

【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8月16日(2007.8.16)

【公表番号】特表2007-502808(P2007-502808A)

【公表日】平成19年2月15日(2007.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-006

【出願番号】特願2006-523697(P2006-523697)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 45/06 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/545 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/439 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/32 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/34 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/36 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 K 31/545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 25/36

【手続補正書】

【提出日】平成19年6月29日(2007.6.29)

【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】

アルコール又はコカインの依存症又は中毒、煙草の依存症又は中毒を治療し、アルコールの禁断症状を低下させ又は禁酒を援助し、アルコール摂取若しくは薬物乱用又はギャンブルなどの行動的依存症を軽減するための薬剤組成物であって、

(a) オピオイド受容体アンタゴニスト又はその医薬的に許容される塩、

(b) CB-1受容体アンタゴニスト又はその医薬的に許容される塩、及び

(c) 医薬的に許容される担体、

を含み、活性物質の上記(a)と(b)は、アルコール又はコカインの依存症又は中毒、煙草の依存症又は中毒を治療し、アルコールの禁断症状を低下させ又は禁酒を援助し、又はアルコール摂取若しくは薬物乱用若しくは行動的依存症を軽減するためにその組成物を有効にする量で存在する、上記薬剤組成物。

【請求項2】

CB-1受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項1に記載の薬剤組成物：

1 - [ 9 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン -

6 - イル] - 3 - エチルアミノ - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン -  
 6 - イル] - 3 - エチルアミノ - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 3 - イソプロピルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;  
 1 - { 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリ  
 ン - 6 - イル] - 4 - フェニルピペリジン - 4 - イル } - エタノン ;  
 { 3 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 9 H - プ  
 リン - 6 - イル] - 3 - ( 1 , 5 , 6 ) - アザピシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イ  
 ル } - ジメチルアミン ;  
 6 - ( 1 - ベンジルピロリジン - 3 - イルオキシ ) - 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8  
 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 9 H - プリン ;  
 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 1 - シクロヘキシルアゼチジン - 3 - イルオキシ  
 ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 9 H - プリン ;  
 6 - t - ブトキシ - 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル )  
 - 9 H - プリン ;  
 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 6 - イソプロポキ  
 シ - 9 H - プリン ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 9 H - プリ  
 ン - 6 - イル] - 4 - プロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - フルオロフェニル ) - 9 H - プリン -  
 6 - イル] - 4 - プロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - プロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - フルオロフェニル ) - 2 - メチル - 9  
 H - プリン - 6 - イル] - 4 - イソプロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - ピロリジン - 1 - イル - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - エチルアミノ - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - イソプロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 8 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 1 - イソプロピル - 1 , 3 , 8 - トリアザスピロ [ 4 . 5 ] デカン - 4 - オン ;  
 9 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 1 - メチル - 4 - オキサ - 1 , 9 - ジアザスピロ [ 5 . 5 ] ウンデカン - 2 - オン ;  
 8 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 9 H - プリ  
 ン - 6 - イル] - 1 - イソプロピル - 1 , 3 , 8 - トリアザスピロ [ 4 . 5 ] デカン - 4 -  
 オン ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - ( 4 - フルオロフェニル ) - ピペリジン - 4 - オール ;  
 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - 4 - フェニルピペリジン - 4 - オール ;  
 4 - ベンジル - 1 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9  
 H - プリン - 6 - イル] - ピペリジン - 4 - オール ;  
 4 - [ 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 - クロロフェニル ) - 9 H - プリン - 6  
 - イル] - ピペラジン - 2 - カルボン酸メチルアミド ;  
 9 - ( 4 - クロロフェニル ) - 8 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 6 - ( 4 - ピリジ  
 ン - 2 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) - 9 H - プリン ;

9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 6 - (4 - ピリミジン - 2 - イル - ピペラジン - 1 - イル) - 9 H - プリン ;  
 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - フルオロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - 4 - イソプロピルアミノ - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - 4 - イソプロピルアミノ - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 4 - アミノ - 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - 4 - エチルアミノ - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 8 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - 1 - イソプロピル - 1, 3, 8 - トリアザスピロ [ 4.5 ] デカン - 4 - オン ;  
 4 - アミノ - 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ; 及び  
 1 - [ 9 - (4 - クロロフェニル) - 8 - (2 - クロロフェニル) - 9 H - プリン - 6 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 並びに、これらの医薬的に許容される塩、又は、これらの化合物又は塩の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 3】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物 :

7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - ピラゾール [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;  
 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (4 - ピリミジン - 2 - イルピペラジン - 1 - イル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;  
 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 4 - [ (1 S, 4 S) - 5 - メタンスルホニル - 2, 5 - ジアザピシクロ [ 2.2.1 ] ヘプタ - 2 - イル ] - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;  
 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - [ 4 - (プロパン - 2 - スルホニル) - ピペラジン - 1 - イル ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - メチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - イソプロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;  
 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - イソプロピルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

3 - アミノ - 1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - メチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - ジメチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - { 1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - フェニルピペリジン - 4 - イル } - エタノン ;

3 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - アザビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イルアミン ;

1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - ( 4 - フルオロフェニル ) - ピペリジン - 4 - オール ;

4 - ベンジル - 1 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - ピペリジン - 4 - オール ;

2 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 5 - メチル - 2, 5, 7 - トリアザスピロ [ 3.4 ] オクタン - 8 - オン ;

2 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 2, 5, 7 - トリアザスピロ [ 3.4 ] オクタン - 8 - オン ;

8 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 1 - イソプロピル - 1, 3, 8 - トリアザスピロ [ 4.5 ] デカン - 4 - オン ;

2 - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 6, 6 - ジメチル - 2, 5, 7 - トリアザスピロ [ 3.4 ] オクタン - 8 - オン ;

4 - ( 1 - ベンジルピロリジン - 3 - イルオキシ ) - 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 4 - ( 1 - シクロヘキシルアゼチジン - 3 - イルオキシ ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 4 - イソプロポキシ - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

4 - t - ブトキシ - 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

ブチル - [ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - アミン ;

7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチル - 4 - ピペリジン - 1 - イル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

[ 7 - ( 2 - クロロフェニル ) - 8 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - [ 2 - ( 4 - フルオロフェニル ) - エチル ] - アミン ;

7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン ;

[ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - (2 - モルホリン - 4 - イル - エチル) - アミン ;

1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 3 - イソプロピルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

3 - アミノ - 1 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ; 及び

8 - [ 7 - (2 - クロロフェニル) - 8 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル ] - 1 - イソプロピル - 1, 3, 8 - トリアザスピロ [ 4.5 ] デカン - 4 - オン ;

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又は、これらの化合物又は塩の溶媒和物若しくは水和物。

#### 【請求項 4】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物 :

3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン ;

3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - ピリミジン - 2 - イル - ピペラジン - 1 - イル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン ;

3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 7 - [ (1 S, 4 S) - 5 - メタンスルホニル - 2, 5 - ジアザビシクロ [ 2.2.1 ] ヘプタ - 2 - イル ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン ;

3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 7 - [ 4 - (プロパン - 2 - スルホニル) - ピペラジン - 1 - イル ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - イソプロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

3 - アミノ - 1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 6 - メチルピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - イソプロピルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5, 6 - ジメチル

ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - エチルアミノ - アゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - メチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - メチルピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

1 - { 1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - フェニルピペリジン - 4 - イル } - エタノン ;

3 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - ( 1 a, 5 a, 6 a ) - アザビシクロ [ 3.1.0 ]ヘキサ - 6 - イルアミン ;

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - ( 4 - フルオロフェニル ) - ピペリジン - 4 - オール ;

4 - ベンジル - 1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - ピペリジン - 4 - オール ;

8 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 1 - イソプロピル - 1,3,8 - トリアザスピロ [ 4.5 ]デカン - 4 - オン ;

2 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 2,5,7 - トリアザスピロ [ 3.4 ]オクタン - 8 - オン ;

8 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - 6 - メチルピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 1 - イソプロピル - 1,3,8 - トリアザスピロ [ 4.5 ]デカン - 4 - オン ;

2 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 5 - メチル - 2,5,7 - トリアザスピロ [ 3.4 ]オクタン - 8 - オン ;

7 - ( 1 - ベンジルピロリジン - 3 - イルオキシ ) - 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン ;

3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - 7 - ( 1 - シクロヘキシルアゼチジン - 3 - イルオキシ ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン ;

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - エチルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ;

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 4 - イソプロピルアミノピペリジン - 4 - カルボン酸アミド ; 及び

1 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) - ピラゾロ [ 1,5 - a ]ピリミジン - 7 - イル ] - 3 - エチルアミノアゼチジン - 3 - カルボン酸アミド ;

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又は、これらの化合物又は塩の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 5】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物 :

5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 3 - ( 5 - シクロヘキシル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 1 - ( 2,4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール ;

5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 3 - ( 2 - シクロヘキシル - 3 H - イミダゾール - 4 - イル ) - 1 - ( 2,4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール ;

5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - メチル - 3 - [1 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール;

5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 3 - [1 - (1 - フェニル - エチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール;

5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - フルオロ - フェニル) - 4 - メチル - 3 - [1 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール;

5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 3 - [1 - (2, 2 - ジメチル - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール;

5 - {2 - (2, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - メチル - 5 - [1 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 2 H - ピラゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシ - ピリジン; 及び

1 - (2 - クロロ - フェニル) - 5 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 3 - [1 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール;

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又は、これらの化合物又は塩の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 6】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物:

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - ピペリジン - 1 - イル - エタノン;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - モルホリン - 4 - イル - エタノン;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタノン;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - メチル - シクロプロパンカルボニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタノン;

N - (1 - {2 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - オキソ - エチル} - ピペリジン - 4 - イル) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - アセトアミド;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - フルオロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - モルホリン - 4 - イル - エタノン;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - フルオロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - ピペリジン - 1 - イル - エタノン;

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - フルオロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - (4 - トリフルオロアセチル - ピペラジン - 1 - イル) - エタノン;

1 - [1 - (2 - クロロ - フェニル) - 5 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エタノン;

1 - [1 - (2 - クロロ - フェニル) - 5 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [1, 4] オキサゼパン - 4 - イル - エタノン; 及び

1 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - (1 - オキサ - 8 - アザ - スピロ [4.5] デカ - 8 - イル) - エタノン;

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又はこれらの化合物の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 7】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物：

2 - (ベンジル - イソプロピル - アミノ) - 1 - [ 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - エタノール；

1 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 2 - ( 3, 5 - ジメチル - ピペリジン - 1 - イル ) - エタノール；

1 - { 2 - [ 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 2 - ヒドロキシ - エチル } - 4 - イソプロピルアミノ - ピペリジン - 4 - カルボン酸アミド；

1 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 2 - ( 3, 3 - ジメチル - ピペリジン - 1 - イル ) - エタノール；

1 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 2 - ピペリジン - 1 - イル - エタノール；及び

1 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 2 - モルホリン - 4 - イル - エタノール；

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又はこれらの化合物の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 8】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物：

2 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 4 - シクロヘキシル - モルホリン；

2 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 4 - (プロパン - 2 - スルホニル) - モルホリン；

2 - [ 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 4 - (トルエン - 4 - スルホニル) - モルホリン；

1 - { 2 - [ 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - モルホリン - 4 - イル } - 2 - メチル - プロパン - 1 - オン；及び

2 - [ 1 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] - 4 - ( 4 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - モルホリン；

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又はこれらの化合物の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 9】

C B - 1 受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物：

1 - [ 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジクロロ - フェニル ) - 5 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] - 2 - ピペリジン - 1 - イル - エタノン；及び

1 - [ 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジクロロ - フェニル ) - 5 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] - 2 - モルホリン - 4 - イル - エタノン；

並びに、これらの医薬的に許容される塩、又はこれらの化合物の溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 10】

オピオイド受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項1に記載の薬剤組成物：

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;

N - [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - メタンスルホンアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - アミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

N - ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル } - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - アミド ;

3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル } - ベンズアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - アミド ;

3 - { 1 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル } - ベンズアミド ;

3 - ( 1 - インダン - 2 - イルメチル - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ) - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 1 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3, 4 - ジメチル

ル - ピペリジン - 4 - イル] - ベンズアミド ;

3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ]  
ヘキサ - 6 - イル ) - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メト  
キシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル } - フェニル ) - メタンスルホ  
ンアミド ;

3 - [ 1 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 , 4 - ジメチル - ピペ  
リジン - 4 - イル ] - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ  
- ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 8 - メトキシ -  
3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ  
- ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3  
. 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシ  
クロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシ  
クロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメ  
チル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イル  
メチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシ  
ル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - ア  
ミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シク  
ロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - ア  
ミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テト  
ラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 -  
イル ] - フェニル } - アミド ;

N - { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ  
- ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ; 及び

N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 -  
イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタン  
スルホンアミド ;

好ましくは、

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 ,  
3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0  
] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;

N - [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 .  
1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - メタンスルホンアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル  
- 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - アミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 -  
アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフ  
タレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェ

ニル} - メタンスルホンアミド ;

N - ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル } - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフトレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフトレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - アミド ;

3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル } - ベンズアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - アミド ;

3 - { 1 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 , 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル } - ベンズアミド ;

3 - ( 1 - インダン - 2 - イルメチル - 3 , 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ) - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 1 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3 , 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 1 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 , 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ] - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ

- ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;
- 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;
- 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - ベンズアミド ;
- 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;
- 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - アミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;
- N - { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ; 及び
- N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド。

【請求項 1 1】

オピオイド受容体アンタゴニストが以下のものから選択される請求項 1 に記載の薬剤組成物 :

- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;
- N - [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - メタンスルホンアミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 [ 3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - フェニル ] - アミド ;
- N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;
- N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;
- N - ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;
- 3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタ - 8 - イル } - ベンズアミド ;
- 2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - アミド ;
- 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフトレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフトレン - 2 - イルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - アミド ;

3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル } - ベンズアミド ;

3 - [ 6 - エチル - 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ] - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 6 - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル } - フェニル ) - アミド ;

3 - { 1 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル } - ベンズアミド ;

3 - ( 1 - インダン - 2 - イルメチル - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ) - ベンズアミド ;

N - { 3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 1 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - ( 6 - エチル - 3 - インダン - 2 - イルメチル - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.1.0 ] ヘキサ - 6 - イル ) - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 1 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 3, 4 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イル ] - ベンズアミド ;

N - ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - メタンスルホンアミド ;

3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 8 - メトキシ - 3 - アザ - ビシクロ [ 3.2.1 ] オクタ - 8 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル } - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフトレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - ベンズアミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - インダン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3.3.1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 ( 3 - { 2 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - シクロヘキシル ) - プロピル ] - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル } - フェニル ) - アミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;

2 - メトキシ - エタンスルホン酸 { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - アミド ;

N - { 3 - [ 2 - ( 1 - ヒドロキシ - 3 - フェニル - シクロブチルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド ; 及び

N - { 3 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イルメチル ) - 2 - アザ - ビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナ - 5 - イル ] - フェニル } - メタンスルホンアミド。