

【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】令和 1 年 12 月 19 日 (2019.12.19)

【公表番号】特表 2019-504108 (P2019-504108A)

【公表日】平成 31 年 2 月 14 日 (2019.2.14)

【年通号数】公開・登録公報 2019-006

【出願番号】特願 2018-544438 (P2018-544438)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/10

C 0 7 D 519/00 3 1 1

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/28

G 0 1 N 33/50 Z

G 0 1 N 33/15 Z

G 0 1 N 33/68

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 11 月 11 日 (2019.11.11)

【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

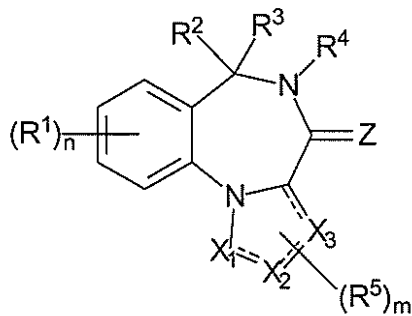
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) の化合物：

【化 1】



(I)

[式中、

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  は、それぞれ独立して、C または N であり、  
各

【化 2】

=====

は、独立して、単結合または二重結合であり、ここで、任意の 2 つの隣接する結合

【化 3】

=====

の少なくとも 1 つは、単結合であり、

$Z$  は、O、S または N ( $-R^Z$ ) であり、

$R^Z$  は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^Z$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^1$  は、独立して、 $-L^1 - R^{11}$  基であり、

各  $L^1$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-NR^{12}R^{12}$ 、 $-COR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-OCOR^{12}$ 、 $-CO$

$\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、 $-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{SOR}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$  および  $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{12}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の $-\text{CH}_2-$ 単位はそれぞれ、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^{12}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$  および  $-\text{SO}_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $\text{R}^{11}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、 $-\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{SOR}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ 、 $-\text{COR}^{12}$ 、 $-\text{COOR}^{12}$ 、 $-\text{OCOR}^{12}$ 、 $-\text{CONR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{12}$  および  $-\text{SO}_3\text{R}^{12}$  から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび  $-\text{L}^{11}-\text{R}^{13}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $\text{R}^{11}$  が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニルまたは  $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび  $-\text{L}^{11}-\text{R}^{13}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $\text{R}^{12}$  は、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換

されており、

ここで、 $R^{1,2}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つの  $R^{1,2}$  基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの  $R^{1,2}$  基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$  アルキレンを形成してもよく、

各  $L^{1,1}$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $R^{1,3}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$  および  $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

$n$  は、0～4の整数であり、

$R^2$  および  $R^3$  は、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し；または  $R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$ 、 $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CN$ 、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^2$  および  $R^3$  のうちの1つもしくは両方が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルもしくは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルもしくは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており；または  $R^2$  および  $R^3$  は、一緒になって、 $=O$

、 $=S$ 、 $=NH$ および $=N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) から選択される二価の基を形成し、

$R^4$  は、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、前記アルケニルおよび前記アルキニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-O-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル)、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^4$  が、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルである場合、前記シクロアルキルまたは前記ヘテロシクロアルキルは、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^5$  は、独立して、 $-L^5 - R^{5.1}$  基であり、

各  $L^5$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{5.2}$ 、 $-NR^{5.2}R^{5.2}$ 、 $-COR^{5.2}$ 、 $-COOR^{5.2}$ 、 $-OCOR^{5.2}$ 、 $-CONR^{5.2}R^{5.2}$ 、 $-NR^{5.2}COR^{5.2}$ 、 $-SR^{5.2}$ 、 $-SOR^{5.2}$ 、 $-SO_2R^{5.2}$ 、 $-SO_2NR^{5.2}R^{5.2}$  および  $-NR^{5.2}SO_2R^{5.2}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NR^{5.2}-$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $R^{5.1}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NR^{5.2}R^{5.2}$ 、 $-OR^{5.2}$ 、 $-SR^{5.2}$ 、 $-SOR^{5.2}$ 、 $-SO_2R^{5.2}$ 、 $-COR^{5.2}$ 、 $-COOR^{5.2}$ 、 $-OCOR^{5.2}$ 、 $-CONR^{5.2}R^{5.2}$ 、 $-NR^{5.2}COR^{5.2}$ 、 $-SO_2NR^{5.2}R^{5.2}$ 、 $-NR^{5.2}SO_2R^{5.2}$  および  $-SO_3R^{5.2}$  から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CO-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH-CO-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)  $-CO-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO_2-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)  $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび  $-L^{5.1} - R^{5.3}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^{5.1}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-$

CO-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-NH-CO- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)-CO- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-SO<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>-NH (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-SO<sub>2</sub>-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-NH-SO<sub>2</sub>- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)-SO<sub>2</sub>- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび-L<sup>5 1</sup>-R<sup>5 3</sup>から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各R<sup>5 2</sup>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> ハロアルキル、-CN、-OH、-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-OH、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、R<sup>5 2</sup>が、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> ハロアルキル、-CN、-OH、-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つのR<sup>5 2</sup>基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つのR<sup>5 2</sup>基は、一緒になって、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub> アルキレンを形成してもよく、

各L<sup>5 1</sup>は、独立して、結合、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニレンおよびC<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の-CH<sub>2</sub>-単位はそれぞれ、-O-、-NH-、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)-、-CO-、-S-、-SO-および-SO<sub>2</sub>-から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各R<sup>5 3</sup>は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> ハロアルキル、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニル、-NH<sub>2</sub>、-NH (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-OH、-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-OH、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-SHおよび-S (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> ハロアルキル、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub> アルキニル、-OH、-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-OH、- (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキレン)-O (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル) (C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub> アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

mは、0~3の整数である]

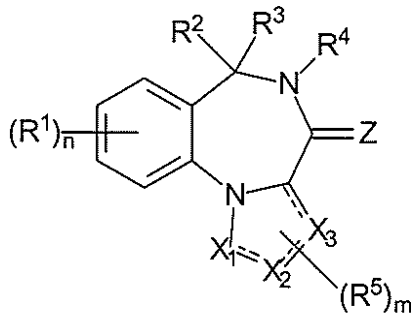
またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ

および1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

#### 【請求項2】

一般式(I)の化合物：

## 【化 4】



(I)

〔式中、

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  は、それぞれ独立して、C または N であり、  
各

## 【化 5】

-----

は、独立して、単結合または二重結合であり、ここで、任意の 2 つの隣接する結合

## 【化 6】

-----

の少なくとも 1 つは、単結合であり、

$Z$  は、O、S または N ( $-R^Z$ ) であり、

$R^Z$  は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^Z$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^1$  は、独立して、 $-L^1-R^{11}$  基であり、

各  $L^1$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-NR^{12}R^{12}$ 、 $-COR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-OCOR^{12}$ 、 $-CONR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}COR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-SOR^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$  および  $-NR^{12}SO_2R^{12}$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる 1 つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、-

O—、—NR<sup>1 2</sup>—、—CO—、—S—、—SO—および—SO<sub>2</sub>—から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各R<sup>1 1</sup>は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、—NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、—OR<sup>1 2</sup>、—SR<sup>1 2</sup>、—SOR<sup>1 2</sup>、—SO<sub>2</sub>R<sup>1 2</sup>、—COR<sup>1 2</sup>、—COOR<sup>1 2</sup>、—OCOR<sup>1 2</sup>、—CONR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、—NR<sup>1 2</sup>COR<sup>1 2</sup>、—SO<sub>2</sub>NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、—NR<sup>1 2</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1 2</sup>および—SO<sub>3</sub>R<sup>1 2</sup>から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CHO、—CO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—COOH、テトラゾリル、—COO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CO—NH<sub>2</sub>、—CO—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CO—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SO<sub>2</sub>—NH<sub>2</sub>、—SO<sub>2</sub>—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SO<sub>2</sub>—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび—L<sup>1 1</sup>—R<sup>1 3</sup>から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、R<sup>1 1</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CHO、—CO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—COOH、テトラゾリル、—COO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CO—NH<sub>2</sub>、—CO—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—CO—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SO<sub>2</sub>—NH<sub>2</sub>、—SO<sub>2</sub>—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SO<sub>2</sub>—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび—L<sup>1 1</sup>—R<sup>1 3</sup>から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各R<sup>1 2</sup>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、R<sup>1 2</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N

H<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つのR<sup>1 2</sup>基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つのR<sup>1 2</sup>基は、一緒になって、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキレンを形成してもよく、

各L<sup>1 1</sup>は、独立して、結合、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニレンおよびC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の-CH<sub>2</sub>-単位はそれぞれ、-O-、-NH-、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)-、-CO-、-S-、-SO-および-SO<sub>2</sub>-から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各R<sup>1 3</sup>は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-OH、-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-OH、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-SHおよび-S(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、-OH、-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-OH、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

nは、0～4の整数であり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し；またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、-OH、-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-SH、-S(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-SO-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-CN、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、-CN、-OH、-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-OH、-(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>のうちの1つもしくは両方が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニルもしくはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルもしくは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、-CN、-OH、-O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており；またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、一緒になって、=O、=S、=NHおよび=N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)から選択される二価の基を形成し、

R<sup>4</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、前記アルケニルおよび前記アルキニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、-

O—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル)、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、R<sup>4</sup>が、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルである場合、前記シクロアルキルまたは前記ヘテロシクロアルキルは、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルキニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各R<sup>5</sup>は、独立して、—L<sup>5</sup>—R<sup>5 1</sup>基であり、

各L<sup>5</sup>は、独立して、結合、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキレン、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルケニレンおよびC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル、—CN、—OR<sup>5 2</sup>、—NR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup>、—COR<sup>5 2</sup>、—COOR<sup>5 2</sup>、—OCOR<sup>5 2</sup>、—CONR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup>、—NR<sup>5 2</sup>COR<sup>5 2</sup>、—SR<sup>5 2</sup>、—SOR<sup>5 2</sup>、—SO<sub>2</sub>R<sup>5 2</sup>、—SO<sub>2</sub>NR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup> および—NR<sup>5 2</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5 2</sup> から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の—CH<sub>2</sub>—単位はそれぞれ、—O—、—NR<sup>5 2</sup>—、—CO—、—S—、—SO—および—SO<sub>2</sub>—から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各R<sup>5 1</sup>は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルキニル、—NR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup>、—OR<sup>5 2</sup>、—SR<sup>5 2</sup>、—SOR<sup>5 2</sup>、—SO<sub>2</sub>R<sup>5 2</sup>、—COR<sup>5 2</sup>、—COOR<sup>5 2</sup>、—OCOR<sup>5 2</sup>、—CONR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup>、—NR<sup>5 2</sup>COR<sup>5 2</sup>、—SO<sub>2</sub>NR<sup>5 2</sup>R<sup>5 2</sup>、—NR<sup>5 2</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5 2</sup> および—SO<sub>3</sub>R<sup>5 2</sup> から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルキニル、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CHO、—CO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—COOH、テトラゾリル、—COO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CO—NH<sub>2</sub>、—CO—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CO—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—SO<sub>2</sub>—NH<sub>2</sub>、—SO<sub>2</sub>—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—SO<sub>2</sub>—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび—L<sup>5 1</sup>—R<sup>5 3</sup> から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、R<sup>5 1</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub> アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CHO、—CO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—COOH、テトラゾリル、—COO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CO—NH<sub>2</sub>、—CO—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—CO—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)—CO—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—SO<sub>2</sub>—NH<sub>2</sub>、—SO<sub>2</sub>—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—SO<sub>2</sub>—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)、—NH—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub> アルキル)

、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび $-L^{51}-R^{53}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各 $R^{52}$ は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、 $R^{52}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つの $R^{52}$ 基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの $R^{52}$ 基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$  アルキレンを形成してもよく、

各 $L^{51}$ は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の $-CH_2-$ 単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})-$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $R^{53}$ は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-SH$ および $-S(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

$m$ は、0～3の整数である]

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグであって、

但し、以下の化合物：

5-アリル-3, 3a, 5, 6-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]ピロロ-[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4(2H)-オン；

5-ブチル-3, 3a, 5, 6-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]ピロロ-[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4(2H)-オン；

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4-オン；

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-3, 5, 10b-トリアザベンゾ[e]アズレン-4-オン;

5-メチル-4-オキソ-5, 6-ジヒドロ-4H-1, 2, 5, 10b-テトラアザベンゾ[e]アズレン-3-カルボン酸エチルエステル;

5-メチル-4-オキソ-5, 6-ジヒドロ-4H-1, 2, 5, 10b-テトラアザベンゾ[e]アズレン-3-カルボン酸メチルエステル;

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザベンゾ[e]アズレン-4-オン;

9-フルオロ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザベンゾ[e]アズレン-4-オン;

8-メトキシ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザベンゾ[e]アズレン-4-オン;

3-プロモ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザベンゾ[e]アズレン-4-オン;

5-(4-クロロブチル)-5, 6-ジヒドロベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4-オン;および

5-(4-クロロブチル)-ベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4, 6-ジオン

が式(I)から除外される、一般式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項3】

$X_1$ 、 $X_2$ および $X_3$ の少なくとも2つが、それぞれCであり、 $X_1$ 、 $X_2$ および $X_3$ のその他のものが、CまたはNである、請求項2に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項4】

$X_1$ 、 $X_2$ および $X_3$ が、それぞれCである、請求項2もしくは3に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項5】

Zが、Oである、請求項2～4のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項6】

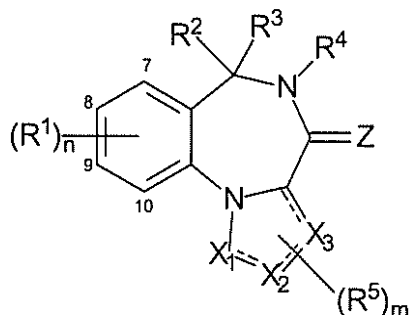
nが、1～4の範囲の整数であり、

各 $L^1$ が、独立して、結合および $C_1 \sim C_{10}$ アルキレンから選択され、ここで、前記アルキレンが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-N$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-SH$ および $-S$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレンに含まれる1つまたは2つの $-CH_2-$ 単位がそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CO-$ および $-SO_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $R^{1,1}$ が、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-N$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-OH$ および $-O$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルがそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-OH$ 、 $-O$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-(C_1 \sim C_4$ アルキレン)- $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4$ アルキレン)- $-O$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-N$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)( $C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)

**【請求項 7】**

【化 7】



【請求項 8】

【請求項 9】

$R^4$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、ここで、前記アルキルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$

ハロアルキル、 $-O-$  ( $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル)、 $-CN$ 、 $-OH$  および  $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されている、請求項 2～8 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

【請求項 10】

$R^4$  が、メチルおよびメトキシメチルから選択される、請求項 9 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

【請求項 11】

各  $L^5$  が、独立して、結合および  $C_1 \sim C_{10}$  アルキレンから選択され、ここで、前記アルキレンが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SH$  および  $-S$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレンに含まれる 1 つまたは 2 つの  $-CH_2-$  単位がそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-$ 、 $-CO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $R^{5,1}$  が、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-OH$  および  $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルがそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_4$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^{5,1}$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである場合、前記アルキルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されている、請求項 2～10 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

【請求項 12】

$Z$  が、 $O$  であり、  
 $R^2$  および  $R^3$  が、それぞれ独立して、水素および  $C_1 \sim C_4$  アルキルから選択され、こ

ここで、 $R^2$  および  $R^3$  の両方が水素であることはなく、または  $R^2$  および  $R^3$  が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキルを形成し、

$R^4$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、ここで、前記アルキルが、 $-OH$  および  $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) から選択される 1 つの基で任意選択で置換されている、請求項 2 ～ 7 および 11 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

【請求項 13】

9-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-5-メトキシメチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-5-(メチル- $d_3$ ) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

2, 9-ジプロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-2-クロロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-3-クロロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-7-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-10-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-8-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-2-フェニル-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

9-プロモ-6, 6-スピロシクロプロピル-5-メチル-2-フェニル-5, 6-ジヒドロ-3, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン；

8-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

7-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

10-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

8-プロモ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

2-プロモ-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

2-プロモ-5-メチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

2-プロモ-5-メチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン；

5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [

1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メトキシメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-エチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-メチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(1-メチル-ピラゾール-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(1-メチル-ピラゾール-5-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-フルオロ-2-メチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-フルオロピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-フルオロピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-メチルピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3, 4-ジメトキシフェニル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-アミノ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパ

ン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(6-モルホリン-4-イル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-[1, 2'] ビピリジニル-5'-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(3-シアノフェニル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(3-(1H-テトラゾール-5-イル) -フェニル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(1-ピリミジン-4-イル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(1-アセチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(4-メチル-オキサゾール-5-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(4-メチルチアゾール-5-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-アセトニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-アクリロニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-プロピオニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(6-クロロピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-(メチル-d<sub>3</sub>) -9-(6-フルオロピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(2, 6-ジメチルピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(4-フルオロピリジン-2-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(3-メチル-ピラジン-2-イル) -5, 6-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

5-メチル-9-(4-メチル-ピリミジン-5-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;

;

5-メチル-9-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2-プロピルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2-シクロプロピルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2,4-ジメチルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(3-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2-ヒドロキシピリジン-4-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(ピリダジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2-メトキシカルボニルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

5-メチル-9-(2-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

7-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

7-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

10-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

10-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

8-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン;

8-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-プロモ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-プロモ-2-クロロ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-クロロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-クロロ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-3-クロロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

1-プロモ-5-メチル-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-1-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5, 8-ジメチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

8-モルホリン-4-イル-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5, 7-ジメチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5, 10-ジメチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

10-シアノ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

10-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-フェニル-9-ピリジン-3-イル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -9-イル)安息香酸;

5-メチル-2-フェニル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-フェニル-9-(6-アミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-フェニル-9-(2, 6-ジメチル-ピリジン-4-イル)-スピロ [

ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(5-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(2-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(4-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(ピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(ピリミジン-5-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(2-メチル-ピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(2, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-ピラジン-2-イル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-ピリダジン-3-イル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(ピリジン-2-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(6-エチルピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(2-フルオロ-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン ;

5-メチル-2-フェニル-9-(6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]

]-4(5H)-オン；

9-ジメチルアミノ-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

5-メチル-2-フェニル-9-(2-メトキシ-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

5-メチル-2-フェニル-9-(6-シアノ-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

5-メチル-2-フェニル-9-(6-メチルアミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

5-メチル-2-フェニル-9-(2-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

8-モルホリン-4-イル-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピロロ[1,2-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(2,6-ジメチル-ピリジン-4-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(2-メチル-ピリジン-4-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

2,9-ジフェニル-5-メチル-2-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(4-アミノ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(2,6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(6-アミノ-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(4-メトキシ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(3-シアノ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(3-クロロ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(2-クロロ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1,5-a][1,4]ジアゼピン-6,1'-シクロプロパン]-4(5H)-オン；

9-(オキサゾール-5-イル)-5-メチル-2-フェニルースピロ[ベンゾ[f]ピ

ラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -9-イル) 安息香酸;

9-(1H-ピラゾール-4-イル) -5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(4-クロロフェニル) -5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(1H-ピラゾール-3-イル) -5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-シアノ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-フェニル-9-(ピロリジン-1-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチルピリジン-3-イル) -5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

N, N-ジメチル-3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -9-イル) ベンゼンスルホンアミド;

N, N-ジメチル-3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -9-イル) ベンゼンスルホンアミド;

5-メチル-2-(ピリジン-3-イル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

2, 5-ジメチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-(ピリジン-4-イル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-(1H-ピラゾール-3-イル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-(2-クロロフェニル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-(3-クロロフェニル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-2-(4-クロロフェニル) -9-(2-メチルピリジン-3-イル) スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ

プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(4-フルオロフェニル)-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(2-フルオロフェニル)-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(3-フルオロフェニル)-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-シアノ-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f]  
ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H)  
- オン ;  
5-メチル-2-ジメチルアミノ-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
- 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-シクロプロピル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
- 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-シクロペンチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
- 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(チアゾール-2-イル)-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(チアゾール-2-イル)-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-9-(6-メチル-ピ  
リジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピ  
ン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-9-(2-メチル-ピ  
リジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピ  
ン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-ジメチルアミノ-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
- 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(2-フルオロフェニル)-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン ;  
5-メチル-2-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-9-(2-エチル-ピ  
リジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピ  
ン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
9-ブromo-5-メチル-2-フェニル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1,  
2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン ;  
9-(6-アミノ-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニル-5, 6-ジヒド  
ロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン ;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-2-フェニル-5, 6-ジヒドロ  
-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン ;  
5-エチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-2-フェニル-5, 6-ジヒドロ

- 4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン ;  
 5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 ピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ  
 パン] -2-カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ  
 パン] -2-カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ  
 パン] -2-カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
 プロパン] -2-カルバルデヒド ;  
 5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4,  
 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'  
 -シクロプロパン] -2-カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-ブロモ-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1,  
 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -2-カルバルデヒド  
 ;  
 5-メチル-9-(3-シアノフェニル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベン  
 ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -2  
 -カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-(ピリダジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベ  
 ンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -  
 2-カルバルデヒド ;  
 5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ  
 パン] -2-カルボン酸 ;  
 5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロ  
 スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
 プロパン] -2-カルボン酸 ;  
 5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-4-オキソ-4,  
 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'  
 -シクロプロパン] -2-カルボン酸 ;  
 5-メチル-9-ブロモ-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1,  
 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -2-カルボン酸 ;  
 5-メチル-9-(ピリダジン-3-イル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベ  
 ンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -  
 2-カルボン酸 ;  
 5-メチル-9-(3-シアノフェニル)-4-オキソ-4, 5-ジヒドロスピロ [ベン  
 ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -2  
 -カルボン酸 ;  
 5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(オキサゾール-5-イル  
 )-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シ  
 クロプロパン] -4(5H)-オン ;  
 5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(3H-イミダゾール-4  
 -イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'  
 -シクロプロパン] -4(5H)-オン ;  
 5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(1H-イミダゾール-2  
 -イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1

’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]オキサジア  
ゾール-2-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン  
-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-2-(1H-イミダゾール-  
2-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6,  
1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]オキサジ  
アゾール-2-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピ  
ン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]  
]オキサジアゾール-2-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]  
]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-プロモ-2-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル-スピロ[ベ  
ンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]  
-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]オ  
キサジアゾール-2-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジ  
アゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]オキサジア  
ゾール-2-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン  
-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(3-シアノフェニル)-2-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-  
イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-  
シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(ピリダジン-3-イル)-2-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2  
-イル-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’  
-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(シクロペンタンカルボニ  
ル)-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-  
シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-アセチル-スピロ[ベンゾ  
[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4  
(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(シクロペンチルメチル)  
-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シク  
ロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-エチル-スピロ[ベンゾ[f]  
ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5  
H)-オン；  
2, 5-ジメチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピ  
ラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)  
-オン；  
2, 5-ジメチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-スピロ[ベンゾ[f]ピ  
ラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’-シクロプロパン]-4(5H)  
-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-(モルホリン-4-イルメ  
チル)-スピロ[ベンゾ[f]ピラゾロ[1, 5-a][1, 4]ジアゼピン-6, 1’  
-シクロプロパン]-4(5H)-オン；  
5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-ジフルオロメチル-スピロ

[ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-ヒドロキシメチル-5-メチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-ヒドロキシメチル-5-メチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-ヒドロキシメチル-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-メトキシメチル-5-メチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-メトキシメチル-5-メチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
2-メトキシメチル-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
9-ブロモ-5-メチル-1, 2, 3, 3a-テトラヒドロ-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-1, 2, 3, 3a-テトラヒドロ-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
5-メチル-9-ブロモ-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5-メチル-9-ブロモ-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5-メチル-9-ブロモ-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
9-ブロモ-5, 6-ジメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
9-ブロモ-5-メチル-6-エチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5, 6-ジメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
9-(6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル)-5, 6-ジメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
6-エチル-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;  
5, 6, 6-トリメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

9-クロロ-5, 6, 6-トリメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4-オン；

5, 6, 6-トリメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4-オン；

ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物およびプロドラッグから選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項14】

請求項2～13のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ、および1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項15】

変化したグルタミン酸作動性シグナル伝達および／もしくは機能に関連する状態ならびに／またはグルタミン酸レベルもしくはシグナル伝達の変化により影響を受け得る状態の、処置および／または予防のための、請求項1あるいは請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

処置または予防される状態が、てんかん；認知症；パーキンソニズムおよび運動障害；運動ニューロン疾患；筋萎縮性側索硬化症；神経系の神経変性および／または遺伝性障害；末梢神経系の障害；多発性硬化症および神経系の他の脱髄性疾患；脳性小児麻痺；片麻痺および片側不全麻痺、および他の麻痺性症候群；脳血管障害；片頭痛；頭痛；筋神経障害；眼および視覚路の障害；頭蓋内外傷／傷害；神経および脊髄への外傷／傷害；中毒；薬物、医薬的および生物学的物質の神経学的および精神医学的な副作用；括約筋制御および性機能の障害；精神遅滞、学習障害、運動技能障害、コミュニケーション障害、広汎性発達障害、注意欠陥および破壊的行動障害、栄養補給および摂食障害、T I C障害、および排泄障害；せん妄および他の認知障害；物質関連障害；統合失調症および他の精神病的障害；気分障害；不安障害；摂食障害；睡眠障害；薬物誘発性運動障害；内分泌および代謝性疾患；急性および慢性疼痛；悪心および嘔吐；過敏性腸症候群；ならびにがんから選択される、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

パーキンソン病の処置および／または予防のための、請求項1あるいは請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項18】

変化したグルタミン酸作動性シグナル伝達および／もしくは機能に関連する状態ならびに／またはグルタミン酸レベルもしくはシグナル伝達の変化により影響を受け得る状態の、処置および／または予防のための医薬を調製するための、請求項2～13のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグの使用。

【請求項19】

処置または予防される状態が、てんかん；認知症；パーキンソニズムおよび運動障害；運動ニューロン疾患；筋萎縮性側索硬化症；神経系の神経変性および／または遺伝性障害；末梢神経系の障害；多発性硬化症および神経系の他の脱髄性疾患；脳性小児麻痺；片麻痺および片側不全麻痺、および他の麻痺性症候群；脳血管障害；片頭痛；頭痛；筋神経障害；眼および視覚路の障害；頭蓋内外傷／傷害；神経および脊髄への外傷／傷害；中毒；薬物、医薬的および生物学的物質の神経学的および精神医学的な副作用；括約筋制御および性機能の障害；精神遅滞、学習障害、運動技能障害、コミュニケーション障害、広汎性発達障害、注意欠陥および破壊的行動障害、栄養補給および摂食障害、T I C障害、および排泄障害；せん妄および他の認知障害；物質関連障害；統合失調症および他の精神病的障害；気分障害；不安障害；摂食障害；睡眠障害；薬物誘発性運動障害；内分泌および代謝性疾患；急性および慢性疼痛；悪心および嘔吐；過敏性腸症候群；ならびにがんから選択される、

請求項18に記載の使用。

## 【請求項 20】

パーキンソン病の処置および／または予防のための医薬を調製するための、請求項 2 ～ 13 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグの使用。

## 【請求項 21】

m G l u R 3 のポジティブアロステリックモジュレーターとしての、請求項 2 ～ 13 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグのインビトロ使用。

## 【請求項 22】

代謝型グルタミン酸受容体 3 (m G l u R 3) に結合する薬剤を同定するための方法であって、以下のステップ：

(a) m G l u R 3 を、放射性標識または蛍光標識されている請求項 2 ～ 13 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグに、化合物が m G l u R 3 に結合することを可能にする条件下で接触させ、それにより結合した標識化合物を生成するステップ；

(b) 試験薬剤の非存在下で、結合した標識化合物の量に相当するシグナルを検出するステップ；

(c) 結合した標識化合物を試験薬剤に接触させるステップ；

(d) 試験薬剤の存在下で、結合した標識化合物の量に相当するシグナルを検出するステップ；および

(e) ステップ (d) において検出されたシグナルをステップ (b) において検出されたシグナルと比較して、試験薬剤が m G l u R 3 に結合するかどうかを決定するステップを含む、方法。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0817

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0817】

実施例 226

線条体一次ニューロンに対する実施例 63 の神経保護。

一次マウスニューロンを、ビヒクルまたは NMDA (60  $\mu$ M) + ビヒクルまたは実施例 63 または LY379268 (陽性対照として使用される混合 m G l u R 2 / 3 アゴニスト) とともに 24 時間インキュベートした。試験は三重に行った。ニューロン生存度を、MTT 試験を使用して測定した。

結果：

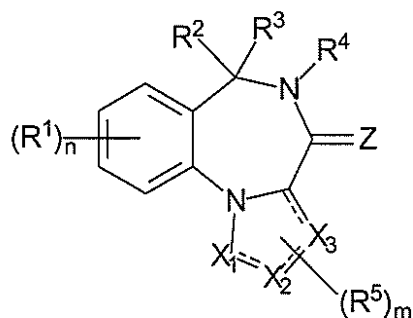
図 2 において、NMDA 処理がニューロン生存度の 70 % 近い低減を誘発したことを見ることができる (黒色ヒストグラム)。実施例 63 は、NMDA 攻撃投与の非存在下の単独では、30 nM ~ 30  $\mu$ M の範囲の濃度で、線条体一次ニューロン生存度に対して毒性を有しない (刻み模様のヒストグラム)。実施例 63 は、10  $\mu$ M までは、NMDA により誘発される毒性を用量依存的に低減させ、この効果は、30  $\mu$ M で消失する傾向にある (白色ヒストグラム)。基準 LY379268 (m G l u R 2 / 3 アゴニスト) は、単独では毒性を有さず、1  $\mu$ M で NMDA 誘発性毒性を減少させる (灰色ヒストグラム)。

本発明の態様

態様 1

医薬として使用するための、一般式 (I) の化合物：

【化 2 6 0】



(I)

〔式中、

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  は、それぞれ独立して、C または N であり、  
各

【化 2 6 1】

=====

は、独立して、単結合または二重結合であり、ここで、任意の 2 つの隣接する結合

【化 2 6 2】

=====

の少なくとも 1 つは、単結合であり、

$Z$  は、O、S または N ( $-R^Z$ ) であり、

$R^Z$  は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^Z$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^1$  は、独立して、 $-L^1-R^{11}$  基であり、

各  $L^1$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-NR^{12}R^{12}$ 、 $-COR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-OCOR^{12}$ 、 $-CONR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}COR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-SOR^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$  および  $-NR^{12}SO_2R^{12}$  から独立して選択される 1 つまた

は複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の $-CH_2-$ 単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NR^{12}-$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $R^{11}$ は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-NR^{12}R^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-SOR^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-COR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-OCOR^{12}$ 、 $-CONR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}COR^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{12}$ および $-SO_3R^{12}$ から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび $-L^{11}-R^{13}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^{11}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_{10}$ アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび $-L^{11}-R^{13}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各 $R^{12}$ は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、 $R^{12}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_{10}$

アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つの $R^{1,2}$ 基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの $R^{1,2}$ 基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$  アルキレンを形成してもよく、

各 $L^{1,1}$ は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の $-CH_2-$ 単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $R^{1,3}$ は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$ および $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

$n$ は、0～4の整数であり、

$R^2$ および $R^3$ は、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し；または $R^2$ および $R^3$ は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$ 、 $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CN$ 、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン) $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^2$ および $R^3$ のうちの1つもしくは両方が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルもしくは $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルもしくは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており；または $R^2$ および $R^3$ は、一緒になって、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NH$ および $=N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)から選択される二価の基を形成し、

$R^4$ は、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、

シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、前記アルケニルおよび前記アルキニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-O-(C_1 \sim C_{10} \text{ ハロアルキル})$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$  およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^4$  が、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルである場合、前記シクロアルキルまたは前記ヘテロシクロアルキルは、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$  およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^5$  は、独立して、 $-L^5-R^{51}$  基であり、

各  $L^5$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{52}$ 、 $-NR^{52}R^{52}$ 、 $-COR^{52}$ 、 $-COOR^{52}$ 、 $-OCOR^{52}$ 、 $-CONR^{52}R^{52}$ 、 $-NR^{52}COR^{52}$ 、 $-SR^{52}$ 、 $-SOR^{52}$ 、 $-SO_2R^{52}$ 、 $-SO_2NR^{52}R^{52}$  および  $-NR^{52}SO_2R^{52}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NR^{52}-$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $R^{51}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NR^{52}R^{52}$ 、 $-OR^{52}$ 、 $-SR^{52}$ 、 $-SOR^{52}$ 、 $-SO_2R^{52}$ 、 $-COR^{52}$ 、 $-COOR^{52}$ 、 $-OCOR^{52}$ 、 $-CONR^{52}R^{52}$ 、 $-NR^{52}COR^{52}$ 、 $-SO_2NR^{52}R^{52}$ 、 $-NR^{52}SO_2R^{52}$  および  $-SO_3R^{52}$  から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび  $-L^{51}-R^{53}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^{51}$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、

—SO<sub>2</sub>—NH<sub>2</sub>、—SO<sub>2</sub>—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SO<sub>2</sub>—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—SO<sub>2</sub>—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび—L<sup>5 1</sup>—R<sup>5 3</sup>から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各R<sup>5 2</sup>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、R<sup>5 2</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つのR<sup>5 2</sup>基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つのR<sup>5 2</sup>基は、一緒になって、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキレンを形成してもよく、

各L<sup>5 1</sup>は、独立して、結合、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニレンおよびC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の—CH<sub>2</sub>—単位はそれぞれ、—O—、—NH—、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)—、—CO—、—S—、—SO—および—SO<sub>2</sub>—から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各R<sup>5 3</sup>は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—SHおよび—S(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル、—CN、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル、—OH、—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—OH、—(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキレン)—O(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—NH<sub>2</sub>、—NH(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、—N(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

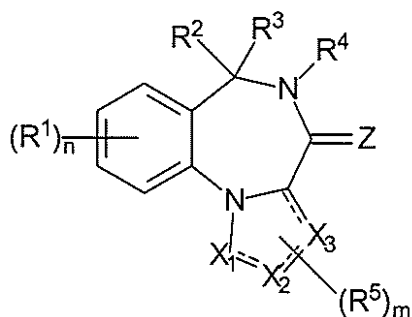
mは、0～3の整数である]

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

## 態様 2

一般式 (I) の化合物：

【化 2 6 3】



(I)

〔式中、

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  は、それぞれ独立して、C または N であり、  
各

【化 2 6 4】

-----

は、独立して、単結合または二重結合であり、ここで、任意の 2 つの隣接する結合

【化 2 6 5】

-----

の少なくとも 1 つは、単結合であり、

$Z$  は、O、S または N ( $-R^Z$ ) であり、

$R^Z$  は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^Z$  が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $R^1$  は、独立して、 $-L^1 - R^{11}$  基であり、

各  $L^1$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-NR^{12}R^{12}$ 、 $-COR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-OCOR^{12}$ 、 $-CONR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}COR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-SOR^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$  および  $-NR^{12}SO_2R^{12}$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる 1 つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、-

$\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^{12}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ および $-\text{SO}_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $\text{R}^{11}$ は、独立して、アリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{SR}^{12}$ 、 $-\text{SOR}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ 、 $-\text{COR}^{12}$ 、 $-\text{COOR}^{12}$ 、 $-\text{OCOR}^{12}$ 、 $-\text{CONR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{12}$ および $-\text{SO}_3\text{R}^{12}$ から選択され、ここで、前記アリーール、前記ヘテロアリーール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーールおよび $-\text{L}^{11}-\text{R}^{13}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $\text{R}^{11}$ が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニルまたは $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーールおよび $-\text{L}^{11}-\text{R}^{13}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各 $\text{R}^{12}$ は、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、アリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリーール、前記ヘテロアリーール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキレン})-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、 $\text{R}^{12}$ が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニルまたは $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}$

$H_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つの  $R^{12}$  基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの  $R^{12}$  基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$  アルキレンを形成してもよく、

各  $L^{11}$  は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニレンおよび  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の  $-CH_2-$  単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)  $-$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $R^{13}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$  および  $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

$n$  は、0～4の整数であり、

$R^2$  および  $R^3$  は、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルを形成し；または  $R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SH$ 、 $-S$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-CN$ 、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10}$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^2$  および  $R^3$  のうちの1つもしくは両方が、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルもしくは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルもしくは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル)、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つもしくは複数の基で任意選択で置換されており；または  $R^2$  および  $R^3$  は、一緒になって、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NH$  および  $=N$  ( $C_1 \sim C_{10}$  アルキル) から選択される二価の基を形成し、

$R^4$  は、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキル、前記アルケニルおよび前記アルキニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-$

$\text{O}-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル)、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $\text{R}^4$  が、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルである場合、前記シクロアルキルまたは前記ヘテロシクロアルキルは、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) およびシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各  $\text{R}^5$  は、独立して、 $-\text{L}^5 - \text{R}^{51}$  基であり、

各  $\text{L}^5$  は、独立して、結合、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキレン、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニレンおよび  $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンおよび前記アルキニレンはそれぞれ、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{52}$ 、 $-\text{NR}^{52} \text{R}^{52}$ 、 $-\text{COR}^{52}$ 、 $-\text{COOR}^{52}$ 、 $-\text{OCOR}^{52}$ 、 $-\text{CONR}^{52} \text{R}^{52}$ 、 $-\text{NR}^{52} \text{COR}^{52}$ 、 $-\text{SR}^{52}$ 、 $-\text{SOR}^{52}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{R}^{52}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{52} \text{R}^{52}$  および  $-\text{NR}^{52} \text{SO}_2 \text{R}^{52}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の  $-\text{CH}_2-$  単位はそれぞれ、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^{52}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$  および  $-\text{SO}_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各  $\text{R}^{51}$  は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、 $-\text{NR}^{52} \text{R}^{52}$ 、 $-\text{OR}^{52}$ 、 $-\text{SR}^{52}$ 、 $-\text{SOR}^{52}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{R}^{52}$ 、 $-\text{COR}^{52}$ 、 $-\text{COOR}^{52}$ 、 $-\text{OCOR}^{52}$ 、 $-\text{CONR}^{52} \text{R}^{52}$ 、 $-\text{NR}^{52} \text{COR}^{52}$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^{52} \text{R}^{52}$ 、 $-\text{NR}^{52} \text{SO}_2 \text{R}^{52}$  および  $-\text{SO}_3 \text{R}^{52}$  から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキレン)  $-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキレン)  $-\text{O}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{OCO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CO}-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}-\text{CO}-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)  $-\text{CO}-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{SO}_2-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)  $-\text{SO}_2-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび  $-\text{L}^{51} - \text{R}^{53}$  から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $\text{R}^{51}$  が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルケニルまたは  $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$  アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{COOH}$ 、テトラゾリル、 $-\text{COO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{OCO}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{CO}-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}-\text{CO}-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)  $-\text{CO}-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{SO}_2-\text{N}$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル) ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$  ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル)

、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル}) - SO_2 - (C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよび $-L^{51} - R^{53}$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

各 $R^{52}$ は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

ここで、 $R^{52}$ が、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_{10}$ アルキニルである場合、前記アルキル、前記アルケニルまたは前記アルキニルは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらに、2つの $R^{52}$ 基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの $R^{52}$ 基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$ アルキレンを形成してもよく、

各 $L^{51}$ は、独立して、結合、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキレン、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニレンおよび $C_2 \sim C_{10}$ アルキニレンから選択され、ここで、前記アルキレン、前記アルケニレンまたは前記アルキニレンに含まれる1つまたは複数の $-CH_2-$ 単位はそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル}) -$ 、 $-CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から独立して選択される基により任意選択で置き換えられており、

各 $R^{53}$ は、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-SH$ および $-S(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルはそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン}) - O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、

$m$ は、0～3の整数である]

またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグであって、但し、以下の化合物：

5-アリル-3, 3a, 5, 6-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]ピロロ-[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4(2H)-オン；

5-ブチル-3, 3a, 5, 6-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]ピロロ-[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4(2H)-オン；

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ[f]ピロロ[1, 2-a][1, 4]ジアゼピン-4-オン；

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-3, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;

5-メチル-4-オキソ-5, 6-ジヒドロ-4H-1, 2, 5, 10b-テトラアザ-ベンゾ [e] アズレン-3-カルボン酸エチルエステル;

5-メチル-4-オキソ-5, 6-ジヒドロ-4H-1, 2, 5, 10b-テトラアザ-ベンゾ [e] アズレン-3-カルボン酸メチルエステル;

5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;

9-フルオロ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;

8-メトキシ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;

3-プロモ-5-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;

5-(4-クロロ-ブチル)-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン; および

5-(4-クロロ-ブチル)-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4, 6-ジオン

が式 (I) から除外される、一般式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ。

#### 態様 3

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  の少なくとも 2 つが、それぞれ C であり、 $X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  のその他のものが、C または N である、態様 1 に記載の使用のための化合物、または態様 2 に記載の化合物。

#### 態様 4

$X_1$ 、 $X_2$  および  $X_3$  が、それぞれ C である、態様 1 もしくは 3 に記載の使用のための化合物、または態様 2 もしくは 3 に記載の化合物。

#### 態様 5

Z が、O である、態様 1 および 3～4 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～4 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 6

n が、1～4 の範囲の整数である、態様 1 および 3～5 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～5 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 7

各  $L^1$  が、独立して、結合および  $C_1 \sim C_{10}$  アルキレンから選択され、ここで、前記アルキレンが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  ( $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ )、 $-SH$  および  $-S(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレンに含まれる 1 つまたは 2 つの  $-CH_2-$  単位がそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-$ 、 $-CO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられている、態様 1 および 3～6 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～6 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 8

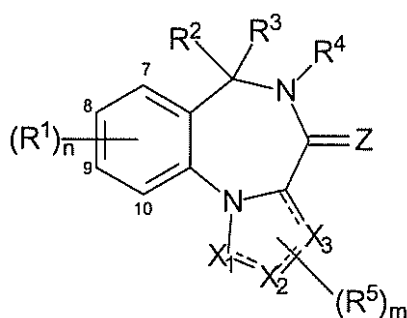
各  $R^{11}$  が、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  ( $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ )、 $-OH$  および  $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルがそれ

ぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-(C_1 \sim C_4$  アルキレン)  $-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4$  アルキレン)  $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^1$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである場合、前記アルキルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CHO$ 、 $-CO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-OCO$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-CO-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-CO-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-SO_2-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)  $-SO_2-$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様1および3～7のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2～7のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様9

$n$  が、1であり、ここで、 $R^1$  が、以下の：

【化266】



に示されている通り、式(I)に含まれる三環式部分の9位に結合しており、ここで、前記 $R^1$ が、フェニル、ピリジニルおよびイミダゾ[1,2-a]ピリジニルから選択され、ここで、前記フェニル、前記ピリジニルおよび前記イミダゾ[1,2-a]ピリジニルがそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-OH$ 、 $-O$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) および $-COOH$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様1および3～8のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2～8のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様10

$R^2$  および  $R^3$  が、それぞれ独立して、水素および  $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、好ましくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルから選択されるか；または  $R^2$  および  $R^3$  が、互いに結合して、それ

らが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキルを形成する、態様 1 および 3～9 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～9 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 1 1

$R^2$  および  $R^3$  が、それぞれ独立して、水素、メチルもしくはエチルから選択されるか、または  $R^2$  および  $R^3$  が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成する、態様 1 0 に記載の使用のための化合物、または態様 1 0 に記載の化合物。

#### 態様 1 2

$R^2$  および  $R^3$  の両方が水素であることはない、態様 1 および 3～1 1 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～1 1 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 1 3

$R^4$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、ここで、前記アルキルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ ハロアルキル})$ 、 $-CN$ 、 $-OH$  および  $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様 1 および 3～1 2 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～1 2 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 1 4

$R^4$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、ここで、前記アルキルが、 $-OH$  および  $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様 1 および 3～1 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～1 3 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 1 5

$R^4$  が、メチルおよびメトキシメチルから選択される、態様 1 4 に記載の使用のための化合物、または態様 1 4 に記載の化合物。

#### 態様 1 6

各  $L^5$  が、独立して、結合および  $C_1 \sim C_{10}$  アルキレンから選択され、ここで、前記アルキレンが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  ( $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ )、 $-SH$  および  $-S(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、前記アルキレンに含まれる 1 つまたは 2 つの  $-CH_2-$  単位がそれぞれ、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-$ 、 $-CO-$  および  $-SO_2-$  から独立して選択される基により任意選択で置き換えられている、態様 1 および 3～1 5 のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様 2～1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様 1 7

各  $R^{5,2}$  が、独立して、水素、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキルおよび前記ヘテロシクロアルキルがそれぞれ、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$  アルキニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキレン})-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$  ( $C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル}$ )、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されており、ここで、 $R^{5,2}$  が、 $C_2 \sim C_{10}$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  アルキニルである場合、前記アルケニルまたは前記アルキニルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_{10}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$  ( $C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル}$ )、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択で置換されてお

り、さらに、2つの $R^{5,2}$ 基が、同じ窒素原子に結合している場合、これらの2つの $R^{5,2}$ 基は、一緒になって、 $C_2 \sim C_8$ アルキレンを形成してもよい、態様1および3～16のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2～16のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様18

各 $R^{5,1}$ が、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-OH$ および $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルがそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{アルキレン})-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されており、さらにここで、 $R^{5,1}$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルである場合、前記アルキルが、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様1および3～17のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2～17のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様19

各 $R^{5,1}$ が、独立して、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-OH$ および $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ から選択され、ここで、前記アリール、前記ヘテロアリール、前記シクロアルキル、前記ヘテロシクロアルキル、前記シクロアルケニルおよび前記ヘテロシクロアルケニルがそれぞれ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{アルキレン})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{アルキレン})-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CHO$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-COOH$ 、テトラゾリル、 $-COO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-CO-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-NH-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様1および3～17のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2～17のいずれか一項に記載の化合物。

ル) -CO- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)、-SO<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>-NH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)、-SO<sub>2</sub>-N (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)、-NH-SO<sub>2</sub>- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)、-N (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)-SO<sub>2</sub>- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル)、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択で置換されている、態様1および3 ~ 18のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2 ~ 18のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様20

Zが、Oであり、  
R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、それぞれ独立して、水素およびC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルから選択されるか、またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルを形成し、  
R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、ここで、前記アルキルが、-OHおよび-O (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) から選択される1つの基で任意選択で置換されている、態様1、3 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様21

Zが、Oであり、  
R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、それぞれ独立して、水素およびC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルから選択され、ここで、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の両方が水素であることはなく、またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルを形成し、  
R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、ここで、前記アルキルが、-OHおよび-O (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) から選択される1つの基で任意選択で置換されている、態様1、3 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様22

Zが、Oであり、  
R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、それぞれ独立して、水素、メチルおよびエチルから選択されるか、またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成し、  
R<sup>4</sup>が、-OCH<sub>3</sub>で任意選択で置換されているメチルである、態様1、3 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様23

Zが、Oであり、  
R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、それぞれ独立して、水素、メチルおよびエチルから選択され、ここで、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の両方が水素であることはなく、またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、互いに結合して、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成し、  
R<sup>4</sup>が、-OCH<sub>3</sub>で任意選択で置換されているメチルである、態様1、3 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の使用のための化合物、または態様2 ~ 9および16 ~ 19のいずれか一項に記載の化合物。

#### 態様24

9-ブromo-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
9-ブromo-5-メトキシメチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
9-ブromo-5-(メチル-d<sub>3</sub>)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
2, 9-ジブromo-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4]

ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-2-クロロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-3-クロロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-7-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-10-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-8-フルオロ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-2-フェニル-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 9-プロモ-6, 6-スピロシクロプロピル-5-メチル-2-フェニル-5, 6-ジヒドロ-3, 5, 10b-トリアザ-ベンゾ [e] アズレン-4-オン;  
 8-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 7-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 10-プロモ-5-メチルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 8-プロモ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 2-プロモ-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 2-プロモ-5-メチル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 2-プロモ-5-メチル-9-(2-エチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メトキシメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(2-エチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(6-メチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(2-メチルピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]-4 (5H)-オン;  
 5-メチル-9-(3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-スピロ [ベンゾ

[f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(1-メチル-ピラゾール-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
;  
5-メチル-9-(1-メチル-ピラゾール-5-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
;  
5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-フルオロ-2-メチルピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-フルオロピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-フルオロピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(2-トリフルオロメチルピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-メチルピリジン-4-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3, 4-ジメトキシフェニル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-アミノ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(6-モルホリン-4-イル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-[1, 2'] ビピリジニル-5'-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-シアノフェニル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-9-(3-(1H-テトラゾール-5-イル) -フェニル) -スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(1-ピリミジン-4-イル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(1-アセチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(4-メチル-オキサゾール-5-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(4-メチルチアゾール-5-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-アセトニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-アクリロニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-プロピオニトリル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(6-クロロピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(6-フルオロピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2, 6-ジメチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(4-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(3-メチル-ピラジン-2-イル)-5, 6-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(4-メチル-ピリミジン-5-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2-プロピルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2-シクロプロピルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-(メチル-d<sub>3</sub>)-9-(5-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2, 4-ジメチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロ

ロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(3-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(6-フルオロピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2-ヒドロキシピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(ピリダジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2-メトキシカルボニルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-(2-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

7-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

7-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

10-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

10-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

8-フルオロ-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

8-フルオロ-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-ブロモ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-ブロモ-2-クロロ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-クロロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;

9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-2-クロロ-1-フルオロ-5-メチル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ

パン] - 4 (5 H) - オン ;

9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 3 - クロロ - 5 - メチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

1 - プロモ - 5 - メチル - 9 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 1 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イル) 9 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5, 8 - ジメチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

8 - モルホリン - 4 - イル - 5 - メチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5, 7 - ジメチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5, 10 - ジメチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

10 - シアノ - 5 - メチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

10 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - ピリジン - 3 - イル - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

3 - (5 - メチル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 9 - イル)

安息香酸 ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (6 - アミノ - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (2, 6 - ジメチル - ピリジン - 4 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (5 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (2 - エチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (2 - トリフルオロメチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (4 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン ;

5 - メチル - 2 - フェニル - 9 - (ピリジン - 4 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピロロ

[1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン  
;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-メチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ  
[f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (  
5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(ピリミジン-5-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロ  
ロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オ  
ン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(2-メチル-ピリジン-4-イル)-スピロ [ベンゾ  
[f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (  
5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4  
(5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(2, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-スピロ [  
ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
-4 (5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-ピラジン-2-イル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1  
, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-ピリダジン-3-イル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [  
1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4  
(5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(ピリジン-2-イル)-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ  
[1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン  
;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-エチルピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ [  
f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5  
H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(2-フルオロ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4  
(5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ  
[ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン  
] -4 (5H) -オン;  
9-ジメチルアミノ-5-メチル-2-フェニル-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2  
-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(2-メトキシ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベン  
ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4  
(5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-シアノ-ピリジン-3-イル)-スピロ [ベンゾ  
[f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (  
5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(6-メチルアミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ [  
ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン]  
-4 (5H) -オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(2-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル)-スピロ  
[ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン  
] -4 (5H) -オン;

8-モルホリン-4-イル-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(2, 6-ジメチル-ピリジン-4-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(2-メチル-ピリジン-4-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 2, 9-ジフェニル-5-メチル-2-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(4-アミノ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(2, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(6-アミノ-ピリジン-3-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(4-メトキシ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(3-シアノ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(3-クロロ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(2-クロロ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(オキサゾール-5-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -9-イル) 安息香酸;  
 9-(1H-ピラゾール-4-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(4-クロロ-フェニル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-(1H-ピラゾール-3-イル)-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オン;  
 9-シアノ-5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a]

[1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジ  
アゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-フェニル-9-(ピロリジン-1-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピラ  
ゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H) -  
オン;  
9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) - 5-メチル-2-フェニルスピロ [ベンゾ  
[f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4  
(5H) - オン;  
N, N-ジメチル-3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロス  
ピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロ  
パン] - 9-イル) ベンゼンスルホンアミド;  
N, N-ジメチル-3-(5-メチル-4-オキソ-2-フェニル-4, 5-ジヒドロス  
ピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプ  
ロパン] - 9-イル) ベンゼンスルホンアミド;  
5-メチル-2-(ピリジン-3-イル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -  
スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン;  
2, 5-ジメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピ  
ラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (5H)  
- オン;  
5-メチル-2-(ピリジン-4-イル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -  
スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(1H-ピラゾール-3-イル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-  
イル) -スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'  
-シクロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(2-クロロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -  
スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(3-クロロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -  
スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(4-クロロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -  
スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(4-フルオロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シク  
ロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(2-フルオロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シク  
ロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-(3-フルオロフェニル) - 9-(2-メチル-ピリジン-3-イル)  
-スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シク  
ロプロパン] - 4 (5H) - オン;  
5-メチル-2-シアノ-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [ベンゾ [  
f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] - 4 (  
5H) - オン;  
5-メチル-2-ジメチルアミノ-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -スピロ [  
ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン

] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - シクロプロピル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン]

] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - シクロペンチル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン]

] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (チアゾール - 2 - イル) - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (チアゾール - 2 - イル) - 9 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イル) - 9 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イル) - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - ジメチルアミノ - 9 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 9 - (2 - エチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

5 - メチル - 2 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イル) - 9 - (2 - エチル - ピリジン - 3 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5 H) - オン;

9 - ブロモ - 5 - メチル - 2 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 4 - オン;

9 - (6 - アミノ - ピリジン - 3 - イル) - 5 - メチル - 2 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 4 - オン;

5 - メチル - 9 - (2 - メチルピリジン - 3 - イル) - 2 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - 4 H - ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 4 - オン;

5 - エチル - 9 - (2 - メチルピリジン - 3 - イル) - 2 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - 4 H - ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 4 - オン;

5 - メチル - 9 - (2 - メチルピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド;

5 - メチル - 9 - (2 - エチル - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド;

5 - メチル - 9 - (6 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド;

5 - メチル - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド;

5 - (メチル - d<sub>3</sub>) - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1'

' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド ;  
 5 - メチル - 9 - プロモ - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド ;  
 5 - メチル - 9 - (3 - シアノフェニル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド ;  
 5 - メチル - 9 - (ピリダジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルバルデヒド ;  
 5 - メチル - 9 - (2 - メチルピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - メチル - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - (メチル - d<sub>3</sub>) - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - メチル - 9 - プロモ - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - メチル - 9 - (ピリダジン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - メチル - 9 - (3 - シアノフェニル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロスピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 2 - カルボン酸 ;  
 5 - メチル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 2 - (オキサゾール - 5 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 2 - (3H - イミダゾール - 4 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 2 - (1H - イミダゾール - 2 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 2 - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - (1H - イミダゾール - 2 - イル) - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - (メチル - d<sub>3</sub>) - 9 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - 2 - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン] - 4 (5H) - オン ;  
 5 - メチル - 9 - プロモ - 2 - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル - スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 4] ジアゼピン - 6, 1' - シクロプロパン]

－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（6－ジメチルアミノ－ピリジン－3－イル）－2－[1, 3, 4] オキサジアゾール－2－イルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（6－クロロ－ピリジン－3－イル）－2－[1, 3, 4] オキサジアゾール－2－イルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（3－シアノフェニル）－2－[1, 3, 4] オキサジアゾール－2－イルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（ピリダジン－3－イル）－2－[1, 3, 4] オキサジアゾール－2－イルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－（シクロペンタンカルボニル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－アセチルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－（シクロペンチルメチル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－エチルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2, 5－ジメチル－9－（6－メチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2, 5－ジメチル－9－（2－エチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－（モルホリン－4－イルメチル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

5－メチル－9－（2－メチル－ピリジン－3－イル）－2－ジフルオロメチルースピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2－ヒドロキシメチル－5－メチル－9－（6－メチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2－ヒドロキシメチル－5－メチル－9－（2－エチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2－ヒドロキシメチル－5－メチル－9－（6－フルオロ－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2－メトキシメチル－5－メチル－9－（6－メチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン－6, 1'－シクロプロパン]－4（5H）－オン；

2－メトキシメチル－5－メチル－9－（2－エチル－ピリジン－3－イル）－スピロ [

ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン  
] -4 (5H) -オン;

2-メトキシメチル-5-メチル-9-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル) -スピロ  
[ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパ  
ン] -4 (5H) -オン;

9-ブromo-5-メチル-1, 2, 3, 3a-テトラヒドロ-スピロ [ベンゾ [f] ピロ  
ロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロプロパン] -4 (5H) -オ  
ン;

5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル) -1, 2, 3, 3a-テトラヒドロ  
-スピロ [ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-6, 1'-シクロ  
プロパン] -4 (5H) -オン;

5-メチル-9-ブromo-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 5-a  
] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5-メチル-9-ブromo-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] イミダゾ [1, 2-a  
] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5-メチル-9-ブromo-5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ [f] ピラゾロ [1, 5-a  
] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

9-ブromo-5, 6-ジメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a]  
[1, 4] ジアゼピン-4-オン;

9-ブromo-5-メチル-6-エチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2  
-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ  
[f] イミダゾ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ  
[f] イミダゾ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5-メチル-9-(2-メチルピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ-4H-ベンゾ  
[f] ピラゾロ [1, 5-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5, 6-ジメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ-ベン  
ゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

9-(6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル) -5, 6-ジメチル-5, 6-ジヒド  
ロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

6-エチル-5-メチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ  
-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5, 6, 6-トリメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1,  
4] ジアゼピン-4-オン;

9-クロロ-5, 6, 6-トリメチル-5, 6-ジヒドロ-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2  
-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

5, 6, 6-トリメチル-9-(2-メチル-ピリジン-3-イル) -5, 6-ジヒドロ  
-ベンゾ [f] ピロロ [1, 2-a] [1, 4] ジアゼピン-4-オン;

ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物およびプロドラッグから選択される、  
態様1に記載の使用のための化合物、または態様2に記載の化合物。

#### 態様25

態様1～24のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和  
物もしくはプロドラッグ、および1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤を含む、医  
薬組成物。

#### 態様26

処置または予防される状態が好ましくは、てんかん；認知症；パーキンソニズムおよび  
運動障害；運動ニューロン疾患；筋萎縮性側索硬化症；神経系の神経変性および／または  
遺伝性障害；末梢神経系の障害；多発性硬化症および神経系の他の脱髄性疾患；脳性小児  
麻痺；片麻痺および片側不全麻痺、および他の麻痺性症候群；脳血管障害；片頭痛；頭痛

；筋神経障害；眼および視覚路の障害；頭蓋内外傷／傷害；神経および脊髄への外傷／傷害；中毒；薬物、医薬的および生物学的物質の神経学的および精神医学的な副作用；括約筋制御および性機能の障害；精神遅滞、学習障害、運動技能障害、コミュニケーション障害、広汎性発達障害、注意欠陥および破壊的行動障害、栄養補給および摂食障害、T I C障害、および排泄障害；せん妄および他の認知障害；物質関連障害；統合失調症および他の精神病性障害；気分障害；不安障害；摂食障害；睡眠障害；薬物誘発性運動障害；内分泌および代謝性疾患；急性および慢性疼痛；悪心および嘔吐；過敏性腸症候群；ならびにがんから選択される、

変化したグルタミン酸作動性シグナル伝達および／もしくは機能に関連する状態ならびに／またはグルタミン酸レベルもしくはシグナル伝達の変化により影響を受け得る状態の、処置および／または予防において使用するための、態様1～24のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ、あるいは態様25に記載の医薬組成物。

#### 態様27

パーキンソン病の処置および／または予防において使用するための、態様1～24のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ、あるいは態様25に記載の医薬組成物。

#### 態様28

処置または予防される状態が好ましくは、てんかん；認知症；パーキンソニズムおよび運動障害；運動ニューロン疾患；筋萎縮性側索硬化症；神経系の神経変性および／または遺伝性障害；末梢神経系の障害；多発性硬化症および神経系の他の脱髄性疾患；脳性小児麻痺；片麻痺および片側不全麻痺、および他の麻痺性症候群；脳血管障害；片頭痛；頭痛；筋神経障害；眼および視覚路の障害；頭蓋内外傷／傷害；神経および脊髄への外傷／傷害；中毒；薬物、医薬的および生物学的物質の神経学的および精神医学的な副作用；括約筋制御および性機能の障害；精神遅滞、学習障害、運動技能障害、コミュニケーション障害、広汎性発達障害、注意欠陥および破壊的行動障害、栄養補給および摂食障害、T I C障害、および排泄障害；せん妄および他の認知障害；物質関連障害；統合失調症および他の精神病性障害；気分障害；不安障害；摂食障害；睡眠障害；薬物誘発性運動障害；内分泌および代謝性疾患；急性および慢性疼痛；悪心および嘔吐；過敏性腸症候群；ならびにがんから選択される、

変化したグルタミン酸作動性シグナル伝達および／もしくは機能に関連する状態ならびに／またはグルタミン酸レベルもしくはシグナル伝達の変化により影響を受け得る状態の、処置および／または予防のための医薬を調製するための、態様1～24のいずれか一項に記載の化合物の使用。

#### 態様29

m G l u R 3 のポジティブアロステリックモジュレーターとしての、態様1～24のいずれか一項に記載の化合物のインビトロ使用。

#### 態様30

代謝型グルタミン酸受容体3（m G l u R 3）に結合する薬剤を同定するための方法であって、以下のステップ；

（a）m G l u R 3 を、放射性標識または蛍光標識されている態様1～24のいずれか一項に記載の化合物に、化合物がm G l u R 3 に結合することを可能にする条件下で接触させ、それにより結合した標識化合物を生成するステップ；

（b）試験薬剤の非存在下で、結合した標識化合物の量に相当するシグナルを検出するステップ；

（c）結合した標識化合物を試験薬剤に接触させるステップ；

（d）試験薬剤の存在下で、結合した標識化合物の量に相当するシグナルを検出するステップ；および

（e）ステップ（d）において検出されたシグナルをステップ（b）において検出されたシグナルと比較して、試験薬剤がm G l u R 3 に結合するかどうかを決定するステップ

を含む、方法。

### 態様 3 1

疾患または障害、好ましくは、変化したグルタミン酸作動性シグナル伝達および／もしくは機能に関連する状態ならびに／またはグルタミン酸レベルもしくはシグナル伝達の変化により影響を受け得る状態を、処置および／または予防する方法であって、態様 1 ～ 2 4 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、溶媒和物もしくはプロドラッグ、あるいは態様 2 5 に記載の医薬組成物を、そのような処置または予防を必要とする対象に投与することを含む、方法。

### 態様 3 2

処置または予防される状態が、てんかん；認知症；パーキンソニズムおよび運動障害；運動ニューロン疾患；筋萎縮性側索硬化症；神経系の神経変性および／または遺伝性障害；末梢神経系の障害；多発性硬化症および神経系の他の脱髄性疾患；脳性小児麻痺；片麻痺および片側不全麻痺、および他の麻痺性症候群；脳血管障害；片頭痛；頭痛；筋神経障害；眼および視覚路の障害；頭蓋内外傷／傷害；神経および脊髄への外傷／傷害；中毒；薬物、医薬的および生物学的物質の神経学的および精神医学的な副作用；括約筋制御および性機能の障害；精神遅滞、学習障害、運動技能障害、コミュニケーション障害、広汎性発達障害、注意欠陥および破壊的行動障害、栄養補給および摂食障害、T I C 障害、および排泄障害；せん妄および他の認知障害；物質関連障害；統合失調症および他の精神病的障害；気分障害；不安障害；摂食障害；睡眠障害；薬物誘発性運動障害；内分泌および代謝性疾患；急性および慢性疼痛；悪心および嘔吐；過敏性腸症候群；ならびにがんから選択され、

好ましくは、処置および／または予防が、パーキンソン病の処置および／または予防である、態様 3 1 に記載の方法。