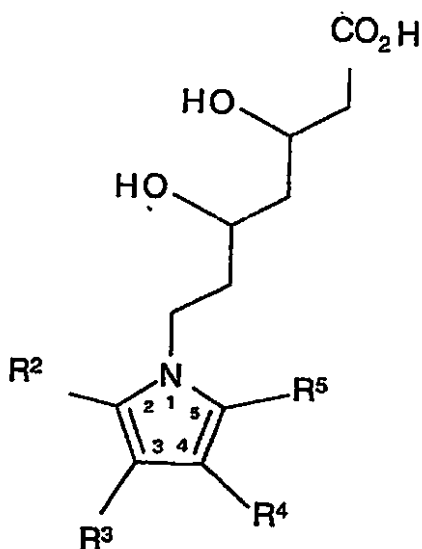
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



式I

を有する化合物、又はその医薬として受容可能な塩、エステル、アミド、立体異性体又はプロドラッグ、又はプロドラッグの医薬として受容可能な塩〔式中：

$R^2$  は、場合により置換されているベンジル、ナフチル又はシクロヘキシル；又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで場合により置換されているフェニル；ピリジニル、又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで置換されているピリジニル；又は1から7の炭素原子のアルキルであり；

$R^3$  及び  $R^4$  の一方は、H；場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル；直鎖又は分枝鎖  $C_1 \sim C_8$  アルキル；又は  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり；そして  $R^3$  及び  $R^4$  の他方は、H、I、 $COOR'$ 、 $R^6 R^7 NC(O) -$  又は  $SO_2 NR^9 R^{10}$  であり；

$R^6$  及び  $R^7$  の一方は、 $SO_2 NHR^8$  又は  $SO_2 R^8$  であり；そして  $R^6$  及び  $R^7$  の他方は、H又は  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^8$  は、場合により置換されているアリール又はヘテロアリールであり；

$R^9$  及び  $R^{10}$  は、各々独立して、H；ハロゲン、 $OR'$ 、 $(CH_2)_n COOR'$ 、 $(CH_2)_n CONR'R''$ 、 $(CH_2)_n SO_2 NR'R''$ 、 $(CH_2)_n SO_2 R'$  又はCNで場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール又はヘテロアラルキル；非置換  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、又はOH、 $CO_2 R'$  又は  $CONR'R''$  で

置換されている  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルであり；又は、

$N$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  は一緒になって、 $O$ 、 $N$  及び  $S$  から選択される 2 つまでのヘテロ原子を場合により含んでいる 4 ～ 11 員環を形成し、前記環は場合により、 $=O$ 、 $OH$ 、ベンジル、フェニル、 $CO_2 R'$ 、 $R'OR''$ 、 $(CH_2)_n SO_2 R'$  又は  $CONR'R''$  で置換されており；

$R^5$  は、場合によりハロゲンで置換されている 1 から 4 の炭素原子のアルキルであり；

$R'$  及び  $R''$  は、各々独立して、 $H$ 、低級アルキルであるか、又は一緒になって 4 ～ 7 員環を形成し；そして

$n$  は 0 ～ 2 である ]。

【請求項 2】

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 - メチルスルファモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 3 - ベンジルスルファモイル - 4, 5 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシ - フェニルスルファモイル) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルスルファモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

4 - [ 1 - ( (3R, 5R) - 6 - カルボキシ - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘキシル ) - 4, 5 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 1H - ピロール - 3 - スルホニルアミノ ] 安息香酸；

1 - [ 1 - ( (3R, 5R) - 6 - カルボキシ - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘキシル ) - 4, 5 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 1H - ピロール - 3 - スルホニル ] - ピペリジン - 4 - カルボン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 - (2 - メトキシカルボニル - エチルスルファモイル) - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 - (3 - メトキシカルボニル - プロピルスルファモイル) - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 3 - (2, 4 - ジフルオロ - フェニルスルファモイル) - 4, 5 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 3 - カルバモイル - 4, 5 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 - (トルエン - 4 - スルホニルアミノカルボニル) - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - (4 - フルオロ - フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシ - エチルスルファモイル) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

【請求項 3】

4 - { [ 1 - ( 3 R , 5 R ) - 6 - カルボキシ - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘキシル ] - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - カルボニル } アミノ } - 安息香酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - シアノ - フェニル ) - 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - ブロモ - フェニル ) - 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 3 , 4 - ジフルオロ - フェニル ) - 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

4 - { [ 1 - ( ( 3 R , 5 R ) - 6 - カルボキシ - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘキシル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - カルボニル ] アミノ } - 安息香酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - ヒドロキシ - フェニルスルファモイル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 3 - ナフタレン - 2 - イル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - シクロプロピル - 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - ジメチルカルバモイル - フェニルカルバモイル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

#### 【請求項 4】

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ヨ - ド - 5 - イソプロピル - 3 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - ジエチルカルバモイル - フェニルカルバモイル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( 4 - メチルカルバモイル - フェニルカルバモイル ) - 3 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - 3 - ピリジン - 4 - イル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - フルオロ - フェニルスルファモイル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 3 - ヒドロキシ - フェニルスルファモイル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - カルバモイル - フェニルスルファモイル ) - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - エチル - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - イソプロピル - 3 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( 4 - スルファモイル - フェニルスルファモイル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

【請求項 5】

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 3 , 5 - ジイソプロピル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - エチル - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - フェネチル - 3 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 3 - ベンジルカルバモイル - 2 - エチル - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( モルホリン - 4 - スルホニル ) - 3 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 3 - ( ベンジル - メチル - スルファモイル ) - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 3 - ( ベンジル - メチル - スルファモイル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 3 - ( ベンジル - メチル - スルファモイル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 3 - ( 4 - ベンジル - ピペリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

【請求項 6】

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - エチル - 5 - メチル - 4 - ( 5 - メチル - ピリジン - 2 - イルカルバモイル ) - 3 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - ( 2 , 5 - ジメチル - 3 - ナフタレン - 2 - イル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - [ 2 - エチル - 5 - メチル - 4 - ( 5 - メチル - ピリジン - 2 - イルカルバモイル ) - 3 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - ( 2 - エチル - 5 - メチル - 3 - フェニル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

(3 R, 5 R) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 2 , 5 - ジメチル - 4 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 2 , 5 - ジメチル - 4 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 5 - エチル - 2 - メチル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - エチル - 4 - ( 2 - メトキシ - エチルカルバモイル ) - 3 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 5 - メチル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 5 - エチル - 2 - メチル - 4 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 2 - エチル - 4 - ( 2 - メトキシ - エチルカルバモイル ) - 5 - メチル - 3 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

【請求項 7】

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ベンジルカルバモイル - 5 - エチル - 4 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - 2 - メチル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 3 - ベンジルカルバモイル - 5 - エチル - 2 - メチル - 4 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 2 , 5 - ジメチル - 3 - フェネチルカルバモイル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - 7 - ( 3 - イソブチルカルバモイル - 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル - ヘプタン酸 ) ;

( 3 R , 5 R ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - 7 - ( 3 - イソブチルカルバモイル - 2 , 5 - ジメチル - 4 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ) - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 2 - エチル - 4 - イソブチルカルバモイル - 5 - メチル - 3 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 2 , 5 - ジメチル - 3 - フェネチルカルバモイル - 4 - p - トリル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - ( 2 - ベンジル - 5 - メチル - 3 - フェニル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 7 - [ 3 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 2 - メチル - 4 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸 ;

( 3 R , 5 R ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - 7 - ( 2 - メチル - 4 , 5 - ジフェニル - 3 - フェニルカルバモイル - ピロール - 1 - イル ) - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

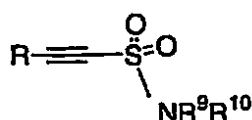
【請求項 8】

請求項 1 の化合物、その医薬として受容可能な塩、エステル、アミド、又はプロドラッグ、又はプロドラッグの医薬として受容可能な塩 ; 及び医薬として受容可能な坦体、希釈剤又は賦形剤を含んでなる医薬組成物。

【請求項 9】

式 1 5

【化 2】



を有する化合物（式中、Rは、直鎖又は分枝鎖C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル；又はC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルであり；R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、各々独立して、H；場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール又はヘテロアラルキル；非置換C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、又はOH、CO<sub>2</sub>R'又はCONR'R''で置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキルであるか；又は、N、R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、一緒になって4～7員環を形成し、場合によりO、N及びSから選択される2つまでのヘテロ原子を含んでおり、前記環は場合により、OH、ベンジル、フェニル、CO<sub>2</sub>R'又はCONR'R''で置換されており；そして、R'及びR''は、各々独立して、H、低級アルキルであるか、又は一緒になって4～7員環を形成する）。

【請求項10】

(3R, 5R) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ヨ - ド - 5 - イソプロピル - 3 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 3 - ( 4 - カルバモイル - フェニルスルファモイル ) - 4, 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2, 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( 4 - スルファモイル - フェニルスルファモイル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( モルホリン - 4 - スルホニル ) - 3 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

(3R, 5R) - 7 - [ 3 - ( ベンジル - メチル - スルファモイル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - ナフタレン - 2 - イル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

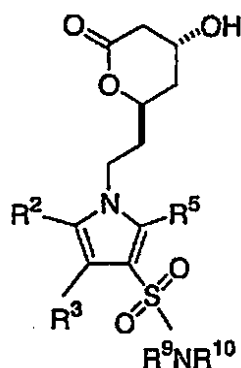
(3R, 5R) - 7 - [ 3 - ( 4 - ベンジル - ピペリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - ピロール - 1 - イル ] - 3, 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。

【請求項11】

式C

【化3】



C.

を有する化合物〔式中：

R<sup>2</sup>は、場合により置換されているベンジル、ナフチル又はシクロヘキシル；又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで場合により置換されているフェニル；ピリジニル、又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで置換されているピリジニル；又は1から7の炭素原子のアルキルであり；

$R^3$  は、H；場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル；直鎖又は分枝鎖  $C_1 \sim C_8$  アルキル；又は  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり；

$R^5$  は、場合によりハロゲンで置換されている 1 から 4 の炭素原子のアルキルであり；

$R^9$  及び  $R^{10}$  は、各々独立して、H；ハロゲン、 $OR'$ 、 $(CH_2)_n COOR'$ 、 $(CH_2)_n CONR'R''$ 、 $(CH_2)_n SO_2 NR'R''$ 、 $(CH_2)_n SO_2 R'$  又は CN で場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール又はヘテロアラルキル；非置換  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、又は OH、 $CO_2 R'$  又は  $CONR'R''$  で置換されている  $C_1 \sim C_{10}$  アルキルであるか；又は

N、 $R^9$  及び  $R^{10}$  は、一緒になって、O、N 及び S から選択される 2 つまでのヘテロ原子を場合により含んでいる 4 ～ 7 員環を形成し、前記環は場合により、OH、ベンジル、フェニル、 $CO_2 R'$  又は  $CONR'R''$  で置換されており；

$R^5$  は、場合によりハロゲンで置換されている 1 から 4 の炭素原子のアルキルであり；

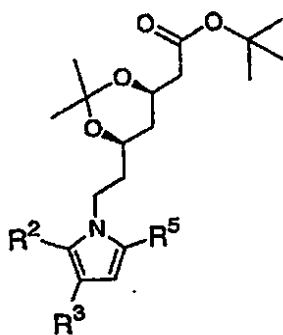
$R'$  及び  $R''$  は、各々独立して、H、低級アルキルであるか、又は一緒になって 4 ～ 7 員環を形成し；そして

n は 0 ～ 2 である ]。

【請求項 12】

式

【化 4】



を有する化合物、又はその医薬として受容可能な塩、エステル、アミド、立体異性体又はプロドラッグ、又はプロドラッグの医薬として受容可能な塩 [ 式中：

$R^2$  は、場合により置換されているベンジル、ナフチル又はシクロヘキシル；又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで場合により置換されているフェニル；ピリジニル、又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで置換されているピリジニル；又は 1 から 7 の炭素原子のアルキルであり；

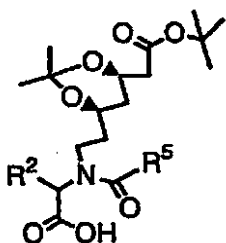
$R^3$  は、H；場合により置換されているアリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル；直鎖又は分枝鎖  $C_1 \sim C_8$  アルキル；又は  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり；

$R^5$  は、場合によりハロゲンで置換されている 1 から 4 の炭素原子のアルキルである ]

【請求項 13】

式

【化 5】





を有する化合物〔式中：R<sup>2</sup>は、場合により置換されているベンジル、ナフチル又はシクロヘキシル；又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで場合により置換されているフェニル；ピリジニル、又はフッ素、塩素、臭素、ヒドロキシル又はトリフルオロメチルで置換されているピリジニル；又は1から7の炭素原子のアルキルであり；及び、R<sup>5</sup>は、場合によりハロゲンで置換されている1から4の炭素原子のアルキルである〕。

【請求項14】

請求項1の化合物を含んでなる、ラセミ体混合物。

【請求項15】

7 - [ 3 - ( 3 - アザ - スピロ [ 5 . 5 ] ウンデカン - 3 - スルホニル ) - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 4 - ヒドロキシ - ピペリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( ピロリジン - 1 - スルホニル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - ヒドロキシメチル - ピロリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 3 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( 3 - フェニル - ピロリジン - 1 - スルホニル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( 3 - メタンスルホニル - ピロリジン - 1 - スルホニル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 3 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - スルホニル ) - 5 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 3 - ジフェニルスルファモイル - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( チオモルホリン - 4 - スルホニル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジオキソ - 1 ) 6 - チオモルホリン - 4 - スルホニル ] - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 3 - ( 2 , 6 - ジメチル - モルホリン - 4 - スルホニル ) - 4 , 5 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - イソプロピル - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸；

7 - [ 2 , 3 - ビス - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソプロピル - 4 - ( オクタヒドロ - イソキノリン - 2 - スルホニル ) - ピロール - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジヒドロキシ - ヘプタン酸、

から成る群より選択される化合物、及びその医薬として受容可能な塩、エステル及びアミド。