

【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9月29日(2011.9.29)

【公表番号】特表2009-532366(P2009-532366A)

【公表日】平成21年9月10日(2009.9.10)

【年通号数】公開・登録公報2009-036

【出願番号】特願2009-503074(P2009-503074)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/08	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/00	(2006.01)
A 6 1 P 7/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/04	(2006.01)
A 6 1 P 27/14	(2006.01)
A 6 1 P 11/02	(2006.01)
A 6 1 P 5/14	(2006.01)
A 6 1 P 21/04	(2006.01)
A 6 1 P 7/06	(2006.01)
A 6 1 P 7/04	(2006.01)
A 6 1 P 31/22	(2006.01)
A 6 1 P 1/16	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14	C S P
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 7/00	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 17/06	

A 6 1 P 17/04  
 A 6 1 P 27/14  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 5/14  
 A 6 1 P 21/04  
 A 6 1 P 7/06  
 A 6 1 P 7/04  
 A 6 1 P 31/22  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 15/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年8月11日(2011.8.11)

## 【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

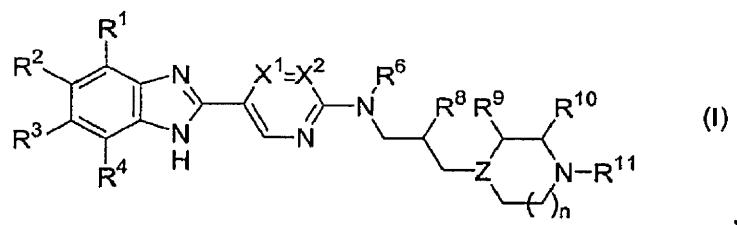
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

## 【化1】



[式中、

R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニル、フェニル、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-CN、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-OC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-SC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-S(O)C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-C(O)C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-C(O)フェニル、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-CO<sub>2</sub>H または -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> であり；かつR<sup>a</sup> およびR<sup>b</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルまたはC<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルであり；

X<sup>1</sup> およびX<sup>2</sup> の一方はNでありそしてもう一方はC - R<sup>c</sup> であり；

ここで、R<sup>c</sup> は、H、メチル、ヒドロキシメチル、ジメチルアミノメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、-CF<sub>3</sub>、シクロプロピルまたはシクロブチルであり；

n は、1 または 2 であり；

Z は、N、CH または C(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) であり；

R<sup>6</sup> は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルまたは单環式シクロアルキルであり；

R<sup>8</sup> は、H または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は、各々独立して、H または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり；そして

R<sup>11</sup> は、H または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルである]

で表される化合物、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容される塩、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容されるプロドラッグまたは式(I)で表される化合物の製薬学的に有効な代謝産物である化学物質。

## 【請求項2】

R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup> が各々独立してH、メチル、t-ブチル、メトキシ、-CF<sub>3</sub>、-CN、フル

オロ、クロロ、メトキシカルボニルまたはベンゾイルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 3】

$X^2$  が N である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 4】

$X^1$  が N である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 5】

$R^c$  が H、メチル、エチル、 $CF_3$ 、シクロプロピルまたはシクロブチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 6】

$R^c$  が H またはメチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 7】

$n$  が 1 である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 8】

$Z$  が N または CH である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 9】

$Z$  が CH である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 10】

$R^6$  が H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピルまたはシクロブチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 11】

$R^6$  が H またはメチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 12】

$R^8$  が H である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 13】

$R^9$  および  $R^{10}$  が各々独立して H またはメチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 14】

$R^9$  および  $R^{10}$  が両方とも H である請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 15】

$R^{11}$  が H またはメチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 16】

$R^{11}$  がメチルである請求項 1 記載の化学物質。

【請求項 17】

下記：

[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 5 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 6 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - ア

ミニン；

- アミン；

[ 5 - ( 5 - t - プチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 5 - クロロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 5 , 6 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 5 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - イソプロピル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；

[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン；およびこれらの製薬学的に許容される塩

から選択される化学物質。

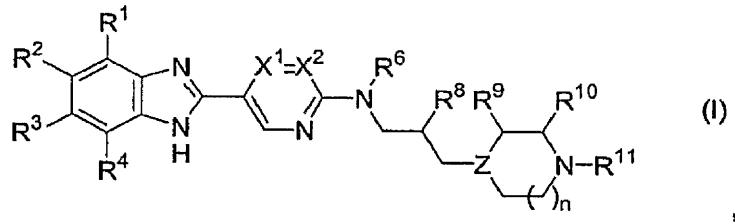
#### 【請求項 1 8】

式 ( I ) で表される化合物または前記式 ( I ) で表される化合物の製薬学的に許容される塩である請求項 1 記載の化学物質。

#### 【請求項 1 9】

ヒスタミン H<sub>4</sub> 受容体の活性が媒介する病気、障害または病状を治療するための製薬学的組成物であって、式 ( I ) ；

#### 【化 2】



[ 式中、

R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニル、フェニル、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-CN、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-OC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-SC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-S(O)C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-C(O)C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-C(O)フェニル、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-CO<sub>2</sub>

$C_{1-4}$  アルキル、 $-CO_2H$  または  $-NR^aR^b$  であり；かつ  $R^a$  および  $R^b$  は、各々独立して、H、 $C_{1-4}$  アルキルまたは  $C_{3-7}$  シクロアルキルであり；

$X^1$  および  $X^2$  の一方はNでありそしもう一方は  $C-R^c$  であり；かつ

$R^c$  は、H、メチル、ヒドロキシメチル、ジメチルアミノメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、 $-CF_3$ 、シクロプロピルまたはシクロブチルであり；

$n$  は、1または2であり；

$Z$  は、N、CHまたは  $C(C_{1-4}$  アルキル)であり；

$R^6$  は、H、 $C_{1-6}$  アルキルまたは単環式シクロアルキルであり；

$R^8$  は、Hまたは  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$R^9$  および  $R^{10}$  は、各々独立して、Hまたは  $C_{1-4}$  アルキルであり；そして

$R^{11}$  は、Hまたは  $C_{1-4}$  アルキルである]

で表される化合物、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容される塩、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容されるプロドラッグおよび式(I)で表される化合物の製薬学的に有効な代謝産物から選択される少なくとも1種の薬剤を有効な量で含有して成る製薬学的組成物。

#### 【請求項20】

前記少なくとも1種の薬剤が下記：

[5-(5-フルオロ-4-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,6-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(6-フルオロ-4-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,5-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,6-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,6-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - メチル - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-エチル-ピリミジン-2-イル] - メチル - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,5-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-エチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4-フルオロ-5-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-プロピル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-イソプロピル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル] - アミン；



[5 - (4, 5 -ジメチル -1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -4 -トリフルオロメチル -ピリミジン -2 -イル] - [3 - (1 -メチル -ピペリジン -4 -イル) -プロピル] -アミン;

[5 - (5, 6 -ジフルオロ -1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -4 -トリフルオロメチル -ピリミジン -2 -イル] - [3 - (1 -メチル -ピペリジン -4 -イル) -プロピル] -アミン;

[5 - (4, 5 -ジフルオロ -1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -4 -イソプロピル -ピリミジン -2 -イル] - [3 - (1 -メチル -ピペリジン -4 -イル) -プロピル] -アミン;

[5 - (1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -ピラジン -2 -イル] - [3 - (1 -メチル -ピペリジン -4 -イル) -プロピル] -アミン;

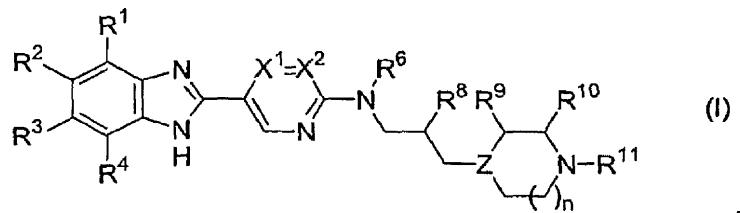
[5 - (4, 5 -ジメチル -1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -ピラジン -2 -イル] - [3 - (1 -メチル -ピペリジン -4 -イル) -プロピル] -アミン; およびこれらの製薬学的に許容される塩

から選択される請求項19記載の製薬学的組成物。

【請求項21】

ヒスタミンH<sub>4</sub>受容体の活性が媒介する病気、障害または病状に苦しんでいるか或はそうであると診断された被験体を治療する方法であって、前記治療を必要としている被験体に式(I) :

【化3】



〔式中、

R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、C<sub>2</sub> - 4 アルケニル、C<sub>2</sub> - 4 アルキニル、フェニル、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-CN、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-OC<sub>1</sub> - 4 アルキル、-SC<sub>1</sub> - 4 アルキル、-S(O)C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-C(O)C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-C(O)フェニル、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-CO<sub>2</sub>H または -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> であり；かつR<sup>a</sup> およびR<sup>b</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - 4 アルキルまたはC<sub>3</sub> - 7 シクロアルキルであり；

X<sup>1</sup> およびX<sup>2</sup> の一方はN でありそしてもう一方はC - R<sup>c</sup> であり；

ここで、R<sup>c</sup> は、H、メチル、ヒドロキシメチル、ジメチルアミノメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、-CF<sub>3</sub>、シクロプロピルまたはシクロブチルであり；

n は、1 または 2 であり；

Z は、N、CH または C(C<sub>1</sub> - 4 アルキル) であり；

R<sup>6</sup> は、H、C<sub>1</sub> - 6 アルキルまたは単環式シクロアルキルであり；

R<sup>8</sup> は、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は、各々独立して、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；そして

R<sup>11</sup> は、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルである】

で表される化合物、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容される塩、式(I)で表される化合物の製薬学的に許容されるプロドラッグおよび式(I)で表される化合物の製薬学的に有効な代謝産物から選択した少なくとも1種の薬剤を有効な量で投与することを含んで成る方法。

【請求項22】

前記少なくとも1種の薬剤を下記：

[5 - (5 -フルオロ -4 -メチル -1H -ベンゾイミダゾール -2 -イル) -4 -メチ



リミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 4 - エチル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - イソプロピル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 4 - メチル - 5 - ( 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 - フルオロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - [ 4 - メチル - 5 - ( 5 - トリフルオロメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 - t - ブチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 - クロロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 , 6 - ジクロロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 5 , 6 - ジフルオロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 , 5 - ジフルオロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - イソプロピル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ; およびこれら の製薬学的に許容される塩  
から選択する請求項 2 1 記載の方法。

#### 【請求項 2 3】

前記病気、障害または病状が炎症である請求項 2 1 記載の方法。

#### 【請求項 2 4】

前記病気、障害または病状が炎症性疾患、アレルギー性疾患、皮膚疾患、自己免疫病、リンパ系疾患および免疫不全疾患から成る群より選択される請求項 2 1 記載の方法。

【請求項 2 5】

前記病気、障害または病状がアレルギー、喘息、ドライアイ、慢性閉塞性肺疾患 (COPD)、アテローム性動脈硬化症、関節リウマチ、多発性硬化症、炎症性腸疾患、大腸炎、クローン病、潰瘍性大腸炎、乾癬、搔痒、皮膚の痒み、アトピー性皮膚炎、皮膚の搔痒、蕁麻疹、眼の炎症、結膜炎、鼻ポリープ、アレルギー性鼻炎、鼻の痒み、強皮症、自己免疫性甲状腺疾患、免疫介在性糖尿病、狼瘡、重症筋無力症、自己免疫性神経障害、ギラン・バレー、自己免疫性ブドウ膜炎、自己免疫性溶血性貧血、悪性貧血、自己免疫性血小板減少症、側頭動脈炎、抗リン脂質症候群、血管炎、ヴェーゲナー肉芽腫症、ベーチェット病、疱疹状皮膚炎、尋常性天疱瘡、白斑、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性肝炎、自己免疫性卵巣炎、自己免疫性精巣炎、副腎の自己免疫病、多発性筋炎、皮膚筋炎、脊椎関節症、強直性脊椎炎およびシェーグレン症候群から選択される請求項 2 1 記載の方法。

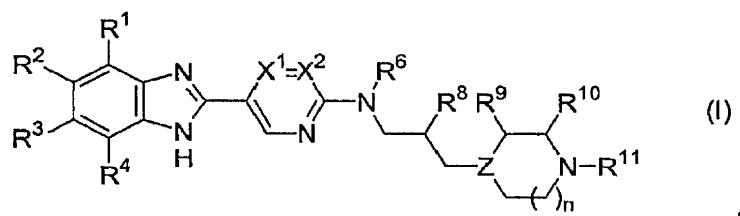
【請求項 2 6】

前記病気、障害または病状がアレルギー、喘息、自己免疫病および搔痒から選択される請求項 2 1 記載の方法。

【請求項 2 7】

ヒスタミンH<sub>4</sub>受容体の活性をモジュレートする方法であって、ヒスタミンH<sub>4</sub>受容体を、有効な量の式 (I) :

【化 4】



〔式中、

R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、C<sub>2</sub> - 4 アルケニル、C<sub>2</sub> - 4 アルキニル、フェニル、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-CN、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-OC<sub>1</sub> - 4 アルキル、-SC<sub>1</sub> - 4 アルキル、-S(O)C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-C(O)C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-C(O)フェニル、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - 4 アルキル、-CO<sub>2</sub>H または -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> であり；かつR<sup>a</sup> およびR<sup>b</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub> - 4 アルキルまたはC<sub>3</sub> - 7 シクロアルキルであり；

X<sup>1</sup> およびX<sup>2</sup> の一方はN でありそしてもう一方はC - R<sup>c</sup> であり；かつ

R<sup>c</sup> は、H、メチル、ヒドロキシメチル、ジメチルアミノメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、-CF<sub>3</sub>、シクロプロピルまたはシクロブチルであり；

n は、1 または 2 であり；

Z は、N、CH または C (C<sub>1</sub> - 4 アルキル) であり；

R<sup>6</sup> は、H、C<sub>1</sub> - 6 アルキルまたは単環式シクロアルキルであり；

R<sup>8</sup> は、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は、各々独立して、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり；そして

R<sup>11</sup> は、H または C<sub>1</sub> - 4 アルキルである]

で表される化合物および式 (I) で表される化合物の塩から選択した少なくとも 1 種の薬剤に接触させることを含んで成る方法。

【請求項 2 8】

前記少なくとも 1 種の薬剤が：

[5 - (5 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル] - [3 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - プロピル] - アミン；



[ 4 - エチル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - イソプロピル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 4 - メチル - 5 - ( 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 - フルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - [ 4 - メチル - 5 - ( 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 - t - ブチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 - クロロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 , 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 5 , 6 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 , 5 - ジフルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - イソプロピル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピラジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ; およびこれらの塩

の中の 1 種である請求項 2 7 記載の方法。

【請求項 2 9】

下記 :

[ 5 - ( 4 , 6 - ビス - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

2 - { 4 - メチル - 2 - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピルアミノ ] - ピリミジン - 5 - イル } - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボニトリル ;  
 [ 5 - ( 5 - メトキシ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 6 - フルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 , 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - エチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - エチル - 5 - ( 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 6 - クロロ - 5 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

およびこれらの製薬学的に許容される塩  
から選択した化学物質。

【請求項 30】

前記少なくとも 1 種の薬剤が下記 :

[ 5 - ( 4 , 6 - ビス - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 2 - { 4 - メチル - 2 - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピルアミノ ] - ピリミジン - 5 - イル } - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボニトリル ;

[ 5 - ( 5 - メトキシ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 6 - フルオロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 , 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - エチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - エチル - 5 - ( 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 6 - クロロ - 5 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

およびこれらの製薬学的に許容される塩

から選択される請求項 1 9 記載の製薬学的組成物。

【請求項 3 1】

前記少なくとも 1 種の薬剤を下記 :

[ 5 - ( 4 , 6 - ビス - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 2 - { 4 - メチル - 2 - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピルアミノ ] - ピリミジン - 5 - イル } - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボニトリル ;  
 [ 5 - ( 5 - メトキシ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - トリフルオロメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 6 - フルオロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 - クロロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 5 , 6 - ジクロロ - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - エチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - エチル - 5 - ( 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 6 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 4 , 6 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 6 - クロロ - 5 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;  
 [ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - メチル - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

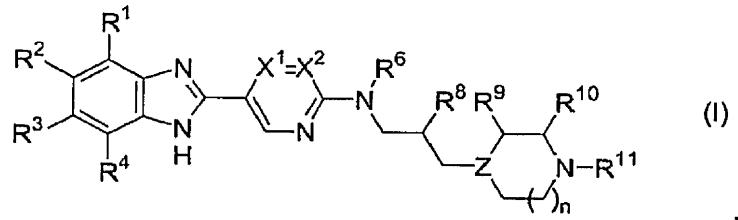
およびこれらの製薬学的に許容される塩

から選択する請求項 2 1 記載の方法。

【請求項 3 2】

式 ( I ) :

【化 5】



[ 式中、

$R^1 \sim R^4$  は、各々独立して、H、 $C_{1 \sim 4}$  アルキル、 $C_{2 \sim 4}$  アルケニル、 $C_{2 \sim 4}$  アルキニル、フェニル、- $CF_3$ 、- $OCF_3$ 、-CN、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-OC<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-SC<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-S(O)C<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-C(O)C<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-C(O)フェニル、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル、-CO<sub>2</sub>H または -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> であり；かつ  $R^a$  および  $R^b$  は、各々独立して、H、 $C_{1 \sim 4}$  アルキルまたは  $C_{3 \sim 7}$  シクロアルキルであり；

$X^1$  および  $X^2$  の一方はNでありそともう一方はC-R<sup>c</sup>であり；

ここで、 $R^c$  は、H、メチル、ヒドロキシメチル、ジメチルアミノメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、-CF<sub>3</sub>、シクロプロピルまたはシクロブチルであり；

$n$  は、1または2であり；

$Z$  は、N、CHまたはC(C<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキル)であり；

$R^6$  は、H、 $C_{1 \sim 6}$  アルキルまたは単環式シクロアルキルであり；

$R^8$  は、HまたはC<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキルであり；

$R^9$  および  $R^{10}$  は、各々独立して、HまたはC<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキルであり；そして

$R^{11}$  は、HまたはC<sub>1</sub><sub>4</sub> アルキルである]

で表される化合物、式(I)で表される化合物の一水化物、式(I)で表される化合物の二水化物または式(I)で表される化合物の半酒石酸塩である、化学物質。

### 【請求項 3 3】

下記：

[5-(5-フルオロ-4-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,6-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(6-フルオロ-4-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,5-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,6-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,6-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-メチル-ピリミジン-2-イル]-メチル-[3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-エチル-ピリミジン-2-イル]-メチル-[3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,5-ジフルオロ-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-エチル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4-フルオロ-5-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-プロピル-ピリミジン-2-イル] - [3-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-プロピル]-アミン；

[5-(4,5-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-4-イソプロピル





[ 4 - シクロプロピル - 5 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 6 - クロロ - 5 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

[ 5 - ( 4 - クロロ - 6 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ) - 4 - メチル - ピリミジン - 2 - イル ] - [ 3 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル ) - プロピル ] - アミン ;

およびこれらの一水化物、二水化物および半酒石酸塩から選択した化学物質。