

【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8月5日(2010.8.5)

【公表番号】特表2009-544579(P2009-544579A)

【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2009-518466(P2009-518466)

【国際特許分類】

C 07 C 237/34	(2006.01)
C 07 D 295/18	(2006.01)
A 61 K 31/495	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
C 07 D 213/65	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 211/58	(2006.01)
C 07 D 207/14	(2006.01)
A 61 K 31/40	(2006.01)
A 61 K 31/166	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 295/12	(2006.01)
C 07 D 213/74	(2006.01)
C 07 D 241/08	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 243/08	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 5/30	(2006.01)
A 61 P 1/08	(2006.01)
A 61 P 25/08	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 1/14	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 25/36	(2006.01)
A 61 P 27/16	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)

【F I】

C 07 C 237/34	C S P
C 07 D 295/18	A
A 61 K 31/495	
A 61 K 31/496	
C 07 D 213/65	
A 61 K 31/5377	
C 07 D 211/58	

C 0 7 D 207/14  
 A 6 1 K 31/40  
 A 6 1 K 31/166  
 C 0 7 D 401/12  
 A 6 1 K 31/4439  
 C 0 7 D 295/12 A  
 C 0 7 D 213/74  
 C 0 7 D 241/08  
 A 6 1 K 31/551  
 C 0 7 D 243/08 5 0 2  
 C 0 7 D 243/08 5 0 1  
 A 6 1 P 43/00 1 1 3  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/20  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 5/30  
 A 6 1 P 1/08  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 1/14  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 25/36  
 A 6 1 P 27/16  
 A 6 1 P 27/02

## 【手続補正書】

【提出日】平成22年6月15日(2010.6.15)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

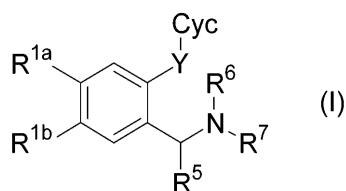
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

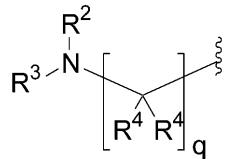
## 【化1】



[式中、

R<sup>1a</sup>およびR<sup>1b</sup>の中の一方は

## 【化2】



でありそしてもう一方は-Hであり；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、各々独立して、-H；-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、-N(R<sup>a</sup>)R<sup>b</sup>または-Fで置換されているか或は置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキル基；-CO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>アルキル；および-C<sub>1-4</sub>アルキル、-OH、ハロまたは-CF<sub>3</sub>で置換されているか或は置換されていない单環式シクロアルキル基から成る群より選択され；かつ

R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>は各々独立して-H、-C<sub>1-6</sub>アルキルまたは单環式シクロアルキルであるか或はR<sup>a</sup>とR<sup>b</sup>がこれらが結合している窒素と一緒にになって单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しているが；但し

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の両方がHであることはないことを条件とし；或は、

R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>がこれらの結合している窒素と一緒にになって炭素環員が1、2または3個のR<sup>d</sup>部分で置換されているか或は置換されておらずかつ窒素環員がR<sup>e</sup>部分で置換されている飽和单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており；かつ

各R<sup>d</sup>部分は独立して-C<sub>1-6</sub>アルキル；-C<sub>1-4</sub>アルキル-OH；ハロ；-OH；-OC<sub>1-6</sub>アルキル；イプソ置換-OC<sub>2-3</sub>アルキルO-；-CN；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sup>g</sup>)R<sup>h</sup>；-C(O)N(R<sup>g</sup>)R<sup>h</sup>；-N(R<sup>g</sup>)SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル；-C(O)C<sub>1-6</sub>アルキル；-S(O)<sub>0-2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル；-SO<sub>2</sub>N(R<sup>g</sup>)R<sup>h</sup>；-SCF<sub>3</sub>；-CF<sub>3</sub>；-OCF<sub>3</sub>；-CO<sub>2</sub>Hおよび-CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択され；かつ

R<sup>g</sup>およびR<sup>h</sup>は各々独立して-Hまたは-C<sub>1-6</sub>アルキルであるか或はR<sup>g</sup>とR<sup>h</sup>がこれらが結合している窒素と一緒にになって单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており；かつ

R<sup>e</sup>は-H；ハロ、-CN、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキルまたは-CF<sub>3</sub>で置換されているか或は置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキルもしくは-C(O)C<sub>1-6</sub>アルキル基；-C(O)CF<sub>3</sub>；-S(O)<sub>0-2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル；-CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル；および各々が-C<sub>1-4</sub>アルキル、ハロ、-CN、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキルまたは-CF<sub>3</sub>で置換されているか或は置換されていないフェニル、单環式炭素結合ヘテロアリール、单環式シクロアルキルもしくは单環式炭素結合ヘテロシクロアルキル基から成る群より選択され；

qは、0または1であり；

各R<sup>4</sup>は、独立して、-Hまたはメチルであるか、或は両方のR<sup>4</sup>置換基が一緒にになってカルボニルを形成しており；

Yは、-O-、-OCH<sub>2</sub>-、-S-、-SO-または-SO<sub>2</sub>-であり；

R<sup>5</sup>は、-Hまたは-C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

R<sup>6</sup>は、-H；または各々が-C<sub>1-4</sub>アルキル、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキル、ハロ、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1-4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>Hまたは-CO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>アルキルで置換されているか或は置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>3-6</sub>アルケニル、-C<sub>3-6</sub>アルキニル、单環式シクロアルキルもしくは-C<sub>1-6</sub>アルキル-(单環式シクロアルキル)であり；

R<sup>7</sup>は、-H；または各々が-C<sub>1-4</sub>アルキル、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキル、ハロ、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1-4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>Hまたは-CO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>アルキルで置換されているか或は置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>3-6</sub>アルケニル、-C<sub>3-6</sub>アルキニル、单環式シクロアルキルもしくは-C<sub>1-6</sub>アルキル-(单環式シクロアルキル)であるか；或は

R<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>がこれらが結合している窒素と一緒にになって-C<sub>1-4</sub>アルキル、-OC<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換されているか或は置換されていない飽和单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており；そして

Cycは、1、2または3個のR<sup>k</sup>部分で置換されているか或は置換されていないフェニルもしくは単環式炭素結合ヘテロアリール基であり；かつ

各R<sup>k</sup>部分は独立して-C<sub>1-6</sub>アルキル、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-C<sub>2-6</sub>アルケニル、-C<sub>2-6</sub>アルキニル、-OH、-OC<sub>1-6</sub>アルキル、-OCHF<sub>2</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OC<sub>3-6</sub>アルケニル、-OC<sub>3-6</sub>アルキニル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>1</sup>)R<sup>m</sup>、-N(R<sup>1</sup>)C(O)R<sup>m</sup>、-N(R<sup>1</sup>)SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)C<sub>1-6</sub>アルキル、-S(O)<sub>0-2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)N(R<sup>1</sup>)R<sup>m</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)R<sup>m</sup>、-SCF<sub>3</sub>、ハロ、-CO<sub>2</sub>Hおよび-CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択されるか；或は一緒に結合している隣接炭素原子上の2個のR<sup>k</sup>部分が1または2個のフルオロ置換基で置換されているか或は置換されていない環式環を形成している-OC<sub>1-4</sub>アルキレンO-であり；かつ

R<sup>1</sup>およびR<sup>m</sup>は各々独立して-Hまたは-C<sub>1-6</sub>アルキルであるが；但し

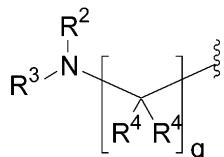
両方のR<sup>4</sup>置換基が一緒にになってカルボニルを形成している時にはR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒にになってジアゼパニルであることはないことを条件とする】

で表される化合物またはこれの製薬学的に許容される塩、製薬学的に許容されるプロドラッグまたは製薬学的に有効な代謝産物。

#### 【請求項2】

R<sup>1b</sup>が

#### 【化3】



である請求項1記載の化合物。

#### 【請求項3】

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が各々独立して-H；または各々が上述した如く置換されているか或は置換されていないメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、s-ブチル、2-メチルプロピル、シクロプロピル、シクロブチルもしくはシクロペンチルである請求項1記載の化合物。

#### 【請求項4】

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が各々独立して-H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、s-ブチル、2-ヒドロキシエチル、2-メトキシエチル、2-メチルアミノエチル、2-ジメチルアミノエチル、2-(シクロプロピル-メチル-アミノ)-エチル、2-ピロリジン-1-イル-エチル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル、3-ジメチルアミノプロピル、シクロプロピル、シクロブチルまたはシクロペンチルである請求項1記載の化合物。

#### 【請求項5】

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が各々独立して-H、メチル、シクロプロピル、ジメチルアミノエチルまたはジメチルアミノプロピルである請求項1記載の化合物。

#### 【請求項6】

R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>が各々独立して-H、メチルまたはシクロプロピルであるか或はR<sup>a</sup>とR<sup>b</sup>が一緒にになってピロリジニルを形成している請求項1記載の化合物。

#### 【請求項7】

R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>がこれらの結合している窒素と一緒にになって各々が上述した如く置換されているか或は置換されていないアゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、1,1-ジオキソ-1<sup>6</sup>-チオモルホリン-4-イル、ホモピペリジニル、ジアゼパニル、ピペラジノニルもしくはジアゼパノニルを形成している請求項1記載の化合物。

#### 【請求項8】

R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>がこれらの結合している窒素と一緒にアゼチジニル、3,3-ジフルオ

ロアゼチジニル、ピロリジニル、2 - メチルピロリジニル、3 - ヒドロキシピロリジニル、3 - ジメチルアミノピロリジニル、2 , 5 - ジメチルピロリジニル、2 - トリフルオロメチルピロリジニル、ピペリジニル、3 - フルオロピペリジニル、4 - フルオロピペリジニル、3 , 3 - ジフルオロピロリジニル、4 , 4 - ジフルオロピペリジニル、3 - トリフルオロメチルピペリジニル、4 - トリフルオロメチルピペリジニル、1 , 4 - ジオキサ - 8 - アザ - スピロ [ 4 . 5 ] デコ - 8 - イル、4 - シアノピペリジニル、4 - カルボエトキシピペリジニル、3 - ヒドロキシピペリジニル、4 - ヒドロキシピペリジニル、2 - ヒドロキシメチルピペリジニル、3 - ヒドロキシメチルピペリジニル、4 - ヒドロキシエチルピペリジニル、4 - ヒドロキシエチルピペリジニル、4 - ジメチルアミノピペリジニル、4 - モルホリン - 4 - イル - ピペリジン - 1 - イル、モルホリニル、2 - メチルモルホリン - 4 - イル、3 - メチルモルホリン - 4 - イル、2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イル、3 - ヒドロキシメチルモルホリン - 4 - イル、2 - ヒドロキシメチルモルホリン - 4 - イル、ピペラジニル、4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル、4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - フルオロエチル ) - ピペラジン - 1 - イル、4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル、4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) ピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - メトキシエチル ) - ピペラジン - 1 - イル、4 - ( t - プトキシカルボニル ) ピペラジン - 1 - イル、4 - フェニルピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - ヒドロキシフェニル ) ピペラジニル、4 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - ピペラジン - 1 - イル、4 - チアゾール - 2 - イル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - チオフェニル ) ピペラジニル、4 - ピリジン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル、4 - アセチルピペラジン - 1 - イル、4 - イソブチリル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ピペラジン - 2 - オニル、1 - イソプロピル - 4 - ピペラジン - 2 - オニル、4 - イソプロピル - 1 - ピペラジン - 2 - オニル、1 - シクロプロピル - 4 - ピペラジン - 2 - オニル、チオモルホリニル、1 , 1 - ジオキソ - 1 <sup>6</sup> - チオモルホリン - 4 - イル、4 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル、4 - シクロプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル、1 - シクロブチル - 4 - ジアゼパン - 5 - オニル、4 - イソプロピル - 1 - ジアゼパン - 5 - オニル、1 - イソプロピル - 4 - ジアゼパン - 5 - オニルまたは1 - シクロプロピル - 4 - ジアゼパン - 5 - オニルを形成している請求項 1 記載の化合物。

#### 【請求項 9】

$R^2$  と  $R^3$  がこれらの結合している窒素と一緒にになってピロリジニル、3 - ジメチルアミノピロリジニル、ピペリジニル、4 - フルオロピペリジニル、4 - ジメチルアミノピペリジニル、4 - モルホリン - 4 - イル - ピペリジン - 1 - イル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル、4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - フルオロエチル ) - ピペラジン - 1 - イル、4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル、4 - シクロブチル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ピリジン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル、4 - ピペラジン - 2 - オニル、1 - イソプロピル - 4 - ピペラジン - 2 - オニル、4 - イソブチリル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イルまたは1 - イソプロピル - 4 - ジアゼパン - 5 - オニルを形成している請求項 1 記載の化合物。

#### 【請求項 10】

各  $R^d$  部分が独立してメチル、エチル、イソプロピル、ヒドロキシエチル、フルオロ、メトキシ、ジメチルアミノ、ピペリジニル、モルホリニル、アセチル、トリフルオロメチル、- CO<sub>2</sub>H および - CO<sub>2</sub> - メチルから成る群より選択される請求項 1 記載の化合物。

#### 【請求項 11】

$R^g$  および  $R^h$  が各々独立して - H、メチル、エチルまたはイソプロピルであるか或は  $R^g$  と  $R^h$  がこれらの結合している窒素と一緒にになってピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニルまたはチオモルホリニルを形成している請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

$R^e$ -H、メチル、エチル、イソプロピル、2-フルオロエチル、ヒドロキシエチル、メトキシプロピル、アセチル、t-ブトキシカルボニル、フェニル、4-ピリジル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびピペリジニルから成る群より選択される請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

$R^e$ -H、イソプロピルおよびシクロプロピルから成る群より選択される請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

qが1でありそして両方の $R^4$ 置換基が一緒になってカルボニルを形成している請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

qが0である請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 6】

qが1でありそして各 $R^4$ が-Hである請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 7】

Yが-O-または-S-である請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 8】

Cycが1、2または3個の $R^k$ 部分で置換されているか或は置換されていないフェニルもしくはピリジル基である請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 9】

Cycが1、2または3個の $R^k$ 部分で置換されているか或は置換されていないチオフェニル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリジニルもしくはピラジニル基である請求項1記載の化合物。

## 【請求項 2 0】

Cycがフェニル、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシ-2-メチルフェニル、4-ヒドロキシ-3-フルオロフェニル、3,4-ジヒドロキシフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、4-エトキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、2,5-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、3-エチニルフェニル、4-エチニルフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、3-ヨードフェニル、4-ヨードフェニル、2,3-ジフルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、2,3-ジクロロフェニル、2,4-ジクロロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2-フルオロ-3-クロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、4-フルオロ-3-メチルフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、2-フルオロ-4-メトキシフェニル、3-フルオロ-4-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、4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、4-ジフルオロメトキシフェニル、2-シアノフェニル、3-シアノフェニル、4-シアノフェニル、3-アセチルフェニル、4-アセチルフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニル、4-アミノフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、4-カルバモイルフェニル、4-メタンスルファニルフェニル、4-メタンスルフィニルフェニル、4-メタンスルホニルフェニル、4-トリフルオロメタンスルファニルフェニル、3-メチル-4-メチルスルファニルフェニル、ベンゾ[1,

3] ジオキソール - 4 - イル、ベンゾ[1,3]ジオキソール - 5 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、2H-ピラゾール - 3 - イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、4-トリフルオロメチル-ピリジン - 2 - イル、2,6-ジメチル-ピリジン - 3 - イル、6-メチル-ピリジン - 3 - イル、2-クロロ - 5 - ピリジニル、2-ジメチルアミノ - 5 - ピリジニル、6-メトキシ-ピリジン - 3 - イル、6-メチルスルファニル-ピリジン - 3 - イル、2-ヒドロキシ-5-ピリジニル、6-ブロモ-ピリジン - 3 - イルまたはピラジン - 2 - イルである請求項1記載の化合物。

【請求項21】

Cycがフェニル、3-メトキシフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3-クロロ-2-フルオロフェニル、4-クロロ-2-フルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-メタンスルファニルフェニル、3-メチル-4-メタンスルファニルフェニル、2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは6-メチル-3-ピリジニルである請求項1記載の化合物。

【請求項22】

各R<sup>k</sup>部分が独立してメチル、メトキシ、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、メタンスルファニル、トリフルオロメタンスルファニル、シアノおよびトリフルオロメトキシから成る群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項23】

R<sup>l</sup>およびR<sup>m</sup>が各々独立して-Hまたはメチルである請求項1記載の化合物。

【請求項24】

R<sup>5</sup>が-Hまたはメチルである請求項1記載の化合物。

【請求項25】

R<sup>5</sup>が-Hである請求項1記載の化合物。

【請求項26】

R<sup>6</sup>が-H、各々が上述した如く置換されているか或は置換されていないメチル、エチル、イソプロピル、s-ブチル、シクロプロピル、シクロブチルもしくはシクロペンチルである請求項1記載の化合物。

【請求項27】

R<sup>6</sup>が-Hまたはメチルである請求項1記載の化合物。

【請求項28】

R<sup>7</sup>が-H、各々が上述した如く置換されているか或は置換されていないメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、s-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチルもしくはシクロペンチルメチルである請求項1記載の化合物。

【請求項29】

R<sup>7</sup>がメチル、エチル、イソプロピル、s-ブチル、シクロプロピル、シクロブチルまたはシクロペンチルである請求項1記載の化合物。

【請求項30】

R<sup>7</sup>がメチル、エチル、イソプロピルまたはシクロプロピルである請求項1記載の化合物。

【請求項31】

R<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>がこれらの結合している窒素と一緒にになって各々が上述した如く置換されているか或は置換されていないアゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、1,1-ジオキソ-1<sup>6</sup>-チオモルホリン-4-イル、ホモピペリジニル、ジアゼパニルもしくはホモモルホリニルを形成している請求項1記載の化合物。

【請求項32】

R<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>がこれらの結合している窒素と一緒にになってピペリジニル、ピロリジニル、モ

ルホリニル、4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルまたはホモモルホリニルを形成している請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3 3】

下記：

[ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 3 - メチル - 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ( 3 - メトキシ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン ;  
 [ 4 - ( 4 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 [ 4 - ( 4 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - シクロプロピルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 [ 4 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - ( 3 - メチルアミノメチル - 4 - フエノキシ - フェニル ) - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ( 3 - フルオロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - トリフルオロメチル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 [ 3 - シクロプロピルアミノメチル - 4 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 3 - メチル - 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 [ 3 - シクロプロピルアミノメチル - 4 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 [ 4 - ( 4 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン ;  
 ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 6 - メチル - ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
 [ 4 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 [ 4 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
 [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - ( 4 - モルホリン - 4 - イル - ピペリジン - 1 - イル ) - メタノン ;

[ 4 - ( 3 - クロロ - 2 - フルオロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
( S ) - 3 - ジメチルアミノ - ピロリジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
4 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - N - ( 2 - ジメチルアミノ - エチル ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンズアミド ;  
4 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - N - ( 3 - ジメチルアミノ - プロピル ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンズアミド ;  
[ 4 - ( 4 - クロロ - フェニルスルファニル ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルスルファニル ) - フェニル ] - メタノン ;  
[ 4 - シクロプロピルアミノメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
[ 4 - シクロプロピルアミノメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
[ 4 - シクロプロピルアミノメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - ( 3 - ジメチルアミノ - ピロリジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ピペリジン - 1 - イルメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ピペリジン - 1 - イルメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
( 3 - ジメチルアミノ - ピロリジン - 1 - イル ) - [ 4 - ピペリジン - 1 - イルメチル - 3 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - フェニル ] - メタノン ;  
[ 3 - ( 4 - クロロ - フエノキシ ) - 4 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
[ 3 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 4 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
[ 3 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - 4 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 3 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 4 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン  
[ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
メチル - [ 5 - ( 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - シクロブチル - ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
メチル - [ 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - 5 - ( 4 - ピリジン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンジル ] - アミン ;  
[ 5 - [ 4 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン  
[ 5 - ( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
[ 2 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
1 - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - ピペラジン - 2 - オン ;

4 - イソプロピル - 1 - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - ピペラジン - 2 - オン ;  
1 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - 4 - イソプロピル - ピペラジン - 2 - オン ;  
メチル - [ 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - 5 - ( 4 - モルホリン - 4 - イル - ピペリジン - 1 - イル ) - ベンジル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - シクロプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
1 - イソプロピル - 4 - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;  
[ 2 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 5 - ( 4 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - シクロプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 1 - イル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
1 - シクロプロピル - 4 - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;  
( S ) - ジメチル - { 1 - [ 3 - メチルアミノメチル - 4 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - フェニル ] - ピロリジン - 3 - イル } - アミン ;  
( 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - ベンジルオキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - メタノン ;  
シクロプロピル - [ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - メチル - アミン ;  
[ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - ジメチル - アミン ;  
エチル - [ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - アミン ;  
イソプロピル - [ 5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジル ] - アミン ;  
5 - ( 4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - メチルスルファニル - フエノキシ ) - ベンジルアミン ;  
4 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンジル ] - 1 - イソプロピル - ピペラジン - 2 - オン ;  
1 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンジル ] - 4 - イソプロピル - ピペラジン - 2 - オン ;  
1 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンジル ] - 4 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;  
4 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンジル ] - 1 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;  
1 - シクロブチル - 4 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - ベンジル ] - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;  
4 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - N - ( 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチル ) - ベンズアミド ;  
[ 4 - ( 3 - クロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - ( 4 - シクロブチル - ピペラジン - 1 - イル ) - メタノン ;  
4 - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フエノキシ ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル ] - 1 - イソプロピル - [ 1 , 4 ] ジアゼパン - 5 - オン ;

(4 - シクロブチル - ピペラジン - 1 - イル) - [4 - (3, 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル] - メタノン；  
 (4 - シクロペンチル - ピペラジン - 1 - イル) - [4 - (3, 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル] - メタノン；  
 [4 - (3 - クロロ - フェノキシ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル] - (4 - シクロペンチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [4 - (4 - クロロ - フェノキシ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル] - (4 - シクロブチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [4 - (4 - クロロ - フェノキシ) - 3 - メチルアミノメチル - フェニル] - (4 - シクロペンチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - [3 - メチルアミノメチル - 4 - (4 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルスルファニル) - フェニル] - メタノン；  
 (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - [4 - ジメチルアミノメチル - 3 - (2, 6 - ジメチル - ピリジン - 3 - イルオキシ) - フェニル] - メタノン；  
 (3 - ベンジルオキシ - 4 - ジメチルアミノメチル - フェニル) - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [4 - { [ビス - (2 - メトキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - 3 - (2, 6 - ジメチル - ピリジン - 3 - イルオキシ) - フェニル] - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [3 - (2, 6 - ジメチル - ピリジン - 3 - イルオキシ) - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル] - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 (4 - ジメチルアミノメチル - 3 - フェノキシ - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル - メタノン；  
 (4 - { [ビス - (2 - メトキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - 3 - フェノキシ - フェニル) - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [4 - { [ビス - (2 - メトキシ - エチル) - アミノ] - メチル} - 3 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) - フェニル] - (4 - ジメチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) - メタノン；  
 [4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - 3 - フェノキシ - フェニル] - ピペリジン - 1 - イル - メタノン；  
 [4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - 3 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) - フェニル] - ピペリジン - 1 - イル - メタノン；  
 4 - ジメチルアミノメチル - N - (2 - メチルアミノ - エチル) - 3 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) - ベンズアミド；  
 N - [2 - (シクロプロピル - メチル - アミノ) - エチル] - 4 - ジメチルアミノメチル - 3 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) - ベンズアミド；および  
 [5 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - カルボニル) - 2 - (3 - メトキシ - フェノキシ) - ベンジル] - メチル - カルバミン酸 t - ブチルエステル；  
 およびこれらの製薬学的に許容される塩、  
 から成る群より選択される化合物。

**【請求項 3 4】**

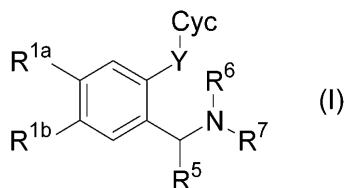
請求項 1 記載の化合物または製薬学的に許容される塩。

**【請求項 3 5】**

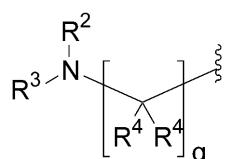
ヒスタミン H<sub>3</sub>受容体および / またはセロトニン輸送体活性が媒介する病気、障害または病状を治療するための製薬学的組成物であって、

(a) 有効な量の式 (I) :

【化4】



[式中、  
 $R^{1a}$ および $R^{1b}$ の中の一方は  
 【化5】



でありそしてもう一方は- H であり；  
 $R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、- H ; - OH ; - OC<sub>1-4</sub>アルキル、- NH<sub>2</sub>、- N ( R<sup>a</sup> )  
 $R^b$ または- F で置換されているか或は置換されていない- C<sub>1-6</sub>アルキル基； - CO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>  
 アルキル；および- C<sub>1-4</sub>アルキル、- OH 、ハロまたは- CF<sub>3</sub>で置換されているか或は  
 置換されていない单環式シクロアルキル基から成る群より選択され；かつ  
 $R^a$ および $R^b$ は各々独立して- H 、- C<sub>1-6</sub>アルキルまたは单環式シクロアルキルであるか  
 或は $R^a$ と $R^b$ がこれらが結合している窒素と一緒にになって单環式ヘテロシクロアルキル基  
 を形成しているが；但し

$R^2$ および $R^3$ の両方がHであることはないことを条件とし；或は、  
 $R^2$ と $R^3$ がこれらの結合している窒素と一緒にになって炭素環員が1、2または3個の $R^d$   
 部分で置換されているか或は置換されておらずかつ窒素環員が $R^e$ 部分で置換されている  
 飽和单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており；かつ

各 $R^d$ 部分は独立して- C<sub>1-6</sub>アルキル；- C<sub>1-4</sub>アルキル- OH ; ハロ；- OH ; - OC<sub>1-6</sub>  
 アルキル；イプソ置換- OC<sub>2-3</sub>アルキルO- ; - CN ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sup>g</sup> ) R<sup>h</sup> ; -  
 C ( O ) N ( R<sup>g</sup> ) R<sup>h</sup> ; - N ( R<sup>g</sup> ) SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル； - C ( O ) C<sub>1-6</sub>アルキル； -  
 S ( O ) <sub>0-2</sub>- C<sub>1-6</sub>アルキル； - SO<sub>2</sub>N ( R<sup>g</sup> ) R<sup>h</sup> ; - SCF<sub>3</sub> ; - CF<sub>3</sub> ; - OCF<sub>3</sub> ;  
 - CO<sub>2</sub>H および- CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択され；かつ

$R^g$ および $R^h$ は各々独立して- H または- C<sub>1-6</sub>アルキルであるか或は $R^g$ と $R^h$ がこれらが  
 結合している窒素と一緒にになって单環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており；かつ  
 $R^e$ は- H ; ハロ、- CN 、- OH 、- OC<sub>1-4</sub>アルキルまたは- CF<sub>3</sub>で置換されているか  
 或は置換されていない- C<sub>1-6</sub>アルキルもしくは- C ( O ) C<sub>1-6</sub>アルキル基； - C ( O )  
 CF<sub>3</sub> ; - S ( O ) <sub>0-2</sub>- C<sub>1-6</sub>アルキル； - CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル；および各々が- C<sub>1-4</sub>  
 アルキル、ハロ、- CN 、- OH 、- OC<sub>1-4</sub>アルキルまたは- CF<sub>3</sub>で置換されているか或  
 は置換されていないフェニル、单環式炭素結合ヘテロアリール、单環式シクロアルキルも  
 しくは单環式炭素結合ヘテロシクロアルキル基から成る群より選択され；

qは、0または1であり；

各 $R^4$ は、独立して、- H またはメチルであるか、或は両方の $R^4$ 置換基が一緒にになってカルボニルを形成しており；

Yは、- O- 、- OCH<sub>2</sub>- 、- S- 、- SO- または- SO<sub>2</sub>- であり；

$R^5$ は、- H または- C<sub>1-6</sub>アルキルであり；

$R^6$ は、- H ；または各々が- C<sub>1-4</sub>アルキル、- OH 、- OC<sub>1-4</sub>アルキル、ハロ、- NH<sub>2</sub>  
 、- NH ( C<sub>1-4</sub>アルキル ) 、- N ( C<sub>1-4</sub>アルキル ) <sub>2</sub> 、- CN 、- CO<sub>2</sub>H または- CO<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>  
 アルキルで置換されているか或は置換されていない- C<sub>1-6</sub>アルキル、- C<sub>3-6</sub>アル  
 ケニル、- C<sub>3-6</sub>アルキニル、单環式シクロアルキルもしくは- C<sub>1-6</sub>アルキル- ( 单環式

シクロアルキル)であり;

$R^7$ は、-H; または各々が- $C_{1-4}$ アルキル、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキル、ハロ、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_{1-4}$ アルキル)、-N( $C_{1-4}$ アルキル)<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>Hまたは-CO<sub>2</sub> $C_{1-4}$ アルキルで置換されているか或は置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>3-6</sub>アルケニル、-C<sub>3-6</sub>アルキニル、単環式シクロアルキルもしくは-C<sub>1-6</sub>アルキル-(単環式シクロアルキル)であるか; 或は

$R^6$ と $R^7$ がこれらが結合している窒素と一緒にになって-C<sub>1-4</sub>アルキル、-OC<sub>1-4</sub>アルキルまたはハロで置換されているか或は置換されていない飽和単環式ヘテロシクロアルキル基を形成しており; そして

Cycは、1、2または3個のR<sup>k</sup>部分で置換されているか或は置換されていないフェニルもしくは単環式炭素結合ヘテロアリール基であり; かつ

各R<sup>k</sup>部分は独立して-C<sub>1-6</sub>アルキル、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-C<sub>2-6</sub>アルケニル、-C<sub>2-6</sub>アルキニル、-OH、-OC<sub>1-6</sub>アルキル、-OCHF<sub>2</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OC<sub>3-6</sub>アルケニル、-OC<sub>3-6</sub>アルキニル、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>l</sup>)R<sup>m</sup>、-N(R<sup>l</sup>)C(O)R<sup>m</sup>、-N(R<sup>l</sup>)SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)C<sub>1-6</sub>アルキル、-SC(O)<sub>0-2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)N(R<sup>l</sup>)R<sup>m</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>l</sup>)R<sup>m</sup>、-SCF<sub>3</sub>、ハロ、-CO<sub>2</sub>Hおよび-CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキルから成る群より選択されるか; 或は一緒に結合している隣接炭素原子上の2個のR<sup>k</sup>部分が1または2個のフルオロ置換基で置換されているか或は置換されていない環式環を形成している-OC<sub>1-4</sub>アルキレンO-であり; かつ

R<sup>l</sup>およびR<sup>m</sup>は各々独立して-Hまたは-C<sub>1-6</sub>アルキルであるが; 但し

両方のR<sup>4</sup>置換基が一緒にになってカルボニルを形成している時にはR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一緒にになってジアゼパニルであることはないことを条件とする]

で表される化合物またはこれの製薬学的に許容される塩、製薬学的に許容されるプロドッグまたは製薬学的に有効な代謝産物、および

(b) 製薬学的に許容される賦形剤、

を含有して成る製薬学的組成物。

#### 【請求項36】

更にH<sub>1</sub>受容体アンタゴニスト、H<sub>2</sub>受容体アンタゴニスト、H<sub>3</sub>受容体アンタゴニスト、セロトニン-ノルエピネフリン再摂取阻害剤、選択的セロトニン再摂取阻害剤、ノルアドレナリン再摂取阻害剤、非選択的セロトニン再摂取阻害剤、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤およびモダフィニルから成る群より選択される有効成分も含有して成る請求項35記載の製薬学的組成物。

#### 【請求項37】

請求項1～34のいずれかに記載の化合物またはこれの製薬学的に許容される塩、製薬学的に許容されるプロドッグもしくは製薬学的に有効な代謝産物を有効成分として含んでなる、ヒスタミンH<sub>3</sub>受容体および/またはセロトニン輸送体活性が媒介する病気、障害または病状に苦しんでいるか或はそうであると診断された被験体を治療するための製薬学的製剤。

#### 【請求項38】

前記病気、障害または病状が認知障害、睡眠障害、精神障害および他の障害から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

#### 【請求項39】

前記病気、障害または病状が認知症、アルツハイマー病、認知機能障害、軽度認知障害、前認知症、注意欠陥多動性障害、注意欠陥障害および学習および記憶障害から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

#### 【請求項40】

前記病気、障害または病状が学習障害、記憶障害および記憶喪失から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

#### 【請求項41】

前記病気、障害または病状が不眠症、睡眠障害、関連した脱力発作を伴うか或は伴わな

いナルコレプシー、脱力発作、睡眠／覚醒恒常性の障害、突発性眠気、日中の異様な眠気、概日リズム障害、疲労、嗜眠および時差ボケから成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

【請求項42】

前記病気、障害または病状が睡眠時無呼吸、閉経前後のホルモン変化、パーキンソン病、多発性硬化症、鬱病、化学療法および交代勤務制から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

【請求項43】

前記病気、障害または病状が統合失調症、双極性障害、躁病、鬱病、強拍性障害および心的外傷後ストレス障害から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

【請求項44】

前記病気、障害または病状が乗り物酔い、目まい、てんかん、片頭痛、神経性炎症、摂食障害、肥満症および薬物乱用障害から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

【請求項45】

前記病気、障害または病状が鬱病、睡眠障害、疲労、嗜眠、認知障害、記憶障害、記憶喪失、学習障害、注意欠陥障害および摂食障害から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。

【請求項46】

更にトピラメートも含有して成る請求項35記載の製薬学的組成物。

【請求項47】

前記病気、障害または病状が加齢に伴う認識衰退、REM行動障害、良性頭位目まい症、耳鳴り、運動障害、下肢静止不能症候群、眼関連障害、黄斑変性症および網膜色素変性症から成る群より選択される請求項37記載の製薬学的製剤。