【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12月7日(2006.12.7)

【公表番号】特表2002-521463(P2002-521463A)
【公表日】平成14年7月16日(2002.7.16)
【出願番号】特願2000-562103(P2000-562103)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/135　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/136　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/138　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/275　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/40　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/428　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/44　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/445　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4453　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4523　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4545　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4709　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/495　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/506　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/5375　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/55　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　3/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　11/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　11/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　13/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　15/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　21/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　217/18　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　217/16　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　251/48　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　255/54　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　207/18　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　211/14　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　211/58　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　211/60　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　211/62　(2006.01)

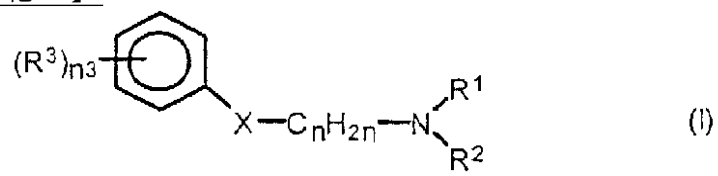
C07D 211/70 (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01)
C07D 215/38 (2006.01)
C07D 215/46 (2006.01)
C07D 239/42 (2006.01)
C07D 271/06 (2006.01)
C07D 277/82 (2006.01)
C07D 295/02 (2006.01)
C07D 295/08 (2006.01)
C07D 295/18 (2006.01)

【ＦＩ】

A61K 31/135
A61K 31/136
A61K 31/138
A61K 31/275
A61K 31/40
A61K 31/428
A61K 31/44
A61K 31/445
A61K 31/4453
A61K 31/4523
A61K 31/4545
A61K 31/4709
A61K 31/495
A61K 31/506
A61K 31/5375
A61K 31/55
A61P 1/00
A61P 1/04
A61P 3/04
A61P 11/02
A61P 11/06
A61P 13/00
A61P 15/00
A61P 19/02
A61P 21/00
A61P 25/00
A61P 25/06
A61P 25/18
A61P 25/24
A61P 25/28
A61P 29/00
A61P 37/08
A61P 43/00 101
A61P 43/00 113
C07C 217/18
C07C 217/16
C07C 251/48
C07C 255/54
C07D 207/18

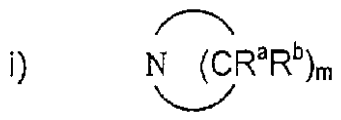
C07D 211/14
C07D 211/58
C07D 211/60
C07D 211/62
C07D 211/70
C07D 213/74
C07D 215/38
C07D 215/46
C07D 239/42
C07D 271/06
C07D 277/82
C07D 295/02 Z
C07D 295/08 Z
C07D 295/18 A

【手続補正書】
【提出日】平成18年7月28日(2006.7.28)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
下記一般式(Ｉ)を有する化合物：
【化１】

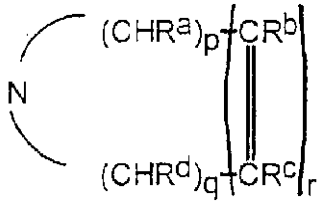


(I)

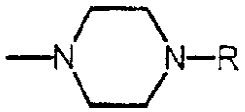
（ここで、
C_nH_{2n}は直鎖または分岐した炭化水素鎖（nは2～8の数）であり、
Ｘは酸素または硫黄原子であり、
R^1およびR^2は各々互いに独立して下記１）～５）のいずれかを表し、互いに同一でも異なってもよい：
１）　１～６の炭素原子を有するアルキルまたは３～６の炭素原子を有する飽和炭素環、あるいは、R^1およびR^2が結合している窒素原子と一緒になって、
２）　飽和窒素含有環：
【化２】



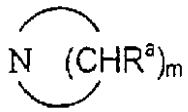
（ここで、ｍは２～8までの数を表す）
３）　非芳香族不飽和窒素含有環：
【化３】

ii) 

（ここで、ｐとｑは互いに独立して0～3までの数を表し、ｒは0～4までの数を表し、ただし、ｐとｑが同時に0になることはなく、２≦ｐ＋ｑ＋ｒ≦８であり、
$R^{a\sim d}$は互いに独立して水素原子、１～６の炭素原子を有するアルキル、３～６の炭素原子を有する飽和炭素環、カルボアルコキシ基を表す）、
４）　モルホリノ基、
５）　Ｎ-置換されたピペラジノ基：
【化４】



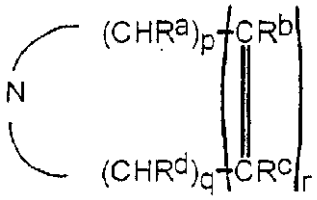
（ここで、Ｒは１～６の炭素原子を有するアルキル、３～６の炭素原子を有する飽和炭素環、カルボアルコキシ、アリール、アリールアルキル、アルカノイルまたはアロイル基を表す）
n_3は0～5までの整数であり、
R^3は各々互いに独立して下記1）～3）のいずれかを表す：
1）　ハロゲン原子、
2）　１～６の炭素原子を有するアルキル、３～６の炭素原子を有する飽和炭素環、トリフロロメチル、アリール、アルコキシ、痢-アルキルオキシアルキル、アリールオキシ、ニトロ、フォルミル、アルカノイル、アロイル、アリールアルカノイル、アミノ、カルボキシアミド、シアノ、アルキルオキシイミノ、アリールオキシイミノ、アルキルアルコキシイミノ、痢-ヒドロキシアルキル、アルケニル、アルキニル、スルファミド、スルファモイル、スルホンアミド、カルボアミド、カルボニルシクロアルキル、アルキルカルボニルアルキル、カルボアルコキシ、アリールアルキルまたはオキシム基、
3）　それが結合しているフェニル環の炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5-または6-員環またはベンゼン環を形成する）
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体の、ヒスタミンＨ３-受容体リガンドとして作用する医薬品の製造での使用。
【請求項２】
R^1とR^2が互いに独立して１～６の炭素原子を有するアルキル基である請求項1に記載の使用。
【請求項３】
R^1とR^2が各々エチル基である請求項2に記載の使用。
【請求項４】
-ＮR^1R^2が飽和した窒素含有環である請求項1に記載の使用：
【化５】

i) 

（ここで、ｍは請求項1で定義のもの）
【請求項５】
ｍが4、5または6である請求項4に記載の使用。

【請求項６】
-ＮＲ^{1}Ｒ^{2}がピペリジル基を表す請求項5に記載の使用。
【請求項７】
-ＮＲ^{1}Ｒ^{2}がピロリジニル基を表す請求項5に記載の使用。
【請求項８】
-ＮＲ^{1}Ｒ^{2}が下記の非芳香不飽和窒素含有環である請求項1に記載の使用：
【化６】

ii)



（ここで、ｐ、ｑ、ｒおよびＲ$^{a-d}$は請求項1に定義のもの）
【請求項９】
ｐ、ｑおよびｒが１または2、好ましくはｐが2で、ｑおよびｒが１である請求項8に記載の使用。
【請求項１０】
Ｒ$^{a-d}$が各々水素原子を表す請求項4～9のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１１】
窒素含有環i)またはii)がアルキル基でモノ置換またはジ置換された、好ましくはモノ置換されている請求項４～９のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１２】
窒素含有環がメチル基でモノ置換された請求項11に記載の使用。
【請求項１３】
置換基が窒素原子に対してメタ位である請求項11または12項に記載の使用。
【請求項１４】
-ＮＲ^{1}Ｒ^{2}がモルホリノ基である請求項1に記載の使用。
【請求項１５】
-ＮＲ^{1}Ｒ^{2}がN-置換されたピペラジノ基、好ましくはN-アセチルピペラジノである請求項1に記載の使用。
【請求項１６】
n_3が０である請求項1～の15のいずれか一項に記載の使用：
【請求項１７】
n_3が１で、Ｒ^{3}が請求項1に定義のもの、好ましくはパラ位にある1～の15のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１８】
Ｒ^{3}が低級アルキル、好ましくはC1-C4アルキルである請求項15～17のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１９】
Ｒ^{3}がハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アルカノイル、アルキルオキシイミノまたはヒドロキシアルキル、好ましくはCN、NO_2、$COCH_3$、COC_2H_5、H_3C-C=N-OHまたはH_3C－CHOHまたはシクロアルキル-COである請求項１～15および17のいずれか一項に記載の使用。
【請求項２０】
Ｒ^{3}がフェニル基の炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の５-または６員環、特に5,6,7,8 tert-ヒドロナフチル基を形成する請求項１～15のいずれか一項に記載の使用。
【請求項２１】
Ｒ^{3}がフェニル基と一緒になってナフチル基を形成する請求項１～15のいずれか一項に記載の使用。
【請求項２２】

-CnH_{2n}-が直鎖の炭化水素鎖-(CH_2)n-であり、ｎが請求項１に定義のものである請求項１～21のいずれか一項に記載の使用。

【請求項２３】

Ｘが酸素原子をである請求項１～22のいずれか一項に記載の使用。

【請求項２４】

Ｘが硫黄原子である請求項１～22のいずれか一項に記載の使用。

【請求項２５】

nが3～5、好ましくは3である請求項１～24のいずれか一項に記載の使用。

【請求項２７】

下記化合物の一つである請求項１～25のいずれか一項に記載の使用：

1-(5-フェノキシペンチル)－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)－ピロリジン
N-メチル-N-(5-フェノキシペンチル)－エチルアミン
1-(5-フェノキシペンチル)－モルホリン
N-(5-フェノキシペンチル)－ヘキサメチレンイミン
N-エチル-N-(5-フェノキシペンチル)－プロピルアミン
1-(5-フェノキシペンチル)-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-シクロプロパンカルボニルフェノキシ)プロピル]－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)-2-Ｒ-メチルプロピル]ピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]-4-メチルピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]-3-メチルピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)-2-S-メチルプロピル]ピペリジン
1-{3-[4-(3-オキソブチル)フェノキシ]プロピル}ピペリジン
1-[3-(4-シアノ-3-フルオロフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-ニトロフェノキシ)プロピル]-3-メチルピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-ニトロフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-ニトロフェノキシ)プロピル]-4-メチルピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]-2、6-ジメチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-3-メチルピペリジン
1-[3-(4-シクロブタンカルボニルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-シクロペンタンカルボニルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]－シス-2-メチル-5-エチルピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]－トランス-2-メチル-5-エチルピペリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]－シス-3, 5-ジメチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-4-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-{3-[4-(l-ヒドロキシプロピル)フェノキシ]プロピル}-3-メチルピペリジン
1-{3-[4-(l-ヒドロキシプロピル)フェノキシ]プロピル}-4-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-4-メチルピペリジンメトキシム
1-[3-(4-シアノフェノキシ)プロピル]－トランス-3,5-ジメチルピペリジン
1-[3-(4-シクロプロピルカルボニルフェノキシ)プロピル]－トランス-3,5－ジメチルピペリジン
1-[3-(4-シクロプロピルカルボニルフェノキシ)プロピル]-cis-3、5-ジメチルピペリジン
1-[3-(4-カルボメトキシフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-プロペニルフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-2-メチルピペリジン
1-{3-[4-(l-エトオキシプロピル)フェノキシ]プロピル}-2-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)プロピル]-4-メチルピペリジン

1-[3-(4-ブロモフェノキシ)プロピル]ピペリジン
I-[3-(4-ニトロフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-N,N-ジメチルスルフォンアミドフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-sec-ブチルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-プロピルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-[3-(4-エチルフェノキシ)プロピル]ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-4-プロピル－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-4-メチル－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-3-メチル－ピペリジン
1－アセチル-4-(5-フェノキシペンチル)－ピペラジン
1-(5-フェノキシペンチル)-3,5-トランス－ジメチル－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-3,5-シス－ジメチル－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-2,6-シス－ジメチル－ピペリジン
4-カルボエトキシ-1-(5-フェノキシペンチル)－ピペリジン
3-カルボエトキシ-I-(5-フェノキシペンチル)－ピペリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン
1-[5-(4-ニトロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-クロロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-メトキシフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-15-(4-メチルフェノキシ)－ペンチル)－ピロリジン
1-[5-(4-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(2-ナフチルオキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(l－ナフチルオキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(3-クロロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-フェニルフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-{5-[2-(5,6,7,8-tert-ヒドロナフチル)－オキシ]－ペンチル}－ピロリジン
1-[5-(3-フェニルフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-(5-フェノキシペンチル)-2,5-ジヒドロピロール
1-{5-[l-(5,6,7,8-tert-ヒドロナフチル)－オキシ]－ペンチル}－ピロリジン
1-(4-フェノキシブチル)－ピロリジン
1-(6-フェノキシヘキシル)－ピロリジン
1-(5-フェニルチオペンチル)－ピロリジン
1-(4-フェニルチオブチル)－ピロリジン
１-(3-フェノキシプロピル)－ピロリジン
1-[5-(3-ニトロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-フルオロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-ニトロフェノキシ)－ペンチル]-3-メチル－ピペリジン
1-[5-(4-アセチルフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-アミノフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(3-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
N-[3-(4-ニトロフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
1-[5-(4-ベンゾイルフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-{5-[4-(フェニルアセチル)－フェノキシ]－ペンチル}－ピロリジン
N-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
1-[5-(4-アセタミドフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-フェノキシフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-[5-(4-N-ベンズアミドフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-{5-[4-(l－ヒドロキシエチル)－フェノキシ]－ペンチル}－ピロリジン

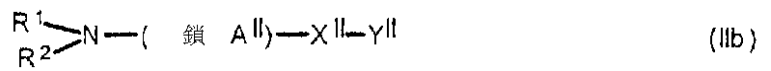
1-[5-(4-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ジエチルアミン
1-[5-(4-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ピペリジン
N-[5-(4-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ジメチルアミン
N-[2-(4-シアノフェノキシ)－エチル]－ジエチルアミン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ジメチルアミン
N-[4-(4-シアノフェノキシ)－ブチル]－ジエチルアミン
N-[5-(4-シアノフェノキシ)－ペンチル]－ジプロピルアミン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ピロリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ヘキサメチレンジアミン
N-[6-(4-シアノフェノキシ)－ヘキシル]－ジエチルアミン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ジプロピルアミン
N-3-[4-(l－ヒドロキシエチル)－フェノキシ]－プロピル－ジエチルアミン
4-(3-ジエチルアミノプロポキシ)－アセトフェノン－オキシム
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-3-メチル－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-3,5-トランス－ジメチル－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-4-メチル－ピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-3,5-cis-ジメチル－ピペリジン
1-[3-(4-フォルミルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
1-[3-(4-イソブチリルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
N-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
1-[3-(4-ブチリルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル] 1,2,3,6-テトラヒドロピリジン
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体。

【請求項２７】

下記の化合物の一つである請求項1～26のいずれか一項に記載の使用：
1-[5-(4-ニトロフェノキシ)－ペンチル]－ピロリジン
1-{5-[4-(l－ヒドロキシエチル)－フェノキシ]－ペンチル－ピロリジン
1-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ヘキサメチレンジアミン
N-3-[4-(l－ヒドロキシエチル)－フェノキシ]－プロピル－ジエチルアミン
4-(3-ジエチルアミノプロポキシ)－アセトフェノン－オキシム
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-3-メチル－ピペリジン
1-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]-4-メチルピペリジン
1-[3-(4-プロピオニルフェノキシ)－プロピル]－ピペリジン
N-[3-(4-シアノフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
N-[3-(4-アセチルフェノキシ)－プロピル]－ジエチルアミン
N-[4-(4-シアノフェノキシ)－ブチル]－ジエチルアミン
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体。

【請求項２８】

下記一般式（IIb）の化合物：
【化９】

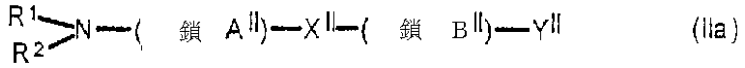


(IIb)

（ここで、
R^1とR^2は請求項1～15で定義のものであり、

鎖A^{II}は、硫黄原子のようなヘテロ原子によって中断されていてもよい１～６つの炭素原子を含む飽和または不飽和の直鎖または分枝した炭化水素鎖を表し、
X^{II}は酸素原子、硫黄原子、-NH-、-NHCO-、-N(アルキル)CO-、-NHCONH-、-NH-CS-NH-、-NHCS-、-O-CO-、-CO-O-、-OCONH-、-OCON(アルキル)－、-OCON(アルケン)、-OCONH-CO-、-CONH-、-CON(アルキル)－、-SO-、-CO-、-CHOH-、-N(飽和または不飽和アルキル)を表し、
鎖B^{II}はアリール、アリールアルキル、アリールアルカノイル基、１～５の炭素原子を含む直鎖のアルキレン鎖、２～８の炭素原子を含む分岐したアルキレン鎖（アルキレン鎖は必要に応じて1または複数の酸素または硫黄原子によって中断されていてもよい）、
Y^{II}は１～８の炭素原子含む直鎖または分岐したアルキル基、３～６の炭素原子を含むシクロアルキル、ビシクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、窒素および硫黄原子の中から選択される１つまたは２つのヘテロ原子を含む５員環または６員環の複素環基、または、ベンゼン環と上記定義のヘテロ環とが縮合して生じる二環式の基を表す）
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体の、ヒスタミンＨ３-受容体リガンドとして作用する医薬品の製造での使用。

【請求項２９】
下記一般式（IIa）の化合物：
【化１０】



（ここで、
R^1とR^2は請求項1～15で定義のものであり、
A^{II}鎖は分岐したまたは分岐していない不飽和アルキル基$-(CH_2)n_{II}-$（n_{II}は1～8の整数）、1～８の炭素原子を有する分岐したまたは分岐していないアルケン基、または１～４の炭素原子を有する分岐したまたは分岐していないアルキン基を表し、
X^{II}は-OCONH-、-OCON(アルキル)－、-OCON(アルケン)－、-OCO-、-OCSNH-、$-CH_2-$、-O-、$-OCH_2CO-$、-S-、-CO-、-CS-、アミン、飽和または不飽和アルキルを表し、
鎖B^{II}は1～８の炭素原子を有する分岐したまたは分岐していない不飽和低級アルキル、または$-(CH_2)n_{II}$(ヘテロ原子)（n_{II}は1～５の整数）を表し、
Y^{II}は未置換またはハロゲン原子、OCF_3、CHO、CF_3、SO_2N(アルキル)$_2$、NO_2、S(アルキル)、S(アリール)、SCH_2(フェニル)の中から選択される一つ以上の互いに同一かまたは異なる置換基でモノ置換または多置換されたフェニル基、分岐したまたは分岐していないアルケン、必要に応じてトリアルキルシリル基で置換されていてもよい分岐したまたは分岐してないアルキン、-O(アルキル)、-O(アリール)、$-CH_2CN$、ケトン、アルデヒド、スルホン、アセタール、アルコール、低級アルキル、-CH=CH-CHO、-C(アルキル)=N-OH、-C(アルキル)=NO(アルキル)、-CH=NOH、-CH=NO(アルキル)、$-C(アルキル)=NH-NH-CONH_2$、0-フェニルまたは$-OCH_2$(フェニル)基、-C(シクロアルキル)=NOH、-C(シクロアルキル)=N-O(アルキル)、必要に応じて置換されていてもよいヘテロ環、シクロアルキル、二環式基、1～８つの炭素原子を有する分岐したまたは分岐していない低級アルキル、1～８の炭素原子を有する分岐したまたは分岐していないアルキン、未置換であるか、モノ置換または多置換されたフェニル基でモノまたは多置換された直鎖または分岐したアルキル、アルキル基が分岐しているかまたは分岐していないか環式であるフェニルアルキルケトン、置換されまたは未置換のベンゾフェノン、置換されまたは未置換の分岐したまたは分岐していない環状フェニルアルコール、分岐したまたは分岐していないアルケン、ピペリジル基、フェニルシクロアルキル基、多環式基、フェノール基、ケトン基、ジフェニル基、フェノキシフェニル基、またはベンジルオキシフェニル基を表す）
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体の、ヒスタミンＨ３-受容体リガンドとして作用する医薬品の製造での使用。

【請求項３０】
X^{II}が-O-、-NH-、-CH_2-、-OCONH-、-NHCO-、-NHCONH-から選択され、好ましくは酸素原子を表す請求項２８または２９に記載の使用。
【請求項３１】
Y^{II}が、直鎖または分岐したアルキル基、シクロアルキル基、モノ置換されたのフェニル基、複素環基、二環式基の中から選択される請求項28～30のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３２】
Y^{II}がケト置換基でモノ置換されたフェニル基、特に、1～８つの炭素原子を有する必要に応じて水酸基を有する直鎖または分岐鎖を有する脂肪族ケトン、シクロアルキルケトン、アリールアルキルケトンまたはアリールアルケニルケトン、ヘテロアリールケトン、オキシムまたはハロゲン原子を表す請求項28～30のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３３】
Y^{II}が-CHO、ケトン、アルデヒド、-CH=CH-CHO、-C(アルキル)=N-OH、-C(アルキル)=N-O(アルキル)、-CH=N-OH、-CH=NO(アルキル)、-C(シクロアルキル)=NOH、-C(シクロアルキル)=N-O(アルキル)で置換されたフェニル基である請求項28～30のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３４】
鎖A^{11}が鎖-(CH_2)n_{II}-で、nが1～6である請求項28～33のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３５】
鎖B^{11}が-(CH_2)$_2$-または-(CH_2)$_3$-である請求項28～34のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３６】
Xが酸素原子で、式（Ila）の化合物のAが-(CH_2)$_3$-を表し、鎖Bが-(CH_2)$_3$-を表す請求項28～35のいずれか一項に記載の使用。
【請求項３７】
化合物が下記の化合物の一つである請求項28～36のいずれか一項に記載の使用：
3,3-ジメチルブチル3-ピペリジノプロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-ピペリジノプロピルエーテル
3-(4-クロロフェニル)プロピル3-ピペリジノプロピルエーテル
2-ベンゾチアゾリル3-ピペリジノプロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-(4-メチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-(3,5-cis-ジメチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-(3,5-トランス－ジメチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-(3-メチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-ピロリジノプロピルエーテル
3-(4-クロロフェニル)プロピル3-(4-メチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-(4-クロロフェニル)プロピル3-(3,5-シス－ジメチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-(4-クロロフェニル)プロピル3-(3,5-トランス－ジメチルピペリジノ)プロピルエーテル
3-フェニルプロピル3-(N,N-ジエチルアミノ)プロピルエーテル
N-フェニル-3-ピペリジノプロピルカルバメート
N- ベンチル-3-ピペリジノプロピルカルバメート
（S）-(+)-N-[2-(3、3- ジメチル)ブチル]-3-ピペリジノプロピルカルバメート
3-シクロペンチル-N-(3-(l－ピロリジニル)プロピル)プロパンアミド
N-シクロヘキシル-N'-(l－ピロリジニル-3-プロピル)尿素
2-((2-ピペリジノエチル)アミノ)ベンゾチアゾール
5-ピペリジノペンチルアミン
2-ニトロ-5-(6-ピペリジノヘキシル)ピリジン
3-ニトロ-2-(6-ピペリジノヘキシルアミン)ピリジン
2-(6-ピペリジノヘキシルアミノ)ピリミジン
N-(6-フェニルヘキシル)ピペリジン

N-フェニル-N'-(ジエチルアミノ-3-プロピル)尿素
N-ベンジル-N'-(3-ピペリジノプロピル)グアニジン
N-(3-(N,N-ジエチルアミノ)プロピル)N'-フェニル尿素
N-シクロヘキシルメチル-N'-(3-ピペリジノプロピル)グアニジン
上記化合物の薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体および鏡像異性体。

【請求項３８】

ヒスタミンＨ３-受容体リガンドが拮抗薬である請求項１～３７のいずれか一項に記載の使用。

【請求項３９】

中枢神経系障害の治療での請求項３８の使用。

【請求項４０】

アルツハイマー病、注意力および記憶力の疾患の治療での請求項３９の使用。

【請求項４１】

精神病理学上の認識欠乏の治療での請求項３９の使用。

【請求項４２】

高齢者の認識障害、抑うつ病、無気力の治療での請求項３９の使用。

【請求項４３】

肥満症、眩暈、動揺病の治療での請求項３９の使用。

【請求項４４】

ヒスタミンＨ３-受容体リガンドが作動薬または部分作動薬である請求項１～３８のいずれか一項に記載の使用。

【請求項４５】

神経系、呼吸系、心臓系、消化系、泌尿器系、生殖器系の疾患の治療での請求項４４の使用。

【請求項４６】

不眠、片頭痛、頭痛、痛み、向神経病、喘息、気管支炎、鼻炎、気管炎、心筋機能不全、潰瘍性梗塞形成、胃または十二指腸潰瘍、大腸炎、クローン病、過敏性腸症候群、膀胱炎、子宮筋層炎、糞尿失禁、じんま疹、痒み、関節炎、結膜炎、月経前症候群の治療での請求項４５の使用。

【請求項４７】

化合物が3-(4-クロロフェニル)プロピル-3-ピペリジノプロピルエーテル、その薬学的に許容される塩、水化物、水和塩、これらの化合物の多形結晶構造体、光学異性体、ラセミ化合物、ジアステレオ異性体または鏡像異性体である請求項１～４６のいずれか一項に記載の使用。

【請求項４８】

化合物が薬学的に許容される塩であた、この塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ハロゲン金属塩、水素化蓚酸塩手ある請求項１～４７のいずれか一項に記載の使用。