

【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11月24日(2006.11.24)

【公表番号】特表2006-505590(P2006-505590A)

【公表日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【年通号数】公開・登録公報2006-007

【出願番号】特願2004-547134(P2004-547134)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/541 (2006.01)
A 6 1 K 31/438 (2006.01)
A 6 1 K 31/445 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/08 (2006.01)
A 6 1 P 11/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/08 (2006.01)
A 6 1 P 25/18 (2006.01)
A 6 1 P 25/20 (2006.01)
A 6 1 P 25/26 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 207/09 (2006.01)
C 0 7 D 211/22 (2006.01)
C 0 7 D 211/26 (2006.01)
C 0 7 D 211/32 (2006.01)
C 0 7 D 211/44 (2006.01)
C 0 7 D 211/58 (2006.01)
C 0 7 D 401/06 (2006.01)
C 0 7 D 401/10 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 413/10 (2006.01)
C 0 7 D 491/20 (2006.01)
A 6 1 K 51/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/541
A 6 1 K 31/438
A 6 1 K 31/445
A 6 1 K 31/454
A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/26
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 207/09
 C 0 7 D 211/22 C S P
 C 0 7 D 211/26
 C 0 7 D 211/32
 C 0 7 D 211/44
 C 0 7 D 211/58
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 401/10
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 413/10
 C 0 7 D 491/20
 A 6 1 K 49/02 A

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月27日(2006.9.27)

【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

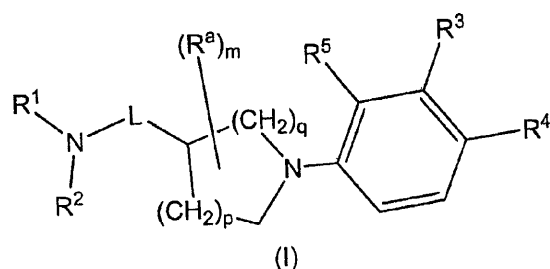
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中

L は、直接結合、または、NR¹R²がsp³混成炭素に結合されているC₁₋₄アルキレン若しくはC₃₋₄アルケニレン、NR¹R²がsp³混成炭素に結合されているC₃₋₄アルキニレン、NR¹R²がsp³混成炭素に結合されているC₂₋₄アルキリデン、NR¹R²が酸素に結合されていないアリールオキシ、NR¹R²がイオウに結合されていないアリールチオ、NR¹R²が酸素若しくは酸素に結合されている炭素に結合されていないC₂₋₄アルコキシ、NR¹R²がイオウ若しくはイオウに結合されている炭素に結合されていないC₂₋₄アルキルチオ、および - C₂₋₃アルキル - X - C₁₋₂アルキル - (式中XはO、S若しくはNHで

ありかつ NR^1R^2 は X に結合されている炭素に結合されていない) よりなる群から選択される場合によっては C_{1-4} 置換された基であり;

p は 0、1 若しくは 2 であり;

q は 1 若しくは 2 であるが; 但し $2 \leq p + q \leq 4$;

R^1 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-9} カルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレン、および (フェニル) C_{1-6} アルキレンよりなる群から独立に選択される置換基であり;

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-9} 員のカルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレン、および (フェニル) C_{1-6} アルキレンよりなる群から独立に選択される置換基であるか;

または、 R^1 および R^2 はそれらが結合されている窒素と一緒になって飽和の 3 - 13 員の N 結合したヘテロシクリルを形成し、ここで N 結合する窒素に加え、該 3 - 13 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、 R^1 および R^2 は、場合によっては tert - ブチルオキシカルボニル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、アミノ、シアノ、カルボキサミド、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシル、5 - 9 員ヘテロシクリル、- N (C_{1-6} アルキル) (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- NH (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- O (5 - 9 員ヘテロシクリル)、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-3} アルキレン、 C_{1-2} ヒドロキシアルキレン、 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 - よりなる群から選択される 1 ~ 3 個の置換基で独立に置換され; また、ここで、 R^1 および R^2 の前記置換基のそれぞれは、トリフルオロメチル、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、および C_{1-3} アルキルよりなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基を場合によっては有してもよく;

R^3 、 R^4 および R^5 の 1 つは G でありかつ他の 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 C_{1-3} アルコキシであり;

G は L^2Q であり;

L^2 は非分枝状 - $(\text{CH}_2)_n$ - であり、式中 n は 1 から 7 までの整数であり;

Q は NR^8R^9 であり、式中、 R^8 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-9} カルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレンおよび (フェニル) C_{1-6} アルキレンから独立に選択され; また、 R^9 は C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、3 - 9 員カルボシクリル、3 - 13 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレンおよび (フェニル) C_{1-6} 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 - 15 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 - 15 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 ~ 4 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、tert - ブチルオキシカルボニル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、アミノ、シアノ、カルボキサミド、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシル、5 - 9 員ヘテロシクリル、- N (C_{1-6} アルキル) (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- NH (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- O (5 - 9 員ヘテロシクリル)、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-3} アルキレン、 C_{1-2} ヒドロキシアルキレン、 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 (先行する段落に加えて) 選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換され; かつ

ここで、Q の前記置換基群は、トリフルオロメチル、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 個の置換基を場合によっては有してよく;

R^a は独立に C_{1-3} アルキル、トリフルオロメチルであり;

m は 0、1、2 若しくは 3 であり; かつ

ここで、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、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個の置換基で独立にかつ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。

【請求項2】

NR^1R^2 が一緒になって、置換若しくは未置換のモルホリニル、チオモルホリニル、ピペリジニル、メチルピペリジニル、ピペラジニル、N-メチルピペラジニル、ジメチルアミノ、ピロリジニル、アザトリシクロデカニル、シクロヘキシルメチルアミノ、メチルフェネチルアミノ、ピリジルアミノ、アニリノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、エチルプロピルアミノ、若しくはジプロピルアミノを形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

NR^1R^2 が一緒になって飽和のN結合した窒素を含有するヘテロシクリルを形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

NR^1R^2 が一緒になって、置換若しくは未置換のピペリジニル、置換若しくは未置換のピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニル、およびモルホリニルから選択される置換基を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

NR^1R^2 が一緒になって、N-(C_{1-6} 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置換基を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

NR^1R^2 が一緒になって、アジリジン、1,4,7-トリオキサ-10-アザシクロデカン、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'}-ピピリジニル、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-イルアミンよりなる群から選択されるアミンの一価の基を形成する、請求項2に記載の化合物。

【請求項7】

NR^1R^2 が一緒になってモルホリニルおよびピペリジニルよりなる群から選択される置換基を形成し、ここで前記置換基は、ヒドロキシ、ハロ、カルボキサミド、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシル、5-9員ヘテロシクリル、-N(C_{1-6} アルキル)(5-9員ヘテロシクリル)、-NH(5-9員ヘテロシクリル)、-O(5-9員ヘテロシクリル)、(5-9員ヘテロシクリル) C_{1-3} アルキレン、 C_{1-2} ヒドロキシアルキレン、 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-から選択される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、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4に記載の化合物。

【請求項8】

飽和のN結合した窒素を含有するヘテロシクリルが、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) C_{1-6} 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) C_{1-6} アルキレン、テトラゾリル、(トリアゾリル) C_{1-6} アルキレン、トリアゾリル、(ピロリル) C_{1-6} アルキレン、ピロリジニル、およびピロリルよりなる群から選択される置換基で置換されている、請求項3に記載の化合物。

【請求項9】

NR^1R^2 が一緒になってモルホリニル、ピペリジニル、ピロリジニル若しくはジエチルアミノを形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

Qがモルホリニル、ピペリジニル、ピロリジニル若しくはジエチルアミノである、請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

NR^1R^2 が一緒になってモルホリニル、ピペリジニル若しくはピロリジニルを形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

Qがモルホリニル、ピペリジニル若しくはピロリジニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項13】

NR^1R^2 が置換若しくは未置換のモルホリノである、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

R^3 および R^4 の1つがGである、請求項1に記載の化合物。

【請求項15】

R^4 がGである、請求項1に記載の化合物。

【請求項16】

R^3 がGである、請求項14に記載の化合物。

【請求項17】

qが2でありかつpが1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

qが1でありかつpが1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

qが2でありかつpが2である、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

Lが $-CH_2-$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項21】

Lが直接結合である、請求項1に記載の化合物。

【請求項22】

Lが $-CH_2CH_2-$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項23】

L^2 が $-CH_2-$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項24】

Qが、置換若しくは未置換のピロリジニル、ピペリジニル、メチルピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、アザトリシクロデカニル、シクロヘキシルアミノ、シクロヘキシルメチルアミノ、ピペラジニル、N-メチルピペラジニル、ジメチルアミノ、メチルフェネチルアミノ、ピリジルアミノ、アニリノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、エチルプロピルアミノ、ジプロピルアミノ、若しくは1,4,7,10-テトラオキサ-13-アザシクロペンタデカニル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25】

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 26】

Q が、置換ピペリジニル、未置換ピペリジニル、置換ピペラジニル、未置換ピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニルおよびモルホリニルよりなる群から選択される置換基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

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}デシル若しくは 1, 4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ{4.5}デシルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 28】

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'}ピピリジニル、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、アリルシクロベンチルアミン、{2 - (1H - インドル - 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ール - 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、およびピリジン - 2 - イルアミンよりなる群から選択されるアミンの一価の基である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 29】

Q がモルホリニル、ピリジル若しくはピペリジニルであり、かつ、Q が、ヒドロキシ、ハロ、カルボキサミド、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アシル、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)、- N H (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、C₁₋₂ヒドロキシアルキレン、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 と 3 個との間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、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 25 に記載の化合物。

【請求項 30】

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、ベンゾイミダゾリル、2 - オキサベンゾイミダゾリル、(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 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

Q が置換若しくは未置換のモルホリニルである、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

R⁸ が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 33】

R⁸ が C₁₋₆アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 34】

R⁸ がシクロヘキシルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 35】

R⁸ および R⁹ 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 36】

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 37】

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 38】

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、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 C_{1-3} アルキルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換されている、請求項 32 に記載の化合物。

【請求項 39】

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) C_{1-6} 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) C_{1-6} アルキレン、テトラゾリル、(トリアゾリル) C_{1-6} アルキレン、トリアゾリル、(ピロリル) C_{1-6} アルキレンおよびピロリルから選択される、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

R^9 が置換若しくは未置換のフェニルである、請求項 39 に記載の化合物。

【請求項 41】

R^9 が置換若しくは未置換のピリジルである、請求項 39 に記載の化合物。

【請求項 42】

R^1 および R^2 が C_2 アルキルから独立に選択されるか、若しくはそれらが結合されている窒素と一緒にあってそれらが O、S および NH から独立に選択される付加的なヘテロ原子を場合によっては包含する非芳香族 5 - 6 員ヘテロシクリルを形成し；

R^3 、 R^4 および R^5 の 1 つが G でありかつ残りの 2 つが H であり；

G が L^2 Q であり；

L^2 がメチレンであり；

Q が NR^8R^9 であり、式中 R^8 が、水素、 C_{1-2} アルキル、 C_3 アルケニル、 C_{5-9} カルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレン、および(フェニル) C_{1-6} アルキレンから独立に選択され；かつ、 R^9 が、 C_{1-2} アルキル、 C_3 アルケニル、 C_{5-9} 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) C_{1-6} アルキレン、および(フェニル) C_{1-6} アルキレンから独立に選択されるか；若しくは Q が飽和の 3 - 15 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て、該 3 - 15 員ヘテロシクリルが、O、S および NH から選択される 1 ~ 4 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、上のアルキル、アルキレン、アルケニル、アルケニレン、ヘテロシクリルおよびカルボシクリル基のそれぞれは、それぞれ、メトキシ、ハロ、アミノ、ニトロ、ヒドロキシおよび C_{1-3} アルキルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で独立にかつ場合によっては置換されていてもよく；

ここで、Q の置換基は、tert - ブチルオキシカルボニル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、アミノ、シアノ、カルボキサミド、5 - 9 員ヘテロシクリル、- NH (6 員ヘテロシクリル)、- O (6 員ヘテロシクリル)、 C_2 - ヒドロキシアルキレン、フェニル、ベンジルからさらに選択され得、また、ここで、Q の上のヘテロシクリル、フェニルおよびアルキル置換基群のそれぞれはトリフルオロメチルで場合によっては置換されていてよい、請求項 1 に記載の化合物、

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。

【請求項 43】

NR^1R^2 が一緒にあってモルホリニル、ピペリジニル、ピロリジニル若しくはジエチルアミノを形成し、

p が 1 でありかつ q が 2 であり、ならびに

Q が置換若しくは未置換のピペリジニル、ピペラジニル、ピロリニル、ピロリジニル、チオモルホリニルおよび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 4 4】

(a) NR^1R^2 が一緒になってピペリジニル若しくはピロリジニルを形成し、(b) n が 1 であり、(c) p が 1 でありかつ q が 2 であり、ならびに (d) Q がモルホリニルおよびピペリジニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

(a) NR^1R^2 が一緒になってピペリジニル若しくはピロリジニルを形成し、(b) n が 1 であり、(c) p が 1 でありかつ q が 2 であり、ならびに (d) Q がモルホリニルおよびピペリジニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

Q がピペリジニル若しくは置換ピペリジニルである、請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

NR^1R^2 が一緒になってピペリジニル、ピロリジニル若しくはジエチルアミノを形成し、

n が 1 であり、

p が 1 でありかつ q が 2 であり、ならびに

Q が NR^8R^9 であり、かつ、 R^8 が H であり、ならびに R^9 がフェニル若しくは芳香族 5 - 9 員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ヘテロシクリルが、トリフルオロメチル、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、および C_{1-3} アルキルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R^9 が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

4 - { 2 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - モルホリン；

シクロヘキシル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アザシクロトリデカン；

ジエチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

ジメチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

1 - メチル - 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペラジン；

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン - 4 - オール；

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - チオモルホリン；

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン；

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン；

4 - { 3 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - チオモルホリン；

4 - { 3 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - モルホリン；

4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (3 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) -

ピペリジン；

1 - { 3 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン；

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アザシクロトリデカン；

シクロヘキシル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン；

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン - 4 - オール；

1 - メチル - 4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペラジン；

4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - チオモルホリン；

4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - モルホリン；

ジメチル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン；

4 - { 2 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - モルホリン；

4 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン；

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン；

シクロヘキシル - { 1 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル } - アミン；

シクロヘキシルメチル - { 1 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル } - アミン；

4 - { 4 - { 4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - ピペリジン - 1 - イル } - ベンジル } - モルホリン；

エチルメチル - { 1 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル } - アミン；

4 - { 1 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル } - モルホリン；

4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - モルホリン；

1' - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - { 1 , 4' } ビピペリジニル；

1' - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - { 1 , 4' } ビピペリジニル；

(4 - { 1 , 4' } ビピペリジニル - 1' - イルベンジル) - ピリジン - 2 - イルアミン；

フェニル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

ピリジン - 2 - イル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

1 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン；

4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン；

(4 - フルオロフェニル) - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン；

4 - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - モルホリン；

ジエチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ;

メチルフェネチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ;

1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - 3 - トリフルオロメチルベンジル] - ピペリジン ;

1 - (2 - ニトロ - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン ;

4 - [3 - ニトロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - モルホリン ;

1 - [3 - ニトロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - トリフルオロメチルベンジル] - ピペリジン ;

1 - イソプロピル - 4 - [3 - メチル - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペラジン ;

1 - (2 - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピロリジン ;

1 - [3 - メチル - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピロリジン ;

1 - { 1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルピペリジン - 1 - イルメチル) - 2 - トリフルオロメチルフェニル] - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピロリジン ;

1 - (1 - { 3 - トリフルオロメチル - 4 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - ピペリジン - 1 - イルメチル] - フェニル } - ピペリジン - 4 - イルメチル) - ピロリジン ;

1 - { 1 - [2 - フルオロ - 4 - (4 - フェニルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピロリジン ;

[3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ジメチルアミン ;

1 - [3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン ;

1 3 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - トリフルオロメチルベンジル] - 1 , 4 , 7 , 10 - テトラオキサ - 1 3 - アザシクロペンタデカンジトリフルオロメタンスルホン酸塩 ; および

{ 1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - 3 - トリフルオロメチルベンジル] - ピペリジン - 4 - イル } - メタノール

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 50】

(4 - { 1 , 4 ' } ビピペリジニル - 1 ' - イルベンジル) - ピリジン - 2 - イルアミン ;

1 ' - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - { 1 , 4 ' } ビピペリジニル ;

1 ' - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - { 1 , 4 ' } ビピペリジニル ;

1 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン ;

4 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン ;

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン ;

1 - { 3 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン ;
 1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アザシクロトリデカン ;
 1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン - 4 - オール ;
 1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン ;
 1 - メチル - 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペラジン ;
 1 - メチル - 4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペラジン ;
 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン ;
 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - チオモルホリン ;
 4 - { 3 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - チオモルホリン ;
 4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - チオモルホリン ;
 4 - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - モルホリン ;
 4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (3 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン ;
 4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン ;
 シクロヘキシル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;
 シクロヘキシル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン ;
 シクロヘキシルメチル - { 1 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル } - アミン ;
 ジエチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;
 ジエチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ;
 ジメチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;
 ジメチル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン ;
 メチルフェネチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ;
 フェニル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;
 ピリジン - 2 - イル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;
 1 - (2 - ニトロ - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン ;
 1 - [3 - ニトロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - トリフルオロメチルベンジル] - ピペリジン ;

1 - (2 - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピロリジン ;

1 - [3 - メチル - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピロリドン ;

1 - { 1 - [4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルピペリジン - 1 - イルメチル) - 2 - トリフルオロメチルフェニル] - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピロリジン ;

1 - { 1 - [2 - フルオロ - 4 - (4 - フェニルピペリジン - 1 - イルメチル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピロリジン ;

[3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ジメチルアミン ; および

1 - [3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン

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 5 1】

1' - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - { 1 , 4' } ビピペリジニル ; 1 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン ;

4 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン ;

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン ;

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン ;

1 - メチル - 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペラジン ;

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン ;

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - チオモルホリン ;

4 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - チオモルホリン ;

4 - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - モルホリン ;

4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン ;

シクロヘキシル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;

シクロヘキシル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン ;

ジエチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;

ジエチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ;

ジメチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イル

メチル} - アミン；

ジメチル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン；

メチルフェネチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン；

ピリジン - 2 - イル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

1 - (2 - ニトロ - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン；

1 - [3 - ニトロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン - 4 - オール；

1 - (2 - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピロリジン；

[3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ジメチルアミン；および

1 - [3 - フルオロ - 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル] - ピペリジン

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 5 2】

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン - 4 - オール；

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン；

1 - メチル - 4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペラジン；

1 - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - ピペリジン；

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - モルホリン；

4 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - チオモルホリン；

4 - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - モルホリン；

4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン；

シクロヘキシル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

シクロヘキシル - { 4 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン - 1 - イル) - ベンジル } - アミン；

ジエチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

ジエチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン；

ジメチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン；

メチルフェネチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン；

1 - (2 - ニトロ - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピペリジン；および

1 - (2 - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 -

イルメチルピロリジン

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 5 3】

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン - 4 - オール ;

1 - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - ピペリジン ;

4 - ピロリジン - 1 - イルメチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン ;

4 - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - モルホリン ;

シクロヘキシル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;

ジエチル - { 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピペリジン - 4 - イルメチル } - アミン ;

ジエチル - { 2 - { 1 - (4 - ピペリジン - 1 - イルメチルフェニル) - ピロリジン - 3 - イル } - エチル } - アミン ; および

1 - (2 - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルフェニル) - 4 - ピロリジン - 1 - イルメチルピロリジン

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 5 4】

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 5 5】

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 5 6】

被験体におけるヒスタミンH₃受容体活性の阻害用製薬学的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 7】

ヒスタミン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の製薬学的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 8】

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、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、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、鼻うっ血、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 5 7 に記載の使用。

【請求項 5 9】

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の医薬の組み合わせシステムを提供するための (a) ヒスタミンH₁受容体アンタゴニスト化合物、および (b) 請求項 1 に記載の化合物の共同使用。

【請求項 6 0】

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 5 9 に記載の使用。

【請求項 6 1】

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の医薬の組み合わせシステムを提供するための (a) ヒスタミンH₂受容体アンタゴニスト化合物、および (b) 請求項 1

に記載の化合物の共同使用。

【請求項 6 2】

ヒスタミン H_2 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 6 1 に記載の使用。

【請求項 6 3】

睡眠 / 覚醒 (wake) 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製薬学的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 6 4】

注意欠陥多動障害 (ADHD) の治療用製薬学的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 6 5】

認知症、軽度の認知障害 (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製薬学的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 6 6】

上部気道アレルギー応答、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製薬学的製剤を製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。

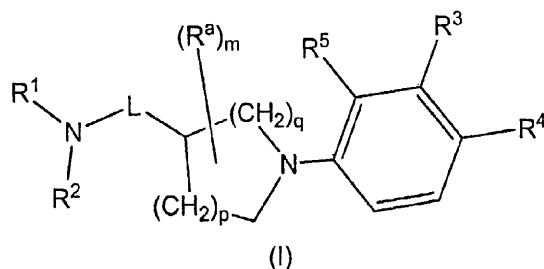
【請求項 6 7】

陽電子断層撮影法 (PET) の分子プローブとして請求項 1 に記載の ^{18}F 標識若しくは ^{11}C 標識化合物を使用することを含んでなる、ヒスタミン H_3 受容体により媒介される障害の研究方法。

【請求項 6 8】

式 (I) :

【化 2】



[式中

L は、直接結合、または、 NR^1R^2 が sp^3 混成炭素に結合されている C_{1-4} アルキレン若しくは C_{3-4} アルケニレン、 NR^1R^2 が sp^3 混成炭素に結合されている C_{3-4} アルキニレン、 NR^1R^2 が sp^3 混成炭素に結合されている C_{2-4} アルキリデン、 NR^1R^2 が酸素に結合されていないアリーロキシ、 NR^1R^2 がイオウに結合されていないアリールチオ、 NR^1R^2 が酸素若しくは酸素に結合されている炭素に結合されていない C_{2-4} アルコキシ、 NR^1R^2 がイオウ若しくはイオウに結合されている炭素に結合されていない C_{2-4} アルキルチオ、および $-C_{2-3}$ アルキル $-X-C_{1-2}$ アルキル $-$ (式中 X は O 、 S 若しくは NH でありかつ NR^1R^2 は X に結合されている炭素に結合されていない) よりなる群から選択される場合によっては C_{1-4} 置換された基であり；

p は 0、1 若しくは 2 であり；

q は 1 若しくは 2 であるが；但し $2 \leq p + q \leq 4$ ；

R^1 および R^2 は、水素、 C_{1-3} アルキル、アリル、 C_{3-8} シクロアルキル、5 - 9 員ヘテロシクリル、フェニル、および (フェニル) C_{1-3} アルキレンから独立に選択されるか、または、それらが結合されている窒素と一緒にあって、それらは、 O 、 S および NH から独立に選択される 2 個までの追加のヘテロ原子を場合によっては包含する非芳香族の 4 - 13 員ヘテロシクリルを形成し；また、式中 R^1 および R^2 は、場合によってはトリフルオロ

メチル、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシおよび C_{1-3} アルキルよりなる群から選択される置換基で独立に置換され；

R^3 、 R^4 および R^5 の 1 つは G でありかつ他の 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 C_{1-3} アルコキシであり；

G は $L^2 Q$ であり；

L^2 は非分枝状 - $(CH_2)_n$ - であり、式中 n は 1 から 7 までの整数であり；

Q は $NR^8 R^9$ であり、式中 R^8 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{4-9} カルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレンおよび (フェニル) C_{1-6} アルキレンから独立に選択され；また、 R^9 は C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{4-9} 員カルボシクリル、3 - 12 員ヘテロシクリル、フェニル、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-6} アルキレンおよび (フェニル) C_{1-6} 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 - 15 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 - 15 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 ~ 4 個の追加のヘテロ原子を場合によっては含有してよく；

また、ここで、Q は、tert - ブチルオキシカルボニル、ヒドロキシ、ハロ、ニトロ、アミノ、シアノ、カルボキサミド、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アシル、5 - 9 員ヘテロシクリル、- N (C_{1-6} アルキル) (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- NH (5 - 9 員ヘテロシクリル)、- O (5 - 9 員ヘテロシクリル)、(5 - 9 員ヘテロシクリル) C_{1-3} アルキレン、 C_{1-2} ヒドロキシアルキレン、 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 (先行する段落に加えて) 選択される 1 ~ 3 個の置換基で場合によっては置換され；かつ、ここで、Q の前記置換基群はトリフルオロメチル、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 個の置換基を場合によっては有してよく；

R^a は独立に C_{1-3} アルキル、トリフルオロメチルであり；また、

m は 0、1、2 若しくは 3 である]

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。