

【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6月7日(2007.6.7)

【公表番号】特表2006-524645(P2006-524645A)

【公表日】平成18年11月2日(2006.11.2)

【年通号数】公開・登録公報2006-043

【出願番号】特願2006-505114(P2006-505114)

【国際特許分類】

|                |           |
|----------------|-----------|
| C 07 D 239/42  | (2006.01) |
| A 61 K 31/505  | (2006.01) |
| A 61 K 31/506  | (2006.01) |
| C 07 D 403/12  | (2006.01) |
| C 07 D 405/12  | (2006.01) |
| A 61 K 31/5377 | (2006.01) |
| C 07 D 403/04  | (2006.01) |
| C 07 D 403/06  | (2006.01) |
| A 61 P 43/00   | (2006.01) |
| A 61 P 11/06   | (2006.01) |
| A 61 P 37/08   | (2006.01) |
| A 61 P 27/16   | (2006.01) |
| A 61 P 17/00   | (2006.01) |
| A 61 P 27/14   | (2006.01) |
| A 61 P 35/02   | (2006.01) |

【F I】

|                |         |
|----------------|---------|
| C 07 D 239/42  | C S P Z |
| A 61 K 31/505  |         |
| A 61 K 31/506  |         |
| C 07 D 403/12  |         |
| C 07 D 405/12  |         |
| A 61 K 31/5377 |         |
| C 07 D 403/04  |         |
| C 07 D 403/06  |         |
| A 61 P 43/00   | 1 2 3   |
| A 61 P 11/06   |         |
| A 61 P 37/08   |         |
| A 61 P 27/16   |         |
| A 61 P 17/00   |         |
| A 61 P 27/14   |         |
| A 61 P 35/02   |         |
| A 61 P 43/00   | 1 1 1   |

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月11日(2007.4.11)

【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

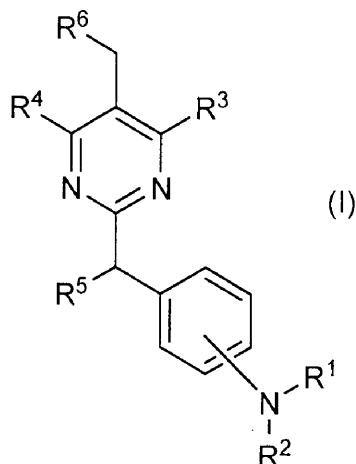
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

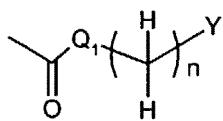
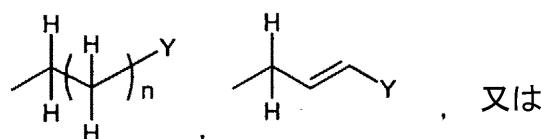
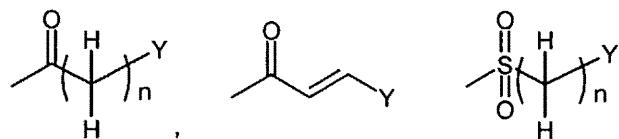
式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

## 【化 1】



上記式において、R<sup>1</sup>は水素原子、

## 【化 2】



を表わし、

上記式において、nは0～6の整数を表わし、

-Q<sub>1</sub>-は、-NH-、-N(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)-、又は-O-を表わし、

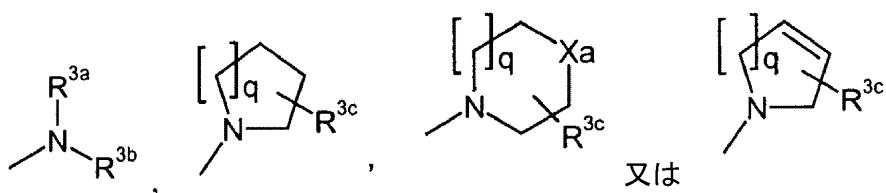
Yは、水素原子、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルで任意に置換されているC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>シクロアルキル、ベンゼンと結合しているC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>シクロアルキル、アリール又はヘテロアリール(式中、前記アリール及びヘテロアリールは、置換し得る位置で、シアノ、ハロゲン、ニトロ、グアニジノ、ピロリル、スルファモイル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)アミノスルホニル、フェニルオキシ、フェニル、アミノ、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(

$C_{1-6}$ アルキル)アミノ,  $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル,  $C_{1-6}$ アルカノイル,  $C_{1-6}$ アルカノイルアミノ, カルバモイル,  $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル, ジ-( $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイル,  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル, モノ-, ジ-, 又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキル、モノ-, ジ-, 又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、及びモノ-, ジ-, 又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルチオからなる群から選択される1以上の置換基で任意に置換される)、あるいは1,3-ジオキソランと結合しているアリールを表わし;

$R_2$ は水素原子又は $C_{1-6}$ アルキルを表わし;

$R_3$ はハロゲン、モノ-, ジ-, 又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、

【化3】



を表わし、

上記式において、 $R^{3a}$ 及び $R^{3b}$ は、独立に $C_{3-8}$ シクロアルキル又は $C_{1-6}$ アルキルを表わし、該 $C_{1-6}$ アルキルは、ヒドロキシ、カルボキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、カルバモイル、 $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル、アリール-置換された $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル、 $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルカルバモイル、 $C_{3-8}$ ヘテロシクロカルボニル、( $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ又は $C_{1-6}$ アルコキシで任意に置換されており、

$q$ は1~3の整数を表わし;

$R^{3c}$ は、水素原子、ヒドロキシ、カルボキシ、あるいはヒドロキシ、カルボキシ又は(フェニル-置換 $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイルで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わし;

$Xa$ は-0-, -S-又は- $N(R^{3d})$ -を表わし、

$R^{3d}$ は $C_{1-6}$ アルキルを表わし;

$R^4$ は、水素原子、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、あるいは $C_{1-6}$ アルコキシ、若しくはモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わし;

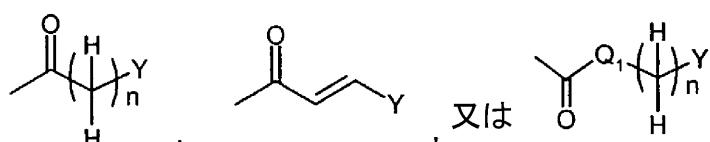
$R^5$ は水素原子又は $C_{1-6}$ アルキルを表わし;かつ

$R^6$ はカルボキシ、カルボキシアミド、ニトリル又はテトラゾリルを表わす。

【請求項2】

$R^1$ が

【化4】



で表され、

上記式において、nが0～2の整数を表し、

-Q<sub>1</sub>-が、-NH-、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)-、又は-O-を表わし；

Yが、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキルで任意に置換されているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、インデニル、及びテトラヒドロナフチルからなる群から選択される、ベンゼンと結合しているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、フェニル及びナフチルからなる群から選択されるアリール、あるいはインドリル、キノリル、ベンゾフラニル、フラニル、クロマニル、及びピリジルからなる群から選択されるヘテロアリールを表わし、式中、前記アリール及びヘテロアリールは、置換し得る位置で、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ピロリル、スルファモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル、フェニルオキシ、フェニル、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1-6</sub>アルカノイルアミノ、カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、ジ-(C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルコキシ、及びモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルチオからなる群から選択される1以上の置換基で任意に置換されており；かつ

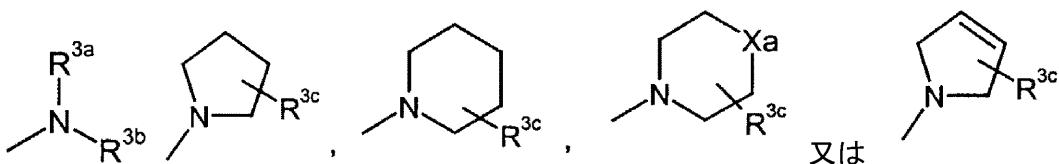
R<sup>2</sup>が水素原子を表わす、

請求項1記載の、式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

#### 【請求項3】

R<sup>3</sup>がモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルコキシ、

#### 【化5】



を表わし、

上記式において、R<sup>3a</sup>及びR<sup>3b</sup>は、独立にヒドロキシ、カルボキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルカルバモイル、C<sub>3-8</sub>ヘテロシクロカルボニル、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ又はC<sub>1-6</sub>アルコキシで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし、

R<sup>3c</sup>は、水素原子、ヒドロキシ、カルボキシ、あるいはヒドロキシ、カルボキシ、又は(フェニル-置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイルで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし；かつ

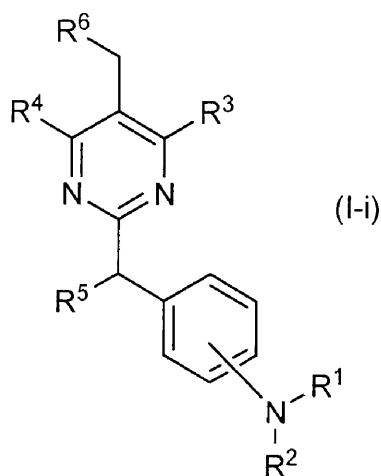
X<sup>a</sup>は、-O-、-S-又は-N(R<sup>3d</sup>)-を表わし、R<sup>3d</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキルを表わす、

請求項1記載の、式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

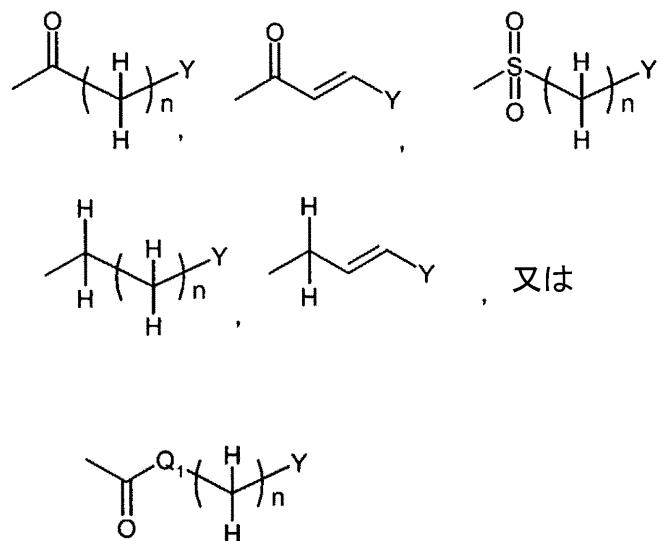
#### 【請求項4】

式(I-i)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

【化6】

上記式において、R<sup>1</sup>は水素原子、

【化7】



を表わし、

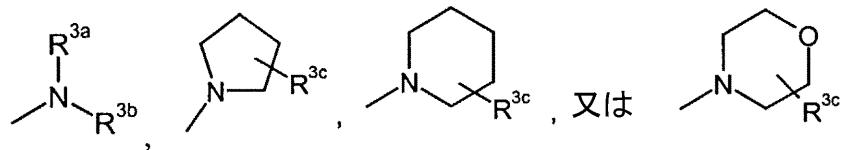
上記式において、nは0～2の整数を表し、

-Q<sub>1</sub>-は、-NH-、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)-、又は-O-を表わし；

Yは、フェニル、ナフチル、インドリル、キノリル、ベンゾフラニル、フラニル又はピリジルを表わし、

式中、前記フェニル、ナフチル、インドリル、キノリル、ベンゾフラニル、フラニル及びピリジルは、置換し得る位置で、シアノ、ハロゲン、ニトロ、フェニルオキシ、フェニル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルコキシ、及びモノ-、ジ-、又はトリハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルチオからなる群から選択される1個又は2個の置換基で任意に置換されており、R<sup>2</sup>は、水素原子又はC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし；

$R^3$  は  
【化 8】



を表わし、

上記式において、

$R^{3a}$  及び  $R^{3b}$  は、独立に、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、あるいは  $C_{3-8}$  シクロアルキル、カルバモイル、 $C_{1-6}$  アルキルカルバモイル、フェニル-置換された  $C_{1-6}$  アルキルカルバモイル、 $C_{1-6}$  アルキルカルバモイル、ジ( $C_{1-6}$  アルキル)カルバモイル、 $C_{3-8}$  シクロアルキルカルバモイル、 $C_{3-8}$  ヘテロシクロカルボニル、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$  アルキル)アミノ又は  $C_{1-6}$  アルコキシで任意に置換されている  $C_{1-6}$  アルキルを表わし、

$R^{3c}$  は、水素原子、ヒドロキシ、カルボキシ、あるいはヒドロキシ、カルボキシ又は(フェニル-置換された  $C_{1-6}$  アルキル)カルバモイルで任意に置換されている  $C_{1-6}$  アルキルを表わし；

$R^4$  は、水素原子、塩素、臭素、 $C_{1-6}$  アルコキシ、ジ( $C_{1-6}$  アルキル)アミノ、又は  $C_{1-6}$  アルコキシで任意に置換されている  $C_{1-6}$  アルキルを表わし；

$R^5$  は水素原子又はメチルを表わし；かつ

$R^6$  はカルボキシ又はテトラゾリルを表わす。

#### 【請求項 5】

式(I)の上記ピリミジン誘導体が、下記化合物からなる群から選択される、請求項1記載の、式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

{4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-{メチル[2-オキソ-2-(1-ピロリジニル)エチル]アミノ}-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(イソプロピルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロヘキシルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{2-[4-(ベンゾイルアミノ)ベンジル]-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-2-{4-[(シクロヘキシルアセチル)アミノ]ベンジル}-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(3-フェニルプロパノイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-[(4-メチルフェニル)アセチル]アミノ)ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(2-キノリニルカルボニル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-[(2E)-3-フェニル-2-プロペノイル]アミノ)ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(4-メトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-[4-(1-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{2-{4-[(1-ベンゾフラン-2-イルカルボニル)アミノ]ベンジル}-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(1H-インドール-2-イルカルボニル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-2-{4-[(4-シアノベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-{4-[(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルアセチル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-[(3-フェノキシフェニル)アセチル]アミノ)ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-[(4-フェノキシフェニル)アセチル]アミノ)ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
(4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(2-キノリニルカルボニル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-(4-[(2E)-3-フェニル-2-プロペノイル]アミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-(ジメチルアミノ)ベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,4-ジメトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,4-ジメトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-(ジメチルアミノ)ベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-(4-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)-2-プロペノイル]アミノ)ベンジル]-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[2-{4-[(4-ブロモベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(2,5-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,4-ジフルオロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,5-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル} 酢酸；  
(4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(3-メトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル} 酢酸；

{4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-[3-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル}酢酸；  
[2-(4-{[(4-tert-ブチルシクロヘキシル)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-ニトロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[2-(4-{[4-(アセチルアミノ)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)-4-クロロ-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-フェノキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-イソプロポキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-6-(1-ピロリジニル)-2-{4-[(4-(1H-ピロール-1-イル)ベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-メトキシ-3-ニトロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(4-メトキシ-3,5-ジメチルベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(2E)-3-フェニル-2-プロペノイル]アミノ}ベンジル]-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル}酢酸；  
(4-クロロ-2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル)酢酸；  
[4-クロロ-6-ピロリジン-1-イル-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
[4-クロロ-2-(4-{[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル)-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル]酢酸；  
{4-クロロ-6-[(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]ピリミジン-5-イル}酢酸；  
[4-クロロ-2-(4-{[(2S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-2-イルカルボニル]アミノ}ベンジル)-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
{4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-[4-({(2E)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパ-2-エノイル}アミノ)ベンジル]ピリミジン-5-イル}酢酸；  
{4-(ジメチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル}酢酸；  
{4-[(2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル)(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル}酢酸；  
{4-{メチル[2-オキソ-2-(1-ピロリジニル)エチル]アミノ}-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル}酢酸；  
{2-[4-(ベンゾイルアミノ)ベンジル]-4-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル}酢酸；  
[4-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-{[(2E)-3-フェニル-2-プロペノイル]アミノ}ベンジル)-5-ピリミジニル]酢酸；  
[2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル]酢酸；  
(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(4-メトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル)酢酸；  
[2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル]

ル] 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(2-キノリニルカルボニル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル) 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{[(2E)-3-フェニル-2-プロペノイル]アミノ}ベンジル)-5-ピリミジニル] 酢酸；

[2-(4-{[(2E)-3-(4-クロロフェニル)-2-プロペノイル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)-5-ピリミジニル] 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(3-メトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル) 酢酸；

[2-{4-[(3-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル] 酢酸；

[2-{4-[(4-ブロモベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-5-ピリミジニル] 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-2-[4-{[(2E)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{1-[4-(2-ナフトイルアミノ)フェニル]エチル}ピリミジン-5-イル) 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{[4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(4-フルオロベンゾイル)アミノ]ベンジル} ピリミジン-5-イル) 酢酸；

[2-(1-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]フェニル}エチル)-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-2-[1-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}フェニル)エチル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-2-[1-(4-{[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]アミノ}フェニル)エチル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(1-{4-[(キノリン-2-イルカルボニル)アミノ]フェニル}エチル) ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-(1-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]フェニル}エチル)-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(1-{4-[(4-フルオロベンゾイル)アミノ]フェニル}エチル) ピリミジン-5-イル] 酢酸；

(4-ピロリジン-1-イル-2-{4-[(キノリン-2-イルカルボニル)アミノ]ベンジル} ピリミジン-5-イル) 酢酸；

(2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル) 酢酸；

(2-{4-[(4-フルオロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル) 酢酸；

[4-ピロリジン-1-イル-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

{2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-4-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル} 酢酸；  
(2-{4-[(3-メチルブタノイル)アミノ]ベンジル}-4-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル) 酢酸ナトリウム；

(2-{4-[(3,3-ジメチルブタノイル)アミノ]ベンジル}-4-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル) 酢酸；

[4-クロロ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；

N-{5-(カルボキシメチル)-6-クロロ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-4-ピリミジニル}-N-メチルグリシン；  
{4-クロロ-6-[シクロヘキシル(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[イソプロピル(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-(4-モルフォリニル)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-6-(1-ペペリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；  
(4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(1H-インドール-6-イルカルボニル)アミノ]ベンジル}-5-ピリミジニル) 酢酸；  
{4-クロロ-6-メトキシ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-(2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-1-イル)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-(ジエチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[エチル(メチル)アミノ]-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-(3-ヒドロキシ-1-ピロリジニル)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
1-{5-(カルボキシメチル)-6-クロロ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-4-ピリミジニル}-L-プロリン；  
[4-クロロ-2-(4-{[4-(メチルチオ)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；  
[4-クロロ-2-{4-[(3-クロロ-4-メトキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；  
{2-{4-[(アニリノカルボニル)アミノ]ベンジル}-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{2-(4-{[(ベンジルアミノ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
{4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-[4-({[(2-フェニルエチル)アミノ]カルボニル}アミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-2-(4-{[(2-ナフチルアミノ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-5-ピリミジニル] 酢酸；  
[2-(4-{[(ベンジルアミノ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
[2-[4-({[ベンジル(メチル)アミノ]カルボニル}アミノ)ベンジル]-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
{4-(ジメチルアミノ)-6-(4-モルフォリニル)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4,6-ビス(ジメチルアミノ)-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
{4,6-ビス(ジメチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-5-ピリミジニル} 酢酸；  
[4-(ジメチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；  
[4-(ジメチルアミノ)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-6-(1-ペペリジニル)-5-ピリ

ミジニル] 酢酸；

[2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4,6-ビス(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4,6-ビス(ジメチルアミノ)-2-(4-{{[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-(4-{{[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル}-4,6-ビス(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-(4-{{[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{{[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル}-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-ピロリジン-1-イル-2-(4-{{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-{4-[(ビフェニル-3-イルカルボニル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-{4-[(ビフェニル-4-イルカルボニル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-モルフォリン-4-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-モルフォリン-4-イル-2-(4-{{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-モルフォリン-4-イル-2-(4-{{[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(3-フェノキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

(4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(4-フェノキシベンゾイル)アミノ]ベンジル}-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{{[(2E)-3-(4-メトキシフェニル)プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル}-6-モルフォリン-4-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-(4-{{[(2E)-3-(2-メトキシフェニル)プロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル}-6-モルフォリン-4-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-ピロリジン-1-イルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-メチル-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；

[2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-メチル-6-(1-ピロリジニル)-5-ピリミジニル] 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-6-メチル-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

[2-{4-[(3,4-ジクロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-メチルピリミジン-5-イル] 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-メチル-2-(4-{{[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-6-(メトキシメチル)-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-(メトキシメチル)-2-(4-{{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル} ピリミジン-5-イル] 酢酸；

{4-(ジメチルアミノ)-6-エチル-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-6-エチル-2-(4-{{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベン

ジル) ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
 {4-(ジメチルアミノ)-6-イソプロピル-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；  
 [4-(ジメチルアミノ)-6-イソプロピル-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノ}ベンジル) ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
 [2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
 {4-(ジメチルアミノ)-2-[4-({[(4-フルオロベンジル)オキシ]カルボニル}アミノ}ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；  
 [2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル] 酢酸；  
 {4-(ジメチルアミノ)-2-[4-({[(4-ニトロベンジル)オキシ]カルボニル}アミノ}ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；  
 {4,6-ジクロロ-2-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル] ピリミジン-5-イル} 酢酸；  
 N-(4-{[5-(2-アミノ-2-オキソエチル)-4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-2-イル]メチル}フェニル)-2-ナフトアミド；及び  
 N-(4-{[4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)-5-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)ピリミジン-2-イル]メチル}フェニル)-2-ナフトアミド。

【請求項 6】

$R^6$ がカルボキシアミド、ニトリル、又はテトラゾリルを表わす、請求項 1 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項 7】

$-Q_1-$ が-N ( $C_{1-6}$ アルキル)-又は-0-を表わす、請求項 1 又は 6 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項 8】

$Y$ が $C_{1-6}$ アルキルを表わす、請求項 1、6、又は 7 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項 9】

$R^{3a}$ 及び / 又は $R^{3b}$ が、ヒドロキシで置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わす、請求項 1、6、7、又は 8 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項 10】

$R^4$ が $C_{1-6}$ アルコキシで置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わす、請求項 1、6、7、8、又は 9 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

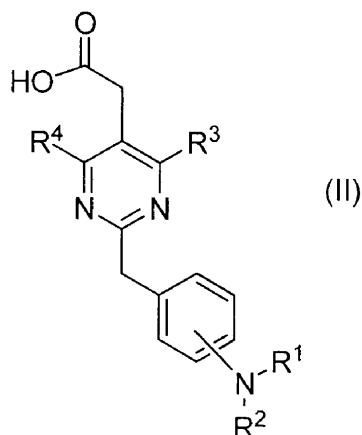
【請求項 11】

$R^5$ が $C_{1-6}$ アルキルを表わす、請求項 1、6、7、8、9、又は 10 記載の、式 (I) のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

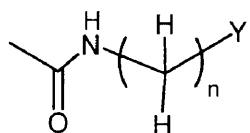
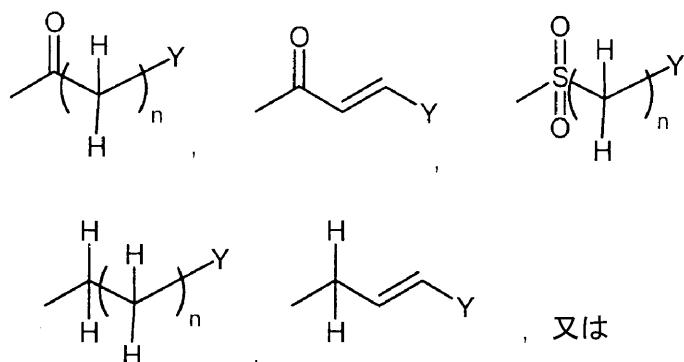
【請求項 12】

式 (II) のピリミジニル酢酸誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

【化9】

上記式において、R<sup>1</sup> は

【化10】



を表わし、

上記式において、n は 0 ~ 6 の整数を表わし、

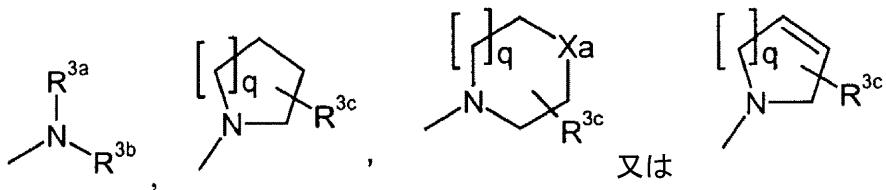
Y は、C<sub>1-6</sub>アルキルで任意に置換されているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、ベンゼンと結合しているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、アリール又はヘテロアリール（式中、前記アリール及びヘテロアリールは、置換し得る位置で、シアノ、ハロゲン、ニトロ、グアニジノ、ピロリル、スルファモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル、フェニルオキシ、フェニル、アミノ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1-6</sub>アルカノイル、C<sub>1-6</sub>アルカノイルアミノ、カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、ジ-(C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルコキシ、及びモノ-、ジ-、又はトリ-

-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルチオからなる群から選択される1以上の置換基で任意に置換される)、あるいは1,3-ジオキソランと結合しているアリールを表わし;

R<sub>2</sub>は水素原子又はC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし;

R<sub>3</sub>はハロゲン、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルコキシ、

【化11】



又は

を表わし、

上記式において、R<sup>3a</sup>及びR<sup>3b</sup>は、独立にC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、あるいはカルボキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、カルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、アリール-置換されたC<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイル、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルカルバモイル、C<sub>3-8</sub>ヘテロシクロカルボニル、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ又はC<sub>1-6</sub>アルコキシで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし、

qは1~3の整数を表わし、

R<sup>3c</sup>は、水素原子、ヒドロキシ、カルボキシ、あるいはヒドロキシ、カルボキシ又は(フェニル-置換C<sub>1-6</sub>アルキル)カルバモイルで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし;

Xaは-O-、-S-又は-N(R<sup>3d</sup>)-を表わし、

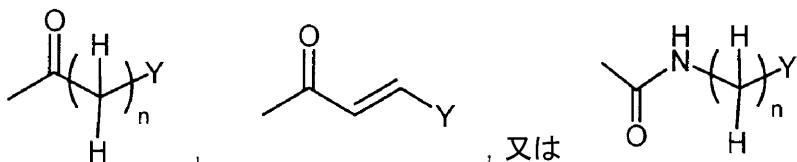
R<sup>3d</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキルを表わし; かつ

R<sup>4</sup>は、水素原子、ハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ、あるいはC<sub>1-6</sub>アルコキシ、若しくはモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されているC<sub>1-6</sub>アルキルを表わす。

【請求項13】

R<sup>1</sup>が

【化12】



を表わし、

上記式において、nが0~2の整数を表わし;

Yが、C<sub>1-6</sub>アルキルで任意に置換されているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、ベンゼンと結合しているC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、フェニル及びナフチルからなる群から選択されるアリール、あるいはインドリル、キノリル、ベンゾフラニル、フラニル及びピリジルからなる群から選択されるヘテロシクリルを表わし、式中、前記アリール及びヘテロアリールは、置換し得

る位置で、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ピロリル、スルファモイル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノスルホニル、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノスルホニル、フェニルオキシ、フェニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルカノイルアミノ、カルバモイル、 $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル、ジ-( $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイル、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキル、モノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、及びモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルチオからなる群から選択される1以上の置換基で任意に置換されており；かつ

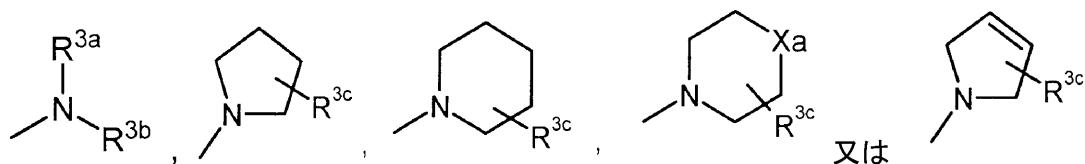
$R^2$ が水素原子を表わす、

請求項12記載の、式(II)のピリミジニル酢酸誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項14】

$R^3$ がモノ-、ジ-、又はトリ-ハロゲンで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、

【化13】



又は

を表わし、

上記式において、 $R^{3a}$ 及び $R^{3b}$ が、独立にカルボキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、カルバモイル、 $C_{1-6}$ アルキルカルバモイル、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルカルバモイル、 $C_{3-8}$ ヘテロシクロカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、又は $C_{1-6}$ アルコキシで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わし、

$R^{3c}$ が水素原子、ヒドロキシ、カルボキシ、あるいはヒドロキシ、カルボキシ、又は(フェニル-置換された $C_{1-6}$ アルキル)カルバモイルで任意に置換されている $C_{1-6}$ アルキルを表わし；かつ

$Xa$ が-0-、-S-、又は-N( $R^{3d}$ )-を表わし、 $R^{3d}$ が $C_{1-6}$ アルキルを表わす、

請求項12記載の、式(II)のピリミジニル酢酸誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩、又はエステル。

【請求項15】

式(I)の上記ピリミジン誘導体が、下記化合物からなる群から選択される、請求項1記載の、式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

{2-[4-([フラン-2-イルカルボニル]アミノ)ベンジル]-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]ピリミジン-5-イル}酢酸；

{2-(4-ヘキサンアミドベンジル)-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-ピリミジン-5-イル}酢酸；

{2-(2-[3-{2-(ビフェニル-4-イル)アセトアミド}ベンジル])-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-ピリミジン-5-イル}酢酸；

2-{2-(3-[2-(ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)アセトアミド]ベンジル)-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]ピリミジン-5-イル}酢酸；

2-{4-クロロ-2-[3-(4-スルファモイルベンズアミド)ベンジル]-6-(ジメチルアミノ)-ピリミジン-5-イル}酢酸；

2-{4-クロロ-2-[3-(2,3-ジクロロベンズアミド)ベンジル]-6-(ジメチルアミノ)-ピリミジン-5-イル}酢酸；

[4-(ジメチルアミノ)-2-[3-(3,4-ジメトキシベンズアミド)ベンジル]-ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 2-{2-[3-(2-シクロプロピルアセトアミド)ベンジル]-4-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 2-[2-(3-ブチルアミドベンジル)-4-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 2-{2-[3-({[ベンジル(メチル)アミノ]カルボニル}アミノ)ベンジル]-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 {2-(4-ヘキサンアミドベンジル)-4-クロロ-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]-ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 2-{4-クロロ-2-[2-(4-[(2E)-3-フェニル-プロペニル]アミノ)ベンジル]-6-[[2-(シクロペンチルアミノ)-2-オキソエチル](メチル)アミノ]ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 [4-クロロ-2-{4-[(4-クロロベンゾイル)(メチル)アミノ]ベンジル}-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 2-{4-(ジメチルアミノ)-6-(ピロリジン-1-イル)-2-(4-{[(キノリン-2-イル)カルボニル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 2-{2-[4-(3,4-ジクロロベンズアミド)ベンジル]-4-(ジメチルアミノ)-6-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 [2-{4-[(4-クロロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-(モルフォリン-4-イル)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 2-{2-[4-(4-フルオロベンズアミド)ベンジル]-4-(ジメチルアミノ)-6-(ピロリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル}酢酸；  
 [2-{4-[(4-フルオロベンゾイル)アミノ]ベンジル}-4-(ジメチルアミノ)-6-(モルフォリン-4-イル)ピリミジン-5-イル]酢酸；及び  
 N-(4-{[4-クロロ-5-(シアノメチル)-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-2-イル]メチル}フェニル)-2-ナフトアミド。

【請求項 1 6】

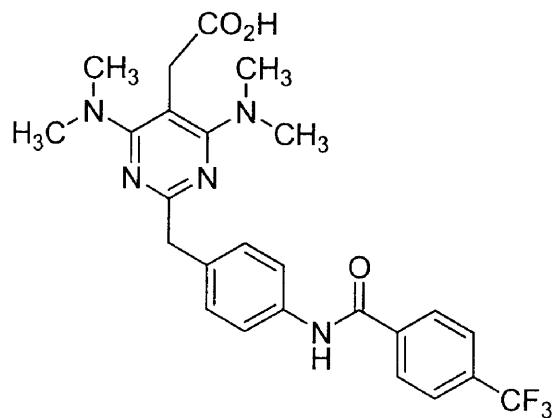
式(I)の上記ピリミジン誘導体が、下記化合物からなる群から選択される、請求項1記載の、式(I)のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル：

[2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 {4-(ジメチルアミノ)-2-[4-{[(4-フルオロベンジル)オキシ]カルボニル}アミノ]ベンジル}ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 [2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-クロロ-6-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 {4-(ジメチルアミノ)-2-[4-{[(4-ニトロベンジル)オキシ]カルボニル}アミノ]ベンジル}ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 [2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)-6-(メトキシメチル)-ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 [2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)-4-(ジメチルアミノ)-6-エチル-ピリミジン-5-イル]酢酸；  
 [4,6-ビス(ジメチルアミノ)-2-(4-{[(ベンジルオキシ)カルボニル]アミノ}ベンジル)ピリミジン-5-イル]酢酸；及び  
 (4-(ジメチルアミノ)-2-{4-[(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)オキシ]カルボニル}アミノ]ベンジル}ピリミジン-5-イル]酢酸。

【請求項 1 7】

式

【化14】

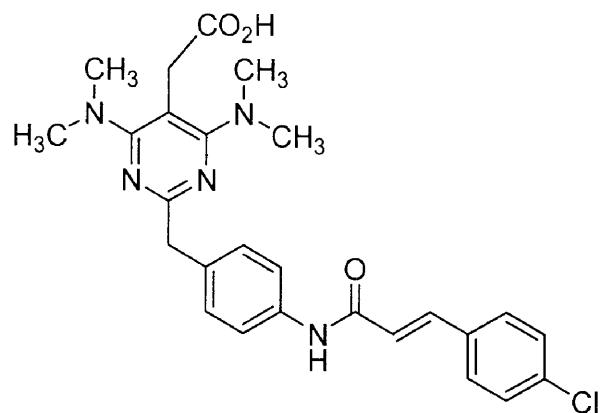


を有する、請求項1のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項18】

式

【化15】

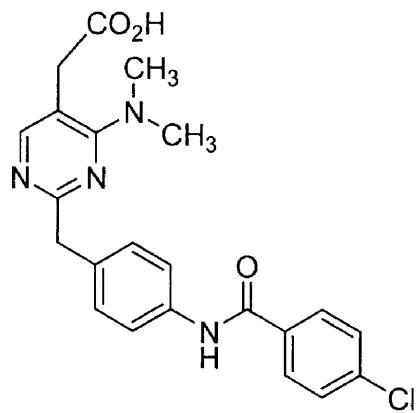


を有する、請求項1のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項19】

式

【化16】

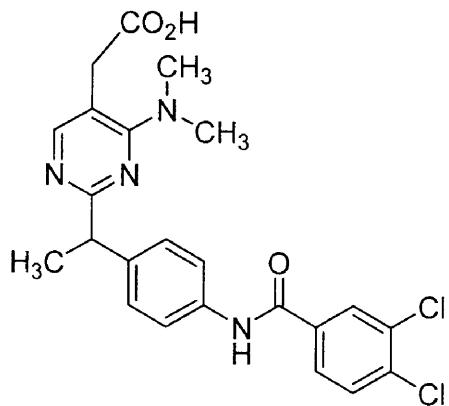


を有する、請求項1のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項20】

式

【化17】

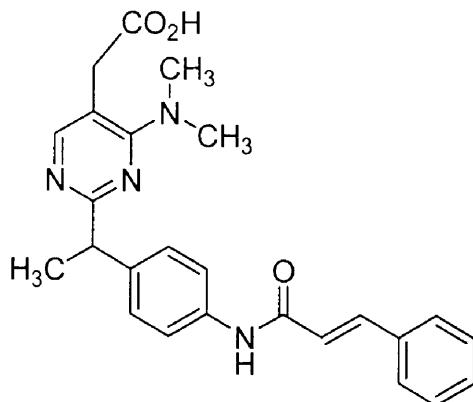


を有する、請求項1のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

【請求項21】

式

## 【化18】



を有する、請求項1のピリミジン誘導体、その互変異性又は立体異性体、あるいはそれらの塩又はエステル。

## 【請求項22】

上記化合物が互変異性体である、請求項1～21のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項23】

上記化合物が立体異性体である、請求項1～21のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項24】

上記化合物が塩である、請求項1～21のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項25】

上記化合物がエステルである、請求項1～21のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項26】

上記化合物がラセミ体である、請求項1～21のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項27】

活性成分として、請求項1～26のいずれかに記載の化合物、その互変異性又は立体異性体、あるいは生理的に許容される塩を含有する医薬。

## 【請求項28】

更に賦形剤を含有する、請求項27記載の医薬。

## 【請求項29】

該賦形剤が担体、希釈剤、香料、甘味料、滑沢剤、可溶化剤、懸濁剤、結合剤、錠剤崩壊剤、又は封入材料である、請求項28の医薬。

## 【請求項30】

上記化合物がC<sub>RT</sub>H<sub>2</sub>のアンタゴニストである、請求項27記載の医薬。

## 【請求項31】

C<sub>RT</sub>H<sub>2</sub>活性に関連する障害又は疾病の治療及び/又は予防のための、請求項27記載の医薬。

## 【請求項32】

上記障害又は疾病が、喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、及びアレルギー性結膜炎からなる群から選択される、請求項31記載の医薬。

## 【請求項33】

上記障害又は疾病が、炎症性腸疾患、チャーグ-ストラウス症候群、副鼻腔炎、好塩基性白血病、慢性じんま疹、及び好塩基球増加症からなる群から選択される、請求項31記載の医薬。

## 【請求項34】

C R T H 2 活性と関連する障害又は疾病の治療及び／又は予防のための医薬を製造するための、請求項 1～26 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 35】

上記障害又は疾病が、喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、及びアレルギー性結膜炎からなる群から選択される、請求項 34 の使用。

【請求項 36】

上記障害又は疾病が、炎症性腸疾患、チャーグ-ストラウス症候群、副鼻腔炎、好塩基球性白血病、慢性じんま疹、及び好塩基球増加症からなる群から選択される、請求項 34 の使用。