

【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22年9月30日(2010.9.30)

【公表番号】特表2009-544709(P2009-544709A)

【公表日】平成21年12月17日(2009.12.17)

【年通号数】公開・登録公報2009-050

【出願番号】特願2009-521813(P2009-521813)

【国際特許分類】

C 0 7 D 237/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 237/32 (2006.01)

C 0 7 D 237/26 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/50 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 237/14

C 0 7 D 403/12 C S P

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

C 0 7 D 237/32

C 0 7 D 237/26

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/50

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/502

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 P 25/20  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 9/10

## 【手続補正書】

【提出日】平成22年8月6日(2010.8.6)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

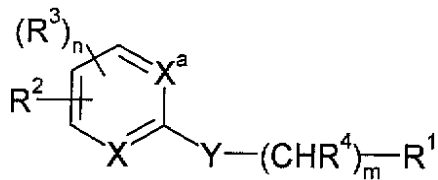
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I \* の化合物、またはその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩であり、

【化338】



I \*

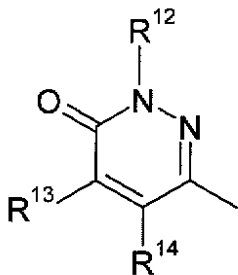
式中、

XおよびX<sup>a</sup>は、それぞれ独立して、CHまたはNであり、Yは、S(O)<sub>q</sub>、OまたはNR<sup>15</sup>であり、

R<sup>1</sup>は、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>であるか、または1個または2個の窒素原子を含み、1~3個のR<sup>20</sup>基で選択的に置換された4~9員ヘテロシクロアルキル環であり、

R<sup>2</sup>は、下記であり、

【化339】



式中、

$R^2$  は  $Y - (CHR^4)_m - R^1$  基に対してパラであり、

各  $R^3$  は、独立して、H、F、Cl、Br、I、 $OR^{21}$ 、 $NR^{23}R^{24}$ 、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C(=O)R^{21}$ 、 $CO_2R^{21}$ 、または  $C(=O)NR^{23}R^{24}$  であるか、または

$R^3$  が  $R^2$  に対してオルトであるとき、 $R^3$  および  $R^{14}$  は共に、 $-(CH_2)_s-$ 、 $-CH_2Z-$ 、 $-ZCH_2-$ 、 $-ZCH_2CH_2-$  または  $CH_2CH_2Z-$  を形成し、ここで Z は、O、 $S(O)_y$ 、または  $NR^{27}$  であり、

各  $R^4$  は、独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキルまたは  $OR^{21}$  であり、ここで、アルキル基は 1 ~ 3 個の  $R^{20}$  基で選択的に置換されており、

$R^{10}$  および  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキルまたは  $C_3 - C_6$  シクロアルキルであり、ここで、アルキルまたはシクロアルキル基は 1 ~ 3 個の  $R^{20}$  基で選択的に置換されており、

$R^{12}$  は、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、シクロアルキル、アリアル、アリアルアルキル、ヘテロアリアル、ヘテロシクロアルキル、 $C(=O)R^{27}$  または  $CO_2R^{27}$  であり、ここで、アルキル、シクロアルキル、アリアル、アリアルアルキル、ヘテロアリアルまたはヘテロシクロアルキル基は 1 ~ 3 個の  $R^{20}$  基で選択的に置換されており、

$R^{13}$  および  $R^{14}$  は、それぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、アリアル、アリアルアルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシル、 $S(=O)_y - C_1 - C_6$  アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリアルであり、

$R^{13}$  および  $R^{14}$  は、それらを結合している炭素原子と共に、縮合フェニル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、ピリジニルまたは  $C_3 - C_6$  シクロアルキル環を形成し、前記縮合フェニル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、ピリジニルまたはシクロアルキル環は、1 ~ 3 個の  $R^{20}$  基で選択的に置換されており、

$R^{15}$  は、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C(=O)R^{25}$ 、 $CO_2R^{25}$  であり、

$R^{20}$  は、各置換基において独立して、H、F、Cl、Br、I、 $OR^{21}$ 、 $OR^{22}$ 、 $NR^{23}R^{24}$ 、 $NHOH$ 、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $OR^{26}$  で選択的に置換されている  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_2 - C_6$  アルケニル、 $C_2 - C_6$  アルキニル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル  $C_0 - C_4$  アルキル、3 ~ 7 員ヘテロシクロアルキル  $C_0 - C_4$  アルキル、フェニル、5 または 6 員ヘテロアリアル  $C_0 - C_4$  アルキル、アリアルアルキル、 $(=O)$ 、 $C(=O)R^{21}$ 、 $CO_2R^{21}$ 、 $OC(=O)R^{21}$ 、 $C(=O)NR^{23}R^{24}$ 、 $NR^{27}C(=O)R^{21}$ 、 $NR^{27}C(=O)OR^{21}$ 、 $OC(=O)NR^{23}R^{24}$ 、 $NR^{27}C(=S)R^{21}$ 、または  $S(O)_qR^{21}$  であり、

各  $R^{21}$  は、独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、アリアルまたはアリアルアルキルであり、

各  $R^{22}$  は、独立して、カルボキシル基のヒドロキシル基が除去された後のアミノ酸の残基であり、

各  $R^{23}$  および  $R^{24}$  は、独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキルおよびアリアルから選択されるか、または  $R^{23}$  および  $R^{24}$  は、それらが結合している窒素原子と共に、 $=O$  で選択的に置換されている 3 ~ 7 員複素環を形成し、

$R^{25}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、アリアルまたはアルキルアリアルであり、

$R^{26}$  は、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、アリアルまたはアルキルアリアルであり、

$R^{27}$  は、H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

m は、 $R^1$  が窒素原子を介して結合している場合に 1、2、3、4 または 5 であり、 $R^1$  が炭素原子を介して結合している場合に m は 0、1、2、3、4 または 5 であり、

n は、1、2 または 3 であり、

q は、0、1 または 2 であり、

s は、1、2 または 3 であり、

y は、0、1 または 2 である、化合物であって、

但し、

(1) 前記化合物は、6 - [ 4 - ( 2 - ジエチルアミノエトキシ ) - フェニル ] - 3 (

2 H) ピリダジノン以外の化合物である、

式 I \* の化合物、またはその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

請求項 1 記載の化合物において、X および X<sup>a</sup> の少なくとも 1 つはそれぞれ C H である。

【請求項 3】

請求項 2 記載の化合物において、Y は O である。

【請求項 4】

請求項 1 記載の化合物において、R<sup>1</sup> は、1 または 2 個の窒素原子を含む 4 ~ 9 員のヘテロシクロアルキル環である。

【請求項 5】

請求項 4 記載の化合物において、R<sup>1</sup> は、選択的に置換されたピペリジンまたはピロリジン環である。

【請求項 6】

請求項 5 記載の化合物において、前記選択的に置換されたピペリジンまたはピロリジン環は、窒素原子を介して結合しているものである。

【請求項 7】

請求項 6 記載の化合物において、前記ピペリジンまたはピロリジン環は、1 または 2 個のアルキル基で置換されているものである。

【請求項 8】

請求項 5 記載の化合物において、前記ピペリジン環は、炭素原子を介して結合しているものである。

【請求項 9】

請求項 8 記載の化合物において、前記ピペリジン環は、シクロアルキル基で窒素置換されているものである。

【請求項 10】

請求項 1 記載の化合物において、R<sup>1 3</sup> および R<sup>1 4</sup> は、それらが結合している炭素原子と共に、縮合フェニル、チエニル、オキサゾリル、ピリジニルまたは C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル環を形成するものであり、前記縮合フェニル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、ピリジニルまたはシクロアルキル環は、1 ~ 3 個の R<sup>2 0</sup> 基で選択的に置換されているものである。

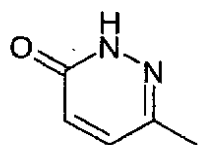
【請求項 11】

請求項 1 記載化合物において、R<sup>1 2</sup> は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルまたはヘテロアリールである。

【請求項 12】

請求項 1 記載の化合物において、R<sup>2</sup> は以下である。

【化 3 4 0】



【請求項 13】

請求項 3 記載の化合物において、R<sup>1 3</sup> および R<sup>1 4</sup> は、それぞれ独立して、H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである。

【請求項 14】

請求項 1 記載の化合物において、R<sup>1 4</sup> はヘテロアリールである。

【請求項 15】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^4$  は、H、アルキルまたはアルコキシルである。

【請求項 1 6】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^4$  は、H または  $C_1$  アルキルである。

【請求項 1 7】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^1$  が、1 または 2 個の窒素原子を有し、1 ~ 3 個の  $R^{20}$  で選択的に置換され、炭素原子を介して結合した 4 または 9 員環のヘテロシクロアルキル環の場合、 $m$  は 0 または 1 である。

【請求項 1 8】

請求項 8 記載の化合物において、 $m$  は 0 または 1 である。

【請求項 1 9】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^1$  が窒素原子を介して結合している場合、 $m$  は 3 である。

【請求項 2 0】

請求項 7 記載の化合物において、 $m$  は 3 である。

【請求項 2 1】

請求項 1 記載の化合物において、 $s$  は 2 である。

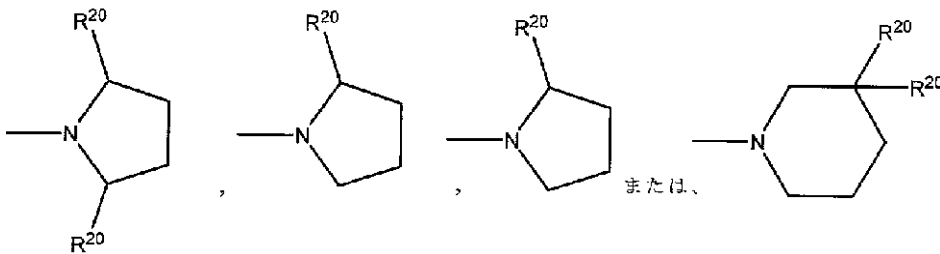
【請求項 2 2】

請求項 1 記載の化合物において、 $n$  は 0 または 1 である。

【請求項 2 3】

請求項 7 記載の化合物において、 $R^1$  は以下である。

【化 3 4 1】



【請求項 2 4】

請求項 2 3 記載の化合物において、 $R^{20}$  は、F、Cl、 $CF_3$ 、 $NR^{23}R^{24}$ 、または  $OR^{26}$  で選択的に置換されている  $C_1 - C_6$  アルキル、シクロアルキル  $C_0 - C_4$  アルキル、またはヘテロシクロアルキル  $C_0 - C_4$  アルキルである。

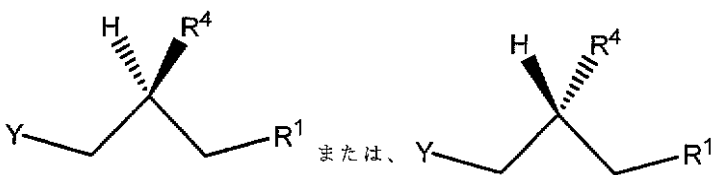
【請求項 2 5】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^{23}$  および  $R^{24}$  は、それぞれ独立して  $C_1 - C_6$  アルキルである。

【請求項 2 6】

請求項 1 記載の化合物において、 $Y - (CHR^4)_m - R^1$  は以下である。

【化 3 4 2】



【請求項 2 7】

請求項 1 記載の化合物において、 $R^4$  は  $OR^{21}$  であり、 $R^{21}$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルである。

【請求項 2 8】

請求項 1 記載の化合物において、この化合物は、以下から成る群、

2 - メチル - 6 - { 4 - [ ( R ) - 2 - メチル - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジ

ン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シプロペンチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ) - フェニル] - 2 -  
 メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 3 , 5 - ジフルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル  
 ) - プロポキシ] - フェニル} - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 3 - クロロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロ  
 ポキシ] - フェニル} - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェ  
 ニル} - 5 - ピリジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ) - フェニル] - 5 - ピ  
 リジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 2 - ( 2 - フルオロ - エチル) - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン  
 - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 3 - フルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プ  
 ロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 3 - フルオロ - 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] -  
 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 4 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロ  
 ポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - 2  
 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 4 - { 4 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - ヒドロキシメチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロポ  
 キシ] - フェニル} - 2 - メチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 2 H - フタラジン -  
 1 - オン、  
 2 - メチル - 4 - { 3 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロ  
 ポキシ] - フェニル} - 2 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン  
 - 1 - オン、  
 2 - メチル - 4 - [ 3 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - 2  
 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、  
 4 - { 3 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - ヒドロキシメチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロポ  
 キシ] - フェニル} - 2 - メチル - 2 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ]  
 ピリダジン - 1 - オン、  
 2 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プロポキシ] - 5 - ( 6  
 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロ - ピリダジン - 3 - イル) - ベンゾニトリル、  
 2 - [ 3 - ( ピペリジン - 1 - イル) - プロポキシ] - 5 - ( 6 - オキソ - 1 , 6 - ジ  
 ヒドロ - ピリダジン - 3 - イル) - ベンゾニトリル、  
 2 - ( 2 - ヒドロキシエチル) - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン  
 - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ ( S ) - 2 - メチル - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル  
 ) - プロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 4 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - 2 , 5 , 6 , 7  
 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - 2 H - ピリダジ  
 ン - 3 - オン、  
 6 - [ 3 - メトキシ - 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] -  
 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 3 - メトキシ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル) - プ  
 ロポキシ] - フェニル} - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 2 - メチル - 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - 2  
 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 - ピリミジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロペンチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロペンチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 - イソプロピル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 6 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - ピリジン - 3 - イル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロボキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 6 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - ピリジン - 3 - イル ] - 2 - ピリジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロペンチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 - ピリジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( ( R ) - 1 - シクロヘキシル - ピロリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( ( R ) - 1 - シクロブチル - ピロリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチル ) - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロボキシ ) - フェニル ] - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチル ) - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 4 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、  
 6 - { 3 , 5 - ジフルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 3 , 5 - ジブromo - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 5 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 5 - エチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロボキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - { 2 - メトキシ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 2 - フルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - ピリジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 4 - ピリジン - 2 - イル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - 2 - フルオロ - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 5 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 3 - モルホリン - 4 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( シクロブチル - メチル - アミノ ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( シクロペンチル - メチル - アミノ ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 2 - ヒドロキシ - 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 2 - ヒドロキシ - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ ( S ) - 2 - ヒドロキシ - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ ( R ) - 2 - ヒドロキシ - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( ( R ) - 2 - ヒドロキシ - 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン

から選択される化合物、或いはそれらの立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩である。

【請求項 29】

請求項 28 記載の化合物であり、この化合物は、以下から成る群、

5 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 6 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ ( S ) - 2 - メチル - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、  
 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン

から選択される化合物、或いはそれらの立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩である。

【請求項 30】

請求項 29 記載の化合物であり、この化合物は、以下から成る群、

6 - { 4 - [ ( S ) - 2 - メチル - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

から選択される化合物、或いはそれらの立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩である。

【請求項 3 1】

請求項 3 0 記載の化合物であり、この化合物は、6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、或いはその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩である。

【請求項 3 2】

請求項 1 記載の化合物、或いはその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩、および 1 若しくはそれ以上の医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

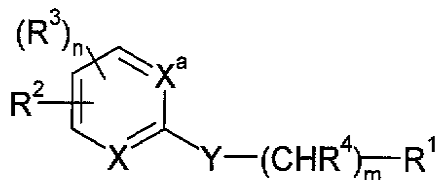
【請求項 3 3】

ナルコレプシーまたは睡眠 / 覚醒障害、摂食行動、摂食障害、肥満、認知、覚醒、記憶、気分障害、気分注意変調、注意欠陥過活動性障害 ( ADHD )、アルツハイマー病 / 認知症、統合失調症、痛み、ストレス、片頭痛、動揺病、うつ病、精神疾患、癲癇、胃腸障害、呼吸障害、炎症および心筋梗塞から成る群から選択される疾患治療用の請求項 1 に記載の式 I \* の化合物、或いはその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩形態

【請求項 3 4】

以下の構造を有する請求項 1 記載の化合物、並びにその立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩形態であり、

【化 3 4 3】



式中、

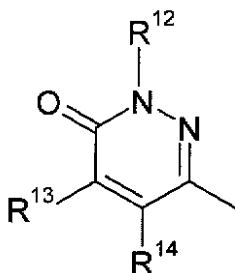
X および X<sup>a</sup> は、それぞれ独立して、CH または N であり、

Y は、S(O)<sub>q</sub>、O および NR<sup>1 5</sup> から選択され、

R<sup>1</sup> は、NR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup> であるか、または 1 個または 2 個の窒素原子を含み、1 ~ 3 個の R<sup>2 0</sup> 基で選択的に置換されている 4 ~ 9 員ヘテロシクロアルキル環であり、

R<sup>2</sup> は、下記であり、

【化 3 4 4】



式中、

R<sup>2</sup> は Y - (CHR<sup>4</sup>)<sub>m</sub> - R<sup>1</sup> 基に対してパラであり、

R<sup>3</sup> は、各官能基において独立して、H、F、Cl、Br、I、OR<sup>2 1</sup>、NR<sup>2 3</sup>R

$R^{2,4}$ 、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C(=O)R^{2,1}$ 、 $CO_2R^{2,1}$ 、  
 または $C(=O)NR^{2,3}R^{2,4}$ であるか、または

$R^3$ が $R^2$ に対してオルトであるとき、 $R^3$ および $R^{1,4}$ は共に、 $-(CH_2)_s-$ 、  
 $-CH_2Z-$ 、または $CH_2CH_2Z-$ を形成し、ここで、 $Z$ は、 $O$ 、 $S(O)_y$ 、ま  
 たは $NR^{2,7}$ であり、

$R^4$ は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $OR^{2,1}$ であり、ここで、アルキル基は1~3  
 個の $R^{2,0}$ 基で選択的に置換されており、

$R^{1,0}$ および $R^{1,1}$ は、それぞれ独立して、 $H$ または $C_1 - C_6$ アルキルであり、ここ  
 で、アルキル基は1~3個の $R^{2,0}$ 基で選択的に置換されており、

$R^{1,2}$ は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、  
 ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、 $C(=O)R^{2,7}$ または $CO_2R^{2,7}$ であり、  
 ここで、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよ  
 びヘテロシクロアルキル基は1~3個の $R^{2,0}$ 基で選択的に置換されており、

$R^{1,3}$ および $R^{1,4}$ は、独立して、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはアリール  
 アルキルであるか、または、 $R^{1,3}$ および $R^{1,4}$ は、共に、縮合フェニル、チエニル、ピ  
 ロリル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル環を形成することができ、ここで、フェニ  
 ル、チエニル、ピロリル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル環は、1~3個の $R^{2,0}$   
 基で選択的に置換されており、

$R^{1,5}$ は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C(=O)R^{2,5}$ 、 $CO_2R^{2,5}$ であり、

$R^{2,0}$ は、各官能基において独立して、 $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $OR^{2,1}$ 、 $OR^{2,2}$ 、  
 $NR^{2,3}R^{2,4}$ 、 $NHOH$ 、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $OR^{2,6}$ で選択的に置換されてい  
 る $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_7$ シク  
 ロアルキル、3~7員ヘテロシクロアルキル、フェニル、5または6員ヘテロアリール、  
 アリールアルキル、 $(=O)$ 、 $C(=O)R^{2,1}$ 、 $CO_2R^{2,1}$ 、 $OC(=O)R^{2,1}$ 、  
 $C(=O)NR^{2,3}R^{2,4}$ 、 $NR^{2,7}C(=O)R^{2,1}$ 、 $NR^{2,7}C(=O)OR^{2,1}$ 、  
 $OC(=O)NR^{2,3}R^{2,4}$ 、 $NR^{2,7}C(=S)R^{2,1}$ 、または $S(O)_qR^{2,1}$ であ  
 り、

$R^{2,1}$ は、各官能基において独立して、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはアリ  
 ールアルキルであり、

$R^{2,2}$ は、各官能基において独立して、カルボキシル基のヒドロキシル基が除去された  
 後のアミノ酸の残基であり、

$R^{2,3}$ および $R^{2,4}$ は、各官能基において独立して、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキルおよびア  
 リールから選択されるか、または $R^{2,3}$ および $R^{2,4}$ は、それらが結合している窒素原子  
 と共に、 $=O$ で選択的に置換されている3~7員複素環を形成し、

$R^{2,5}$ は、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはアルキルアリールであり、

$R^{2,6}$ は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、アリールまたはアルキルアリールであり、

$R^{2,7}$ は、 $H$ または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

$m$ は、 $R^1$ が窒素原子を介して結合している場合に1、2、3、4または5であり、 $R$   
 $^1$ が炭素原子を介して結合している場合に $m$ は0、1、2、3、4または5であり、

$n$ は、0、1、2または3であり、

$q$ は、0、1または2であり、

$s$ は、1、2または3である。

#### 【請求項35】

請求項34記載の化合物において、前記化合物は、以下の群、

2-メチル-6-{4-[3-(R)-2-メチル-ピロリジン-1-イル]-プロ  
 ポキシ]-フェニル}-2H-ピリダジン-3-オン、

2-メチル-6-[4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-2  
 H-ピリダジン-3-オン、

2-イソプロピル-6-[4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル  
 ]-2H-ピリダジン-3-オン、

- 2 - イソプロピル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - エチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - { 3 - フルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - ( 3 , 5 - ジクロロ - フェニル ) - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - [ 3 - フルオロ - 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 - フェニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 4 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、
- 2 - メチル - 6 - { 4 - [ ( S ) - 2 - メチル - 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - { 4 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - ヒドロキシメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - ヒドロキシメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - ベンジル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - フェニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( 2 , 5 - ジメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - イソプロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( 3 , 3 - ジメチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - イソプロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - { 4 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - メトキシメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メトキシメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - [ 4 - ( 3 - ジエチルアミノ - プロポキシ ) - フェニル ] - 5 - イソプロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - [ 4 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - イソプロピル - 7 - { 4 - [ 3 - ( 4 - ピロリジン - 1 - イル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( ( 2 R , 5 R ) - 2 , 5 - ジメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - イソプロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - プロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、

- 7 - { 4 - [ 3 - ( ( 2 R , 5 R ) - 2 , 5 - ジメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - プロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - プロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 7 - { 4 - [ 3 - ( 4 - ジメチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - プロピル - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - プロピル - 7 - { 4 - [ 3 - ( ( S ) - 2 - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - ( 4 - クロロ - ベンジル ) - 7 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 5 - ( 4 - クロロ - ベンジル ) - 7 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 H - チエノ [ 2 , 3 - d ] ピリダジン - 4 - オン、
- 2 , 4 - ジメチル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 , 4 - ジメチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - イソプロピル - 4 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - イソプロピル - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - ベンジル - 4 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - ベンジル - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 4 - ベンジル - 2 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 4 - ベンジル - 2 - メチル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - メチル - 6 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5 - フェニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - メチル - 5 - フェニル - 6 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、
- 2 - メチル - 4 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - メチル - 4 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - メチル - 4 - [ 4 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ ) - フェニル ] - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - メチル - 4 - [ 4 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 4 - [ 4 - ( 3 - アゼパン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - ( 4 - クロロ - ベンジル ) - 4 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - ( 4 - クロロ - ベンジル ) - 4 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2 H - フタラジン - 1 - オン、
- 2 - メチル - 4 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロ

ポキシ] - フェニル} - 2, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、

2 - メチル - 4 - [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ ) - フェニル ] - 2, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - シクロペンタ [ d ] ピリダジン - 1 - オン、

2 - メチル - 4 - { 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 2 H - フタラジン - 1 - オン、

4 - { 4 - [ 3 - ( ブチル - エチル - アミノ ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - メチル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 2 H - フタラジン - 1 - オン、

4 - [ 4 - ( 3 - メチル - 4 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - フタラジン - 1 - イル ) - フェノキシメチル ] - ピペリジン - 1 - カルボン酸 t - ブチルエステル、

2 - メチル - 4 - [ 4 - ( ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 H - フタラジン - 1 - オン、

4 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - フタラジン - 1 - オン、

4 - [ 4 - ( 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロ - ピリダジン - 3 - イル ) - フェノキシメチル ] - ピペリジン - 1 - カルボン酸 t - ブチルエステル、

2 - メチル - 6 - [ 4 - ( ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - [ 4 - ( 1 - シクロブチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - [ 4 - ( 1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - [ 4 - ( 1 - シクロプロピルメチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - [ 4 - ( 1 - シクロペンチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

2 - メチル - 6 - [ 4 - ( 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - [ 4 - ( 1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 - メチル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

2 - メチル - 6 - [ 4 - ( ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

2 - メチル - 6 - [ 4 - ( ピペリジン - 4 - イルオキシ ) - フェニル ] - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

6 - { 3 - フルオロ - 4 - [ 3 - ( ( R ) - 2 - メチル - ピロリジン - 1 - イル ) - プロポキシ ] - フェニル } - 2 - フェニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン、

から選択される化合物、またはそれらの立体異性体、立体異性体の混合物、または医薬的に許容される塩形態である。

【請求項 36】

請求項 34 記載の化合物、および 1 若しくはそれ以上の医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 37】

ナルコレプシーまたは睡眠 / 覚醒障害、摂食行動、摂食障害、肥満、認知、覚醒、記憶、気分障害、気分注意変調、注意欠陥過活動性障害 ( ADHD )、アルツハイマー病 / 認知症、統合失調症、痛み、ストレス、片頭痛、動揺病、うつ病、精神疾患、癲癇、胃腸障害、呼吸障害、炎症および心筋梗塞から成る群から選択される疾患治療用請求項 34 記載の化合物。

【請求項 38】

請求項 1 記載の化合物において、この化合物は、ナルコレプシー又は睡眠 / 覚醒障害の

治療に使用されるものである、化合物。

【請求項 39】

請求項 1 記載の化合物において、この化合物は、注意欠陥過活動性障害の治療に使用されるものである、化合物。

【請求項 40】

請求項 34 記載の化合物において、この化合物は、ナルコレプシー又は睡眠ノ覚醒障害の治療に使用されるものである、化合物。

【請求項 41】

請求項 34 記載の化合物において、この化合物は、注意欠陥過活動性障害の治療に使用されるものである、化合物。