

【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6月29日 (2017.6.29)

【公開番号】特開2017-81918(P2017-81918A)

【公開日】平成29年5月18日 (2017.5.18)

【年通号数】公開・登録公報2017-018

【出願番号】特願2016-214165(P2016-214165)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/79 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 239/28 (2006.01)

C 0 7 D 239/69 (2006.01)

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

C 0 7 D 491/052 (2006.01)

C 0 7 H 15/26 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4418 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/7064 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/79 C S P

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 239/28

C 0 7 D 239/69 B

C 0 7 D 239/42 Z

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 491/048

C 0 7 D 491/052

C 0 7 H 15/26

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 413/04

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 405/14  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/4418  
 A 6 1 K 31/519  
 A 6 1 K 31/7064  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/14  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 43/00 1 2 3

【手続補正書】

【提出日】平成29年4月21日(2017.4.21)

【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】

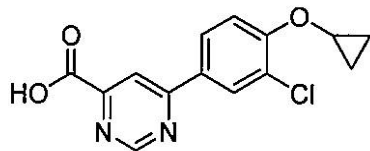
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

脊髄小脳失調、神経変性疾患、精神系または神経系の疾患または障害、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、クロイツフェルト-ヤコブ病、外傷誘発性神経変性、高圧神経症候群、ジストニー、オリブ橋小脳萎縮症、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、癲癇、卒中の結果、脳虚血、卒中（局所的虚血）を含む虚血性障害、低酸素症、多発梗塞性認知症、脳の外傷または損傷の結果、脊髄に対する損傷、認知症、老人性認知症、A I D S 認知症複合、A I D S 誘発性脳症、他の感染関連脳症、ウイルスまたは細菌性髄膜炎、ウイルス、細菌および他の寄生生物によって引き起こされる感染性疾患、ウイルス、細菌または寄生生物によるものを含む一般的な中枢神経系（C N S）感染症、灰白髄炎、ライム病（ボレリア・ブルグドルフェリ感染）敗血症性ショック、マラリア、癌、大脳機能局在、肝性脳症、全身性狼瘡、無痛覚症およびアヘン剤離脱症状を伴う癌、摂食行動、精神障害、不眠症、鬱、統合失調症、作業記憶における重度の欠陥、長期記憶保持における重度の欠陥、認知低下、注意における重度の欠陥、実行機能における重度の欠陥、情報処理の遅滞、神経活動の遅滞、不安、全般性不安障害、パニック不安、強迫性障害、対人恐怖症、演奏不安、外傷後ストレス障害、急性ストレス反応、適応反応、分離不安障害、アルコール離脱不安、うつ病性障害、発育脳または老齢脳の障害、糖尿病、ツレット症候群、ぜい弱X症候群、自閉症スペクトラム障害、思考、感情、言語および他人と関わる能力において重度および広汎性の障害を引き起こす障害、気分障害、情動状態の異常を特徴とする心理的障害、双極性障害、単極性うつ病、大うつ病、内因性うつ病、退行期うつ病、反応性抑うつ、心因性うつ病、基礎疾患によって引き起こされるうつ病、うつ病性障害、循環病、気分変調性障害、全身病状による気分障害、特定不能な気分障害および物質誘発性気分障害、急性壊死性膵炎、A I D S（疾患）、無痛覚症、無菌性髄膜炎、脳疾患、ジル・ド・ラ・ツレット症候群、アスペルガー症候群、レット症候群、広汎発達障害、加齢に伴う脳疾患および発育脳疾患、燃え尽き症候群、一酸化炭素中毒、心停止または心不全および出血性ショック（全脳虚血）、白内障形成および目の加齢、中枢神経系の疾患、脳血管疾患、慢性疲労症候群、慢性ストレス、認知障害、痙攣性障害、大発作および小発作の異型ならびに複合発生型癲癇、真性糖尿病、神経系の疾患、ジスキネジー、L - D O P A 誘導性運動障害、薬物中毒、疼痛および白内障、薬物依存、薬物離脱症状、摂食障害、ギラン-バレー症候群および他の神経障害、肝性脳症、免疫疾患、免疫性障害および生物学的応答の改良を目的とした治療的処置（インターフェロンまたはインターロイキンの投与）、炎症（全身性炎症応答症候群）、中枢および/または末梢神経系の炎症性障害、傷害（外傷、多発外傷）、精神障害および行動障害、代謝疾患、疼痛疾患、

炎症性疼痛、神経障害性疼痛、片頭痛、異痛症、痛覚過敏症疼痛、幻想痛、糖尿病性神経障害に関連する神経障害性疼痛、多臓器不全、溺水、壊死、脳の新生物、リンパ腫および他の悪性血液障害を含む新生物性障害、神経系の疾患（高圧神経症候群、感染）、ニコチン中毒、アルコール依存症、大麻依存、ベンゾジアゼピン依存、バルビツレート依存、モルヒネ依存、コカイン依存、食欲の変化、睡眠障害、睡眠パターンの変化、エネルギー欠乏、疲労、自尊心の低下、不相応な罪に対する自責、死または自殺の頻繁な思考、自殺行為の計画または試行、絶望および無価値の感情、精神運動の煽動または遅滞、思考、集中または決定する能力の低下、神経保護剤、疼痛、外傷後ストレス障害、敗血症、脊髄疾患、脊髄小脳性運動失調、全身性エリテマトーデス、脳および脊髄に対する外傷性損傷、振せん症候群および種々の運動障害（ジスキネジー）、バランス不良、運動緩徐、硬直、振せん、話法の変化、顔の表情の喪失、小字症、嚥下困難、流涎、認知症、錯乱、恐怖、性的機能不全、言語障害、決定力の欠陥、激しい発狂、攻撃性、幻覚、感情鈍麻、抽象的思考の欠陥、心血管疾患、異常リポ蛋白血症、脂質異常症、心臓肥大、アテローム性動脈硬化、心筋梗塞、うっ血性心不全、冠状動脈性心臓病、高血圧症、低血圧症、良性過剰増殖性疾患、悪性過剰増殖性疾患、血管腫、子宮内膜症、肥満、加齢性黄斑変性、網膜症、アテローム性動脈硬化の処置におけるステント留置の結果として再狭窄を引き起こすECおよび平滑筋細胞の増殖、線維芽細胞が関与している過剰増殖性障害、心筋梗塞に伴う心臓リモデリングおよび心不全、過度な創傷治癒、移植片拒絶、対宿主性移植片病、慢性腎臓疾患、全身性炎症性障害、ならびにマラリアおよびアフリカトリバノソーマ症を含む脳の炎症性障害、卒中、ならびに肺炎球菌髄膜炎から選択される疾患または状態の処置のための、式

【化１】



の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項２】

前記疾患または状態が、急性壊死性膵炎、発育脳もしくは老齢脳の障害、精神障害、アルツハイマー病、炎症、癌、統合失調症、神経変性疾患または移植片拒絶である、請求項１に記載の組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】０３４６

【補正方法】変更

【補正の内容】

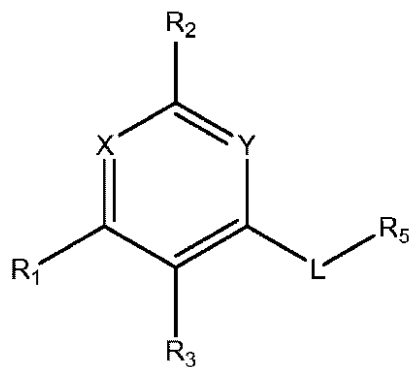
【０３４６】

いくつかの実施形態を示し、記載したが、これらに対して、本発明の趣旨および範囲から逸脱せずに種々の改良および置き換えが行われ得る。例えば、請求項の構成の解釈では、本明細書において以下に示す特許請求の範囲は、なんら文言よりも狭く解釈されることを意図せず、したがって、本明細書の例示的な実施形態が特許請求の範囲に読み替えられることを意図しない。したがって、本発明は、特許請求の範囲の実例として記載したものであって限定するものではないことは理解されよう。

以下は、本発明の実施形態の一つである。

（１）式Ⅰ

## 【化 3 2】



式 I

( 式中 :

X および Y は、独立して - N - および - CH - から選択されるが、ただし、X と Y のうち少なくとも一方は - N - であるものとし；

R<sub>1</sub> は、アリールまたは単環式ヘテロアリールであり、該アリールまたは単環式ヘテロアリールの各々は、

式 - Z - R<sub>6</sub> の第 1 の基、および

第 2 の基

で置換されており、ここで、

Z は、- O -、- S -、- S ( O ) -、- S ( O )<sub>2</sub> -、- C R<sub>1 1</sub> R<sub>1 2</sub> -、- O C R<sub>1 1</sub> R<sub>1 2</sub> -、- N R<sub>1 3</sub> -、- N R<sub>1 3</sub> C R<sub>1 1</sub> R<sub>1 2</sub> -、- C R<sub>1 1</sub> R<sub>1 2</sub> N R<sub>1 3</sub> -、および - C ( O ) - ( 式中、R<sub>1 1</sub>、R<sub>1 2</sub> および R<sub>1 3</sub> は独立して、水素、低級アルキル、ヒドロキシルおよび低級アルコキシから選択される ) から選択され、

R<sub>6</sub> は、水素、任意選択的に置換されている C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるが、ただし、Z が - O - である場合、R<sub>6</sub> は、任意選択的に置換されているベンジルでも任意選択的に置換されているピリジルメチルでもないものとするか、または

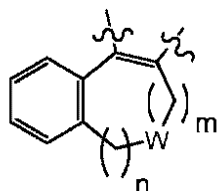
R<sub>6</sub> と R<sub>1 3</sub> が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しており、

該第 2 の基は、ハロおよびハロで任意選択的に置換されている低級アルキルから選択されるか、あるいは

R<sub>1</sub> は、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、クロマン - 6 - イル、1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、ベンゾチオフェン - 5 - イル、ベンゾチアゾール - 5 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、1 H - インドール - 5 - イル、1 H - インダゾール - 5 - イル、イソインドリン - 5 - イル、ベンゾ [ c ] [ 1, 2, 5 ] オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、イミダゾ [ 1, 2 - a ] ピリジン - 6 - イル、ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キナゾリン - 6 - イル、キナゾリン - 7 - イルおよびキノキサリン - 6 - イル ( これらの各々は、任意選択的に置換されている ) から選択されるか、あるいは

R<sub>1</sub> と R<sub>3</sub> が、介在原子と一体となって、式

## 【化 3 3】



(これは任意選択的に置換されており、式中、 $m$ は0または1であり、 $n$ は0または1であるが、ただし、 $m$ と $n$ のうち少なくとも一方は1であり、 $W$ は $-O-$ または $-N(R_8)$  - (式中、 $R_8$ は水素もしくは低級アルキルである)であるものとする)の二環式環を形成しており；

$R_2$ は、水素および任意選択的に置換されている低級アルキルから選択され；

$R_3$ は、水素、ハロ、任意選択的に置換されている低級アルキル、ヒドロキシル、任意選択的に置換されている低級アルコキシ、および任意選択的に置換されているアミノから選択され；

$L$ は、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R_4)-$ 、 $-C(O)N(OR_7)-$ 、 $-N(R_4)S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R_4)-$ 、および $-C(O)N(R_4)-S(O)_2-$ から選択され；

$R_4$ は、水素および低級アルキルから選択され；

$R_5$ は、水素、任意選択的に置換されている低級アルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、任意選択的に置換されているシクロアルキル、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるが、ただし、 $L$ が $-N(R_4)S(O)_2-$ である場合、 $R_5$ は水素でないものとするか、あるいは

$R_4$ と $R_5$ が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている4～7員のヘテロシクロアルキル環を形成しており、該環は、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリールまたは任意選択的に置換されているヘテロアリール環と任意選択的に縮合しているか、あるいは

$R_3$ と $R_5$ が、介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている5～7員の環を形成しており；

$R_7$ は、水素および低級アルキルから選択される)

の化合物ならびにその薬学的に許容され得る塩およびプロドラッグから選択される少なくとも1種類の化学物質であるが、

ただし、式Iの化合物は

6-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-ピリミジン-4-カルボン酸メチルエステル；

6-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-ピリミジン-4-カルボン酸；

6-(3-クロロ-4-メトキシ-フェニル)-ピリミジン-4-カルボン酸メチルエステル；および

6-(3-クロロ-4-メトキシ-フェニル)-ピリミジン-4-カルボン酸から選択されるものではない、化学物質。

(2)  $R_1$ が、

式 $-Z-R_6$ の第1の基(式中、 $Z$ は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、および $-CR_{11}R_{12}-$ から選択され； $R_6$ は、水素、任意選択的に置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択される)、ならびに

ハロおよびハロで任意選択的に置換されている低級アルキルから選択される第2の基で置換されているフェニルである、(1)に記載の少なくとも1種類の化学物質。

( 3 ) Z が - O - である、( 1 ) または ( 2 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 4 ) Z が - S - である、( 1 ) または ( 2 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 5 ) Z が - S ( O ) <sub>2</sub> - である、( 1 ) または ( 2 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 6 ) Z が - C R <sub>1 1</sub> R <sub>1 2</sub> - である、( 1 ) または ( 2 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 7 ) R <sub>6</sub> が、水素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エチル、イソプロピル、( S ) - s e c - ブチル、( R ) - s e c - ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、2 - モルホリン - 4 - イル - エチル、2 - ピペリジン - 1 - イル - エチル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロ - フラン - 3 - イルから選択される、( 1 ) ~ ( 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 8 ) R <sub>1</sub> が、3 - クロロ - 4 - シクロブトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロペンチルオキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - イソプロボキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル、[ 4 - クロロ - 3 - ( 2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ ) - フェニル、3 - クロロ - 4 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ ) - フェニル、3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル、4 - ( S ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル、4 - ( R ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル、4 - クロロ - 3 - ( テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ ) - フェニル、3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - ( 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エトキシ、3 - メトキシ - フェニル、4 - メトキシ - フェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3 - クロロ - 4 - イソプロピルフェニル、3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル、および 3 - フルオロ - 4 - イソプロピルフェニル、3, 4 - ビス ( メチルスルファニル ) フェニル、3, 4 - ビス ( メチルスルホニル ) フェニル、3, 4 - ビス ( トリフルオロメトキシ ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( ジフルオロメトキシ ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( メチルスルファニル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( メチルスルホニル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメトキシ ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( シクロプロボキシメチル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルメチル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( シクロプロパンスルフィニル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - ( シクロプロパンスルホニル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - [ シクロプロピル ( ヒドロキシ ) メチル ] フェニル、3 - クロロ - 4 - ( 1 - シクロプロボキシエチル ) フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロパンカルボニルフェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロピルフェニル、4 - ( アジリジン - 1 - イルメチル ) - 3 - クロロフェニル、3 - クロロ - 4 - [ ( ジメチルアミノ ) メチル ] フェニル、3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルアミノ ) フェニル、3 - クロロ - 4 - [ シクロプロピル ( メチル ) アミノ ] フェニル、3 - クロロ - 4 - [ ( シクロプロピルアミノ ) メチル ] フェニル、3 - クロロ - 4 - { [ シクロプロピル ( メチル ) アミノ ] メチル } フェニル、3 - クロロ - 4 - ( 1 - メトキシシクロプロピル ) フェニル、4 - クロロ - 3 - [ ( 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) オキシ ] フェニル、4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメトキシ ) フェニル、4 - クロロ - 3 - ( 2 - メチルプロボキシ ) フェニル、4 - クロロ - 3 - ( プロパン - 2 - イルオキシ ) フェニル、4 - クロロ - 3 - ( プロパン - 2 - イルオキシ ) フェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、4 - クロロ - 3 - シクロプロボキシフェニル、および 3 - クロロ - 4 - { [ 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパン - 2 - イル ] オキシ } フェニルから選択される、( 1 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 9 ) R <sub>1</sub> が、3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメトキシ ) フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロブトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - イソプロボキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル、4 - ( S ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル、4 - ( R ) - s e c - ブトキ

シ - 3 - クロロ - フェニル、4 - クロロ - 3 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ) - フェニル、3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エトキシ、3 - メトキシ - フェニル、4 - メトキシ - フェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3 - クロロ - 4 - イソプロピルフェニル、3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル、および 3 - フルオロ - 4 - イソプロピルフェニル、3, 4 - ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - クロロ - 4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル、3 - クロロ - 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロポキシメチル)フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルメチル)フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロパンスルフィニル)フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロパンスルホニル)フェニル、3 - クロロ - 4 - [シクロプロピル(ヒドロキシ)メチル]フェニル、3 - クロロ - 4 - (1 - シクロプロポキシエチル)フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロパンカルボニルフェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロピルフェニル、4 - (アジリジン - 1 - イルメチル) - 3 - クロロフェニル、3 - クロロ - 4 - [(ジメチルアミノ)メチル]フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルアミノ)フェニル、3 - クロロ - 4 - [シクロプロピル(メチル)アミノ]フェニル、3 - クロロ - 4 - [(シクロプロピルアミノ)メチル]フェニル、3 - クロロ - 4 - {[シクロプロピル(メチル)アミノ]メチル}フェニル、3 - クロロ - 4 - (1 - メトキシシクロプロピル)フェニル、4 - クロロ - 3 - [(1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル)オキシ]フェニル、4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、4 - クロロ - 3 - (2 - メチルプロポキシ)フェニル、4 - クロロ - 3 - (プロパン - 2 - イルオキシ)フェニル、4 - クロロ - 3 - (プロパン - 2 - イルオキシ)フェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、および 4 - クロロ - 3 - シクロプロポキシフェニルから選択される、(8)に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

(10)  $R_1$  が、1, 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル、クロマン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、イミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 6 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、キノリン - 6 - イル、およびピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 5 - イル(これらの各々は、ハロ、ハロで任意選択的に置換されている低級アルキル、シクロアルキル、およびハロで任意選択的に置換されている低級アルコキシから選択される 1 つまたは 2 つの基で任意選択的に置換されている)から選択される、(1)に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

(11)  $R_1$  が、1, 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル、2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル、8 - クロロ - クロマン - 6 - イル、7 - クロロ - ベンゾフラン - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - メチル - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、8 - クロロイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 6 - イル、4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、キノリン - 6 - イル、およびピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 5 - イルから選択される、(10)に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

(12)  $R_1$  が、1, 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル、2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル、8 - クロロ - クロマン - 6 - イル、7 - クロロ - ベンゾフラン - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - メチル - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、8 - クロロイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 6 - イル、4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、キノリン - 6 - イル、およびピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 5 - イルから選択される、(11)に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 3 )  $R_2$  が水素である、( 1 ) ~ ( 1 2 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 4 )  $R_2$  が低級アルキルである、( 1 ) ~ ( 1 2 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 5 )  $R_2$  がメチルまたはエチルである、( 1 4 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 6 )  $R_2$  がメチルである、( 1 5 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 7 )  $R_3$  が水素である、( 1 ) ~ ( 1 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 8 )  $R_3$  がフルオロまたはクロロである、( 1 ) ~ ( 1 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 1 9 )  $R_3$  がメチルである、( 1 ) ~ ( 1 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 0 )  $R_3$  が  $-CH_2OH$  である、( 1 ) ~ ( 1 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 1 )  $X$  が  $-N-$  である、( 1 ) ~ ( 2 0 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 2 )  $Y$  が  $-N-$  である、( 1 ) ~ ( 2 0 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 3 )  $X$  と  $Y$  が  $-N-$  である、( 1 ) ~ ( 2 0 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 4 )  $L$  が  $-C(O)O-$  である、( 1 ) ~ ( 2 3 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 5 )  $L$  が  $-C(O)N(R_4)-$  である、( 1 ) ~ ( 2 3 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 6 )  $L$  が  $-N(R_4)S(O)_2-$  である、( 1 ) ~ ( 2 3 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

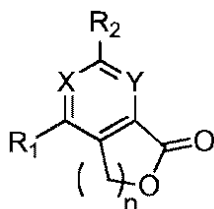
( 2 7 )  $R_4$  が水素である、( 2 5 ) または ( 2 6 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 8 )  $R_5$  が低級アルキルである、( 1 ) ~ ( 2 7 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 2 9 )  $R_5$  が水素である、( 1 ) ~ ( 2 7 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 3 0 ) 式 I の化合物が、式 I I

【化 3 4】



式 II

( 式中、 $n$  は 1 および 2 から選択される )

の化合物から選択される、( 1 ) ~ ( 1 6 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 3 1 )  $n$  が 1 である、( 3 0 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 3 2 )  $n$  が 2 である、( 3 0 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 3 3 ) 式 I の化合物が、

6 - ( 4 - クロロ - 3 - メトキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、



6 - ( 3 - アミノ - 4 - クロロ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸ピリジン - 3 - イルアミド、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( 2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸ピリジン - 3 - イル - アミド、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - イソプロピル - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - フルオロ - 4 - メチル - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - イソプロボキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - イソプロボキシ - フェニル ) - 2 - メチル - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - フルオロ - 4 - メチル - フェニル ) - 2 - メチル - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロペンチルオキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - フルオロ - 4 - イソプロピル - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - ( R ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - ( S ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エトキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
4 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシ - フェニル ) - ピリジン - 2 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - ( R ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル ) - ピリジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - ( S ) - s e c - ブトキシ - 3 - クロロ - フェニル ) - ピリジン - 4 - カルボン酸、  
4 - ( 3 - クロロ - 4 - イソプロボキシ - フェニル ) - ピリジン - 2 - カルボン酸、  
4 - ( 3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - ピリジン - 2 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロブトキシ - フェニル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - キノリン - 6 - イル - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 8 - クロロ - クロマン - 6 - イル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロ - ベンゾフラン - 5 - イル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 8 - クロロ - 1 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル ) - ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 8 - クロロキノリン - 6 - イル ) - ピリミジン - 4 - カルボキシレート、  
N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - ピリミジン - 4 - イル ] - ベンゼンスルホンアミド、  
N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - ピリミジン - 4 - イル ] - 4 - フルオロベンゼン - 1 - スルホンアミド、

N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] -  
4 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンゼン - 1 - スルホンアミド、  
N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] -  
3 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンゼン - 1 - スルホンアミド、  
N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] -  
2 - フルオロベンゼン - 1 - スルホンアミド、  
N - [ 6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] シ  
クロプロパンスルホンアミド、  
6 - ( 8 - クロロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル ) ピリミジン -  
4 - カルボキシレート、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - 5 - メチルピリミジン - 4 - カ  
ルボキシレート、  
6 - { 3 - クロロ - 4 - [ 2 - ( モルホリン - 4 - イル ) エトキシ ] フェニル } ピリミ  
ジン - 4 - カルボキシレート、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カル  
ボキシレート、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( オキセタン - 3 - イルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 -  
カルボキシレート、  
4 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - 5 H , 7 H - フロ [ 3 , 4 - d  
] ピリミジン - 7 - オン、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - 5 - ( ヒドロキシメチル ) ピリ  
ミジン - 4 - カルボン酸、  
4 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) - 5 H , 6 H , 8 H - ピラノ [ 3  
, 4 - d ] ピリミジン - 8 - オン、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロボキシフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸 [ (  
2 R , 3 S , 4 S , 5 R ) - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロキシアキサン - 2 - イル ] メ  
チル、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - { [ 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパン - 2 - イル ] オキ  
シ } フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロボキシメチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カル  
ボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルメチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボ  
ン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルスルファニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 -  
カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロパンスルフィニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 -  
カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロパンスルホニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸、  
6 - { 3 - クロロ - 4 - [ シクロプロピル ( ヒドロキシ ) メチル ] フェニル } ピリミジ  
ン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - シクロプロボキシエチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 -  
カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロパニルカルボニルフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボ  
ン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロピルフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 4 - ( アジリジン - 1 - イルメチル ) - 3 - クロロフェニル ] ピリミジン - 4 -  
カルボン酸、  
6 - { 3 - クロロ - 4 - [ ( ジメチルアミノ ) メチル ] フェニル } ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( シクロプロピルアミノ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [ シクロプロピル ( メチル ) アミノ ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [ ( シクロプロピルアミノ ) メチル ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - { [ シクロプロピル ( メチル ) アミノ ] メチル } フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( フラン - 2 - イル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メトキシシクロプロピル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 8 - クロロイミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 6 - イル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - クロロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( キノリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - クロロ - 3 - シクロプロポキシフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( プロパン - 2 - イルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( 2 - メチルプロポキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 4 - クロロ - 3 - [ ( 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( ベンゾ [ d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 2 , 2 - ジフルオロベンゾ [ d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ b ] [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロベンゾ [ b ] チオフェン - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロベンゾ [ d ] チアゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロベンゾ [ c ] [ 1 , 2 , 5 ] オキサジアゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 , 3 , 3 a , 7 a - テトラヒドロベンゾフラン - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 3 a , 7 a - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 1 - メチル - 3 a , 7 a - ジヒドロ - 1 H - インダゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 8 - クロロキナゾリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 5 - クロロキナゾリン - 7 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 8 - クロロキノキサリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 8 - クロロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メチルシクロプロピル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 - ( トリフルオロメチル ) シクロプロピル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 3 - メチルオキセタン - 3 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 3 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( ピロリジン - 2 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 H - ピロール - 2 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - t e r t - ブチル - 3 - クロロフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、および

7 - クロロ - 8 - シクロプロボキシ - 5 H - クロメノ [ 4 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - カルボン酸

から選択される、( 1 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。

( 3 4 ) 式 I の化合物が、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( メチルスルファニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( メチルスルフィニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( メチルスルホニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [ シクロプロピル ( ヒドロキシ ) メチル ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロパンカルボニルフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( メトキシメチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メトキシエチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [ (ジメチルアミノ) メチル ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルアミノ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [シクロプロピル (メチル) アミノ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 8 - クロロキノキサリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - クロロ - 2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 2 H - 1 , 3 - ベンゾジオキサソール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
4 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - メチルピリジン - 2 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - { [ 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパン - 2 - イル ] オキシ } フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - (シクロプロボキシメチル) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルメチル) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - シクロプロボキシエチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - シクロプロピルフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 4 - (アジリジン - 1 - イルメチル) - 3 - クロロフェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 3 - クロロ - 4 - [ (シクロプロピルアミノ) メチル ] フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 3 - クロロ - 4 - { [シクロプロピル (メチル) アミノ] メチル } フェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - (フラン - 2 - イル) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メトキシシクロプロピル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 7 - クロロ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - { 8 - クロロイミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 6 - イル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - ( 4 - クロロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、

6 - (キノリン - 6 - イル) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - {ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル} ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - クロロ - 3 - シクロプロポキシフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - (プロパン - 2 - イルオキシ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( 2 - メチルプロポキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボ  
ン酸、  
6 - [ 4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル ] ピリミジン - 4 - カルボ  
ン酸、  
6 - { 4 - クロロ - 3 - [ ( 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) オキシ ]  
フェニル } ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 2 , 2 - ジフルオロベンゾ [ d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル ) ピリミジ  
ン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ b ] [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) ピリミジン -  
4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロベンゾ [ b ] チオフェン - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロベンゾ [ d ] チアゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸  
、  
6 - ( 7 - クロロベンゾ [ c ] [ 1 , 2 , 5 ] オキサジアゾール - 5 - イル ) ピリミジ  
ン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロ - 3 a , 7 a - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イル ) ピリミジン  
- 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロ - 1 - メチル - 3 a , 7 a - ジヒドロ - 1 H - インダゾール - 5 - イ  
ル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 8 - クロロキナゾリン - 6 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 5 - クロロキナゾリン - 7 - イル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 7 - クロロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル ) ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メチルシクロプロピル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 - (トリフルオロメチル) シクロプロピル ) フェニル ) ピ  
リミジン - 4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 3 - メチルオキセタン - 3 - イル ) フェニル ) ピリミジン -  
4 - カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - (ピロリジン - 2 - イル) フェニル) ピリミジン - 4 - カルボ  
ン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4  
- カルボン酸、  
6 - ( 3 - クロロ - 4 - ( 1 H - ピロール - 2 - イル ) フェニル ) ピリミジン - 4 - カ  
ルボン酸、  
6 - ( 4 - t e r t - ブチル - 3 - クロロフェニル ) ピリミジン - 4 - カルボン酸、お  
よび  
7 - クロロ - 8 - シクロプロポキシ - 5 H - クロメノ [ 4 , 3 - d ] ピリミジン - 4 -  
カルボン酸  
から選択される、( 1 ) に記載の少なくとも 1 種類の化学物質。  
( 3 5 ) ( 1 ) ~ ( 3 4 ) のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化学物質および少なく  
とも 1 種類の薬学的に許容され得る賦形剤を含む医薬組成物。  
( 3 6 ) キヌレニン 3 - モノ - オキシゲナーゼ活性によって媒介される状態または障害の

処置を、かかる処置を必要とする被験体において行う方法であって、該被験体に治療有効量の（１）～（３４）のいずれかに記載の少なくとも１種類の化学物質を投与する工程を含む方法。

（３７）前記状態または障害が神経変性病態を伴うものである、（３６）に記載の方法。

（３８）（３５）に記載の少なくとも１種類の医薬組成物、およびキヌレニン３-モノ-オキシゲナーゼ活性によって媒介される状態または障害に苦しんでいる被験体を処置するために該組成物を使用するための使用説明書を含む、パッケージ化医薬組成物。

（３９）前記状態または障害がハンティングトン病である、（３８）に記載のパッケージ化医薬組成物。