

【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18年9月21日(2006.9.21)

【公表番号】特表2006-510609(P2006-510609A)

【公表日】平成18年3月30日(2006.3.30)

【年通号数】公開・登録公報2006-013

【出願番号】特願2004-546967(P2004-546967)

【国際特許分類】

C 0 7 D 295/18	(2006.01)
A 6 1 K 31/495	(2006.01)
A 6 1 K 31/55	(2006.01)
A 6 1 K 31/496	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
A 6 1 K 31/541	(2006.01)
A 6 1 K 51/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/20	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 11/02	(2006.01)
A 6 1 P 37/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/30	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
C 0 7 D 295/02	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 295/18	A
A 6 1 K 31/495	
A 6 1 K 31/55	
A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/541	
A 6 1 K 49/02	A
A 6 1 P 25/20	
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 25/00	1 0 1
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 11/02	
A 6 1 P 37/08	

A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/30
A 6 1 P 43/00 1 1 3
C 0 7 D 295/02 C S P A

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月2日(2006.8.2)

【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

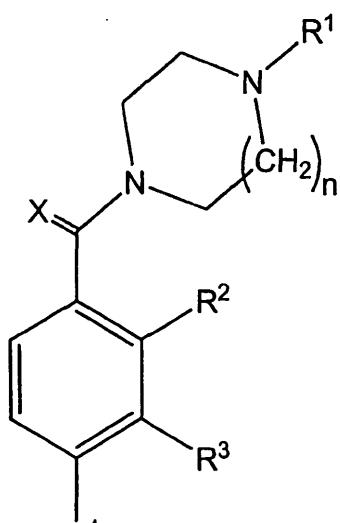
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(I)

[式中]

R¹はC₁₋₁₀アルキル、C₃₋₈アルケニル、C₃₋₈シクロアルキル、(C₃₋₈シクロアルキル)C₁₋₆アルキル、(C₃₋₈シクロアルキル)C₃₋₈アルケニル若しくは(C₁₋₈アルキルカルボニル)C₁₋₈アルキルであり；

nは1若しくは2であり；

XはO若しくはSであり；

R²、R³およびR⁴の1つはGであり、そして他の2つは独立に水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、トリフルオロメチル、メチル若しくはC₁₋₃アルコキシであり；

GはL Qであり；

Lは非分枝状-(CH₂)_m-であり、式中mは1から7までの整数であり；

QはNR⁸R⁹であり、式中R⁸は、水素、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、3-9員カルボシクリル、3-12員ヘテロシクリル、フェニル、(6-9員ヘテロシクリル)C₁₋₆アルキレンおよび(フェニル)C₁₋₆アルキレンから独立に選択され；また、R⁹は、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、6-9員カルボシクリル、3-12員ヘテロシクリル、フェニル、(6-9員ヘテロシクリル)C₁₋₆アルキレンおよび(フェニル)C₁₋₆アルキレンから独立に選択されるか；または、

Q は飽和の 3 - 1 2 員の N 結合したヘテロシクリルであり、ここで、N 結合する窒素に加え、該 3 - 1 2 員ヘテロシクリルは、O、S および NH から独立に選択される 1 ~ 3 個の追加のヘテロ原子を場合によっては含有してよく；

ここで、Q は、ヒドロキシ、ハロ、カルボキサミド、C_{1~6}アルキル、5 - 9 員若しくは 6 - 9 員ヘテロシクリル、-N(C_{1~6}アルキル) (5 - 9 員若しくは 6 - 9 員ヘテロシクリル)、-NH (5 - 9 員若しくは 6 - 9 員ヘテロシクリル)、-O (5 - 9 若しくは 6 - 9 員ヘテロシクリル)、(5 - 9 員若しくは 6 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1~3}アルキレン、C_{1~6}アルコキシ、(C_{3~6}シクロアルキル)-O-、フェニル、(フェニル) C_{1~3}アルキレンおよび(フェニル) C_{1~3}アルキレン-O- よりなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換され、ここで、上のヘテロシクリル、フェニルおよびアルキル基のそれぞれは、トリフルオロメチル、メトキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシおよび C_{1~3}アルキルから独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換されてよいが；

但し、しかしながら、R¹がメチルである場合に G はピペリジン-1-イルメチルでなく；また

上のアルキル、アルキレン、アルケニル、ヘテロシクリル、シクロアルキル、カルボシクリルおよびアリール基のそれぞれは、それぞれ、独立にトリフルオロメチル、メトキシ、ハロ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシおよび C_{1~3}アルキルから独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換されてよい】

の化合物、

またはその製薬学的に許容できる塩、エステル、互変異性体、溶媒和物若しくはアミドを含んでなる組成物。

【請求項 2】

R¹が C_{1~10}アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹が C_{3~5}アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹がイソプロピルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

n が 1 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

X が O である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R³および R⁴の 1 つが G である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R⁴が G である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

L が非分枝状-(CH₂)_m- であり、式中 m が 1 から 4 までの整数である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

L が -CH₂- である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

L が -CH₂CH₂- である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

Q が飽和の N 結合した窒素を含有するヘテロシクリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

Q が、置換若しくは未置換のピペリジニル、ジアゼパニル、アゼパニル、デカヒドロイソキノリン-2-イル、ピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニル若しくはモルホリニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

Qが未置換のピペリジニル、ジアゼパニル、アゼパニル、デカヒドロイソキノリン-2-イル、ピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニル若しくはモルホリニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 15】

Qが未置換のジアゼパニル、アゼパニル、モルホリニル、デカヒドロイソキノリン-2-イル、ピペリジニル若しくはピロリジニルである、請求項14に記載の化合物。

【請求項 16】

置換されたQが、N-(C₁₋₆アルキル)ピペラジニル、N-フェニルピペラジニル、1,3,8-トリアザスピロ{4.5}デシルおよび1,4-ジオキサ-8-アザスピロ{4.5}デシルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項 17】

Qが、アジリジン、1,4,7-トリオキサ-10-アザシクロドデカン、チアゾリジン、1-フェニル-1,3,8-トリアザスピロ{4.5}デカン-4-オン、ピペリジン-3-カルボン酸ジエチルアミド、1,2,3,4,5,6-ヘキサヒドロ-{2,3'}ビピリジニル、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-ピペラジン、2-ピペラジン-1-イルピリミジン、ピペリジン-4-カルボン酸アミド、メチル-(2-ピリジン-2-イルエチル)-アミン、{2-(3,4-ジメトキシフェニル)-エチル}-メチルアミン、チオモルホリニル、アリルシクロペンチルアミン、{2-(1H-インドール-3-イル)-エチル}-メチルアミン、1-ピペリジン-4-イル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾル-2-オン、2-(ピペリジン-4-イルオキシ)-ピリミジン、ピペリジン-4-イルピリジン-2-イルアミン、フェニルアミン、ピリジン-2-イルアミンから選択されるアミンの一価の基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 18】

Qが、場合によってはヒドロキシ、ハロ、カルボキサミド、C₁₋₆アルキル、5-9員若しくは6-9員ヘテロシクリル、-N(C₁₋₆アルキル)(5-9員若しくは6-9員ヘテロシクリル)、-NH(5-9員若しくは6-9員ヘテロシクリル)、-O(5-9員若しくは6-9員ヘテロシクリル)、(5-9員若しくは6-9員ヘテロシクリル)C₁₋₃アルキレン、C₁₋₆アルコキシ、(C₃₋₆シクロアルキル)-O-、フェニル、(フェニル)C₁₋₃アルキレンおよび(フェニル)C₁₋₃アルキレン-O-から選択される1~3個の置換基で置換されていてもよいジアゼパニル、アゼパニル、モルホリニル、ピペリジニルおよびピロリジニルから選択され、ここで、上のヘテロシクリル、フェニルおよびアルキル基のそれぞれは、トリフルオロメチル、メトキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシおよびC₁₋₃アルキルから独立に選択される1から3個までの置換基で場合によっては置換されてよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項 19】

Qが：ピリジル、ピリミジル、フリル、チオフリル、イミダゾリル、(イミダゾリル)C₁₋₆アルキレン、オキサゾリル、チアゾリル、2,3-ジヒドロインドリル、ベンズイミダゾリル、2-オキソベンズイミダゾリル、(テトラゾリル)C₁₋₆アルキレン、テトラゾリル、(トリアゾリル)C₁₋₆アルキレン、トリアゾリル、(ピロリル)C₁₋₆アルキレン、ピロリジニルおよびピロリルから選択される5-9員ヘテロシクリル基を含んでなる置換基で置換されている、請求項12に記載の化合物。

【請求項 20】

Qがピペリジニルである、請求項19に記載の化合物。

【請求項 21】

R⁸が水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 22】

R⁹がC₁₋₆アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 23】

R⁹が未置換若しくは置換フェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^8 および R^9 が独立にC₁₋₆アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^8 および R^9 がメチルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^8 および R^9 がエチルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R^9 がフェニル若しくは5-9員芳香族ヘテロシクリルから選択され、ここで前記フェニル若しくは芳香族ヘテロシクリルが、メトキシ、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチルおよびC₁₋₃アルキルから選択される1~3個の置換基で場合によつては置換されている、請求項21に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R^9 が、置換若しくは未置換のフェニル、ピリジル、ピリミジル、フリル、チオフリル、イミダゾリル、(イミダゾリル)C₁₋₆アルキレン、オキサゾリル、チアゾリル、2,3-ジヒドロインドリル、ベンズイミダゾリル、2-オキソベンズイミダゾリル、(テトラゾリル)C₁₋₆アルキレン、テトラゾリル、(トリアゾリル)C₁₋₆アルキレン、トリアゾリル、(ピロリル)C₁₋₆アルキレン、ピロリジニルおよびピロリルから選択される、請求項27に記載の化合物。

【請求項 2 9】

R^9 がフェニルである、請求項28に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R^9 が置換若しくは未置換のピリジルである、請求項28に記載の化合物。

【請求項 3 1】

R^1 がC₁₋₁₀アルキルであり；

XがOであり；

R^4 がGであり；

Lが-C H₂-であり；かつ

Qが飽和のN結合した窒素を含有するヘテロシクリルである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項 3 2】

R^1 が分枝状である、請求項31に記載の化合物。

【請求項 3 3】

R^1 がC₃₋₅アルキルである、請求項31に記載の化合物。

【請求項 3 4】

R^1 がイソプロピルである、請求項31に記載の化合物。

【請求項 3 5】

Qが、置換若しくは未置換のピペリジニル、ジアゼパニル、アゼパニル、デカヒドロイソキノリン-2-イル、ピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニル若しくはモルホリニルから選択される、請求項31に記載の化合物。

【請求項 3 6】

Qが、未置換のアゼパニル、ジアゼパニル、モルホリニル、デカヒドロイソキノリン-2-イル、ピペリジニル若しくはピロリジニルである、請求項31に記載の化合物。

【請求項 3 7】

(4-{[エチル-(2-メトキシエチル)-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-アゼパン-1-イルメチルフェニル)-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)-メタノン二塩酸塩；
 (4-アゼパン-1-イルメチルフェニル)-(4-sec-ブチルピペラジン-1-イル)-メタノン；
 (4-アゼパン-1-イルメチルフェニル)-{4-(1-エチルプロピル)-ピペラジ

ン - 1 - イル} - メタノン；
(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - メタノン；
(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；
(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - {4 - {(4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン；
(4 - シクロヘキシリピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - ジエ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) - メタノン二塩酸塩；
(4 - ジ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) - メタノン二塩酸塩；
(4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (3 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - {[(2 - メトキシエチル) - プロピルアミノ] - 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 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - フェニルアミノメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - チオモルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシエチルアミノ) - 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 - (ピリジン - 2 - イルアミノメチル) - フェニル] - メタノン；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシ - 1 - メチルエチルアミノ) - 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 - {(4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 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 - {(4 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - {(5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - {(6 - トリフルオロメチルピリジ

ン - 3 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
 (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) -
 メタノン二塩酸塩；
 (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) -
 メタノン二塩酸塩；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル)
 - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェ
 ニル) - メタノン二塩酸塩；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - フェニルアミノメチルフェニル)
 - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェ
 ニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - { 4 - (3 - トリフルオロメチルピペリ
 ジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
 { 3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル } - (4 - メチルピペラ
 ジン - 1 - イル) - メタノン；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - モルホリン - 4 - イル
 メチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - フェニルアミノメチル
 フェニル) - メタノン二塩酸塩；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - ピペリジン - 1 - イル
 メチルフェニル) - メタノン；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - ピロリジン - 1 - イル
 メチルフェニル) - メタノン；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - { 4 - (3 - トリフルオロメ
 チルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - { 4 - (デカヒドロイソキノ
 リン - 2 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；
 { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル } - { 4 - { (4 - トリフルオロ
 メチルフェニルアミノ) - メチル } - フェニル } - メタノン二塩酸塩；
 { 4 - (1 - メチルヘプチル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - モルホリン - 4 - イル
 メチルフェニル) - メタノン；
 { 4 - (1 - メチルヘプチル) - ピペラジン - 1 - イル } - (4 - ピペリジン - 1 - イル
 メチルフェニル) - メタノン；
 { 4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル } - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イ
 ル) - メタノン二塩酸塩；
 { 4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル } - { 4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラ
 ジン - 1 - イル } - メタノン；および
 { 4 - { (5 - クロロピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル } - フェニル } - (4 - イソ
 プロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノン二塩酸塩
 よりなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

(4 - { [エチル - (2 - メトキシエチル) - 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 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル
) - メタノン二塩酸塩；
 (4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イ

ル) - メタノン；

(4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン；

(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - メタノン；

(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - ブチルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；

(4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - ジエ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) - メタノン二塩酸塩；

(4 - ジ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) - メタノン二塩酸塩；

(4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (3 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - {[(2 - メトキシエチル) - プロピルアミノ] - 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 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - フェニルアミノメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - チオモルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシエチルアミノ) - 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 - (ピリジン - 2 - イルアミノメチル) - フェニル] - メタノン；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシ - 1 - メチルエチルアミノ) - 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 - {(5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - {(6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - メタノン二塩酸塩；

(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - s e c - ブチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル)

- メタノン；

(4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - フェニルアミノメチルフェニル) - メタノン；

(4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；

{4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；

{4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

{4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

{4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；

{4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - {4 - (デカヒドロイソキノリン - 2 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；

{4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル} - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノン二塩酸塩；

{4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル} - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン；および

{4 - {(5 - クロロピリジン - 2 - イルアミノ) - メチル} - フェニル} - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノン二塩酸塩

よりなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項39】

(4 - {[エチル - (2 - メトキシエチル) - 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 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノン二塩酸塩；

(4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - メタノン；

(4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン；

(4 - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - シクロヘキシリルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；

(4 - ジエ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) - メタノン二塩酸塩；

(4 - ジ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) - メタノン二塩酸塩；

(4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン二塩酸塩；

(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - {[(2 - メトキシエチル) - プロピルアミノ] - 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 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル)

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 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノンニ塩酸塩；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - チオモルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノンニ塩酸塩；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシエチルアミノ) - 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 - (ピリジン - 2 - イルアミノメチル) - フェニル] - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - [(2 - メトキシ - 1 - メチルエチルアミノ) - メチル] - フェニル} - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノンニ塩酸塩；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノンニ塩酸塩；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノンニ塩酸塩；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - {4 - (デカヒドロイソキノリン - 2 - イルメチル) - フェニル} - メタノン；
 {4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル} - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノンニ塩酸塩；および
 {4 - (ベンジルアミノメチル) - フェニル} - {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - メタノン

よりなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項40】

(4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - メタノンニ塩酸塩；
 (4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - メタノン；
 (4 - シクロヘキシリピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノンニ塩酸塩；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - {4 - (3 - トリフルオロメチルピペリジ

ン - 1 - イルメチル) - フェニル} - メタノン二塩酸塩；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ジメチルアミノメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；および
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン

よりなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

(4 - アゼパン - 1 - イルメチルフェニル) - (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン；
 (4 - s e c - プチルピペラジン - 1 - イル) - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩；および
 {4 - (1 - エチルプロピル) - ピペラジン - 1 - イル} - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - メタノン二塩酸塩

よりなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

請求項 1 に記載の化合物および製薬学的に許容できる賦形剤を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項 4 3】

P E T 若しくは S P E C T により検出されるように同位体標識された請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

被験体におけるヒスタミン H₃受容体活性の阻害用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 4 5】

ヒタミン H₃受容体活性により調節される疾患若しくは状態を有する被験体の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 4 6】

前記疾患若しくは状態が、睡眠 / 覚醒 (w a k e) 障害、覚醒 (a r o u s a l) / 覚醒 (v i g i l a n c e) 障害、偏頭痛、喘息、認知症、認識障害、神経原性の炎症、軽度の認識障害 (前認知症)、アルツハイマー病、癲癇、ナルコレプシー、摂食障害、肥満、乗物酔い、眩暈、注意欠陥多動障害、学習障害、記憶保持障害、統合失調症、物質濫用、双極性障害、躁病およびうつ、鼻うっ血、痒感、アレルギー性鼻炎および上部気道アレ

ルギー応答よりなる群から選択される、請求項 4 5 に記載の使用。

【請求項 4 7】

(a) 有効成分としてのヒスタミン H₁受容体アンタゴニスト化合物、および(b) 有効成分としての請求項 1 に記載の化合物を組み合わせたことを特徴とする、ヒスタミン H₁受容体およびヒスタミン H₃受容体から選択される最低 1 種の受容体により調節される疾患若しくは状態の治療用医薬組成物。

【請求項 4 8】

ヒスタミン H₁受容体アンタゴニストおよび請求項 1 に記載の化合物が同一の投薬形態物中に存在する、請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

(a) 有効成分としてのヒスタミン H₂受容体アンタゴニスト化合物、および(b) 有効成分としての請求項 1 に記載の化合物を組み合わせたことを特徴とする、被験体におけるヒスタミン H₂受容体およびヒスタミン H₃受容体から選択される最低 1 種の受容体により調節される疾患若しくは状態の治療用医薬組成物。

【請求項 5 0】

ヒスタミン H₂受容体アンタゴニストおよび請求項 1 に記載の化合物が同一の投薬形態物中に存在する、請求項 3 9 に記載の組成物。

【請求項 5 1】

睡眠 / 覚醒 (w a k e) 障害、ナルコレプシーおよび覚醒 (arousal) / 覚醒 (vigilance) 障害よりなる群から選択される 1 種若しくはそれ以上の障害若しくは状態の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 2】

注意欠陥多動障害 (A D H D) の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 3】

認知症、軽度の認識障害 (前認知症)、認知障害、統合失調症、うつ、躁病、双極性障害、ならびに学習および記憶障害よりなる群から選択される 1 種若しくはそれ以上の障害若しくは状態の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 4】

上部気道アレルギー応答、搔痒感、鼻うっ血若しくはアレルギー性鼻炎の治療若しくは予防用医薬組成物を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 5】

陽電子断層撮影法 (P E T) の分子プローブとして請求項 1 に記載の¹⁸F 標識若しくは¹¹C 標識化合物を使用することを含んでなる、ヒスタミン H₃受容体により媒介される障害の研究方法。