

【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5年1月11日(2023.1.11)

【国際公開番号】WO2020/115500
 【公表番号】特表2022-510700(P2022-510700A)
 【公表日】令和4年1月27日(2022.1.27)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-015
 【出願番号】特願2021-532119(P2021-532119)

【国際特許分類】

10

- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 7 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 1 3 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 2 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 3 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 1 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 4 4 (2 0 0 6 . 0 1)

20

30

【F I】

- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6 C S P
- C 0 7 D 4 0 5 / 1 4
- C 0 7 D 4 0 1 / 1 4
- C 0 7 D 4 0 9 / 1 4
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4
- C 0 7 D 4 1 7 / 1 4
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 1 3
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7
- A 6 1 P 3 / 0 4
- A 6 1 P 3 / 1 0
- A 6 1 P 2 1 / 0 0
- A 6 1 P 7 / 0 0
- A 6 1 P 3 5 / 0 0
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
- A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 3
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 1
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

40

50

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4

【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 令 和 4 年 1 2 月 2 7 日 (2 0 2 2 . 1 2 . 2 7)

【 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

10

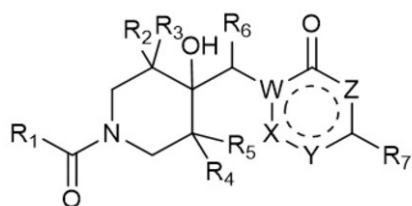
【 補 正 の 内 容 】

【 特 許 請 求 の 範 囲 】

【 請 求 項 1 】

式 (I) :

【 化 1 】



20

(I)

〔 式 中 、

R₁ は、場合により置換されている、アルキル、アルケニル、アルキニル、エーテル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルキルヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキル基であり；

30

R₂ は、Hまたは場合により置換されているアルキル基であり、

R₃ は、Hまたは場合により置換されているアルキル基であり、

R₄ は、Hまたは場合により置換されているアルキル基であり、

R₅ は、Hまたは場合により置換されているアルキル基であり、

R₂ および R₄ は、互いに結合して、それらが結合している炭素を含む、場合により置換されている、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルを形成してよく、

R₄ および R₅ は、互いに結合して、それらが結合している炭素を含む、場合により置換されている、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルを形成してよく；

R₆ は、Hまたは場合により置換されているアルキル基であり；

W は、C または N であり；

X は、N または C R₈ であり、ここで、R₈ は H または場合により置換されている C₁ - C₆ アルキルであり、

40

Y は、N または C R₉ であり、

Z は、C H または N H であり、

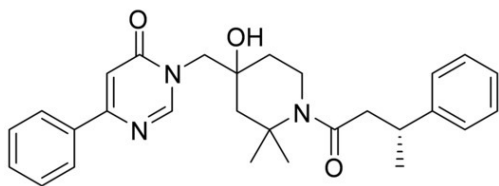
ここで、R₉ は、H または場合により置換されている、アルキル、アミド、アミノ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ハロ、カルボニル、カルボキシル、エステル、アミノアルキルまたはシアノであり；

R₇ は、水素、ハロまたは場合により置換されている、アルキル、アルケニル、アルキニル、アミノ、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールもしくはヘテロシクロアルキル基である。〕

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体もしくは N

50

- オキシド誘導体、または
式：
【化 2】



で示される化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体もしくはN 10
- オキシド誘導体、
を含有する、肥満、インスリン抵抗性、またはII型糖尿病を処置するための医薬組成物。

【請求項 2】

R₁が、場合により置換されている、C₁ - C₆アルキル、場合により置換されている
C₄ - C₁₀アルキルシクロアルキル、場合により置換されているC₄ - C₅ヘテロシク
ロアルキル、場合により置換されているC₇ - C₁₀アリールアルキル、場合により置換
されているC₃ - C₆シクロアルキル、または場合により置換されているC₃ - C₆ヘテ
ロアリールであり、

ここで、場合により存在する各置換基が、独立してC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アル
ケニル、ヒドロキシメチル、メトキシメチル、ベンジルオキシメチル、フェニル、C₃ - 20
C₆シクロアルキル、CF₃、CHF₂、OHまたはハ口から選択される、
請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

R₁が、場合により置換されているC₇ - C₁₀シクロヘキシルアルキル、場合により
置換されているC₄ - C₆シクロプロピルアルキル、場合により置換されているC₅ - C
6シクロブチルアルキル、場合により置換されているC₇ - C₁₀アルキルベンゼン、場
合により置換されている2,2 - ジフルオロプロパン、または場合により置換されている3,
3,3 - トリフルオロプロパンであり、

ここで、場合により存在する各置換基が、C₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル
、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、メトキシメチル、OHまたはハ口から独立して 30
選択され、場合によりR₁が置換されており、該置換基が、C₁ - C₆アルキル、場合
によりメチルである、

請求項 1 または請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

R₁が、メチル置換シクロヘキシルエタン、またはメチル置換エチルベンゼンであるか
、あるいは、R₁が、メチル置換2,2 - ジフルオロプロパン、またはメチル置換3,3,3
- トリフルオロプロパンである、

請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R₁が、C₄ - C₅ヘテロシクロアルキルであり、場合によりフェニルで置換されてお
り、場合によりR₁は、フェニルで置換されているピロリジン、またはフェニルで置換さ
れているペリリジンである、 40

請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R₇が、場合により置換されている、C₆ - C₁₀アリール、C₁ - C₁₂ヘテロアリ
ール、C₁ - C₁₀アルキル、C₂ - C₁₀アルケニル、C₃ - C₁₀シクロアルキル、ア
ミノ、C₁ - C₃アルコキシ、またはハ口から選択され、

ここで、場合により存在する置換基が、C₁ - C₆アルキル、ヒドロキシ置換C₁ - C
6アルキル、C₃ - C₆シクロアルキル、C₁ - C₆ヘテロシクロアルキル、C₁ - C₆
アルコキシ、ハ口置換C₁ - C₆アルコキシ、アミド、シアノまたはハ口から選択される 50

、
請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R₇ が、シクロプロピル、チオフェン、または場合により置換されているフェニルであり、

ここで、場合により存在する置換基が、C₁ - C₆ アルキル、ヒドロキシ置換 C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルキルアミンおよびハロから選択され、場合により R₇ がフェニルまたはフルオロ置換フェニルである、

請求項 1 ~ 6 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

R₂、R₃、R₄、R₅ が独立して、H および C₁ - C₆ アルキルから選択され、場合により R₂ および R₃ が H であり、そして、R₄ および R₅ がメチルである、

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

R₄ および R₅ が、互いに結合して、それらが結合している炭素を含む、場合により置換されている、C₃ - C₆ シクロアルキルまたは C₃ - C₆ ヘテロシクロアルキルを形成し、R₂ および R₃ が独立して、H および C₁ - C₆ アルキルから選択され、場合により、R₂ および R₃ が H であり、R₄ および R₅ が、互いに結合して、それらが結合している炭素を含む C₃ - C₆ シクロアルキルを形成する、

請求項 1 ~ 8 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

R₄ および R₅ が互いに結合してそれらが結合している炭素を含む、C₄ または C₅ シクロアルキルを形成する、

請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

R₆ が、H または C₁ - C₆ アルキルである、

請求項 1 ~ 10 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 12】

R₂ および R₄ が、互いに結合して、それらが結合している炭素を含む C₅ シクロアルキルを形成し、ここで、R₃、R₅ および R₆ が独立して、H または C₁ - C₆ アルキルである、

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 13】

W が N であり、X が CR₈ であり、ここで、R₈ が H またはメチルである、

請求項 1 ~ 12 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 14】

Y が、N または CR₉ であり、ここで、R₉ が H、C₁ - C₆ アルキル、NR' R''、C(O)NR' R''、シアノ、カルボキシル、ハロ、C - C₆ アルキルアミン、C₃ - C₆ アルキルエステル、場合により置換されている C₆ - C₁₀ アリール、または場合により置換されている C₂ - C₆ ヘテロアリールであり、ここで、1 以上のヘテロ原子が N および O から選択され、アリールまたはヘテロアリールの 1 以上の場合により存在する置換基が、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルキルアミン、アミドおよびシアノから選択され、ここで、R' および R'' が H、場合により OH で置換されている C - C₆ アルキル、C₃ - C₇ シクロアルキル、C₁ - C₇ ヘテロシクロアルキル、C₄ - C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ - C₇ アルキルヘテロシクロアルキル、ベンジル、フェニルおよびメトキシから独立して選択され、またはここで、R' および R'' が、互いに結合して、それらが結合している N 原子を含む C₂ - C₇ ヘテロ環を形成し、ここで、ヘテロ環が、場合により、ヒドロキシル置換、オキソ置換、メチル置換、CH₂OH 置換またはアセチル置換、されている、

請求項 1 ~ 13 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 15】

Y が、N または C R₉ であり、ここで、R₉ が、場合によりアミド、シアノまたはメチルアミンで置換されているフェニル；ピリジン；オキサゾール；ピラゾール；カルボキシル；C(O)NR' R''；または NR' R'' から選択され；

ここで、R' および R'' が H、C - C₆ アルキル、C₃ - C₇ シクロアルキル、C₃ - C₇ ヘテロシクロアルキルから独立して選択され、ここで、ヘテロ原子が N または O であるか、またはここで、R' および R'' が互いに結合してそれらが結合している N を含む C - C₇ ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、ヘテロシクロアルキルが、場合によりヒドロキシル置換、オキソ置換、メチル置換、CH₂OH 置換またはアセチル置換、されている、

10

請求項 1 ~ 14 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 16】

R₁ が、場合により置換されているエチルシクロヘキサン、場合により置換されているエチルベンゼン、場合により置換されている 2, 2 - ジフルオロブタン、および場合により置換されている 3, 3, 3 - トリフルオロプロパンから選択され、ここで、場合により存在する置換基が、メチル、エチル、プロピル、プロペニル、ヒドロキシメチルおよびメトキシメチルの 1 以上であるか、またはここで、R₁ がフェニル置換ピロリジンであり；

R₂ および R₃ が独立して、H、メチルから選択され、

R₄ および R₅ が独立して、H、メチルから選択され、または互いに結合してそれらが結合している炭素を含む、C₃ - C₆ シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル、場合によりそれらが結合している炭素を含む C₄ または C₅ シクロアルキルを形成し、

20

R₆ が、H またはメチルであり、

R₇ が、場合により置換されているフェニル、インダゾール、チオフェンまたはピラゾールから選択され、ここで、場合により存在する置換基が C₁ - C₆ アルキル、ヒドロキシ置換 C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ヘテロシクロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、八口置換 C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルキルアミン、アミド、シアノまたは八口から選択され、

W が、N または C であり、

X が、CH または N であり、

Z が、C または NH であり、

30

Y が、N または C R₉ であり、ここで、R₉ が、場合によりアミド、シアノまたはメチルアミンで置換されているフェニル；ピリジン；オキサゾール；ピラゾール；C(O)NR' R''；または NR' R''、から選択され；

ここで、R' および R'' が H、C - C₆ アルキル、C₃ - C₇ シクロアルキル、C₃ - C₇ ヘテロシクロアルキルから独立して選択され、ここで、ヘテロ原子が N または O であるか、またはここで、R' および R'' が互いに結合してそれらが結合している N を含む C - C₇ ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで、ヘテロシクロアルキルが、場合によりヒドロキシル置換、オキソ置換、メチル置換、ヒドロキシメチル置換またはアセチル置換、されている、

請求項 1 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 17】

Y が、C R₉ であり、ここで、R₉ が C(O)NR' R'' であり、ここで、R' および R'' が、互いに結合してそれらが結合している N を含む、場合により置換されている、ピロリジン、ペペリジン、ペペラジンまたはモルホリンを形成し、ここで、ペペリジン、ピロリジン、ペペラジンまたはモルホリンが、場合によりヒドロキシル置換、オキソ置換、メチル置換、ヒドロキシメチル置換またはアセチル置換、されており、ここで、Y が C R₉ であり、場合により、R₉ が C(O)NR' R'' であり、ここで、R' および R'' が互いに結合してペペラジニル環を形成する、

請求項 14 ~ 16 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 18】

50

WがNであり、YがNであり、W、X、Y、Zを含む環が置換ピリミジン環である、請求項1～16の何れか1項に記載の医薬組成物。

【請求項19】

化合物が式(I)のヒドロキシル位置でキラルであるとき、化合物がSエナンチオマーである、

請求項1～18の何れか1つに記載の医薬組成物。

【請求項20】

化合物が次のものである、請求項1に記載の医薬組成物：

- (R) - 5 - プロモ - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン； 10
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルプロパノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- 3 - ((1 - (3 - シクロブチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- 3 - ((1 - (3 - シクロペンチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- (R, S) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (2 - メチル - 3 - フェニルプロパノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- (R) - N - (3 - (1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル)フェニル)アセトアミド； 20
- (R) - 3 - (1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル)ベンズアミド；
- (R) - 5 - (フラン - 2 - イル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン；
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン；
- (R) - 4 - クロロ - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン； 30
- (R) - 4 - (ジメチルアミノ) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン；
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - フェニル - 4 - (プロパ - 1 - エン - 2 - イル)ピリジン - 2(1H) - オン；
- (R) - エチル 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキシレート；
- (R, S) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (2 - メチル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 2 - カルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド； 40
- (R, S) - 1 - ((1 - (3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペリジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン；
- (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (1 - メチル - 1H - インダゾール - 7 - イル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - メトキシフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン；
- (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ 50

- チル) - 2 - メチル - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 2 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 5, 6 - ジフェニルピリダジン - 3 (2 H) - オン ;
 (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 6 - (ナフタレン - 1 - イル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 6 - (3 - (1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル)フェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ -
 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 6 - (チオフエン - 3 - イル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 4 - (2 - フルオロフェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (1 - メチルシクロペンタン
 - 1 - カルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6
 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 3 - ((1 - (1 - エチルシクロヘキサン - 1 - カルボニル) - 4 - ヒドロキシピペリジン -
 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 3 - ((1 - (2 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - メチルブタノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3
 , 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン
 - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 6 - (フラン - 2 - イル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)
 ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 (R) - 6 - (シクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェ
 ニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 6 - (プロパ - 1 - エン - 2 - イル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 6 - (2 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 3 - (((1 R, 5 S) - 3 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 8 -
 ヒドロキシ - 3 - アザピシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル)メチル) - 6 - (2 - フル
 オロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノ
 イル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 5 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 2 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルプロパノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)
 - 2 - メチル - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 6 - (イソブチルアミノ)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 (R) - 1 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペ
 リジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペリジン - 1 - カルボニル)ピリジン
 - 2 (1 H) - オン ;
 (R) - 2 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
 チル) - 5 - フェニルピリダジン - 3 (2 H) - オン ;
 (R) - 4 - (2 - シアノフェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイ
 ル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 1, 6
 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 (R) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペ
 リジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
 3 - ((1 - (2 - (シクロヘキシルメチル)ブタノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 -

- イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- r a c - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (c i s - 2 - フェニルシクロプロパンカルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (1 - メチルシクロヘキサンカルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - ((S) - 1 - (1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)プロピル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - ((R) - 1 - (1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)プロピル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ; 10
- (R, S) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - ヒドロキシプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボアルデヒド ;
- (R) - 5 - ((ジメチルアミノ)メチル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;
- 3 - ((R) - 1 - (4 - ヒドロキシ - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)エチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - ((S) - 1 - (4 - ヒドロキシ - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)エチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ; 20
- (R) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- (R, S) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - フルオロプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ; 30
- 3 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - (((R) - 6 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 9 - ヒドロキシ - 6 - アザスピロ[3.5]ノナン - 9 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - (((S) - 6 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 9 - ヒドロキシ - 6 - アザスピロ[3.5]ノナン - 9 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- (R) - 5 - (3 - (アミノメチル)フェニル) - 1 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ; 40
- 3 - (((S) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- 3 - (((R) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- (R) - 6 - (4 - フルオロフェノキシ) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オ 50

ン；

6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (1 - メチル - 4 - メチレンシクロヘキサンカルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；
(R, S) - 3 - ((1 - (3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

；
(R, S) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘプチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

3 - ((1 - (3 - シクロブチル - 2, 2 - ジメチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン； 10

6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - (((1 R, 5 S) - 8 - ヒドロキシ - 3 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル) - 3 - アザビシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

3 - (((R) - 4 - ヒドロキシ - 2, 2 - ジメチル - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン；

3 - (((S) - 4 - ヒドロキシ - 2, 2 - ジメチル - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン；

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン； 20

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピロリジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン；

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (1, 4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ[4.5]デカン - 8 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン；

(R) - N - シクロヘキシル - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド；

6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (cis - 2 - フェニルシクロプロパン - 1 - カルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン； 30

(R, S) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボニル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

(R, S) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (3 - フェニルプロパノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

(R, S) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (1 - イソブチルシクロプロパン - 1 - カルボニル) - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン； 40

(R, S) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (3 - メチル - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン；

(S) - 1 - ((1 - (4, 4 - ジフルオロ - 3 - フェニルブタノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド；

1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (1 - (チオフエン - 2 - イル)シクロプロパン - 1 - カルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド； 50

- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - (ヒドロキシメチル)フェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- (R) - N,N - ジエチル - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシルブタノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- (R,S) - 3 - ((1 - (3 - シクロヘキシルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- (R,S) - 1 - ((1 - (3 - シクロブチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R,S) - 1 - ((1 - (2 - エチルヘキサノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R,S) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチル - 1 - (1 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボニル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((1 - (3 - (4 - フルオロフェニル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- (R,S) - 3 - ((1 - (3 - シクロプロピルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4(3H) - オン ;
- 1 - ((1 - (2,2 - ジメチルブタノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R) - N - (2 - (1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル)フェニル)アセトアミド ;
- (R) - 5 - (4 - (アミノメチル)フェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- (R) - 1 - ((1 - (3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペリジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - 4 - (2 - メトキシフェニル) - N - メチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- (R) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 1,

6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1' - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4' - フェニル - [2, 3' - ビピリジン] - 6' (1' H) - オン ;

1 - ((1 - (3 - シクロヘキシルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - tert - ブチル 4 - (1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボニル)ピペラジン - 1 - カルボキシレート ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - (p - トリル) - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - メトキシ - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4, 5 - ジフェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - [3, 3' - ビピリジン] - 6 (1 H) - オン ;

(R) - 5 - (3 - (アミノメチル)フェニル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - (m - トリル) - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピリミジン - 5 - イル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

(R) - N - (シクロプロピルメチル) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - N - ベンジル - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

(R) - 2 - (1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル)ベンゾニトリル ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - メチル - 6 - オキソ - N, 4 - ジフェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

3 - (1 - (1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル)エチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1

10

20

30

40

50

H) - オン ;

(R) - 3 - ((1 - (2 - (シクロヘキシルメチル)ペンタ - 4 - エノイル) - 4 - ヒドロキシ
ピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
チル) - 5 - メチル - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;

(R) - 6 - (1,5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ -
1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

3 - (((1 R, 5 S) - 3 - (3 - シクロヘキシルプロパノイル) - 8 - ヒドロキシ - 3 - ア
ザビシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミ
ジン - 4 (3 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
チル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボニトリル ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
チル) - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリ
ジン - 3 - カルボキサミド ;

1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
チル) - 5 - ((S) - 2 - メチルピロリジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン -
2 (1 H) - オン ;

(R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 1 - (3 - フェニルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メ
チル) - 5 - (4 - (ヒドロキシメチル)ピペリジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリ
ジン - 2 (1 H) - オン ;

3 - ((1 - (2 - (シクロヘキシルメチル)ブタノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチ
ルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H) -
オン ;

3 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ -
7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリ
ミジン - 4 (3 H) - オン ;

1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル -
6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4
- フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4
- フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピロリジン -
1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン -
1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキ
シ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン -
1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

3 - ((1 - (2 - (シクロヘキシルオキシ)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメ
チルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3 H)
- オン ;

10

20

30

40

50

- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロプロピル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - [4, 5' - ビピリミジン] - 6 (1H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (1H - ピラゾール - 4 - イル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (1H - ピラゾール - 5 - イル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (チオフェン - 3 - イル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (オキサゾール - 2 - イル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - (ヒドロキシメチル)フェニル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (3 - (ヒドロキシメチル)フェニル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (4 - (ヒドロキシメチル)フェニル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 6 - (4 - (アミノメチル)フェニル) - 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 6 - (2 - (アミノメチル)フェニル) - 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (2, 4, 4 - トリメチルペンタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 4 - クロロ - 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 -

10

20

30

40

50

- ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (ジメチルアミノ) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((1 - ((S) - 3 - (ベンジルオキシ) - 2 - (シクロヘキシルメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - イソブチリル - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロプロピル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ((4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチル - 1 - (2 - メチル - 3 - (1H - ピラゾール - 1 - イル)プロパノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - (ヒドロキシメチル)フェニル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((S) - 3 - シクロヘキシル - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 1 - ((S) - 3 - シクロヘキシル - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1' - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4' - (2 - フルオロフェニル) - [2,3' - ピペリジン] - 6' (1' H) - オン ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - (チオフェン - 3 - イル) - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (3 - (ヒドロキシメチル)フェニル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (3 - シクロヘキシル - 2 - ヒドロキシプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (2 - メチル - 3 - (ピペリジン - 1 - イル)プロパノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 6 - (3 - (アミノメチル)フェニル) - 3 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 1 - (((S) - 1 - ((S) - 3 - シクロヘキシル - 2 - (メトキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

- 4 - (2 - (アミノメチル)フェニル) - 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (4 - (ヒドロキシメチル)フェニル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (2 - メチル - 3 - モルホリノプロパノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((S) - 1 - ((S) - 2 - (シクロヘキシルメチル) - 4 - ヒドロキシブタノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 1 - ((S) - 2 - (シクロヘキシルメチル) - 4 - ヒドロキシブタノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((S) - 1 - ((S) - 3 - シクロブチル - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 1 - ((S) - 3 - シクロブチル - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
 5 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (4,4,4 - トリフルオロ - 3 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (4,4,4 - トリフルオロブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (3 - (テトラヒドロフラン - 3 - イル)プロパノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - ((1R,2S) - 2 - フェニルシクロプロパン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((7 - (シクロプロパンカルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (1 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - ((7 - (3 - フルオロシクロペンタン - 1 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェ

- ニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (1 - (2, 2 - ジフルオロエチル)シクロプロパン - 1 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (ピシクロ[2.2.1]ヘプタン - 1 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - ((S) - 4, 4 - ジフルオロ - 3 - フェニルブタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - ((R) - 4, 4 - ジフルオロ - 3 - フェニルブタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (3 - エトキシプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 3 - フェニルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (3 - (4 - フルオロフェニル)プロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 3 - フェニルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (1 - メチルシクロペンタン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (1H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (1H - インダゾール - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (3 - シクロヘキシル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (1H - インドール - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (ピシクロ[1.1.1]ペンタン - 1 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (5 - フェニルオキサゾール - 4 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (5 - シクロプロピルオキサゾール - 4 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (2 - (シクロヘキシルオキシ)アセチル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ

- [4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (スピロ[2.2]ペンタン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (3 - (トリフルオロメチル)シクロペンタン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (2, 4 - ジメチルペンタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (1 - ベンジル - 1H - ピロール - 2 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (2 - (シクロヘキシルオキシ)プロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 3 - ((1 - ((S) - 3 - シクロブチル - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - (2 - フルオロフェニル)ピリミジン - 4 (3H) - オン ;
- 1 - ((7 - (2 - シクロプトキシアセチル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (3, 3 - ジフルオロシクロペンタン - 1 - カルボニル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルプロパノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1H) - オン ;
- (S) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (2, 2 - トリフルオロエチル)ブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - ((S) - 2 - (ヒドロキシメチル)ピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1H) - オン ;

- キシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (3 - (トリフルオロメチル)シクロブタン - 1 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - ((2 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 5 - ヒドロキシ - 9 - オキサ - 2 - アザスピロ[5.5]ウンデカン - 5 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 1 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - ((2 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - アザスピロ[5.5]ウンデカン - 5 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((2 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - アザスピロ[5.5]ウンデカン - 5 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - ((1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 ;
- 1 - ((7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - メトキシ - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((7 - (4,4 - ジフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;

10

20

30

40

50

- 1 - ((7 - (4, 4 - ジフルオロ - 2, 2 - ジメチルブタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (4 - (トリフルオロメチル)チアゾール - 2 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (2 - (トリフルオロメチル)チアゾール - 4 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- エチル 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキシレート ;
- 1 - (((S) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N - イソプロピル - N - メチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピロリジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 1 - ((S) - 3 - シクロヘキシル - 2 - (メトキシメチル)プロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- (R) - 1 - ((4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (2, 2 - トリフルオロエチル)ブタノイル)ピペリジン - 4 - イル)メチル) - N, N - ジメチル

10

20

30

40

50

- ル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - ((S) - 2 - (ヒドロキシメチル)ピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - ((R) - 3 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 (R) - 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 (R) - 1 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - (4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 4 - (2 - フルオロフェニル) - 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (2 - フルオロフェニル) - 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N, N - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2 (1 H) - オン ;

10

20

30

40

50

- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - シクロプロピル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 1 - ((R) - 3 - シクロブチル - 2 - メチルプロパノイル) - 4 - ヒドロキシ - 3,3 - ジメチルピペリジン - 4 - イル)メチル) - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - N,N - ジメチル - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド ;
- 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((S) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)ブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 4 - フェニル - 5 - (ピペラジン - 1 - カルボニル)ピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- 1 - (((R) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - フェニルピリジン - 2(1H) - オン ;
- エチル 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキシレート ;
- 1 - (((R) - 7 - ((R) - 3 - シクロヘキシル - 2 - メチルプロパノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - オキソ - 4 - フェニル - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 ;
- 3 - ((10 - ヒドロキシ - 7 - ((3R,4R) - 3 - フェニルピペリジン - 4 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (

3 H) - オン ;

3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

6 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

6 - (3 - フルオロフェニル) - 3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((R) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - メチルブタノイル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル)ピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

3 - (((S) - 7 - ((R) - 4,4 - ジフルオロ - 2 - メチルペンタノイル) - 10 - ヒドロキシ - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((3 S, 4 R) - 4 - フェニルピロリジン - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((3 R, 4 S) - 4 - フェニルピロリジン - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ;

3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((2 R, 3 R) - 2 - フェニルピロリジン - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン ; または

3 - (((S) - 10 - ヒドロキシ - 7 - ((2 S, 3 S) - 2 - フェニルピロリジン - 3 - カルボニル) - 7 - アザスピロ[4.5]デカン - 10 - イル)メチル) - 6 - フェニルピリミジン - 4 (3 H) - オン。

【請求項 2 1】

さらに薬学的に許容される希釈剤、添加物または担体を含む、請求項 1 ~ 20 の何れか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

肥満、インスリン抵抗性、またはII型糖尿病を処置するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 20 の何れか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体もしくは N - オキシド誘導体の使用。

【請求項 2 3】

肥満、インスリン抵抗性、またはII型糖尿病を処置するための、USP 19 阻害剤、を含有する、医薬組成物。

10

20

30

40

50