

【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21年7月16日(2009.7.16)

【公表番号】特表2008-543765(P2008-543765A)

【公表日】平成20年12月4日(2008.12.4)

【年通号数】公開・登録公報2008-048

【出願番号】特願2008-515924(P2008-515924)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5513 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 5 2

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/5513

A 6 1 P 15/18

【手続補正書】

【提出日】平成21年6月1日(2009.6.1)

【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

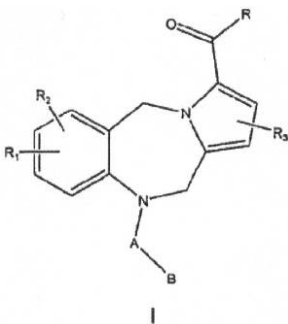
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式Iを有する化合物であって：

【化1】



ここで、

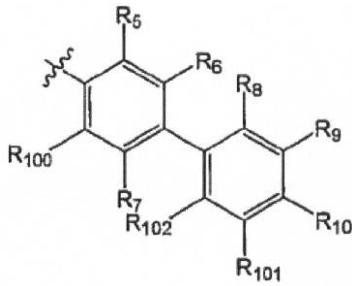
R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素、 (C_1-C_6) アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 OCF_3 、カルボキシ、 $-CONH[(C_1-C_6)$ アルキル]、または $-CON[(C_1-C_6)$ アルキル] $_2$ 、アミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、 $-NHCO[(C_1-C_6)$ アルキル]から選択され；

R_3 は、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ、ヒドロキシル、アミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、 $C(O)-(C_1-C_6)$ アルキル、およびハロゲンからなる群から選択され；

Aは $C=O$ 、 CH_2 および SO_2 からなる群から選択され、

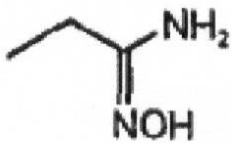
Bは以下であって：

【化 2】

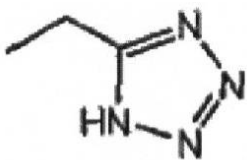


ここで、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₀₀、R₁₀₁およびR₁₀₂は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルコキシ、トリハロメチル、ハロゲン、-C(O)アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルキルオキシアルキル、-CH(OH)アルキル、-CH(アルコキシ)アルキル、ホルミル、ニトロ、チオアルキル、-SO₂アルキル、-SO₂NHR₁₁、-SO₂N(R₁₁)₂、-(CH₂)_PCN、-(CH₂)_PCOOR₁₂、-(CH₂)_PNR₁₃R₁₄、-(CH₂)_PCONR₁₃R₁₄、-CH=NOH、-CH=NO-アルキル、

【化 3】



【化 4】



およびアルキルで任意に置換された-C(O)アリアルからなる群から選択され；

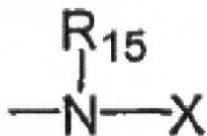
R₁₁およびR₁₂は、それぞれ独立して水素またはアルキルであり；

R₁₃およびR₁₄は、それぞれ独立して水素またはアルキルであるか；あるいは、窒素に結合されて、窒素と共に、1つ以上の追加的なO、SまたはN原子を任意に含有する4~6員環の飽和環を形成することができ；

Pは0または1であり；

Rは、

【化 5】

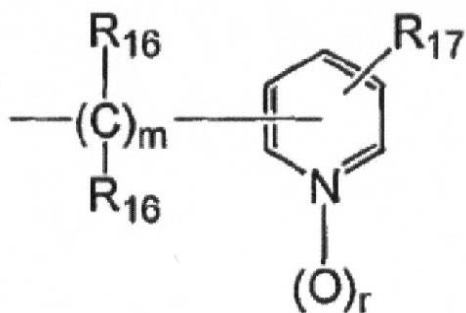


からなる基であり、ここで、

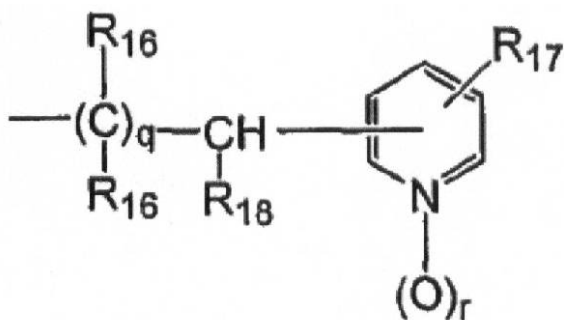
R₁₅は水素またはアルキルであり；

Xは、

【化6】



【化7】



からなる群から独立して選択され；ここで、

各存在における R_{16} は、それぞれ独立して水素またはアルキルから選択され；

R_{17} は、水素、アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、アリアルオキシまたはヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択される1~3個の置換基であり；

R_{18} は、1個の窒素原子を含有する5または6員環の飽和複素環であり；

m は1~4の整数であり；

q は1~2の整数であり；および

r は0または1であり；

ここで仮に、

AがC=Oであり、 m が1または2であり、 r が0であり、 R_7 がメチルまたはメトキシであり、そして R_5 、 R_6 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} 、 R_{100} および R_{101} が水素である場合は、 R_{102} はメチルでもメトキシでもなく；

AがC=Oであり、 m が2であり、 r が0であり、 R_6 がメトキシであり、そして R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} 、 R_{100} 、 R_{101} および R_{102} が水素である場合は、 R_8 はメトキシではなく；

AがC=Oであり、 m が1または2であり、 r が0であり、 R_6 がメチルまたはメトキシであり、そして R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_{10} 、 R_{17} 、 R_{100} 、 R_{101} および R_{102} が水素である場合は、 R_9 はメトキシではなく；

AがC=Oであり、 m が2であり、 r が0であり、 R_6 が塩素であり、 R_{100} がメトキシである場合は、 R_{101} がメトキシではなく、ここで、 R_5 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} および R_{102} は水素であるか、または、 R_{102} がメチルではなく、ここで、 R_5 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} および R_{101} は水素であり；

AがC=Oであり、 m が1または2であり、 r が0または1であり、 R_7 がメチルであり、そして R_5 、 R_6 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} 、 R_{100} 、 R_{101} および R_{102} が水素である場合は、 R_8 はトリフルオロメチルではなく；

AがC=Oであり、 m が1であり、 r が0であり、 R_7 がメトキシであり、そして R_5 、 R_6 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{17} 、 R_{100} および R_{102} が水素である場合は、 R_8 が塩素ではなく、ここで R_{101} は水素であるか、または、 R_{101} がメトキシではなく、ここで、 R_8 は水素であり；

AがC=0であり、mが1であり、rが0であり、R₅がメトキシであり、R₇が塩素であり、そしてR₆、R₁₀、R₁₇、R₁₀₀、R₁₀₁およびR₁₀₂が水素である場合は、R₈がトリフルオロメチルでも、塩素でも、メチルでもなく、ここで、R₉は水素であるか、または、R₉がメトキシではなく、ここで、R₈は水素であり；

AがC=0であり、mが2であり、rが0であり、R₇がメチルであり、そしてR₅、R₆、R₉、R₁₀、R₁₇、R₁₀₀、R₁₀₁およびR₁₀₂が水素である場合は、R₈はメトキシではなく；

AがC=0であり、mが1または2であり、rが0または1であり、R₆が塩素であり、R₁₀₀がメトキシであり、そしてR₅、R₇、R₉、R₁₀およびR₁₇が水素である場合は、R₈がエトキシではなく、ここで、R₁₀₁およびR₁₀₂は水素であるか、または、R₁₀₁はメチルではなく、ここで、R₈およびR₁₀₂は水素であるか、または、R₁₀₂がフッ素でも、トリフルオロメチルでも、メチルでもなく、ここで、R₈およびR₁₀₁は水素であり；

AがC=0であり、mが1または2であり、rが0であり、R₇がメチルであり、そしてR₅、R₆、R₈、R₉、R₁₀、R₁₇、R₁₀₀およびR₁₀₂が水素である場合は、R₁₀₁はメトキシではなく；

AがC=0であり、mが1であり、rが0または1であり、R₆がメトキシであり、R₁₀₂がトリフルオロメチルであり、そしてR₅、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₇およびR₁₀₁が水素である場合は、R₁₀₀は水素でもメトキシでもなく；

AがC=0であり、mが1または2であり、rが0であり、R₈がメチルであり、そしてR₅、R₇、R₉、R₁₀、R₁₇、R₁₀₀、R₁₀₁およびR₁₀₂が水素である場合は、R₆は水素でもメチルでもなく；そして、

AがC=0であり、mが1または2であり、rが0であり、そしてR₅、R₆、R₇、R₉、R₁₀、R₁₇、R₁₀₀、R₁₀₁およびR₁₀₂が水素である場合は、R₈はメトキシではない、前記化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項2】

R₁、R₂およびR₃がそれぞれ水素であり、R₁₅が水素またはメチルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

各R₁₆が水素であり、mが1であり、rが0であり、少なくとも1つのR₁₇が水素ではない、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R₁₆が水素であり、mが1であり、rが0であり、R₁₇のいずれもが水素ではない、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項5】

各R₁₆およびR₁₇が水素であり、qが1であり、rが0であり、R₁₈が5員環の飽和シクロアルキルアミンである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項6】

AがSO₂である、請求項1～10のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

R₁₆およびR₁₇が水素であり、mが1であり、rが0であり、R₆がメチルである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項8】

R₁₆およびR₁₇が水素であり、mが1であり、rが0であり、R₇がメチルまたはメトキシである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項9】

R₁₆およびR₁₇が水素であり、mが1であり、rが0であり、R₈がメチル、塩素、ヒドロキシ、メトキシ、-COCH₃、-CHO、-CH(OH)CH₂CH₃、-CH₂OH、-CN、-CH(CH₃)₂、-CO(フェニル)、-CH₂OCH₃、-CH₂COOCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂CN、-SCH₃、-CH₂COOH、-CH(OH)CH₃、-COCH(CH₃)₂、-SO₂CH₃、-COOCH₃、-COOC(CH₃)₃、-COOH、-CH₂CONH₂、-CH₂CONHCH₃、-CH₂CON(CH₃)₂、-CH₂CONH(CH₂CH₃)、-CH₂CON(CH₂CH₃)₂、-CH(OH)CH(CH₃)₂、-CON(CH₃)₂、-CH₂N(CH₃)₂、-CH₂NHCH₃、-CH₂C(NH₂)=NOH、-CH₂NH₂、-SO₂NH₂、-CONHCH₃、および1つ以上のO、SまたはN原子を任意に含有する4～6員環の飽和環からなる群から選択される、請求項1または2に記載の化合物。

載の化合物。

【請求項 1 0】

R_8 が $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$ および $-\text{CH}_2\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOH}$ からなる群から選択される、請求項 8 に記載の化合物。

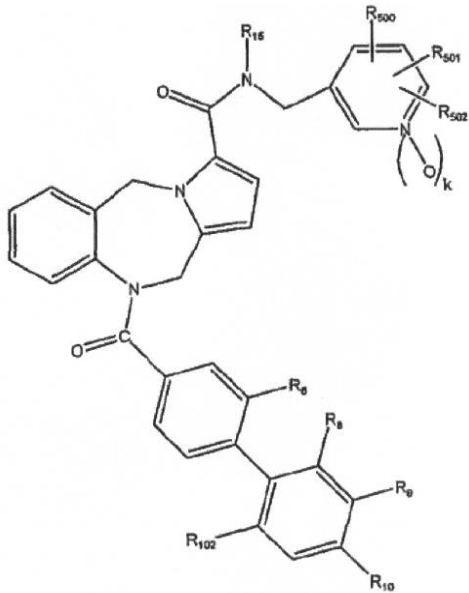
【請求項 1 1】

R_{16} および R_{17} が水素であり、 m が 1 であり、 r が 1 であり、 R_7 がメチルであり、 R_8 がメチルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

以下の式 I-2 を有する化合物であって：

【化 8】



I-2

ここで、 R_6' は、H または (C_{1-3}) アルキルであり；

R_8' は、H、 (C_{1-3}) アルコキシ、ハロゲン、 (C_{1-3}) アルキル、 (C_{1-5}) ヒドロキシアルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{600}$ 、 CN 、 (C_{1-3}) アルコシアルキル、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}_{601}$ 、 CH_2CN 、 $\text{HC}=\text{NOH}$ 、 OH 、 $\text{S}((\text{C}_{1-3})$ アルキル)、 $\text{SO}_2((\text{C}_{1-3})$ アルキル)、 $\text{CH}_2\text{N}(\text{R}_{602})(\text{R}_{603})$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOH}$ および SO_2NH_2 からなる群から選択され；

R_9' は、H、ハロゲンまたは (C_{1-3}) アルキルであり；

R_{10}' は、H、ハロゲン、 (C_{1-3}) アルキル、または $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-3})$ アルキルであり；

R_{102}' は、H または (C_{1-3}) アルキルであり；

R_{15} は、水素またはアルキルであり；

R_{500} は、H、OH、ハロゲン、 (C_{1-3}) アルキル、または O-フェニルであり；

R_{501} および R_{502} は、それぞれ独立して H または OH であり；そして、

k は 0 または 1 であり；

ここで、

R_{600} は、H、OH、 (C_{1-3}) アルキル、フェニル、 (C_{1-6}) アルコキシまたは $\text{NR}_{602}\text{R}_{603}$ であり；

；

R_{601} は、OH、 (C_{1-3}) アルコキシまたは $\text{NR}_{602}\text{R}_{603}$ であり；そして、

R_{602} および R_{603} は、それぞれ独立して H または (C_{1-3}) アルキルであるか、または、

R_{602} および R_{603} は、最大で 3 個の追加的な N または O 原子を有する 5~6 員環の複素環を共に形成し；

ここで仮に、

R_6' がメチルの場合は、 R_8' はメトキシではなく；

R_6' がメチルであり、 R_8' および R_{102}' のうち的一方がメチルである場合は、

(a) R_8' および R_{102}' のうちのもう一方はHではない、または

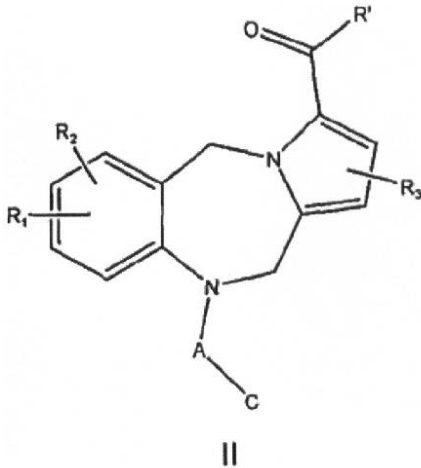
(b) $K=1$ 、のいずれかであり；そして、

R_6' 、 R_9' 、 R_{10}' 、 R_{102}' 、 R_{500} 、 R_{501} および R_{502} がすべてHである場合は、 R_8 はメチルでもメトキシでもない、前記化合物。

【請求項13】

以下の式IIの構造を有する化合物であって：

【化9】



ここで、

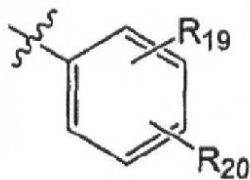
R_1 および R_2 は、独立して、水素、 (C_1-C_6) アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 OCF_3 、カルボキシ、 $-CONH[(C_1-C_6)$ アルキル]、または $-CON[(C_1-C_6)$ アルキル] $_2$ 、アミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、 $-NHCO[(C_1-C_6)$ アルキル]から選択され；

R_3 は、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ、ヒドロキシル、アミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、 $C(O)-(C_1-C_6)$ アルキル、およびハロゲンからなる群から選択される置換基であり；

Aは $C=O$ 、 CH_2 および SO_2 からなる群から選択され；

Cは、

【化10】



、 $-Y$ および Z からなる群から選択され、

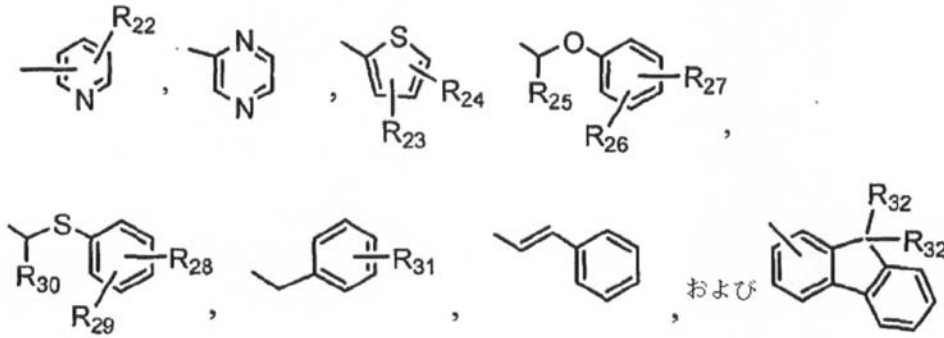
ここで、

R_{19} および R_{20} は、独立して、水素、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $-COOR_{21}$ 、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、アリーロキシ、アロイル、ナフチルおよび $-CH_2NHC(O)O-$ アルキルからなる群から選択されるか、または、 R_{19} および R_{20} は、フェニル部分に結合されて、フェニル部分と共に式 $-O(-CH_2)_n-$ （ここで、 n は1または2）の構造を形成することができ；

R_{21} は水素またはアルキルであり；

Y は、アルキル、シクロアルキル、ナフチル、

【化 1 1】



からなる群から選択され；

ここで、

R_{22} は、水素、アルキル、ハロゲン、アラルキルオキシ、アルキルアミノ、ヒドロキシアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、N-アルキルピペラジノ、(ピリジノアルキル)アミノ、(N-アルキル)アラルキルアミノ、およびアラルキルアミノからなる群から選択され、ここで、アリアルはアルコキシで任意に置換され；

R_{23} および R_{24} は、それぞれ独立して水素またはハロゲンであり；

R_{25} および R_{30} は、それぞれ独立して水素またはアルキルであり；

R_{26} 、 R_{27} 、 R_{28} および R_{29} は、独立して、水素、アルキルおよびハロゲンからなる群から選択され；

R_{31} は、水素、アルキル、ハロゲンまたはアリアルであり；そして、

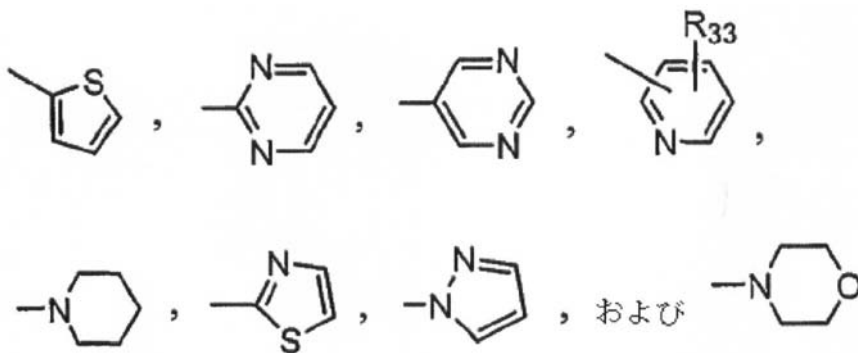
R_{32} は、それぞれ独立して、HまたはOHであるか、あるいは炭素に結合されて炭素と共に-C=Oを形成し；

Zは部分D-Eからなり、ここで、

Dは、水素、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、 $-SO_2NH_2$ 、およびトリフルオロメチルからなる群から選択される1つ以上の置換基によって任意に置換されるアリアルであり；そして、

Eは、

【化 1 2】

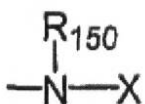


からなる群から選択され；

ここで、 R_{33} は水素またはアルキルであり；そして、

R' は、

【化 1 3】

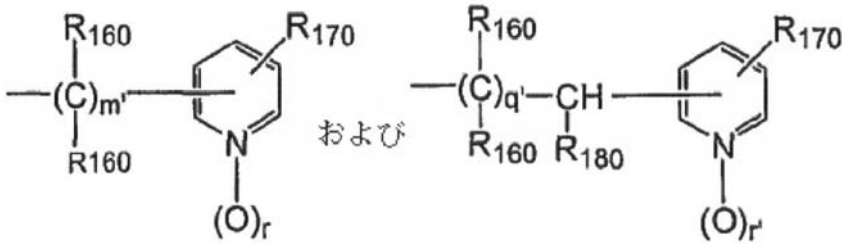


からなる基であり、ここで、

R_{150} は、水素またはアルキルであり；

Xは、独立して、

【化14】



からなる群から選択され；

ここで、

R_{160} は、水素またはアルキルであり；

R_{170} は、水素、アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、アリールオキシおよびヒドロキシア
ルキルからなる群から選択される1~3個の置換基であり；

R_{180} は、5または6員環の飽和シクロアルキルアミンであり；

m' は、1~4の整数であり；

q' は、1~2の整数であり；

r' は、0または1である、前記化合物、

またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項14】

R_{19} および R_{20} が、それぞれ独立して水素、アルキルおよびハロゲンからなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

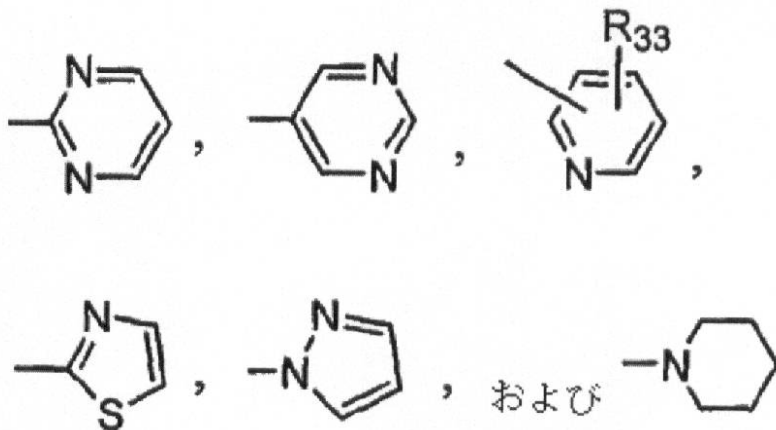
【請求項15】

R_{19} および R_{20} が、それぞれ独立して水素、メチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフル
オロメチル、アロイル、 $-OCF_3$ 、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-(CH_2)_2CH_3$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、
 $-N(O)=O$ 、 $-N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-CH_2NHCOCOC(CH_3)_3$ 、および $-O$ -フェニルからなる群から選択さ
れる、請求項13に記載の化合物。

【請求項16】

Dが、置換されていないアリールであり、Eが、

【化15】

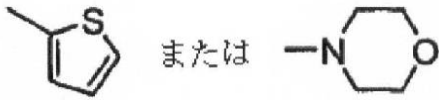


からなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項17】

Dが、メチルまたは $-S(O)_2NH_2$ によって置換されたアリールであり、Eが、

【化 1 6】

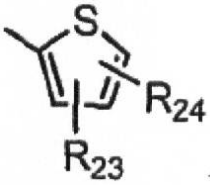


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

Yが、

【化 1 7】

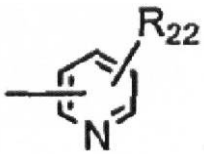


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

Yが、

【化 1 8】

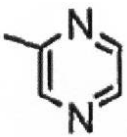


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

Yが、

【化 1 9】

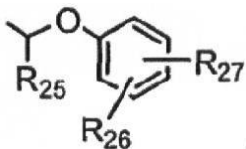


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

Yが、

【化 2 0】

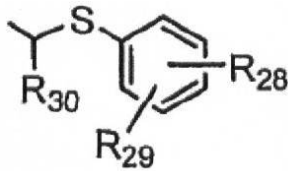


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

Yが、

【化 2 1】

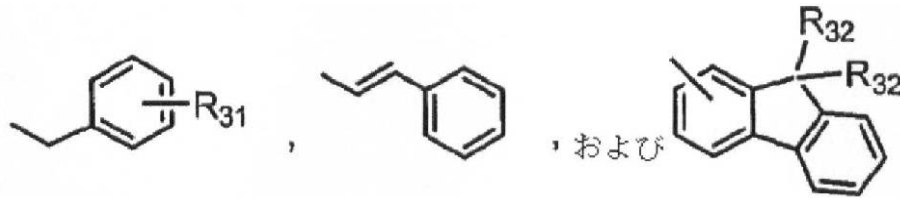


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

Yが、

【化 2 2】



からなる群から選択され、ここで、 R_{31} は塩素またはフェニルであり、 R_{32} はそれぞれ独立してHである、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

Yが3,3-ジメチルブタン、シクロヘキシル、イソブタン、1-ナフチルまたは2-ナフチルからなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

以下のいずれかである請求項 1 に記載の化合物：

- (a) 10-{{2'-((1-ヒドロキシエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；
- (b) 10-{{2'-((ヒドロキシメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；
- (c) 10-{{2'-((メトキシメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；
- (d) メチル(4'-{{3-((ピリジン-3-イルメチル)アミノ)カルボニル}-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル)カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-イル)アセテート；
- (e) (-)-10-{{2'-((1-ヒドロキシエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；
- (f) 10-{{2'-((2-アミノ-2-オキソエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；または
- (g) 10-{{2'-((2-アミノ-2-(ヒドロキシイミノ)エチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；あるいは、その薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 6】

以下のいずれかである請求項 1 に記載の化合物：

- (a) N-{{3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)-2-メチルピリジン-4-イル)メチル}-10-{{2'-((メトキシ-2'-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド}；

- (b) 10-[(2,2'-ジメチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-[(1-オキシドピリジン-3-イル)メチル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (c) N-[(5-プロモピリジン-3-イル)メチル]-10-[(2'-メトキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (d) 10-[(2'-メトキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-[(2-フェノキシピリジン-3-イル)メチル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (e) 10-[(2'-メトキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(2-ピリジン-3-イル-2-ピロリジン-1-イルエチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (f) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[(2,2',6'-トリメチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (g) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (h) 10-[(2',6'-ジメチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (i) 10-(1,1'-ビフェニル-4-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (j) 10-{[2'-(メチルチオ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミドの0.67水和物;
- (k) 10-{[2'-(メチルスルホニル)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (l) 10-{[2'-(アミノスルホニル)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (m) 10-{[2'-(シアノメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (n) 10-({2'-[2-アミノ-2-(ヒドロキシイミノ)エチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (o) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-{[2'-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (p) 10-[(2'-フルオロ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (q) 10-[(2'-クロロ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (r) 10-[(2,4'-ジメチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (s) 10-[(3'-クロロ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (t) 10-[(4'-クロロ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (u) 10-[(3',4'-ジクロロ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-

- 3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (v) 10-[(4'-アセチル-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (w) 10-[(2'-アセチル-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (x) 10-[(2'-シアノ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (y) 10-[(2'-イソプロピル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (z) メチル(4'-{[3-{(ピリジン-3-イルメチル)アミノ}カルボニル]-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-イル)アセテート;
- (aa) 10-[(2'-エトキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (bb) 10-[(2'-ヒドロキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (cc) (4'-{[3-{(ピリジン-3-イルメチル)アミノ}カルボニル]-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-イル)酢酸;
- (dd) 10-[(2'-イソブチリル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ee) 10-{{2'-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ff) 10-{{2'-(2-アミノ-2-オキソエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (gg) 10-{{2'-[2-(メチルアミノ)-2-オキソエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (hh) 10-{{2'-[2-(ジメチルアミノ)-2-オキソエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ii) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-{{2'-(ピロリジン-1-イルメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (jj) 10-{{2'-[(メチルアミノ)メチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (kk) 10-{{2'-(モルホリン-4-イルメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ll) 10-{{2'-(ピペリジン-1-イルメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (mm) 10-{{2'-[(ジメチルアミノ)メチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (nn) 10-{{2'-(アミノメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イ

ルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
 (oo) 10-[(2'-エトキシ-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-
 イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミ
 ド;

(pp) 10-{{2'-(メトキシメチル)-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピ
 リジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カル
 ボキサミド;

(qq) 10-{{2'-(1-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-
 (ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-
 カルボキサミド;

(rr) 10-[(2'-アセチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチ
 ル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ss) 10-{{2'-(1-ヒドロキシエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン
 -3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサ
 ミド;

(tt) (-)-10-{{2'-[1-ヒドロキシエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリ
 ジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボ
 キキサミド;

(uu) (+)-10-{{2'-[1-ヒドロキシエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリ
 ジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボ
 キキサミド;

(vv) 10-{{2'-(1-ヒドロキシエチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-[(1-オキ
 シドピリジン-3-イル)メチル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン
 -3-カルボキサミド;

(ww) 10-[(2'-ホルミル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチ
 ル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(xx) 10-[(2-メチル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)
 -10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(yy) 10-{{2'-(1-ヒドロキシプロピル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリ
 ジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボ
 キキサミド;

(zz) 10-{{2'-(ヒドロキシメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-
 3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサ
 ミド;

(aaa) 10-[(2'-ベンゾイル-1,1'-ビフェニル-4-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イル
 メチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(bbb) 10-{{2'-(メトキシメチル)-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-
 イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミ
 ド;

(ccc) 10-{{2'-[(E)-(ヒドロキシイミノ)メチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル}
 -N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-
 3-カルボキサミド;

(ddd) メチル-4'-{{3-[[ピリジン-3-イルメチル)アミノ]カルボニル]-5H-ピロロ[2,1-c]
 [1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-カルボキシレー
 ト;

(eee) tert-ブチル-4'-{{3-[[ピリジン-3-イルメチル)アミノ]カルボニル]-5H-ピロロ[2
 ,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-カルボキ
 シレート;

(fff) 4'-{{3-[[ピリジン-3-イルメチル)アミノ]カルボニル]-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベ
 ンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}-1,1'-ビフェニル-2-カルボン酸;

(ggg) 10-({2'-[2-(エチルアミノ)-2-オキシエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(hhh) 10-({2'-[2-(ジエチルアミノ)-2-オキシエチル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(iii) 10-({2'-[(ジメチルアミノ)カルボニル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(jjj) 10-({2'-[(メチルアミノ)カルボニル]-1,1'-ビフェニル-4-イル}カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(kkk) 10-[(2'-メトキシ-1,1'-ビフェニル-4-イル)スルホニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(lll) 10-[(2'-クロロ-1,1'-ビフェニル-4-イル)スルホニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド; または

(mmm) 10-(1,1'-ビフェニル-4-イルメチル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド。

【請求項 27】

以下のいずれかである請求項 13 に記載の化合物:

(a) 10-(4-ヨード-3-メチルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(b) 10-(4-ベンゾイルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(c) 10-ベンゾイル-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(d) 10-(4-メチルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(e) 10-(3-フルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(f) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[4-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(g) 10-(4-tert-ブチルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(h) 10-(3,4-ジクロロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(i) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[2-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(j) 10-(3-メチルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(k) 10-[4-(ジメチルアミノ)ベンゾイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(l) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾイル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(m) 10-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(n) メチル 4-{{3-{{(ピリジン-3-イルメチル)アミノ}カルボニル}-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}ベンゾエート;

(o) 4-{{3-{{(ピリジン-3-イルメチル)アミノ}カルボニル}-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}安息香酸;

- (p) 10-(4-メトキシベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (q) 10-(4-シアノベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (r) 10-(4-クロロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (s) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[3-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (f) 10-(4-フルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (u) 10-(2-メチルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (v) 10-(3,5-ジフルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (w) 10-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (x) 10-(2-フルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (y) 10-(4-プロピルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (z) 10-(4-ニトロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (aa) 10-(3,4-ジフルオロベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (bb) 10-(4-フェノキシベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (cc) 10-[4-(ジエチルアミノ)ベンゾイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (dd) tert-ブチル(4-{{3-{{(ピリジン-3-イルメチル)アミノ}カルボニル}-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-10(11H)-イル}カルボニル}ベンジル)カルバメート;
- (ee) 10-(3-メチル-4-チエン-2-イルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ff) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-(4-ピリミジン-2-イルベンゾイル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (gg) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-(4-ピリミジン-5-イルベンゾイル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (hh) 10-(4-ピリジン-2-イルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ii) 10-(4-ピリジン-3-イルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (jj) 10-[4-(3-メチルピリジン-2-イル)ベンゾイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (kk) 10-(4-ピリジン-4-イルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ll) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-[4-(1,3-チアゾール-2-イル)ベンゾイル]-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (mm) 10-[4-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンゾイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (nn) 10-(4-ピペリジン-1-イルベンゾイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(oo) 10-[3-(アミノスルホニル)-4-モルホリン-4-イルベンゾイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド0.5水和物;

(pp) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-(チエン-2-イルカルボニル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(qq) 10-(ピリジン-2-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(rr) 10-[(6-クロロピリジン-3-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ss) 10-[(2,5-ジクロロチエン-3-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(tt) 10-{{6-(ベンジルアミノ)ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(uu) 10-{{6-[(2-メトキシベンジル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(vv) 10-イソニコチノイル-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ww) 10-{{6-[(4-メトキシベンジル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(xx) 10-(ピラジン-2-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(yy) 10-(ピリジン-3-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(zz) 10-[(6-ピペリジン-1-イルピリジン-3-イル)カルボニル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(aaa) 10-{{6-[(2-フェニルエチル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(bbb) 10-{{6-[(3-フェニルプロピル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ccc) 10-{{6-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ddd) 10-{{6-[(3-メトキシベンジル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(eee) 10-{{6-[ベンジル(メチル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(fff) N-(ピリジン-3-イルメチル)-10-{{6-[(ピリジン-3-イルメチル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(ggg) 10-{{6-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

(hhh) 10-{{6-(ブチルアミノ)ピリジン-3-イル}カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;

- (iii) 10-{[6-(ベンジルオキシ)ピリジン-3-イル]カルボニル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (jjj) 10-[(4-tert-ブチルフェノキシ)アセチル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (kkk) 10-(フェノキシアセチル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (lll) 10-(2-フェノキシプロパノイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (mmm) 10-[(4-クロロフェノキシ)アセチル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (nnn) 10-[(4-クロロ-2-メチルフェノキシ)アセチル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ooo) 10-{[(4-プロモフェニル)チオ]アセチル}-N-{[5-ヒドロキシ-4-(ヒドロキシメチル)-6-メチルピリジン-3-イル]メチル}-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ppp) 10-{[(4-プロモフェニル)チオ]アセチル}-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (qqq) 10-[(4-クロロフェニル)アセチル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (rrr) 10-(1,1'-ビフェニル-4-イルアセチル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (sss) 10-[(2E)-3-フェニルプロパ-2-エノイル]-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (ttt) 10-(1-ナフトイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (uuu) 10-(2-ナフトイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (vvv) 10-(9H-フルオレン-2-イルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (www) 10-(3,3-ジメチルブタノイル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;
- (xxx) 10-(シクロヘキシルカルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド;または
- (yyy) 10-イソブチリル-N-(ピリジン-3-イルメチル)-10,11-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-3-カルボキサミド、あるいは、
その薬学的に許容可能な塩。

【請求項 28】

請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む組成物。

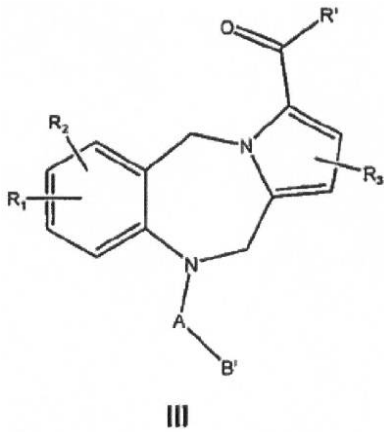
【請求項 29】

有効量の請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物を含む、哺乳動物における受精能を阻害するための医薬組成物。

【請求項 30】

有効量の少なくとも 1 つの以下の式 III の化合物を含む、哺乳動物における受精能を阻害するための医薬組成物であって：

【化23】

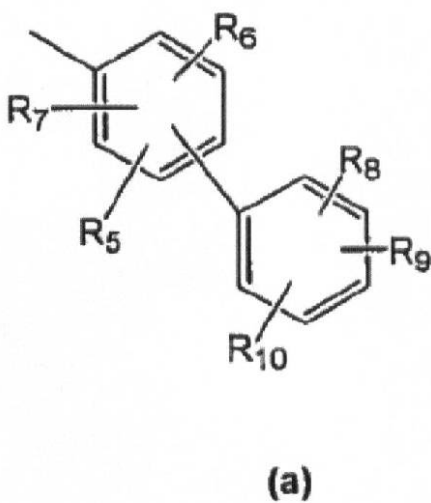


ここで、

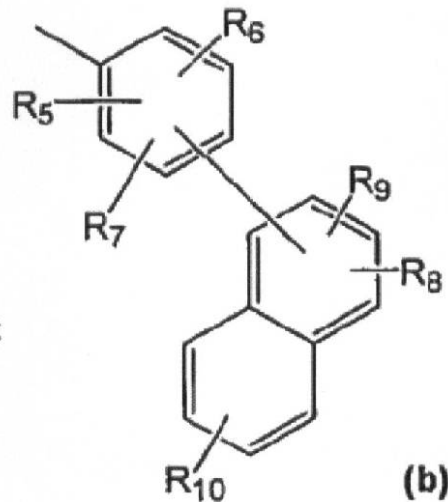
R_1 、 R_2 、 R_3 、 A および R' は、先に定義した通りであり；

B' は、独立して、

【化24】



および



からなる群から選択され、

ここで、

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 および R_{10} は、先に定義した通りである、前記組成物。

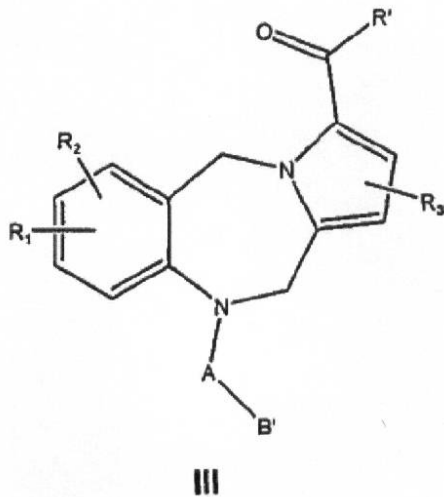
【請求項31】

有効量の請求項1～27のいずれかに記載の少なくとも1つの化合物を含む、哺乳動物における受精を防止するための医薬組成物。

【請求項32】

有効量の少なくとも1つの以下の式IIIの化合物を含む、哺乳動物における受精を防止するための医薬組成物であって：

【化 2 5】

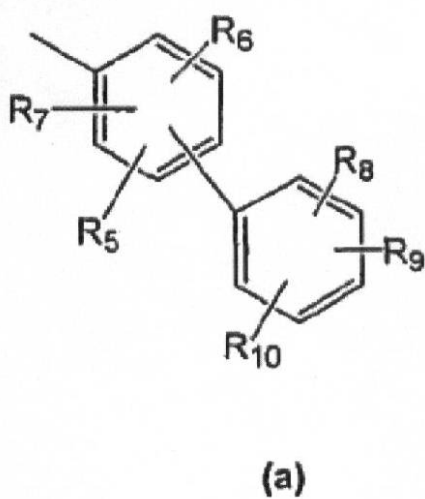


ここで、

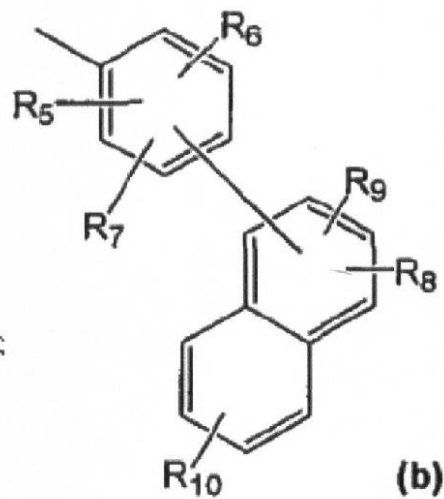
R_1 、 R_2 、 R_3 、 A および R' は、先に定義した通りであり；

B' は、独立して、

【化 2 6】



および



からなる群から選択され、

ここで、

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 および R_{10} は、先に定義した通りである、前記組成物。

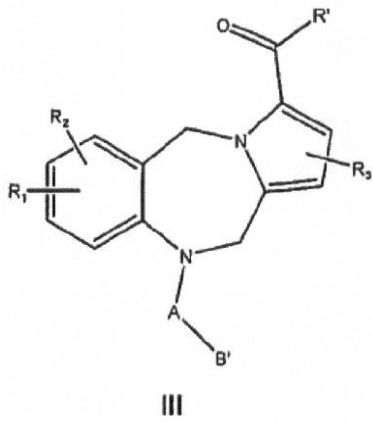
【請求項 3 3】

有効量の請求項 1 ~ 2 7 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物を含む、哺乳動物における FSH に媒介される卵胞発達をブロックするための医薬組成物。

【請求項 3 4】

有効量の少なくとも 1 つの以下の式 III の化合物を含む、哺乳動物における FSH に媒介される卵胞発達をブロックするための医薬組成物であって：

【化27】

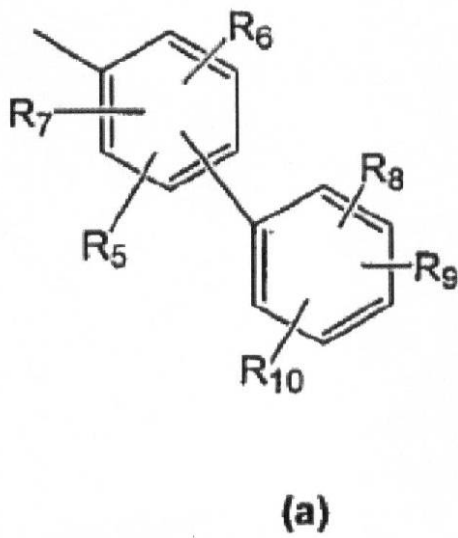


ここで、

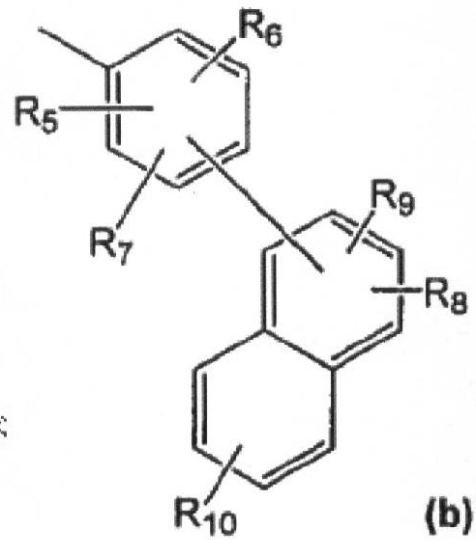
R_1 、 R_2 、 R_3 、 A および R' は、先に定義した通りであり；

B' は、独立して、

【化28】



および



からなる群から選択され、

ここで、

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 および R_{10} は、先に定義した通りである、前記組成物。