

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年5月24日(2007.5.24)

【公表番号】特表2006-522744(P2006-522744A)

【公表日】平成18年10月5日(2006.10.5)

【年通号数】公開・登録公報2006-039

【出願番号】特願2006-504351(P2006-504351)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/38 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 5/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 231/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 307/83 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/06	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/415	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/343	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	5/38	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	1/08	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	5/06	
A 6 1 P	5/10	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/14	
C 0 7 D	487/04	1 4 2
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	231/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 6 A
C 0 7 D	307/83	
C 0 7 D	403/06	
C 0 7 D	487/04	1 5 0
C 0 7 D	417/04	

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月28日(2007.3.28)

【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】

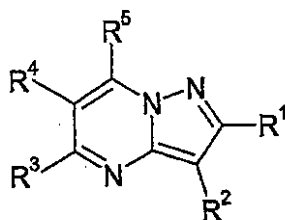
【請求項 1】

11 β -ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ 1 型 (11 β -HSD1) 阻害剤と、グルココルチコイド受容体アゴニストとを含んでなる、併用療法のための組合せ。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が次式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化 1】



式 (I)

ここで、

R¹およびR²は、独立に、水素、ハロ、C(=O)NR⁶R⁷、CO₂R¹⁵、NR⁶C(=O)R¹¹、OR¹²またはSR¹²であり；

R³およびR⁵は、独立に、水素、NR¹³R¹⁴、トリハロメチル、トリハロメトキシ、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリール、またはhetアリールC₁-C₆アルキルであり、ここでのアルキル、アルキニル、アルケニル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、またはアリールアルキル基は独立して 1 以上のR⁸で任意に置換され；

R⁴は、水素、シアノ、ハロ、CO₂R¹⁵、C(=O)NR⁶R⁷、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、またはC₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキルであり、ここでのアルキル、アルキニル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、またはhetアリールアルキル基は独立して、1 以上のR⁹で任意に置換され；

R⁶およびR⁷は、独立に、C₁-C₆アルキル、C₃-C₁₀シクロアルキル、hetC₃-C₁₀シクロアルキル、アリールC₁-C₆アルキル、またはhetアリールC₁-C₆アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールアルキル、およびhetアリールアルキル基は独立して、1 以上のR¹⁰で任意に置換されるか；または

R⁶およびR⁷は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリールC₁-C₆アルキルカルボニル、hetアリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリールC₁-C₆アルキルカルボキシまたはhetアリールC₁-C₆アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R⁸およびR⁹は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、ニトロ、C₃-C₁₀シクロアルキル、C₃-C₁₀heteroシクロアルキル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、

アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノであり；

R^{10} は、水素、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、オキソ、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメチル-ジアルキルアミノオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ or アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{11} は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリールカルボニル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上の R^9 で任意に置換され；

R^{12} は、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ C_1 - C_6 アルキル、アリールカルボニルアミノ C_1 - C_6 アルキル、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ C_1 - C_6 アルキルであり；

R^{13} および R^{14} は、独立に、水素、オキソ、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニルであり；

R^{15} は、水素、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシアルキル、またはアリール C_1 - C_6 アルキルオキシアルキルである。

【請求項3】

請求項2に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤が前記式(I)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

但し、前記式(I)において、

R^1 および R^2 は、独立に、水素、ハロ、 $C(=O)NR^6R^7$ 、 $NC(=O)R^{11}$ 、 OR^{12} または SR^{12} であり；

R^3 および R^5 は、独立に、水素、 $NR^{13}R^{14}$ 、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルチオ、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルキニル、アルケニル、アリール、hetアリール、アリールアルキルまたはhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^8 で任意に置換され；

R^4 は、水素、シアノ、ハロ、 CO_2R^{15} 、 $C(=O)NR^6R^7$ 、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、または C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルキニル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、またはhetアリールアルキル基は独立して1以上の R^9 で任意に置換され；

R^6 および R^7 は、独立に、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、het C_3 - C_{10} シクロアルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールアルキル、およびhetアリールアルキル基は独立して1以上の R^{10} で任意に置換されるか；または

R^6 および R^7 は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル

、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、 C_1-C_6 アルキルオキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、ニトロ、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} hetシクロアルキル、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキルカルボキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、またはアリール C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノであり；

R^{10} は、水素、ハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、オキソ、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} hetシクロアルキル、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメチル-ジアルキルアミノオキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{11} は、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキル、アリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリールカルボニル C_1-C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール およびhetアリール基は独立して1以上の R^9 で任意に置換され；

R^{12} は、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ C_1-C_6 アルキル；アリールカルボニルアミノ C_1-C_6 アルキル、またはアリール C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ C_1-C_6 アルキルであり；

R^{13} および R^{14} は、独立に、水素、オキソ、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{15} は、水素、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシアルキル、またはアリール C_1-C_6 アルキルオキシアルキルである。

【請求項4】

請求項2または3に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記からなる群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

- ・(3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

-2-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；

・アゼパン-1-イル-(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・アゼパン-1-イル-(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)メタノン；

・3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；

・(7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・5-(4-メトキシ-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；

・[5-(4-エトキシ-フェニル-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・アゼパン-1-イル-(3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)]-メタノン；

・アゼパン-1-イル-[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン

アゼパン-1-イル-(5,7-ジフェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)]-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-[7-(4-エトキシ-フェニル)-5-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]メタノン；

・5-(4-エトキシ-フェニル)-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；

・ピペリジン-1-イル-(5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・アゼパン-1-イル-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；

・5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；

・5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・ (5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・ (5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ 5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・ 5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・ (5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ 5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・ (5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 7-フェニル-5-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸シクロヘキシルアミド；および
- ・ (5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン。

【請求項 5】

請求項 2 または 3 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が、下記の群から選択される化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

- ・ 5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチルエステル；
- ・ 5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチルエステル；
- ・ 7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチルエステル；
- ・ (5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(ピペリジン-1-イル)メタノン；
- ・ (5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- 7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

7-フェニル-5-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・(5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・(5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・5-ナフタレン-1-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・[7-(4-エトキシ-フェニル)-5-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(7-フェニル-5-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・(5-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(6-ブロモ-3-クロロ-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・モルホリン-4-イル-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・(6-ブロモ-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(6-ブロモ-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・(3,6-ジブロモ-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・(3-ブロモ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(3-ブロモ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・(3,6-ジブロモ-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(5-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・[5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチル-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド；
- ・[3-クロロ-5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・[5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・(4-ベンゾイル-ピペラジン-1-イル)-[3-クロロ-5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・4-(5-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル；
- ・(5-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(6,7-ジメトキシ-1-メチル-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・[4-(フラン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・(3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・[5-(4-ブromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・[3-クロロ-5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・アゼパン-1-イル-[3-クロロ-5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・[3-クロロ-5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・[5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-

(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ピシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

・ [4-(2-クロロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (4-メチル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・ [5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；

・ (3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；

・ [4-(フラン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・ [5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；

・ (4-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・ [4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ [4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ [3-ブromo-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ [4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (4-ベンゾイル-ピペラジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ (2-エチル-ピペリジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ (4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；

・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；

・ (3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

- 2-イル)-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・(3-ブromo-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・(7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・アゼパン-1-イル-(3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・アゼパン-1-イル-[3-ブromo-5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・3-ブromo-5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-[4-メチル-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；
- ・[5-(4-エトキシ-フェニル)-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・モルホリン-4-イル-[5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-(5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；
- ・[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；
- ・5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；
- ・5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチル-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-アミド；
- ・3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミ

ジン-2-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・(2,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸メチル-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-アミド；

・5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・(2,4-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・(3-ブromo-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；

・[5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；

・(3-クロロ-5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(ヘキサヒドロ-ピローロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；

・(3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；

・(7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・[3-ブromo-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・(3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

・アゼパン-1-イル-(3-クロロ-5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・(4-ベンゾイル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-ブromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・アゼパン-1-イル-[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・[3-ブromo-5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジ

ン-2-イル]-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ [5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ (3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ (4-ベンゾイル-ピペラジン-1-イル)-(3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ [5-(4-エトキシ-フェニル)-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ [5-(4-エトキシ-フェニル)-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ アゼパン-1-イル-(3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(3-ブromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ アゼパン-1-イル-[5-(4-ブromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

・ (3-クロロ-5-チオフェン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；

・ (5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ アゼパン-1-イル-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ アゼパン-1-イル-(5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ [3-ブromo-5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；

・ [5-(4-ブromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ (5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ (5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ (5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・ [3-ブromo-5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ アゼパン-1-イル-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ (2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-[7-(4-エトキシ-フェニル)-5-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ (3,6-ジブromo-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ (3-bromo-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・ [5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-[5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・ [5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ [5-(4-bromo-フェニル)-3-クロロ-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(3-クロロ-5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ [3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ (3-クロロ-5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (3-クロロ-5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [3-クロロ-5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ [4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ (4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ モルホリン-4-イル-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；
- ・ [5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル

] -モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-クロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ [5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・ [5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ アゼパン-1-イル-[5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；

- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；

- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-ニトロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ [3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・ [3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

- ・ 3-クロロ-5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・ [3-クロロ-5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

- ・ (3-クロロ-5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；

- ・ アゼパン-1-イル-(3-クロロ-5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・ アゼパン-1-イル-[3-クロロ-5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン；

- ・ [5-(3,4-ジクロロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

- ・ 5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；

- ・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

- ・ モルホリン-4-イル-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・ モルホリン-4-イル-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・ ピペリジン-1-イル-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-メタノン；

- ・ [3-ブromo-5-(4-ブromo-チオフエン-2-イル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・ (3-ブromo-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

- ・ (3-クロロ-5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

- ・ (7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン;
- ・ (7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン;
- ・ 7-メチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-カルボン酸ベンジル-メチルアミド;
- ・ (2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン;
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン;
- ・ [5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-[4-メチル-ピペラジン-1-イル]-メタノン;
- ・ [5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-[4-フェニル-ピペラジン-1-イル]-メタノン;
- ・ (2-エチル-ピペリジン-1-イル)-[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル]-メタノン;
- ・ (5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン;
- ・ (5-メチル-7-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン;
- ・ (5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン;
- ・ (4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル-メタノン;
- ・ ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミド;
- ・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-[3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル]-メタノン;
- ・ (5,7-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-[4-(4-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン;
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-フルオロ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;
- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン;
- ・ アゼパン-1-イル-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;
- ・ (5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン;
- ・ アゼパン-1-イル-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;
- ・ 4-(5,7-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニル)-ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル;
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(5,7-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;
- ・ [4-(3-クロロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-[5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;
- ・ (4-メチル-ピペリジン-1-イル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル-メタノン;
- ・ [4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル-メタノン;
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;
- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]

ル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；

・(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5,7-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・(5,7-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・アゼパン-1-イル-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-[4-メチル-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-[4-メチル-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・(ヘキサヒドロ-ピロ-ロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(ヘキサヒドロ-ピロ-ロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；

・[5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(ヘキサヒドロ-ピロ-ロ[1,2-a]ピラジン-2-イル)-メタノン；

・1-[5-(3-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニル]-ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル；

・4-[5-(3-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニル]-ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル；

・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(3-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；

・[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-[5-(3-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；

・5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；

・5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸メチル-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-アミド；

・[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(2-エチル-イミダゾール-1-イル)-メタノン；

・[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン；

・1-[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニル]-1H-インドール-3-カルボン酸メチルエステル；

・[4-(4-クロロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；

・[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(1-エチル-5-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；
- ・1-(7-ジフルオロメチル-5-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニル)-ピペリジン-4-カルボン酸アミド；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-エチル-イミダゾール-1-イル)-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-[4-(フラン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；
- ・[7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・アゼパン-1-イル-(7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；
- ・7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸メチル-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-アミド；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-エチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸メチル-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-アミド；
- ・(7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-[4-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・7-ジフルオロメチル-5-p-トリル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；
- ・7-ジフルオロメチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-メチルアミド；
- ・7-ジフルオロメチル-5-フェニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸メチル-(4-ピラゾール-1-イル-ベンジル)-アミド；
- ・アゼパン-1-イル-(5-シクロプロピル-7-ジフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；
- ・(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；
- ・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン；
- ・5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；
- ・(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-チオモルホリン-4-イル-メタノン ;
- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン ;
- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-(5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン ;
- ・ 5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド ;
- ・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン ;
- ・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン ;
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン ;
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-メタノン ;
- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ (5,7-ジフェニル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン ;
- ・ [5-(4-ブromo-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン ;
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン ;
- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン ;
- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン ;
- ・ (5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン ;
- ・ モルホリン-4-イル-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラ

ゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (4-メチル-ピペラジン-1-イル)-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ アゼパン-1-イル-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン;

- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン;

- ・ ピペリジン-1-イル-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;

- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン;

- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン;

- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-チオモルホリン-4-イル-メタノン;

- ・ [4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;

- ・ (4-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;

- ・ (5-フラン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン;

- ・ (4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;

- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-モルホリン-4-イル-メタノン;

- ・ ピペリジン-1-イル-[7-トリフルオロメチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-(5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン;

- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ 5-チオフエン-2-イル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド;

- ・ [5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピロリジン-1-イル-メタノン;

- ・ [5-(4-クロロ-フェニル)-2-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン;

- ・ アゼパン-1-イル-[5-(4-クロロ-フェニル)-2-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン-3-イル]-メタノン;

- ・ [5-(4-クロロ-フェニル)-2-メチル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ [1,5-a]ピリミジ

ン-3-イル]-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・モルホリン-4-イル-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5-p-トリル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；

・5-(4-メトキシ-フェニル)-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；

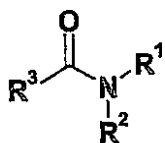
・(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン；および

・モルホリン-4-イル-(5-フェニル-7-トリフルオロメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-メタノン。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の組合せであって、前記 11β-HSD1 阻害剤が次式 (II) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化 2】



式(II)

ここで、

R^1 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} het シクロアルキル、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、または het アリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのシクロアルキル、het シクロアルキル、アルキル、アリールアルキルおよび het アリールアルキル基は独立して 1 以上の R^4 で任意に置換され；

R^2 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル-カルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリールおよびシクロアルキル基は独立して 1 以上の R^5 で任意に置換されるか；または

R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、het アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、het アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、het アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、het アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシまたはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立して 1 以上の R^{14} で任意に置換され；

R^3 は、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルケニル、 C_1 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} het シクロアルキル、アリール、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、het アリール C_1 - C_6 アルキル、アリール- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、het アリール- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、またはアリール C_1 - C_6 アルキル- R^6 - C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、het シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール および het アリール基は独立して 1 以上の R^7 で任意に置換され；

R^4 および R^5 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、ハロ、メチレンジオキシ、 NR^8R^9 、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメチルオキ

シ、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} hetシクロアルキル、 C_3-C_{10} シクロアルケニル、アリール、hetアリール、hetアリール SO_n 、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキル- R^6 - C_1-C_6 アルキル、アリール C_1-C_6 アルキル- R^6 - C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリールカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキル-カルボニル、 C_1-C_6 アルキル SO_n 、 C_1-C_6 アルキル-カルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上の R^{15} で任意に置換され；

R^6 は、酸素、硫黄、 SO_n または NR^{16} であり；

R^7 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $COOR^{17}$ 、 C_1-C_8 アルキル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} het-シクロアルキル、メチレンジオキソ、トリハロメチル、トリハロメチルオキシ、アリール、アリール C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、アリールオキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ C_1-C_6 アルキル、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリール、hetアリール C_1-C_6 アルキル、hetアリールオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリールオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル-オキシ C_1-C_6 アルキル、 NR^8R^9 、 $SO_2NR^8R^9$ 、 NR^4R^5 カルボニル C_1-C_6 アルキル、アリールチオ、hetアリールチオ、 R^{18} カルボニル NR^8 、アリール SO_n 、hetアリール SO_n 、 $R^{19}SO_nNR^8$ 、アリールチオ C_1-C_6 アルキル、hetアリールチオ C_1-C_6 アルキル、またはアリール C_1-C_6 アルキル $R^6C_1-C_6$ アルキルであり；ここでのアリールおよびhetアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、 C_1-C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール およびhetアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換され；または

R^8 および R^9 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は、ハロ、シアノ、 C_1-C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1-C_6 アルキルオキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキル-カルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、 $NR^{12}R^{13}$ 、メチレンジオキソ、トリハロメチル、トリハロメチルオキシであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1-C_8 アルキル or アリール C_1-C_6 アルキルであり；

R^{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、シアノ、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、またはアリールオキシであり；

R^{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、シアノ、 $CONR^8R^9$ または $COOR^{17}$ であり；

R^{16} は、水素、 C_1-C_8 アルキル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} hetシクロアルキル、アリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール、hetアリール C_1-C_6 アルキル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリールオキシ C_1-C_6 アルキル、アリールチオ C_1-C_6 アルキル、またはhetアリールチオ C_1-C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール およびhetアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^{17} は、水素、 C_1-C_8 アルキル、アリール、またはアリール C_1-C_6 アルキルであり；

R^{18} は、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、アリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetア

リール、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、hetアリールオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、または $R^8R^9NC_1$ - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール および hetアリール基は R^{15} で任意に置換され；

R^{19} は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、hetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

mは、1または2であり；

nは、0、1または2である。

【請求項7】

請求項6に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤は前記式(II)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

但し、前記式(II)において、

R^1 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのシクロアルキル、hetシクロアルキル、アルキル、アリールアルキル および hetアリールアルキル基は独立に1以上の R^4 で任意に置換され；

R^2 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリールおよびシクロアルキル基は独立に1以上の R^5 で任意に置換されるか；または

R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{14} で任意に置換され；

R^3 は、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルケニル、 C_1 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、アリール- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、hetアリール- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、またはアリール C_1 - C_6 アルキル- R^6 - C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール および hetアリール基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^4 および R^5 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、ハロ、メチレンジオキシ、 NR^8R^9 、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメチルオキシ、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルケニル、アリール、hetアリール、hetアリール SO_n 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキル- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル- R^6 - C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリールカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、 C_1 - C_6 アルキル SO_n 、 C_1 - C_6 アルキル-カルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール および hetアリール基は独立に1以上の R^{15} で任意に置換され；

R^6 は、酸素、硫黄、 SO_m 、 NR^{16} であり；

R^7 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $COOR^{17}$ 、 C_1-C_8 アルキル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} het-シクロアルキル、メチレンジオキシ、トリハロメチル、トリハロメチルオキシ、アリール、アリール C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、アリールオキシ、アリールオキシ C_1-C_6 アルキル、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリール、hetアリール C_1-C_6 アルキル、hetアリールオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリールオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル-オキシ C_1-C_6 アルキル、 NR^8R^9 、 $SO_2NR^8R^9$ 、 NR^4R^5 カルボニルアルキル、アリールカルボニル NR^8 、アリールチオ、hetアリールチオ、アリール SO_m 、hetアリール SO_m 、アリール SO_mNR^8 、アリールチオ C_1-C_6 アルキル、hetアリールチオ C_1-C_6 アルキル、またはアリール C_1-C_6 アルキル $R^6C_1-C_6$ アルキルであり；ここでのアリールおよびhetアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、 C_1-C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール およびhetアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^8 および R^9 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1-C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール C_1-C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ、アリール C_1-C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1-C_6 アルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルオキシ C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1-C_6 アルキル-カルボキシ、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキシ、ハロ、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、 $NR^{12}R^{13}$ 、メチレンジオキシ、トリハロメチル、またはトリハロメチルオキシであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1-C_8 アルキル、またはアリール C_1-C_6 アルキルであり；

R^{14} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキシ、ニトロ、シアノ、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_6 アルキルオキシ、またはアリールオキシであり；

R^{15} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキシ、ニトロ、シアノ、または $COOR^{17}$ であり；

R^{16} は、水素、 C_1-C_8 アルキル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_3-C_{10} hetシクロアルキル、アリール、アリール C_1-C_6 アルキル、hetアリール、hetアリール C_1-C_6 アルキル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1-C_6 アルキルカルボニル、アリールオキシ C_1-C_6 アルキル、hetアリールオキシ C_1-C_6 アルキル、アリールチオ C_1-C_6 アルキル、またはhetアリールチオ C_1-C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^{17} は、水素、 C_1-C_8 アルキル、アリール、またはアリール C_1-C_6 アルキルであり；

mは、1または2であり；

nは、0、1または2である。

【請求項8】

請求項6または7に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

・3-(10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-1-[4-(1H-イミダゾール-4-イル)-ピペリジン-1-イル]-プロパン-1-オン；

・4-(10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-1-[4-(3H-イミダゾール-4-イル

-)-ピペリジン-1-イル]-ブタン-1-オン；
- ・ 2,4-Bis-ベンジルオキシ-ベンズアミド；
 - ・ (1H-インドール-4-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
 - ・ N-(1,4-ジオキソ-1,4-ジヒドロ-ナフタレン-2-イル)-ベンズアミド；
 - ・ N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-2-(2-フェニル-アダマンタン-2-イル)-アセタミド；
 - ・ (6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-フェニル-メタノン；
 - ・ (2-クロロ-フェニル)-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
 - ・ 3-シクロペンチル-1-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-プロパン-1-オン；
 - ・ (3-クロロ-チエノ[2,3-b]チオフェン-2-イル)-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
 - ・ 2-[2-(4-クロロ-フェニル)-アダマンタン-2-イル]-1-[4-(4-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-エタノン；
 - ・ 1-(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-2-[2-(4-クロロ-フェニル)-アダマンタン-2-イル]-エタノン；
 - ・ 2-[2-(4-クロロ-フェニル)-アダマンタン-2-イル]-1-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-エタノン；
 - ・ 1-[4-(6-クロロ-ピリジン-2-イル)-ピペラジン-1-イル]-2-(2-フェニル-アダマンタン-2-イル)-エタノン；
 - ・ 4-クロロ-N-(1,7,7-トリメチル-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)-ベンズアミド；
 - ・ 3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸(2-シアノ-エチル)-シクロヘキシルアミド；
 - ・ 2-[2-(ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-イルアミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-チアゾール-5-イル]-N-(2-クロロ-フェニル)-アセタミド；
 - ・ [3-(4-sec-ブチル-フェノキシ)-フェニル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
 - ・ 3-(6-クロロ-ピリジン-2-イルオキシ)-N-エチル-ベンズアミド；
 - ・ N-ベンジル-2,4-ジクロロ-N-ピリジン-2-イル-ベンズアミド；
 - ・ 2-[ベンゾイル-(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)-アミノ]-プロピオン酸ブチルエステル；
 - ・ 2-[ベンゾイル-(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)-アミノ]-プロピオン酸ペンチルエステル；
 - ・ 3-(4-フルオロ-フェニル)-1-(4-フェニル-ピペリジン-1-イル)-ブタ-2-エン1-オン；
 - ・ N-(1,7,7-トリメチル-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)-ベンズアミド；
 - ・ 1-(3-シクロペンチル-プロピオニル)-ピペリジン-3-カルボン酸エチルエステル；
 - ・ 4-フェニル-1-フェニルアセチル-ピペリジン-4-カルボニトリル；
 - ・ 1-オクタノイル-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボニトリル；
 - ・ 2,2-ジメチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-プロパン-1-オン；
 - ・ (4-クロロ-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
 - ・ N-[1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エチル]-N-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-ベンズアミド；
 - ・ 2-(2-アミノ-フェニルスルファニル)-1-(5-フルオロ-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル)-エタノン；
 - ・ N-(1-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イルメチル)-N-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-ベンズアミド；
 - ・ 1-ベンゾイル-ピペリジン-2-カルボン酸エチルエステル；
 - ・ N-(2-クロロ-フェニル)-2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-1-イル)-アセタミド；
 - ・ (デカヒドロ-ナフタレン-1-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

- ・ (4-メチル-ピペラジン-1-イル)-(2-p-トリルスルファニル-フェニル)-メタノン；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 (3-ベンジルオキシ-2-エチル-6-メチル-ピリジン-4-イル)-アミド；
- ・ (6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-メタノン；
- ・ N-ビシクロ [2.2.1]ヘプタ-2-イル-3-シクロペンチル-プロピオンアミド；
- ・ (2-ベンゾ [1,2,5]オキサジアゾール-5-イル-チアゾール-4-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸 [4-(4-フルオロ-フェニル)-4-ヒドロキシ-ブチル]-イソプロピル-アミド；
- ・ N-シクロヘキシル-3-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-プロピオンアミド；
- ・ 2-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-3-(1H-インドール-3-イル)-プロピオン酸メチルエステル；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 [3-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル)-5-ニトロ-フェニル]-アミド；
- ・ N-ベンジル-N-(1-シクロプロピル-エチル)-4-フルオロ-ベンズアミド；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸 2-[2-(2-フェニル-アダマンタン-2-イル)-アセチルアミノ]-エチルエステル；
- ・ N-(4-アセチル-フェニル)-2-(2-フェニル-アダマンタン-2-イル)-アセタミド；
- ・ 2-[2-(4-クロロ-フェニル)-アダマンタン-2-イル]-N-(2-ヒドロキシ-エチル)-アセタミド；
- ・ (4-ベンゾイル-ピペリジン-1-イル)-チオフェン-2-イル-メタノン；
- ・ N-(2-ベンゾイル-4-メチル-フェニル)-3-フェニル-アクリルアミド；
- ・ N-(2-ベンゾイル-4-メチル-フェニル)-2-フルオロ-ベンズアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 (4-エトキシ-ベンゾチアゾール-2-イル)-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 (5-ベンゾイル-4-フェニル-チアゾール-2-イル)-アミド；
- ；
- ・ 3-(2-ヒドロキシ-フェニル)-1,3-ジ-ピペリジン-1-イル-プロパン-1-オン；
- ・ N-(1-メチル-2-フェニル-エチル)-3-フェニル-プロピオンアミド；
- ・ 4-オキソ-4-ピペリジン-1-イル-酪酸 4-tert-ブチル-シクロヘキシルエステル；
- ・ N-tert-ブチル-N-(4-メトキシ-ベンジル)-4-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ {4-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-フェノキシ}-酢酸；
- ・ 2-(4-イソブチル-フェニル)-N-(1-フェニル-エチル)-プロピオンアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 4-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-2,6-ジメチル-ピリジン-3-イルエステル；
- ・ 2-フェニル-1-(3-フェニル-ピロリジン-1-イル)-エタノン；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸 4-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-2-エチル-6-メチル-ピリジン-3-イルエステル；
- ・ N-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イルメチル)-N-(4-ヒドロキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ ビフェニル-4-イル-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-(3,5-ジクロロ-フェニル)-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-ビフェニル-4-イル-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-(4-クロロ-フェニル)-メタノン；
- ・ 3-ヘプチルカルバモイル-ビシクロ [2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-カルボン酸；
- ・ アダマンタン-1-イル-アゼパン-1-イル-メタノン；
- ・ N,N-ジベンジル-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-N-イソプロピル-4-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ N-[2-(1H-インドール-3-イル)-1-メチル-エチル]-2-(4-イソブチル-フェニル)-プロ

ピオンアミド；

- ・ N-tert-ブチル-2-(4-イソブチル-フェニル)-プロピオンアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2-アセチル-フェニル)-アミド；
- ・ N-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イルメチル)-N-(4-フルオロ-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ (オクタヒドロ-キノリン-1-イル)-フェニル-メタノン；
- ・ (7-ヒドロキシ-オクタヒドロ-キノリン-1-イル)-フェニル-メタノン；
- ・ N-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イルメチル)-N-p-トリル-ベンズアミド；
- ・ N,N-ジベンジル-4-メチル-ベンズアミド；
- ・ (2-クロロ-フェニル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [4-ブromo-3-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 2-クロロ-N-(3,4-ジメチル-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ 1-アゼパン-1-イル-2-(3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-イソキノリン-1-イリデン)-エタノン；
- ・ N-シクロヘキシル-4-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-ブチルアミド；
- ・ N-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-2-クロロ-ベンズアミド；
- ・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-(2-クロロ-フェニル)-メタノン；
- ・ 2-(ベンゾチアゾール-2-イルスルファニル)-N-シクロヘキシル-アセタミド；
- ・ シクロヘキサカルボン酸(7,7-ジメチル-5-オキソ-5,6,7,8-テトラヒドロ-キナゾリン-2-イル)-アミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-エチル-N-o-トリル-ベンズアミド；
- ・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-(4-フルオロ-フェニル)-メタノン；
- ・ N-シクロヘキシル-4-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-N-メチル-ブチルアミド；
- ・ 3-[2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エチル]-アダマンタン-1-カルボン酸；
- ・ モルホリン-4-イル-(3-p-トリル-アダマンタン-1-イル)-メタノン；
- ・ N-ベンジル-2,4-ジクロロ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸ジベンジルアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-(2-ブromo-フェニル)-メタノン；
- ・ (3,4-ジクロロ-フェニル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ N,N-ジベンジル-3,4-ジクロロ-ベンズアミド；
- ・ 4-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-1-ピペリジン-1-イル-ブタン-1-オン；
- ・ N,N-ジベンジル-2-フルオロ-ベンズアミド；
- ・ (2-クロロ-フェニル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 2-クロロ-N-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-N-エチル-2-フェニル-アセタミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-p-トリル-メタノン；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸ベンジル-エチル-アミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-ジベンジルアミノ-アセタミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-フェニル-プロピオンアミド；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸シクロヘプチルアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-3-ジエチルスルファモイル-4-メチル-ベンズアミド；
- ・ 4-ベンゾイル-N-メチル-N-フェニル-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-2-ブromo-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2-クロロ-N-メチル-N-フェニル-ベンズアミド；
- ・ 4-クロロ-N-エチル-N-o-トリル-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-4,N-ジメチル-ベンズアミド；
- ・ 2-(4-クロロ-3,5-ジメチル-フェノキシ)-N-シクロヘキシル-N-メチル-アセタミド；

- ・ N-ベンジル-2-ブロモ-N-イソプロピル-ベンズアミド；
- ・ 3-(2-クロロ-フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-アクリルアミド；
- ・ N-フェニル-N-(2,2,5-トリメチル-ヘキサ-4-エニル)-アセタミド；
- ・ N-m-トリル-N-(2,2,5-トリメチル-ヘキサ-4-エニル)-アセタミド；
- ・ (3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(5-メチル-ピリジン-2-イル)-アミド；
- ・ 3-ブロモ-N-[2-メチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ブチル]-ベンズアミド；
- ・ 4-クロロ-N-[2-メチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ブチル]-ベンズアミド；
- ・ 4-メチル-N-[2-メチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ブチル]-ベンズアミド；
- ・ シクロヘキサカルボン酸[2-メチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ブチル]-アミド；
- ・ 3-シクロペンチル-N-[2-メチル-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ブチル]-プロピオンアミド；
- ・ 2-クロロ-N-[2-(4-エチル-ベンゾイルアミノ)-エチル]-N-(4-フルオロ-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ N-{1-ベンジル-2-[4-(3-シクロペンチル-プロピオニル)-ピペラジン-1-イル]-2-オキソ-エチル}-3-シクロペンチル-プロピオンアミド；
- ・ N-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-イルメチル-3-シクロペンチル-N-[2-(1H-インドール-3-イル)-エチル]-プロピオンアミド；
- ・ N-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-イルメチル-2,4-ジクロロ-N-[2-(1H-インドール-3-イル)-エチル]-ベンズアミド；
- ・ ナフタレン-2-カルボン酸(2-オキソ-アゼパン-3-イル)-チオフェン-3-イルメチルアミド；
- ・ 3,4,5-トリメトキシ-N-(4-メチル-ベンジル)-N-[6-(ピリジン-2-イルアミノ)-ヘキシル]-ベンズアミド；
- ・ 3-シクロペンチル-N-(4-メチル-ベンジル)-N-[6-(ピリジン-2-イルアミノ)-ヘキシル]-プロピオンアミド；
- ・ N-(3,4-ジメトキシ-ベンジル)-3-メトキシ-N-[6-(ピリジン-2-イルアミノ)-ヘキシル]-ベンズアミド；
- ・ N,N-ジメチル-2-[3-(4-ニトロ-フェニル)-アダマンタン-1-イル]-アセタミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸[4-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-ブチル]-p-トリル-アミド；
- ・ 2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-メチル-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-ブチルアミド；
- ・ 2-(4-クロロ-2-メチル-フェノキシ)-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-プロピオンアミド；
- ・ 4-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-1-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-ブタン-1-オン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[3-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-メタノン；
- ・ 酢酸4-(アゼパン-1-カルボニル)-フェニルエステル；
- ・ N-アダマンタン-1-イルメチル-ベンズアミド；
- ・ [3-(4-ニトロ-フェニル)-アダマンタン-1-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-(1,1-ジメチル-ヘキシル)-2-モルホリン-4-イル-アセタミド；
- ・ アダマンチル-1-カルボン酸(2-メトキシ-エチル)-アミド；
- ・ N-(4-アダマンタン-1-イル-2-メチル-フェニル)-アセタミド；

- ・ 3-p-トリル-アダマンタン-1-カルボン酸(2,5-ジクロロ-フェニル)-アミド；
- ・ (3-クロロ-アダマンタン-1-イル)-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 2-アミノ-5-シクロヘキシルカルバモイル-4-メチル-チオフエン-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ N-(2-クロロ-フェニル)-2-{3-[(2-クロロ-フェニルカルバモイル)-メチル]-アダマンタン-1-イル}-アセタミド；
- ・ 3-p-トリル-アダマンタン-1-カルボン酸(2,4-ジフルオロ-フェニル)-アミド；
- ・ アダマンチル-1-カルボン酸tert-ブチルアミド；
- ・ 2-アダマンタン-1-イル-N-tert-ブチル-アセタミド；
- ・ N-メチル-N-フェニル-4-(ピロリジン-1-スルホニル)-ベンズアミド；
- ・ N-(1-アダマンタン-1-イル-エチル)-2-フルオロ-ベンズアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸[2-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸ジメチルアミド；
- ・ N-ベンジル-4-クロロ-N-(1-シクロプロピル-ビニル)-ベンズアミド；
- ・ 3,5-ジメチル-アダマンタン-1-カルボン酸ベンジルアミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-シクロヘキシル-N-(2-ヒドロキシ-エチル)-ベンズアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2,4-ジクロロ-N-エチル-ベンズアミド；
- ・ 2-[(3-p-トリル-アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-プロピオン酸メチルエステル；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-3-モルホリン-4-イル-プロピオンアミド；
- ・ 3-p-トリル-アダマンタン-1-カルボン酸イソプロピルアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-ベンジルアミノ-アセタミド；
- ・ N-ベンジル-2,4-ジクロロ-N-(1-シクロプロピル-エチル)-5-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-安息香酸エチルエステル；
- ・ N-ベンジル-N-イソプロピル-4-メチル-3-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(2-フルオロ-フェニル)-メタノン；
- ・ N-エチル-2-フルオロ-N-フェニル-ベンズアミド；
- ・ 2-フェネチル-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ 1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-o-トリルオキシ-エタノン；
- ・ 2-(1-ベンジル-1H-イミダゾール-2-イルスルファニル)-N-シクロヘキシル-アセタミド；
- ・ シクロヘキサンカルボン酸(2-プロポキシ-フェニル)-アミド；
- ・ 2-{3-[4-(2-クロロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-3-オキソ-プロピル}-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ N-シクロペンチル-2-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-プロピオンアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2-トリフルオロメチル-フェニル)-アミド；
- ・ (4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 4-(2-エチル-フェニル)-4-アザ-トリシクロ[5.2.2.0^{2,6}]ウンデカ-8-エン-3,5-ジオン；
- ・ 2-フェニル-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-ブチルアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-4-クロロ-2-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ 3-p-トリル-アダマンタン-1-カルボン酸(2,3-ジメチル-フェニル)-アミド；
- ・ N-ベンジル-3-メチル-4-p-トリル-ブチルアミド；
- ・ N-(2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-プロピオンアミド；
- ・ (4-tert-ブチル-フェニル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・ 2-[1-(4-クロロ-ベンゼンスルホニル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル]-N-チオフエン-2-イルメチル-アセタミド；
- ・ 2-フェノキシ-1-[4-(2-トリフルオロメチル-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-エタノン；

- ・シクロヘキサノカルボン酸[5-(2-フルオロ-ベンジルスルファニルメチル)-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル]-アミド；
- ・4-メチル-2-フェニル-チアジアゾール-5-カルボン酸ナフタレン-1-イルアミド；
- ・4-フルオロ-N-[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・(3-メトキシ-フェニル)-(4-0-トリル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・N-アダマンタン-1-イル-3-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-プロピオンアミド；
- ・N-シクロオクチル-2-メトキシ-3-メチル-ベンズアミド；
- ・2-[4-(2,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・(2,3-ジフェニル-キノキサリン-6-イル)-(2,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-(1,3,4,5-テトラヒドロ-ピリド[4,3-b]インドール-2-イル)-メタノン；
- ・N-{4-[1-(ナフタレン-2-スルホニル)-ピペリジン-3-イル]-ブチル}-N'-p-トリル-オキサリルアミド；
- ・N-ベンジル-N-(2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル)-ベンゼンスルホンアミド；
- ・(4-アミノ-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・1-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-2-(2-イソプロピル-5-メチル-フェノキシ)-エタノン；
- ・アダマンタン-1-カルボン酸ベンジル-ピリジン-2-イル-アミド；
- ・アダマンタン-1-イル-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-0-トリル-メタノン；
- ・アダマンチル-1-カルボン酸ベンジルアミド；
- ・ピリジン-2-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；
- ・(3-クロロ-アダマンタン-1-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・2-[3-(アゼパン-1-カルボニル)-フェニル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・2-[3-(ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・4-(ベンジル-メタンスルホニル-アミノ)-N-フラン-2-イルメチル-ベンズアミド；
- ・(4-ニトロ-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・1-シクロヘキシル-5-オキソ-ピロリジン-3-カルボン酸(4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-アミド；
- ・N-(2-クロロ-フェニル)-2-(2-オキソ-2-フェニル-エチルスルファニル)-アセタミド；
- ・3-(4-ヒドロキシ-フェニル)-N-イソクロマン-1-イルメチル-3-フェニル-プロピオンアミド；
- ・(4-エトキシ-フェニル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・1-シクロヘキシル-5-オキソ-ピロリジン-3-カルボン酸(3-クロロ-フェニル)-アミド；
- ・N-[4-(ベンジル-イソプロピル-スルファモイル)-フェニル]-アセタミド；
- ・N-(3,4-ジメチル-フェニル)-N-[4-(ピペリジン-1-カルボニル)-ベンジル]-メタンスルホンアミド；
- ・2-(5-フェニル-1H-イミダゾール-2-イルスルファニル)-N-(1,1,3,3-テトラメチル-ブチル)-アセタミド；
- ・2-(ベンゾチアジアゾール-2-イルスルファニル)-N-(1,1,3,3-テトラメチル-ブチル)-アセ

タミド；

・ 2-(ベンゾオキサゾール-2-イルスルファニル)-N-(1,1,3,3-テトラメチル-ブチル)-アセタミド；

・ 2-(ナフタレン-2-イルカルバモイルメチルスルファニル)-N-(1,1,3,3-テトラメチル-ブチル)-アセタミド；

・ 酢酸 4-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-カルボニル)-フェニルエステル；

・ (4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・ [1-(4-クロロ-ベンゼンスルホニル)-ピペリジン-3-イル]-(オクタヒドロ-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ 2,4-ジクロロ-N-シクロヘキシル-N-(2-ヒドロキシ-エチル)-ベンズアミド；

・ (4-フルオロ-フェニル)-(3,4,4a,8a-テトラヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ N-アダマンタン-1-イル-2-エトキシ-アセタミド；

・ 2-(2-オキソ-2-フェノチアジン-10-イル-エチル)-ヘキサヒドロ-イソインドール-1,3-ジオン；

・ アダマンタン-1-カルボン酸(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミド；

・ 2-ブromo-N-シクロヘプチル-ベンズアミド；

・ ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-[4-(2-エトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；

・ N-フラン-2-イルメチル-2-フェニル-2-フェニルスルファニル-アセタミド；

・ アダマンタン-1-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；

・ 1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-3-(4-フルオロ-フェニル)-プロペノン；

・ アダマンタン-1-イル-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

・ 4-メチル-N-ホモアダマンチル-3-イル-ベンズアミド；

・ (3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(3-メチル-4-ニトロ-フェニル)-メタノン；

・ キノリン-2-カルボン酸シクロオクチルアミド；

・ アダマンタン-1-カルボン酸[2-(2,4-ジメトキシ-フェニル)-エチル]-アミド；

・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-o-トリル-メタノン；

・ (3,6-ジクロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；

・ 3-(1-ベンジル-1H-イミダゾール-2-イルスルファニル)-N-シクロヘキシル-プロピオンアミド；

・ プロピオン酸 2-アミノ-4-メチル-5-p-トリルカルバモイル-チオフェン-3-イルエステル；

・ 2-シクロヘキシル-N-(2,6-ジメチル-フェニル)-N-フラン-2-イルメチル-アセタミド；

・ (3-メトキシ-フェニル)-(2,2,4-トリメチル-4-フェニル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；

・ 1-[4-(2,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-ピロリジン-2,5-ジオン；

・ 1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-(1-ナフタレン-1-イル-1H-テトラゾール-5-イルスルファニル)-エタノン；

・ [4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-o-トリル-メタノン；

・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-メタノン；

・ N-(2-シアノ-フェニル)-2-(9-エチル-9H-1,3,4,9-テトラアザ-フルオレン-2-イルスルファニル)-アセタミド；

・ N-(2-シアノ-フェニル)-2-(9-メチル-9H-1,3,4,9-テトラアザ-フルオレン-2-イルスルファニル)-アセタミド；

・ 1-(チオフェン-2-カルボニル)-2,3-ジヒドロ-1H-キノリン-4-オン；

・ (3-クロロ-6-ニトロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；

・ (4-ブromo-フェニル)-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・ 2-モルホリン-4-イル-N-(1-フェニル-シクロペンチルメチル)-アセタミド；
- ・ 9-オキソ-9H-フルオレン-1-カルボン酸(3-メチル-ブチル)-アミド；
- ・ [4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メ
タノン；
- ・ N-シクロヘブチル-3-ジエチルスルファモイル-ベンズアミド；
- ・ (4-メトキシ-フェニル)-(3-フェニル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 3-アミノ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-エチル-3,4-ジメチル-N-フェニル-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-3,4,N-トリメチル-ベンズアミド；
- ・ (4-フルオロ-フェニル)-(3-フェニル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(3-メトキシ-フェニル)-メタノン
；
- ・ フラン-2-カルボン酸[4-(4-メチル-ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-アミド；
- ・ N-(2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-2-o-トリルオキシ-アセタミド；
- ・ 5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸(1-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-
イル-エチル)-アミド；
- ・ 3-(2-クロロ-フェニル)-1-[4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-プロペ
ノン；
- ・ N-[3-(アゼパン-1-カルボニル)-フェニル]-ベンズアミド；
- ・ [3-(ピペリジン-1-カルボニル)-ピラゾール-1-イル]-o-トリル-メタノン；
- ・ N-(1-フェニル-シクロペンチルメチル)-2-ピペリジン-1-イル-プロピオンアミド；
- ・ 2-モルホリン-4-イル-N-(1-フェニル-シクロペンチルメチル)-プロピオンアミド；
- ・ N-[4-(アゼパン-1-スルホニル)-フェニル]-2,2,2-トリフルオロ-アセタミド；
- ・ 2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-6-カルボン酸(1-アダマンタン-1-イル-エチル
)-アミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(3-メトキシ-フェノキシ)-アセタミド；
- ・ 3-クロロ-ベンゾ[b]チオフエン-2-カルボン酸(2-シアノ-エチル)-フェニル-アミド；
- ・ [4-(4-ニトロ-ベンジル)-ピペリジン-1-イル]-フェニル-メタノン；
- ・ [4-(2-ニトロ-ベンジル)-ピペリジン-1-イル]-フェニル-メタノン；
- ・ 3-[5-(4-フルオロ-フェニル)-フラン-2-イル]-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビスク
ロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-プロペノン；
- ・ 2-(3-フルオロ-ベンゾイルアミノ)-4-メチル-5-(ピペリジン-1-カルボニル)-チオフ
エン-3-カルボン酸メチルエステル；
- ・ N-(2-エチル-フェニル)-2-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-アセタミド；
- ・ 2-(2-メトキシ-ベンゾイルアミノ)-4-メチル-5-(ピペリジン-1-カルボニル)-チオフ
エン-3-カルボン酸メチルエステル；
- ・ 1-フェニル-シクロペンタンカルボン酸(4-フェニル-テトラヒドロ-ピラン-4-イルメ
チル)-アミド；
- ・ 4-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-1-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-ブタン-1-オン；
- ・ ナフタレン-1-カルボン酸シクロヘブチルアミド；
- ・ N-インダン-5-イル-2-メチル-3-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-3-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシメチル)-ベンズアミド；
- ・ 2-メトキシ-N-(1-フェニル-シクロペンチルメチル)-ベンズアミド；
- ・ [5-(2,5-ジクロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(2,6-ジメチル-モルホリン-4
-イル)-メタノン；
- ・ [5-(2-プロモ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-
メタノン；
- ・ 5-(2-メトキシ-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸シクロヘブチルアミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-[1-(2-ニトロ-ベンゼンスルホニル)-ピペ
リジン-3-イル]-メタノン；

- ・ N-シクロオクチル-2-(4-メトキシ-フェノキシ)-アセタミド；
- ・ N-(2,3-ジメチル-フェニル)-4-[メチル-(トルエン-4-スルホニル)-アミノ]-ブチルアミド；
- ・ N-フェニル-N-[4-(ピペリジン-1-カルボニル)-ベンジル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ N-[4-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボニル)-ベンジル]-N-(3,4-ジメチル-フェニル)-メタンスルホンアミド；
- ・ 2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-2-カルボン酸ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イルアミド；
- ・ 4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-3-カルボン酸シクロヘプチルアミド；
- ・ N-(2-アゼパン-1-イル-2-オキソ-エチル)-N-ベンジル-4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 1-(2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル)-3,3-ジフェニル-プロパン-1-オン；
- ・ N-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-4-モルホリン-4-イルメチル-ベンズアミド；
- ・ [3-(2-クロロ-6-ニトロ-フェノキシ)-フェニル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(4-メチル-キノリン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ シクロヘキサカルボン酸(2-フェニルスルファニル-フェニル)-アミド；
- ・ (4-ヒドロキシ-4-フェニル-オクタヒドロ-キノリン-1-イル)-フェニル-メタノン；
- ・ 3-シクロヘキシル-N-(3-フェニル-プロピル)-プロピオンアミド；
- ・ 2-[1-(2,5-ジメチル-フェニル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニル]-N-イソプロピル-N-フェニル-アセタミド；
- ・ N-{2-[4-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-スルホニル)-フェニル]-エチル}-アセタミド；
- ・ N-ベンジル-N-[2-オキソ-2-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-エチル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ [4-(2-クロロ-6-ニトロ-フェノキシ)-フェニル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-シクロヘプチル-3-フェニル-プロピオンアミド；
- ・ (3-クロロ-6-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-シクロヘプチル-2,4-ジメトキシ-ベンズアミド；
- ・ N-(3-クロロ-フェニル)-2-(8,11,11-トリメチル-3,4,6-トリアザトリシクロ[6.2.1.0^{2,7}]ウンデカ-2(7),3,5-トリエン-5-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-ニトロ-フェニル)-2-(8,11,11-トリメチル-3,4,6-トリアザトリシクロ[6.2.1.0^{2,7}]ウンデカ-2(7),3,5-トリエン-5-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-フェニル-2-(8,11,11-トリメチル-3,4,6-トリアザトリシクロ[6.2.1.0^{2,7}]ウンデカ-2(7),3,5-トリエン-5-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-エチル-3-メチル-N-0-トリル-ベンズアミド；
- ・ N-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル]-2,2-ジメチル-プロピオンアミド；
- ・ 4-フルオロ-N-[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビスクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 4-ブromo-1-エチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸(2-メチルスルファニル-フェニル)-アミド；
- ・ 5-ベンゾイル-フラン-2-カルボン酸ジイソプロピルアミド；
- ・ 2-[3-(ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ N-{2-[2-(4-ブromo-フェニル)-2-オキソ-エチルスルファニル]-ベンゾチアゾール-6-イル}-アセタミド；
- ・ 2-(6-アミノ-ベンゾチアゾール-2-イルスルファニル)-N-シクロヘキシル-アセタミド；
- ・ N-(2-シクロヘキシルカルバモイルメチルスルファニル-ベンゾチアゾール-6-イル)-2-メトキシ-ベンズアミド；
- ・ ベンゾフラン-2-イル-(4-フェニル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・ 1-(2-ニトロ-フェニル)-ピペリジン-3-カルボン酸ジエチルアミド；
- ・ 1-(4-ニトロ-フェニル)-ピペリジン-3-カルボン酸ジエチルアミド；
- ・ 5-ブromo-フラン-2-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；
- ・ 3,3-ジメチル-ペンタン二酸bis-[(2,4-ジフルオロ-フェニル)-アミド]；
- ・ 2-(3-ブromo-ベンジルスルファニル)-1-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-エタノン；
- ；
- ・ N-(2-アゼパン-1-イル-2-オキソ-エチル)-N-ベンジル-4-ブromo-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 1-(2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル)-2-p-トリルスルファニル-エタノン；
- ・ [4-(4-ブromo-ベンゼンスルホニル)-ピペラジン-1-イル]-フラン-2-イル-メタノン；
- ・ [5-(2-ブromo-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル)-メタノン；
- ・ 5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸ジエチルアミド；
- ・ 5-(2-ブromo-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸ジエチルアミド；
- ・ 5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸メチル-フェニル-アミド；
- ・ [5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [3-(2,5-ジクロロ-フェノキシメチル)-フェニル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・ [5-(4-エトキシ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 3-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-N-(2-メチル-シクロヘキシル)-プロピオンアミド；
- ・ 3-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニル)-N-フェニル-ベンゼンスルホンアミド；
- ；
- ・ [3-(2,3-ジヒドロ-インドール-1-スルホニル)-フェニル]-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・ [3-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ N-シクロヘキシル-3-(2-ヒドロキシ-4-メチル-フェニル)-3-フェニル-プロピオンアミド；
- ・ 2-Diエチルアミノ-N-(1-フェニル-シクロペンチルメチル)-プロピオンアミド；
- ・ (6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-メタノン；
- ・ (2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル)-[4-(ナフタレン-1-イルオキシメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ N-ベンジル-4-ブromo-N-エチル-ベンズアミド；
- ・ (3-メチル-ピペリジン-1-イル)-[4-(ナフタレン-1-イルオキシメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；
- ・ (4-メチル-ピペリジン-1-イル)-[4-(ナフタレン-1-イルオキシメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-[5-(2,4-ジクロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；
- ・ N-シクロヘプチル-4-(4-メトキシ-2-メチル-フェニル)-ブチルアミド；
- ・ 2-(4-ベンゾチアゾール-2-イル-ピペラジン-1-イル)-N-シクロヘキシル-アセタミド；
- ；
- ・ N-シクロヘプチル-2-(2,6-ジメチル-フェノキシ)-アセタミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(3-ヨード-フェニル)-メタノン；
- ・ N-シクロヘプチル-3-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシメチル)-ベンズアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-[4-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ (2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル)-[4-(ナフタレン-2-イルオキシメチル)-フェニル]

] -メタノン；

- ・アゼパン-1-イル-[3-(4-エトキシ-フェノキシメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ベンゾ[b]チオフェン-3-カルボン酸(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド；
- ・2-(4-クロロ-2-メチル-フェノキシ)-N-シクロヘプチル-アセタミド；
- ・2,4-ジクロロ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・N-シクロオクチル-2-p-トリルオキシ-アセタミド；
- ・(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-メタノン；
- ・ピフェニル-4-イル-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・N-シクロヘキシル-4-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・N-[4-(アゼパン-1-カルボニル)-フェニル]-N-メチル-ベンゼンスルホンアミド；
- ・N-シクロヘプチル-2-フルオロ-ベンズアミド；
- ・N-シクロヘプチル-4-メチル-ベンズアミド；
- ・(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-p-トリル-メタノン；
- ・[2-(3,4-ジメトキシ-フェニルカルバモイル)-ピペリジン-1-イル]-酢酸ベンジルエステル；
- ・N-[4-(2-メチル-ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-アセタミド；
- ・2-(2,4-ジクロロ-フェノキシ)-N-(2-メチル-ブチル)-プロピオンアミド；
- ・[4-(2-クロロ-6-ニトロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-(4-メトキシ-フェニル)-メタノン；
- ・N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシ-3-メチル-フェニル)-ブチルアミド；
- ・(3-クロロ-6-メトキシ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・2-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；
- ・N-シクロヘキシル-N-[(4-フェニル-チアゾール-2-イルカルバモイル)-メチル]-ベンズアミド；
- ・N-(2-アゼパン-1-イル-2-オキソ-エチル)-N-(4-イソプロピル-フェニル)-メタンスルホンアミド；
- ・N-アダマンタン-1-イル-3-p-トリルスルファニル-プロピオンアミド；
- ・6-(2,4-ジクロロ-フェニルカルバモイル)-3,4-ジメチル-シクロヘキサ-3-エンカルボン酸；
- ・(4-ブチル-シクロヘキシル)-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(3,4-ジクロロ-フェニル)-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・N-(2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-3-メトキシ-ベンズアミド；
- ・N-アダマンタン-2-イル-3-(1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-アクリルアミド；
- ・N-アダマンタン-1-イル-N-メチル-4-(4-ニトロ-ピラゾール-1-イルメチル)-ベンズアミド；
- ・5-(4-クロロ-3,5-ジメチル-ピラゾール-1-イルメチル)-フラン-2-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；
- ・2-(4-クロロ-フェノキシ)-N-(2-フルオロ-5-メチル-フェニル)-2-メチル-プロピオンアミド；
- ・N-アダマンタン-1-イル-2-(4-クロロ-3,5-ジメチル-フェノキシ)-アセタミド；
- ・2-[(3-カルボキシ-ビシクロ[2.2.1]ヘプタンカルボニル)-アミノ]-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-3-カルボン酸プロピルエステル；
- ・2-アダマンタン-1-イル-N-[1-(2,5-ジメチル-フェニル)-エチル]-アセタミド；
- ・3-メチル-チオフェン-2-カルボン酸シクロオクチルアミド；
- ・N-p-トリル-2-(8,11,11-トリメチル-3,4,6-トリアザトリシクロ[6.2.1.0^{2,7}]ウンデカ-2,4,6-トリエン-5-イルスルファニル)-プロピオンアミド；
- ・アゼパン-1-イル-[5-(4-クロロ-5-メチル-3-ニトロ-ピラゾール-1-イルメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；

- ・N-アダマンタン-2-イル-3-(4-ブromo-3-ニトロ-ピラゾール-1-イルメチル)-ベンズアミド；
- ・N-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-2-クロロ-ベンズアミド；
- ・[5-(3-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・1-(4-エチル-ベンゾイル)-6-メトキシ-2-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-キノリン-4-オン；
- ・6-フルオロ-2-メチル-1-{3-[4-(プロパン-1-スルホニル)-フェノキシメチル]-ベンゾイル}-2,3-ジヒドロ-1H-キノリン-4-オン；
- ・N-シクロヘプチル-2-(ナフタレン-1-イルオキシ)-アセタミド；
- ・N-シクロヘキシル-4-o-トリルオキシ-ブチルアミド；
- ・(2-ベンジルスルファニル-フェニル)-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・(2-クロロ-5,6-ジフルオロ-3-メチル-フェニル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3-ブromo-フェニル)-[4-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・2-ブromo-N-(1,1,3,3-テトラメチル-ブチル)-ベンズアミド；
- ・N-アダマンタン-1-イル-2-(2-ベンゾイル-5-メトキシ-フェノキシ)-アセタミド；
- ・N-シクロヘキシル-3-メチル-4-p-トリル-ブチルアミド；
- ・[5-(4-メチル-2-ニトロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・[5-(2,5-ジクロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-チオモルホリン-4-イル-メタノン；
- ・5-(4-クロロ-2-ニトロ-フェノキシメチル)-フラン-2-カルボン酸アダマンタン-1-イルアミド；
- ・4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-3-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・4-クロロ-1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸アダマンタン-1-イル-メチルアミド；
- ・4-(4-メトキシ-3-メチル-フェニル)-N-(2-メチル-シクロヘキシル)-ブチルアミド；
- ・3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-1-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-プロペノン；
- ・N-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-3-フェニルスルファニル-プロピオンアミド；
- ・アゼパン-1-イル-[5-(2-ニトロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；
- ・N-ベンジル-2-(4-クロロ-フェニルスルファニル)-N-メチル-アセタミド；
- ・1-(4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-2-ベンジルスルファニル-エタノン；
- ・2-(4-tert-ブチル-フェノキシ)-1-(4-エチル-ピペラジン-1-イル)-エタノン；
- ・[4-(4-エトキシ-フェノキシメチル)-フェニル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・5-(4-ブromo-3,5-ジメチル-ピラゾール-1-イルメチル)-フラン-2-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；
- ・1-アゼパン-1-イル-3-(4-クロロ-フェニルスルファニル)-プロパン-1-オン；
- ・N-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-2-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-(2-メチル-ベンジルスルファニル)-1-(4-フェニル-ピペラジン-1-イル)-エタノン；
- ・N-[2-(1-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-3-フラン-2-イル-3-オキソ-プロピルスルファニル)-フェニル]-アセタミド；
- ・(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(3-ヨード-フェニル)-メタノン；
- ・[5-(2-ブromo-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・N-ベンジル-N-シクロヘキサ-1-エニル-イソニコチンアミド；

- ・ 1-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-2-(2-メチル-ベンジルスルファニル)-エタノン；
- ・ 2-(2-ブromo-4-メチル-フェノキシ)-N-(2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-アセタミド；
- ・ 2-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルスルファニル]-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；
- ・ 5-(4-ニトロ-ピラゾール-1-イルメチル)-フラン-2-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-3-(2-メトキシ-フェニル)-1-ピロリジン-1-イル-プロパン-1-オン；
- ・ N-アダマンタン-2-イル-3,4-ジクロロ-ベンズアミド；
- ・ ベンゾ[b]チオフェン-3-イル-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・ 2-アダマンタン-1-イル-1-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-エタノン；
- ・ 4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-3-カルボン酸(2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-アミド；
- ・ ベンゾ[b]チオフェン-3-カルボン酸(3,3,5-トリメチル-シクロヘキシル)-アミド；
- ・ 2-(2,6-ジメチル-フェノキシ)-N-(2-イソプロピル-フェニル)-アセタミド；
- ・ 4-ブromo-N-[3-(ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-ベンズアミド；
- ・ N-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチル-2-(2-シアノ-フェニルスルファニル)-ベンズアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(ナフタレン-2-イルオキシ)-アセタミド；
- ・ [4-(4-クロロ-フェニルスルファニルメチル)-フェニル]-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・ チオフェン-2-カルボン酸(3,3,5-トリメチル-シクロヘキシル)-アミド；
- ・ ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・ 3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸シクロオクチルアミド；
- ・ 2-[2-モルホリン-4-イル-1-(4-ニトロ-ベンジル)-2-オキソ-エチル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ 2-ヒドロキシ-4,4-ジメチル-6-オキソ-シクロヘキサ-1-エンカルボン酸フェニルアミド；
- ・ (2,4-ジクロロ-フェニル)-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸フラン-2-イルメチル-p-トリル-アミド；
- ・ アゾカン (アゾカン) -1-イル-(4-tert-ブチル-フェニル)-メタノン；
- ・ 3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸ベンジル-メチルアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2-フルオロ-フェニル)-アミド；
- ・ 2-(ピペリジン-1-カルボニル)-5-ピペリジン-1-イル-オキサゾール-4-カルボニトリル；
- ・ N-(4,6-ジメチル-5-ニトロ-ピリジン-3-イル)-ベンズアミド；
- ・ アダマンタン-1-イル-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・ (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-o-トリル-メタノン；
- ・ N-ベンジル-4-クロロ-N-イソプロピル-3-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ N-(3-ヘキシルスルファニル-[1,2,4]チアジアゾール-5-イル)-3-メチル-ブチルアミド；
- ・ 4,N-ジメチル-N-[4-(ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-(5-tert-ブチル-2H-ピラゾール-3-イル)-メタノン；
- ・ 2-アミノ-4-メチル-5-(ピペリジン-1-カルボニル)-チオフェン-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ 5-メチル-フラン-2-カルボン酸(1-アダマンタン-1-イル-エチル)-アミド；

- ・ (3-クロロ-6-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-トリフルオロメチル-ベンズアミド；
- ・ (3-ブromo-フェニル)-(2,2,4-トリメチル-4-フェニル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・ ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-カルボン酸ジプロピルアミド；
- ・ N-(3,3-ジフェニル-プロピル)-4-メトキシ-ベンズアミド；
- ・ [4-(2-クロロ-6-ニトロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-p-トリル-メタノン；
- ・ フラン-2-イル-[4-(トルエン-4-スルホニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・ 3-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニル)-1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-プロペノン；
- ・ 2-クロロ-N-シクロヘプチル-ベンズアミド；
- ・ 1-[4-(4-ニトロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-3-フェニル-プロパン-1-オン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(3,4-ジメチル-フェニル)-メタノン；
- ・ (1-アダマンタン-1-イル-4-ブromo-1H-ピラゾール-3-イル)-モルホリン-4-イル-メタノン；
- ・ 2-フェニル-シクロプロパンカルボン酸シクロオクチルアミド；
- ・ 3-[4-(2-エトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-カルボニル]-イソクロメン-1-オン；
- ・ [3-(4-ブromo-ピラゾール-1-イルメチル)-フェニル]-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 2-アゼパン-1-イル-N-ビフェニル-2-イル-アセタミド；
- ・ N-[5-(3,4-ジメトキシ-ベンジル)-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル]-3-メチル-ブチルアミド；
- ・ アダマンタン-1-イル-(4-フェニル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ N-(2-アゼパン-1-イル-2-オキソ-エチル)-N-(4-エトキシ-フェニル)-4-メチルスルファニル-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 1-アダマンタン-1-イル-4-ブromo-1H-ピラゾール-3-カルボン酸ジエチルアミド；
- ・ (6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-(2-フルオロ-フェニル)-メタノン；
- ・ 3-[4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-カルボニル]-イソクロメン-1-オン；
- ・ N-シクロオクチル-2-(2-メトキシ-フェノキシ)-アセタミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-2-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(1,1-ジオキソ-テトラヒドロ-チオフェン-3-イル)-アミド；
- ・ N-アダマンタン-2-イル-2-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ (2,4-ジクロロ-フェニル)-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 2-(4-tert-ブチル-フェノキシ)-N-シクロオクチル-アセタミド；
- ・ (4-ヒドロキシ-4-フェニル-オクタヒドロ-キノリン-1-イル)-フェニル-メタノン；
- ・ (2-クロロ-フェニル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-(2-メトキシ-フェニル)-メタノン；
- ・ (3-クロロ-フェニル)-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (3-クロロ-6-ニトロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (2,5-ジクロロ-フェニル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ N-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル]-2,2-ジメチル-プロピオンアミド；
- ・ 4-(4-クロロ-2-メチル-フェノキシ)-1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-ブタン-1-オン；
- ・ (3,4-ジクロロ-フェニル)-[4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノ

ン；

- ・シクロオクタンカルボン酸[1-(ナフタレン-2-スルホニル)-ピロリジン-2-イル]-アミド；
- ・1-ブチル-ピロリジン-2-カルボン酸ベンゾ[1,3]ジオキサール-4-イルアミド；
- ・5-メチル-フラン-2-カルボン酸ジベンジルアミド；
- ・(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[3-(4-フェニル-ピペラジン-1-スルホニル)-フェニル]-メタノン；
- ・ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-[4-(2,3-ジメチル-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・N-アダマンタン-1-イル-2-ベンゾイル-ベンズアミド；
- ・[5-(2-クロロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-(2-ヨード-フェニル)-メタノン；
- ・1-ベンゼンスルホニル-ピロリジン-2-カルボン酸シクロオクチルアミド；
- ・(3,4-ジメトキシ-フェニル)-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-メタノン；
- ・3-(2,6-ジクロロ-フェニル)-1-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-プロペノン；
- ・N-(3,4-ジフルオロ-フェニル)-2,6-ジフルオロ-ベンズアミド；
- ・2,6-ジフルオロ-N-ナフタレン-1-イル-ベンズアミド；
- ・(4-クロロ-フェニル)-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・N-[4-(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-2-(ナフタレン-2-イルオキシ)-アセタミド；
- ・(2-クロロ-フェニル)-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・N-{2-[4-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-エチル}-アセタミド；
- ・N-ピフェニル-2-イル-2-(ピリジン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・アゼパン-1-イル-[5-(4-クロロ-3,5-ジメチル-ピラゾール-1-イルメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；
- ・酢酸4-(4-メチル-ピペリジン-1-カルボニル)-フェニルエステル；
- ・酢酸4-(4-ベンジル-ピペリジン-1-カルボニル)-フェニルエステル；
- ・ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-カルボン酸シクロヘプチルアミド；
- ・2-(2,4-ジメチル-フェノキシ)-1-(6-フルオロ-2-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-エタノン；
- ・酢酸4-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニル)-フェニルエステル；
- ・アゼパン-1-イル-(3,5-ジブromo-フェニル)-メタノン；
- ・(3,5-ジブromo-フェニル)-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-メタノン；
- ・N-シクロオクチル-4-イソプロピル-ベンズアミド；
- ・N-シクロオクチル-2-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・(4-tert-ブチル-ピペリジン-1-イル)-フェニル-メタノン；
- ・N-(4-tert-ブチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・(2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-[5-(2,3,5,6-テトラフルオロ-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-メタノン；
- ・2-(4-クロロ-3,5-ジメチル-フェノキシ)-N-シクロヘキシル-N-メチル-アセタミド；
- ・N-シクロヘキシル-3-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-N-メチル-プロピオンアミド；
- ・2-(4-クロロ-3-メチル-フェノキシ)-N-シクロヘキシル-N-メチル-アセタミド；
- ・N-シクロペンチル-3-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニル)-ベンゼンスルホンアミド；
- ・(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-(3-ジメチルアミノ-フェニル)-メタノン；
- ・3-シクロヘキシルカルバモイル-ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-カルボン酸イソプ

ロピルエステル；

- ・ 1-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-2-(2-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ N-ベンジル-N-シクロヘキサ-1-エニル-ベンズアミド；
- ・ [1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペリジン-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[4-(モルホリン-4-スルホニル)-フェニル]-メタノン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[4-(ピロリジン-1-スルホニル)-フェニル]-メタノン；
- ・ (3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[1-(チオフエン-2-スルホニル)-ピペリジン-4-イル]-メタノン；
- ・ (1-ベンゼンスルホニル-ピペリジン-3-イル)-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-メタノン；
- ・ 6,7-ジメチル-4-オキサ-トリシクロ[4.3.0.0^{3,7}]ノナン-3-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- ・ 6,7-ジメチル-4-オキサ-トリシクロ[4.3.0.0^{3,7}]ノナン-3-カルボン酸(2-クロロ-フェニル)-アミド；
- ・ (6,7-ジメチル-4-オキサ-トリシクロ[4.3.0.0^{3,7}]ノナ-3-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 2-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-3-(1H-インドール-3-イル)-プロピオン酸メチルエステル；
- ・ 2-(5,6-ジメチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロ-チエノ[2,3-d]ピリミジン-2-イルスルファニル)-N-フラン-2-イルメチル-アセタミド；
- ・ N-アリル-2-(5,6-ジメチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロ-チエノ[2,3-d]ピリミジン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(5,6,7,8-テトラヒドロ-ベンゾ[4,5]チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニル)-4,7,7-トリメチル-2-オキサ-ビシクロ[2.2.1]ヘプタン-3-オン；
- ・ 1-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボニル)-4,7,7-トリメチル-2-オキサ-ビシクロ[2.2.1]ヘプタン-3-オン；
- ・ アゼパン-1-イル-(6,7-ジメチル-4-オキサ-トリシクロ[4.3.0.0^{3,7}]ノナ-3-イル)-メタノン；
- ・ 2,5-ジメチル-フラン-3-カルボン酸(1-アダマンタン-1-イル-エチル)-アミド；
- ・ 1-シクロヘキシル-5-オキソ-ピロリジン-3-カルボン酸(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフエン-2-イル)-アミド；
- ・ 6-(2,4-ジクロロ-フェニルカルバモイル)-3,4-ジメチル-シクロヘキサ-3-エンカルボン酸；
- ・ 2-(2-シアノ-フェニルスルファニル)-N-シクロペンチル-ベンズアミド；
- ・ [5-(2-メトキシ-4-プロピル-フェノキシメチル)-フラン-2-イル]-(3-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (4-tert-ブチル-フェニル)-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ [4-(2-メトキシ-ナフタレン-1-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-(4-メトキシ-フェニル)-メタノン；
- ・ (3,4-ジクロロ-フェニル)-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (4-エトキシ-フェニル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 2-フェネチル-N-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘプチル-2-フェノキシ-ベンズアミド；

- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2-エトキシ-フェニル)-アミド；
- ・ N-アダマンタン-2-イル-2-*o*-トリルオキシ-アセタミド；
- ・ (2-クロロ-フェニル)-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 1-モルホリン-4-イル-2-[3-(4-ニトロ-フェニル)-アダマンタン-1-イル]-エタノン；
- ・ 2-ジメチルアミノ-N-(2-ニトロ-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ N-ベンジル-2-(4,4,6-トリメチル-1-*p*-トリル-1,4-ジヒドロ-ピリミジン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ [4-(3,5-ジニトロフェノキシ)-フェニル]-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 1-(4-クロロ-ベンゾイル)-2,3-ジヒドロ-1*H*-ベンゾ[g]キノリン-4-オン；
- ・ 2-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸メチルエステル；
- ・ [ベンジル-(4-ニトロ-ベンゾイル)-アミノ]-酢酸エチルエステル；
- ・ 9-オキソ-9*H*-フルオレン-3-カルボン酸メチル-(4-ニトロ-フェニル)-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸[2-(4-メトキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- ・ (10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-(4-フルオロ-フェニル)-メタノン；
- ・ 2-ベンジルスルファニル-N-[2-(2-メトキシ-フェノキシ)-エチル]-アセタミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(2-オキソ-4-フェニル-ピロリジン-1-イル)-アセタミド；
- ・ 2-ブromo-N-トリシクロ[3.2.1.0^{2,4}]オクタ-6-イルメチル-ベンズアミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2,6-ジメトキシ-ピリミジン-4-イル)-アミド；
- ・ ヘキサン二酸(2,7,7-トリメチル-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-1-イル)-アミド (1,7,7-トリメチル-ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)-アミド；
- ・ 2-クロロ-N-(2-シクロヘキシル-エチル)-ベンズアミド；
- ・ 2-[3-(2-エチル-ピペリジン-1-イル)-3-オキソ-プロピル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(2-オキソ-4-フェニル-ピロリジン-1-イル)-アセタミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-ヒドロキシ-2,2-ジフェニル-アセタミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(ナフタレン-1-イルメチル)-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル)-アミド；
- ・ 1-(アゼパン-1-カルボニル)-フルオレン-9-オン；
- ・ 2-(キノリン-2-イルスルファニル)-N-*p*-トリル-アセタミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-[3-(ピペリジン-1-カルボニル)-フェニル]-ベンズアミド；
- ・ 2-クロロ-4,5-ジフルオロ-N-(3,3,5-トリメチル-シクロヘキシル)-ベンズアミド；
- ・ 2-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-N-*p*-トリル-アセタミド；
- ・ [4-(4-クロロ-フェニルスルファニルメチル)-フェニル]-ピロリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-N-メチル-イソニコチンアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-[4-(4-クロロ-フェニルスルファニルメチル)-フェニル]-メタノン；
- ・ (2-クロロ-フェニル)-(1,5,7-トリメチル-3,7-ジアザ[3.3.1]ノナ-3-イル)-メタノン；
- ・ (3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 安息香酸1-ベンゾイル-デカヒドロ-キノリン-4-イルエステル；
- ・ 2-(3-ブromo-ベンジルスルファニル)-1-[4-(2-メトキシ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]-エタノン；
- ・ 4-メチル-N-[2-(フェノキサジン-10-カルボニル)-フェニル]-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 2-[1-(アゼパン-1-カルボニル)-2-メチル-プロピル]-イソインドール-1,3-ジオン；

- ・ 2-(3-プロモ-ベンジルスルファニル)-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；
- ・ 1-[3-(4-プロモ-フェニル)-1-フラン-2-イル-3-オキソ-プロピル]-ピロリジン-2-オン；
- ・ 2-クロロ-N-シクロオクチル-4,5-ジフルオロ-ベンズアミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-(2-フラン-2-イルメチル-シクロヘキシル)-ベンズアミド；
- ・ N-(4-ベンゾイル-フラザン-3-イル)-2-フルオロ-ベンズアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(3-シアノ-4-メトキシメチル-6-メチル-ピリジン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 4-tert-ブチル-N-シクロオクチル-ベンズアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-フェニル-ブチルアミド；
- ・ (3-クロロ-6-メトキシ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ (3,7-ジクロロ-6-メトキシ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ 酢酸1-ベンゾイル-デカヒドロ-キノリン-4-イルエステル；
- ・ 2-プロモ-N-メチル-N-フェニル-ベンズアミド；
- ・ N-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-2,4-ジクロロ-ベンズアミド；
- ・ (3-クロロ-6-フルオロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-ピペリジン-1-イル-メタノン；
- ・ N-(1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ-s-インダセン-1-イル)-2-ピペリジン-1-イル-アセタミド；
- ・ 2-[(アダマンタン-1-カルボニル)-アミノ]-3-(1H-インドール-3-イル)-プロピオン酸メチルエステル；
- ・ 2-[2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-フェニル-プロピオニルアミノ]-3-メチル-酪酸メチルエステル；
- ・ 2-(6-オキソ-6-ピペリジン-1-イル-ヘキシル)-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ 2-[2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-フェニル-プロピオニルアミノ]-3-メチル-酪酸メチルエステル；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(2,6-ジヒドロキシ-ピリミジン-4-イル)-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸[3-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル)-5-ニトロ-フェニル]-アミド；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸メチル-フェニル-アミド；
- ・ 3-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボン酸ジベンジルアミド；
- ・ N-アダマンタン-1-イル-2-(3-シアノ-6-メチル-4-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(3-オキソ-3-フェニル-プロペニル)-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ アダマンタン-1-カルボン酸(4-エトキシ-ベンゾチアゾール-2-イル)-アミド；
- ・ N-[5-(5-クロロ-ベンゾオキサゾール-2-イル)-2-メチル-フェニル]-2-メトキシ-ベンズアミド；
- ・ N-[2-(2-プロモ-フェニル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-メトキシ-ベンズアミド；
- ・ 2-(4-クロロ-フェノキシ)-N-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2,2-ジメチル-N-(5-プロピル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-プロピオンアミド；
- ・ 2-[2-(2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル)-1-メチル-2-オキソ-エチル]-イソインドール-1,3-ジオン；
- ・ 2-(2-シアノ-フェニルスルファニル)-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-ベンズアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-(3,6-ジクロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-メタノン；
- ・ ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-(4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；

- ・アゼパン-1-イル-(3-クロロ-6-メチル-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-メタノン；
- ・N-(5-ヘキシル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-イソブチルアミド；
- ・(3-クロロ-フェニル)-(10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-メタノン；
- ・(2-クロロ-フェニル)-(10,11-ジヒドロ-ジベンゾ[b,f]アゼピン-5-イル)-メタノン；
- ・2-アミノ-5-(アゼパン-1-カルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・アダマンタン-1-イル-(4-シクロプロピル-1,4,6,7-テトラヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-5-イル)-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-(4-トリフルオロメチル-1,4,6,7-テトラヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-5-イル)-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-[4-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル)-ピペリジン-1-イル]-メタノン；
- ・アダマンタン-1-イル-(1,4,6,7-テトラヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-5-イル)-メタノン；
- ・[4-(1H-イミダゾール-4-イル)-ピペリジン-1-イル]-(4-ペンチル-フェニル)-メタノン；
- ・3-シクロヘキシル-1-[4-(1H-イミダゾール-4-イル)-ピペリジン-1-イル]-プロパン-1-オン；
- ・1-(4-プロピル-ピペラジン-1-イル)-3-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-プロパン-1-オン；
- ・N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-3-チオフェン-3-イル-N-(2-チオフェン-2-イル-エチル)-アクリルアミド；
- ・N-(1,3-ジメチル-ペンチル)-2-(3-フルオロ-フェニル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アセタミド；
- ・N-シクロブチル-2-(3-フルオロ-フェニル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アセタミド；
- ・N-シクロブチル-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-4-トリフルオロメチル-ベンズアミド；
- ・N-(3-ヒドロキシ-ベンジル)-2-メチル-3-ニトロ-N-(4-スルファモイル-ベンジル)-ベンズアミド；
- ・N-(4-ブromo-ベンジル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-2-ナフタレン-1-イル-アセタミド；
- ・6-(2-ブromo-フェニルスルファニル)-ヘキサノ酸(3-アミノ-2,2-ジメチル-プロピル)-アミド；
- ・N-(3-アミノ-2,2-ジメチル-プロピル)-4-[2-(2-イソプロピル-フェニルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド；
- ・N-(3-アミノ-2,2-ジメチル-プロピル)-4-[4-(4-クロロ-フェニル)-ピリミジン-2-イルスルファニルメチル]-3-ニトロ-ベンズアミド；
- ・4-(4-ブromo-フェニル)-N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-4-オキソ-N-チオフェン-2-イルメチル-ブチルアミド；
- ・N-[2-(2,4-ジクロロ-フェニル)-エチル]-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-2-チオフェン-3-イル-アセタミド；
- ・N-(2-クロロ-ベンジル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-2-チオフェン-2-イル-アセタミド；
- ・ヘプタン酸ベンジル-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アミド；
- ・N-(4-フルオロ-ベンジル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-2-チオフェン-3-イル-アセタミド；
- ・4-メチル-ペンタン酸(4-フルオロ-ベンジル)-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アミド；
- ・N-アリル-2-(4-クロロ-フェニル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アセタミド；
- ・N-アリル-2-ベンゾ[b]チオフェン-3-イル-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アセタミド；
- ・ヘプタン酸(3-エトキシ-プロピル)-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アミド；

- ・デカ-3-エン酸(4-ヒドロキシ-ベンジル)-(4-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミド ;
- ・6-オキソ-6-フェニル-ヘキサン酸(4-ヒドロキシ-ベンジル)-(4-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミド ;
- ・2-(3,4-ジフルオロ-フェニル)-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-チオフェン-2-イルメチル-アセタミド ;
- ・2-メチル-ペンタ-4-エン酸(3-ヒドロキシ-ベンジル)-[2-(2-メトキシ-フェニル)-エチル]-アミド ;
- ・ヘプタン酸(3-ヒドロキシ-ベンジル)-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミド ;
- ・5-(2,6-ジクロロ-フェニルスルファニル)-ペンタン酸(ナフタレン-1-イルメチル)-アミド ;
- ・N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(5-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(4-フェノキシ-ピリミジン-2-イルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(4-フルオロ-フェニルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・4-(2,6-ジクロロ-フェニルスルファニル)-N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-ブチルアミド ;
- ・N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(5-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(4-フルオロ-フェニルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・5-(3-メチルスルファニル-[1,2,4]チアジアゾール-5-イルスルファニル)-ペンタン酸(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-アミド ;
- ・5-(2,6-ジクロロ-フェニルスルファニル)-ペンタン酸[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エチル]-アミド ;
- ・4-[2-(2,6-ジクロロ-フェニルスルファニル)-エチル]-N-[2-(2-フルオロ-フェニル)-エチル]-ベンズアミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(3-クロロ-4-ヒドロキシ-フェニル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(1,2-ジメチル-プロピル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(1-エチル-プロピル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸[3-(1-ヒドロキシ-エチル)-フェニル]-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(1-エチニル-シクロヘキシル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(2-メトキシ-ジベンゾフラン-3-イル)-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸[2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド ;
- ・2-シクロヘキシルアミノ-チアゾール-4-カルボン酸(4-ヒドロキシ-シクロヘキシル)-アミド ;
- ・2-(2,6-ジフルオロ-ベンジルアミノ)-N-[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エチル]-アセタミド ;
- ・4-{4-[2-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-アセチル]-ピペラジン-1-イル}-3-(2-フェニル-プロピルアミノ)-ベンズアミド ;

- ・ 2-(2-エチル-フェニルスルファニル)-3-[メチル-(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミノ]-N-プロパ-2-イニル-プロピオンアミド；
- ・ 4-メチル-シクロヘキサニルカルボン酸{[2-(2-クロロ-6-フルオロ-ベンジルスルファニル)-エチルカルバモイル]-メチル}-プロパ-2-イニル-アミド；
- ・ 2-ベンジルスルファニル-N-{[2-(2-クロロ-6-フルオロ-ベンジルスルファニル)-エチルカルバモイル]-メチル}-N-(2-メトキシ-エチル)-アセタミド；
- ・ 4-[2-(5-シクロプロピルメチルスルファニル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルスルファニル)-エチル]-N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-ベンズアミド；
- ・ N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-4-[2-(4-フェノキシ-ピリミジン-2-イルスルファニル)-エチル]-ベンズアミド；
- ・ N-(6,6-ジメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプタ-2-イルメチル)-2-p-トリルオキシ-アセタミド；
- ・ ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-5-エン-2-カルボン酸[4-(2,5-ジフルオロ-フェノキシ)-ブチル]-アミド；
- ・ 4-トリフルオロメチル-シクロヘキサニルカルボン酸[6-(2,6-ジフルオロ-フェノキシ)-ヘキシル]-アミド；
- ・ N-シクロプロピル-3-メトキシ-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；
- ・ 3-メトキシ-N-(2-メトキシ-エチル)-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；
- ・ 3-メトキシ-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-N-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-ベンズアミド；
- ・ 3-メトキシ-N-(2-オキソ-アゼパン-3-イル)-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；
- ・ 3-メトキシ-N-[3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル]-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；
- ・ 3-メトキシ-N-メチル-N-(2-ピペリジン-4-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；
- ・ [2-({シクロプロピル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ (2-{[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-(3-メチル-ブチル)-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({シクロペンチル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({(2-メトキシ-エチル)-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({カルバモイルメチル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-ピリジン-4-イル-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({シクロプロピルメチル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [2-({[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-メチル-アミノ}-メチル)-フェノキシ]-酢酸；
- ・ [4-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-フェニル]-メタノン；
- ・ {カルバモイルメチル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-酢酸；
- ・ {(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベン

ゾイル]-アミノ}-酢酸；

・{[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-ピリジン-4-イル-アミノ}-酢酸；

・[[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-(2-オキソ-アゼパン-3-イル)-アミノ]-酢酸；

・3-メトキシ-N-(2-メトキシ-エチル)-N-ピペリジン-3-イルメチル-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；

・4-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイルアミノ]-ピペリジン-1-カルボン酸エチルエステル；

・3-メトキシ-N-[3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル]-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンズアミド；

・3-({カルバモイルメチル-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-安息香酸；

・3-({(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-[3-メトキシ-5-(ピリジン-2-カルボニル)-ベンゾイル]-アミノ}-メチル)-安息香酸；

・4-アミノ-N-(3-ヒドロキシ-ベンジル)-N-インダン-2-イル-2-プロピオニルアミノ-ブチルアミド；

・5-アミノ-2-プロピオニルアミノ-ペンタン酸(3-ヒドロキシ-ベンジル)-インダン-2-イル-アミド；

・N-エチル-2-ヘキシルアミノ-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-アセタミド；

・2-ヘキシルアミノ-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-メチル-アセタミド；

・1-[1-(6-フェニル-ヘキサノイル)-ピペリジン-4-イル]-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン；

・1-[1-(3-シクロヘキシル-プロピオニル)-ピペリジン-4-イル]-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン；

・N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-N-イソブチル-ベンズアミド；

・N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-N-イソブチル-アセタミド；

；

・N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-メチル-ブチル)-ベンズアミド；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-イソブチル-ベンズアミド；

・4-ヒドロキシ-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-イソブチル-ベンズアミド；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-N-イソブチル-アセタミド；

；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-メチル-ブチル)-ベンズアミド；

・N-(2-エトキシ-エチル)-4-ヒドロキシ-N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-ベンズアミド；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-イソプロポキシ-プロピル)-ベンズアミド；

・N-(3-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(4-メチル-ペンチル)-ベンズアミド；

・N-(3-ヒドロキシ-ベンジル)-2-(4-ヒドロキシ-フェニル)-N-(4-メチル-ペンチル)-アセタミド；

・N-(3-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-イソプロポキシ-プロピル)-ベンズアミド；

・N-(2-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-メチル-ブチル)-4-プロピル-ベンズアミド；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(6-ヒドロキシ-ヘキシル)-4-プロピル-ベンズアミド；

；

・N-(4-ヒドロキシ-ベンジル)-N-(3-メチル-ブチル)-4-プロピル-ベンズアミド；および

・N-[2-(4-フルオロ-ベンジルアミノ)-チアゾール-4-イルメチル]-N-フェネチル-ブチルアミド。

【請求項 9】

請求項 6 または 7 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体

、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

- ・ (4-テトラゾール-1-イル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-2-フェノキシメチル-ベンズアミド；
- ・ 4-アミノ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘプチル-N-メチル-2-フェノキシメチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2-クロロ-N-シクロヘキシル-6-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-4-トリフルオロメトキシ-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2,3,N-トリメチル-ベンズアミド；
- ・ 3,5-ジクロロ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-2-フェノキシ-ベンズアミド；
- ・ 2,4-Bis-ベンジルオキシ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2-ベンジルオキシ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-4-フェノキシ-ベンズアミド；
- ・ 4-ベンジルオキシ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-4-フェノキシメチル-ベンズアミド；
- ・ 2-クロロ-N-シクロヘキシル-N-エチル-4-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ 4-クロロ-N-シクロヘキシル-N-エチル-3-ニトロ-ベンズアミド；
- ・ 6-フルオロ-4H-ベンゾ[1,3]ジオキシン-8-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ アゼパン-1-イル-(2-クロロ-フェニル)-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-(3-クロロ-フェニル)-メタノン；
- ・ アゼパン-1-イル-フェニル-メタノン；
- ・ 2-(ビフェニル-4-イルオキシ)-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2-(3,5-ジメトキシ-フェノキシ)-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2-(2,3-ジメトキシ-フェノキシ)-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-(3,3-ジメチル-1,5-ジオキサ-スピロ[5.5]ウンデカ-9-イル)-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ 2,4-ジクロロ-N-メチル-N-(4-オキソ-シクロヘキシル)-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2-ヒドロキシ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-3-メトキシ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 3-ベンジルオキシ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ N-シクロヘキシル-3-ヒドロキシ-N-メチル-ベンズアミド；
- ・ [4-(モルホリン-4-スルホニル)-フェニル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ N-ベンジル-3-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ [4-フルオロ-3-(モルホリン-4-スルホニル)-フェニル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ チオフェン-2-スルホン酸[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-アミド；
- ・ N-フェニル-4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ (4-フェノキシ-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ N-(2,4-ジメチル-フェニル)-3-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-ベンゼンスルホンアミド；

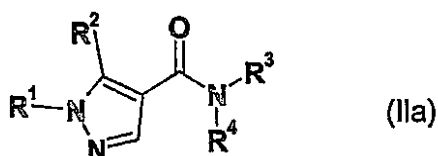
- ・ (2-フェノキシメチル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ 4-(3-アザ-ビシクロ [3.2.2]ノナン-3-カルボニル)-N,N-ジプロピルベンゼンスルホンアミド ;
- ・ 2-プロモ-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド ;
- ・ N-[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-アセタミド ;
- ・ (4-ジメチルアミノ-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-Pyrrol-1-イル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-イミダゾール-1-イル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-アミノ-2-メトキシ-フェニル)-(トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-メタンスルホニル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-ベンゼンスルホニル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-[4-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イルメチル)-フェニル]-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-(4-モルホリン-4-イルメチル-フェニル)-メタノン ;
- ・ [4-(3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-フェニル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-[1,2,4]トリアゾール-1-イル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ (4-ピラゾール-1-イル-フェニル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ 2-ベンジルオキシメチル-N-シクロヘキシル-N-メチル-ベンズアミド ;
- ・ N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-メチル-5-オキソ-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル)-ベンズアミド ;
- ・ 5-メチル-2-[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-2,4-ジヒドロ-ピラゾール-3-オン ;
- ・ (9H-カルバゾール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ [4-(3,5-ジメチル-ピラゾール-1-イル)-フェニル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ フェニル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ アゼパン-1-イル-(2-プロモ-フェニル)-メタノン ;
- ・ (3-アザ-ビシクロ [3.2.2]ノナ-3-イル)-(2-プロモ-フェニル)-メタノン ;
- ・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-キノリン-2-イル-メタノン ;
- ・ (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-キノリン-2-イル-メタノン ;
- ・ (3-アザ-ビシクロ [3.2.2]ノナ-3-イル)-キノリン-2-イル-メタノン ;
- ・ キノリン-2-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド ;
- ・ キノリン-2-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;
- ・ 1-[4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-フェニル]-ピロリジン-2,5-ジオン ;
- ・ ピリジン-3-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン ;

- ・ピリジン-4-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ピリジン-2-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・(6-ピラゾール-1-イル-ピリジン-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-安息香酸；
- ・イミダゾ[2,1-b]チアゾール-6-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・8-(4-ジメチルアミノ-ベンゾイル)-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-3-オン；
- ・(4-ジメチルアミノ-フェニル)-(3-ヒドロキシ-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-8-イル)-メタノン；
- ・(4-ジメチルアミノ-フェニル)-(3-ヒドロキシ-3-メチル-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-8-イル)-メタノン；および
- ・トリフルオロ-酢酸8-(4-ジメチルアミノ-ベンゾイル)-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イルエステル。

【請求項 10】

請求項 6 または 7 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が次式 (IIa) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

【化 3】



ここで、

R^1 は、1 以上の R^6 で任意に置換されたアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、または hetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

R^2 は、ハロ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、トリハロメチル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル NR^5 C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル NR^5 C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、または hetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアリール基は独立に 1 以上の R^7 で任意に置換され；

R^3 は、1 以上の R^8 で任意に置換された C_1 - C_6 アルキルであり；

R^4 は、 C_6 - C_{10} シクロアルキル、 C_6 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_6 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、または C_6 - C_{10} hetシクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキルおよび hetシクロアルキル基は独立に 1 以上の R^8 で任意に置換されるか；または

R^3 および R^4 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、7~12 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、または hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に 1 以上の R^9 で任意に置換され；

R^5 は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C

$_3$ - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、hetアリール、シクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^9 で任意に置換され；

R^6 および R^7 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{10}R^{11}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 $NR^{10}R^{11}$ 、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリールオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであるか；または

R^{10} および R^{11} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項11】

請求項10に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤が前記式(IIa)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグまたはその何れかの互変異性体である組合せ；

但し、前記式(IIa)において、

R^1 は、独立に1以上の R^6 で任意に置換されたアリールまたはhetアリールであり；

R^2 は、ハロ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル NR^5C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル NR^5C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^3 は、1以上の R^8 で任意に置換された C_1 - C_6 アルキルであり；

R^4 は、 C_6 - C_{10} シクロアルキル、 C_6 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_6 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、または C_6 - C_{10} hetシクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^8 で任意に置換され；

R^5 は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C

$_3$ - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、hetアリール、シクロアルキル、およびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^9 で任意に置換され；

R^6 および R^7 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{10}R^{11}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 $NR^{10}R^{11}$ 、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリールオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであるか；または

R^{10} および R^{11} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項12】

請求項10または11に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

- ・1-(4-クロロ-フェニル)-5-プロピル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・1-(4-クロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・[1-(4-メトキシ-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・1 [1-(4-クロロ-フェニル)-5-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・[1-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-プロピル-1H-ピラゾール-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・1-(フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・1-(4-フルオロ-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・1-(4-メトキシ-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・1-(4-クロロ-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・1-(2-メチル-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

・1-(4-アミノ-フェニル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

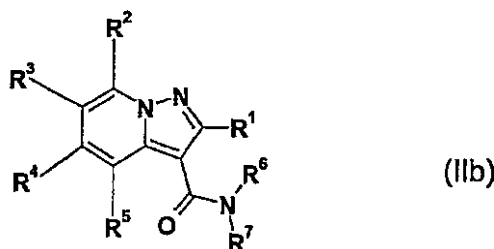
・1-(2-ピリジル)-5-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；および

・1-(2-ピリジル)-5-プロピル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド。

【請求項13】

請求項6または7に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が次式(IIb)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

【化4】



ここで、

R¹は、水素、トリハロメチル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリール、またはhetアラルキルであり、ここでのアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上のR⁸で任意に置換され；

R²、R³、R⁴およびR⁵は、独立に、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、NR⁹R¹⁰、トリハロメチル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリール、またはhetアラルキルであり、ここでのアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上のR⁸で任意に置換されるか；または

R²が、R³と一緒に、3～6の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキシ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、またはhetアリールC₁-C₆アルキルオキシの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R³が、R⁴と一緒に、3～6の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキシ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、またはhetアリールC₁-C₆アルキルオキシの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R^4 が、 R^5 と一緒に、3～6の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^6 は、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、およびシクロアルキル基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換され；

R^7 は、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、およびシクロアルキル基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^6 および R^7 は、それらが結合している窒素と一緒に、6～10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^8 で任意に置換され；

R^9 および R^{10} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリールおよびシクロアルキル基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒に、4～10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^8 で任意に置換され；

R^8 および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、またはアリールオキシである。

【請求項14】

請求項13に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

- ・ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

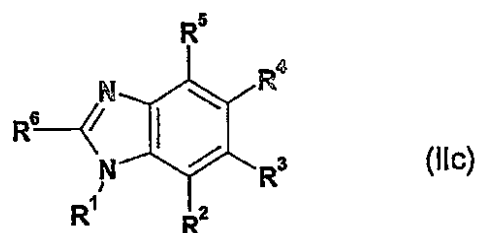
- ・(2-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；および

- ・ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド。

【請求項15】

請求項6または7に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤が次式(IIc)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグ、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化5】



ここで、

R^1 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 SO₂、アリールSO₂、hetアリールSO₂、アリール C_1 - C_6 アルキルSO₂、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルSO₂であり、これらの全てが1以上の R^8 で任意に置換され；

R^2 および R^5 は、独立に、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、トリハロメチル、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、アリールアルキル、hetアリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^9 で置換され；

R^3 は水素で且つ R^4 がC(O)NR⁷R⁸であるか、または R^3 はC(O)NR⁷R⁸で且つ R^4 が水素であり；

R^6 は、水素、ハロ、シアノ、トリハロメチル、NR¹²R¹³、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、アリールアルキル、hetアリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^9 で置換され；

R^7 および R^8 は、独立に、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換されるか；または

R^7 および R^8 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、6~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換され；

R^9 は、水素、ヒドロキシ、オキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、NR¹²R¹³、C(O)NR¹²R¹³、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、オキシ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_8 アルキルカルボニル、hetアリールカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 ア

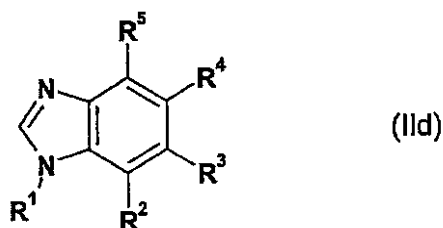
ルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであるか；または

R^{12} および R^{13} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキル-オキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項16】

請求項15に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤が次式(IIId)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグ、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化6】



ここで、

R^1 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり（これらは1以上の R^8 で任意に置換される）；

R^2 および R^5 は、独立に、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、トリハロメチル、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、アリールアルキル、hetアリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^8 で置換され；

R^3 は水素で且つ R^4 が $C(0)NR^6R^7$ であるか；または R^3 は $C(0)NR^6R^7$ で且つ R^4 が水素であり；

R^6 および R^7 は、独立に、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^9 で任意に置換されるか；または

R^6 および R^7 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、6~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^8 は、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{11}R^{12}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R⁹およびR¹⁰は、独立に、水素、ハロ、オキソ、ヒドロキシ、C₁-C₆アルキル、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルであり；

R¹¹およびR¹²は、独立に、水素、C₁-C₈アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、C₃-C₁₀シクロアルキル、C₃-C₁₀hetシクロアルキル、C₃-C₁₀シクロアルキルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキル-カルボキシC₁-C₆アルキルであるか；または

R¹¹およびR¹²は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₈アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキル-オキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリールC₁-C₆アルキル-カルボニル、hetアリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリールC₁-C₆アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項 17】

請求項 2 または 3 に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグ、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

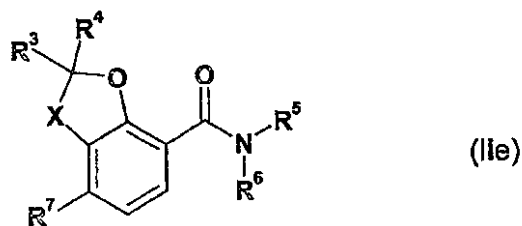
- ・ 1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- 1-ベンジル-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ イソプロピル-2-トリフルオロメチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- 1-ベンジル-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 2-ヒドロキシメチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ 2-(4-アミノ-フェニル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (2-アミノ-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (2-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 3-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ (2-チオフエン-2-イル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；および
- ・ [2-(2-ニトロ-フェニル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン。

【請求項 18】

請求項 6 または 7 に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が次式(IIe)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグ、またはその何れかの互

変異性体である組合せ：

【化 7】



ここで、

Xは、酸素または $(CR^1R^2)_n$ であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキル（これらは独立に1以上の R^8 で任意に置換される）であるか；または

R^1 と R^3 または R^4 の何れかと一緒に、4～8の炭素原子を含む飽和または部分的に飽和された環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R^1 と R^3 または R^4 の何れかと一緒に、単結合と一緒に炭素-炭素二重結合を形成しており；

R^5 は、1以上の R^9 で任意に置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R^6 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル およびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^9 で任意に置換されるか；または

R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒に、6～10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換され；

R^7 は、水素、ハロ、ニトロ、 $NR^{12}R^{13}$ 、シアノ、トリハロメチル、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリールオキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ（これらは独立に1以上の R^{11} で任意に置換される）であり；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{12}R^{13}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシであり；

R^{11} は、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、またはhetアリールオキシであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1

-C₆アルキル、C₃-C₁₀シクロアルキル、C₃-C₁₀hetシクロアルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₃-C₁₀シクロアルキルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルオキシカルボニルであるか；または

R¹²およびR¹³は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリールC₁-C₆アルキルカルボニル、hetアリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリールC₁-C₆アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

nは、1または2である。

【請求項 19】

請求項 18に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

- ・2,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2,5-ジメチル-3-フェニル-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(2,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル)-(2,4,4-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・4-メトキシ-2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2-メチル-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；および
- ・クロマン-8-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド。

【請求項 20】

請求項 18に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、そのプロドラッグ、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

- ・2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・2-メチル-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・(2,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル)-(2,4,4-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・4-メトキシ-2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メ

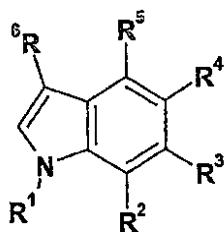
チルアミド；

- ・ 2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；
- ・ (2-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；および
- ・ クロマン-8-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド。

【請求項 21】

請求項 6 または 7 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が次式 (II f) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

【化 8】



(II f)

ここで、

R^1 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、または het アリール C_1 - C_6 アルキル（これらは 1 以上の R^9 で任意に置換される）であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、独立に、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、トリハロメチル、カルボキシ、 $N(R^{12}R^{13})$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} het シクロアルキル、 $N(R^{12}R^{13})C_1$ - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、het アリール、het アリール C_1 - C_6 アルキル、het アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、het アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、または het アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、アリールアルキル、het アリールおよび het アリールアルキル基は独立に 1 以上の R^9 で置換され；

R^7 は、水素、または C_1 - C_8 アルキル（1 以上の R^{10} で任意に置換される）であり；

R^8 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} het シクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのシクロアルキルおよび het シクロアルキル基は独立に 1 以上の R^{10} で任意に置換されるか；または

R^7 および R^8 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、het アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、het アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、het アリール C_1 - C_6 アルキル-オキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、het アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、het アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に 1 以上の R^{11} で任意に置換され；

R^9 は、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{12}R^{13}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル

、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、オキソ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキルカルボニル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキルカルボニル、または C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルカルボニルであり、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されると共に、ここでの R^{11} は上記で定義した通りであるか；または

R^{12} および R^{13} は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキル-オキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項22】

請求項21に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤は前記式(II f)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；但し、前記式(II f)において、

R^1 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキル（これらは1以上の R^9 で任意に置換される）であり；

R^2 および R^5 は、独立に、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、トリハロメチル、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、アリールアルキル、hetアリールおよびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^9 で置換され；また

R^3 は $C(0)NR^7R^8$ で且つ R^4 が水素であるか；または R^3 は水素で且つ R^4 が $C(0)NR^7R^8$ であり；

R^6 は、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 $N(R^{12}R^{13})C_1$ - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキルであり；

R^7 は、1以上の R^{10} で任意に置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R^8 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのシクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^{10} で任意に置換されるか；または

R^7 および R^8 は、それらが結合している窒素と一緒に、6~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキル-オキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル

、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換され；

R^9 は、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、ニトロ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 $NR^{12}R^{13}$ 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、オキソ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルであり；

R^{12} および R^{13} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキルカルボニル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキルカルボニル、または C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルカルボニルであるか；または

R^{12} および R^{13} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキル-オキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項 2 3】

請求項 2 1 または 2 2 に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

- ・(1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

1H-インドール-6-カルボン酸シクロヘキシル-メチルアミド；

- ・(1H-インドール-7-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(1H-インドール-6-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・1H-インドール-6-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；

- ・(6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-(1H-インドール-6-イル)-メタノン；

- ・1H-インドール-6-カルボン酸(8-メチル-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イル)-アミド；

- ・1H-インドール-5-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド；

- ・(6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；

- ・(1H-インドール-4-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(1H-インドール-2-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オク

タ-6-イル)-メタノン；

- ・ (3-アザ-ビシクロ [3.2.2] ノナ-3-イル)-(1H-インドール-3-イル)-メタノン；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸シクロヘプチルアミド；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸アダマンタン-1-イルアミド；
- ・ (3-アザ-ビシクロ [3.2.2] ノナ-3-イル)-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-メタノン

；

- ・ (1-メチル-1H-インドール-3-イル)-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸 (3-ヒドロキシ-アダマンタン-1-イル)-アミド

；

- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸アゼパン-1-イルアミド；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸 (2-オキソ-アゼパン-3-イル)-アミド；
- ・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-メタノン；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸 (2,6-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-アミド；
- ・ 1-メチル-1H-インドール-3-カルボン酸 (2-メチル-ピペリジン-1-イル)-アミド；
- ・ (1-シクロプロピルメチル-6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6

-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・ アゼパン-1-イル-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-メタノン；

・ (5-ベンジルオキシ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (5H-[1,3]ジオキソール o[4,5]インドール-7-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (6-トリフルオロメチル-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (6-メチル-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (6-ニトロ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (6-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (7-ニトロ-1H-インドール-3-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ (1H-インドール-4-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；

・ 2-(1H-インドール-3-イル)-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-エタノン；

- ・ 1-(3-アザ-ビシクロ [3.2.2] ノナ-3-イル)-2-(1H-インドール-3-イル)-エタノン；

・ 1-(3-アザ-ビシクロ [3.2.2] ノナ-3-イル)-2-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-エタノン；

・ 2-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)-1-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-エタノン；

・ [3-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-6-イルオキシ]-酢酸 tert-ブチルエステル；

・ 6-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸；

- ・ 6-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸；
- ・ 4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ 4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸；
- ・ 4-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸エチルエステル；
- ・ [3-(ピペリジン-1-カルボニル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸シアノメチルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸ベンジルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸ジメチルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸アリルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(2-メトキシ-エチル)-アミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸4-メトキシ-ベンジルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミド；
- ・ [3-(2-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ [3-(2,6-ジメチル-モルホリン-4-カルボニル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(1,1-ジオキソ-テトラヒドロ-チオフェン-3-イル)-アミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸[3-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-プロピル]-アミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸4-トリフルオロメチル-ベンジルアミド；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(フラン-2-イルメチル)-アミド；
- ・ [3-(2,3,5,6-テトラヒドロ-[1,2']ピピラジニル-4-カルボニル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

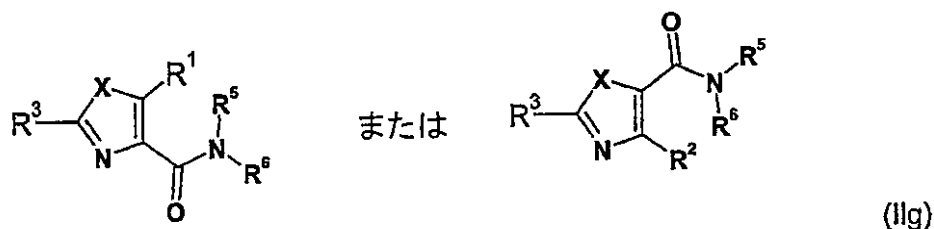
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(2H-テトラゾール-5-イルメチル)-アミド；
- ・ [3-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 3-{[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボニル]-アミノ}-プロピオン酸エチルエステル；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸(4-メトキシ-フェニル)-アミド；
- ・ 3-{[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボニル]-アミノ}-プロピオン酸；
- ・ アゼパン-1-イル-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ 1H-インドール-5-カルボン酸ジベンジルアミド；
- ・ (3-アザ-ビシクロ[3.2.2]ノナ-3-イル)-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ (4-ベンジル-ピペリジン-1-イル)-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ 8-(1H-インドール-5-カルボニル)-1-フェニル-1,3,8-トリアザスピロ[4.5]デカン-4-オン；
- ・ [4-(4-クロロ-フェニル)-4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル]-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ 1-[1-(1H-インドール-5-カルボニル)-ピペリジン-4-イル]-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン；
- ・ (4-tert-ブチル-ピペリジン-1-イル)-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ 1-(1H-インドール-5-カルボニル)-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボニトリル；
- ・ (1H-インドール-5-イル)-(4-フェニル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ (5-ベンジル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)-(1H-インドール-5-イル)-メタノン；
- ・ (1H-インドール-5-イル)-(4-ピロリジン-1-イル-ピペリジン-1-イル)-メタノン；
- ・ 1H-インドール-5-カルボン酸(5-ヒドロキシ-1,3,3-トリメチル-シクロヘキシルメチル)-アミド；
- ・ 1H-インドール-5-カルボン酸(3,4-ジヒドロスピロ(1H-インデン-1,4-ピペリジン)-アミド；
- ・ (3-メタンスルホンイルメチル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (3-ジメチルアミノメチル-1H-インドール-6-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 1-{3-アセチル-2-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-イル]-2,3-ジヒドロ-イミダゾール-1-イル}-エタノン；
- ・ 1-エチル-3-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-イル]-ピロリジン-2,5-ジオン；
- ・ (3-チアゾール-2-イル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (3-Iodo-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 6-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボニトリル；
- ・ 5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボニトリル；
- ・ 6-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-3-カルボン酸アミド；
- ・ [3-(2H-テトラゾール-5-イル)-1H-インドール-6-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；

- ・ N-[3-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-1H-インドール-7-イル]-アセタミド；
- ・ (1-ベンゼンスルホニル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (1-ベンゼンスルホニル-2-メチル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (1-メチル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ (1-ベンジル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ [6-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-インドール-1-イル]-酢酸エチルエステル；
- ・ [1-(2-エトキシ-エチル)-1H-インドール-6-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ {1-[2-(2-メトキシ-エトキシ)-エチル]-1H-インドール-6-イル}-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 3-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-インドール-1-イル]-プロピオン酸エチルエステル；
- ・ (1-フェネチル-1H-インドール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ [1-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 2-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-インドール-1-イル]-アセタミド；
- ・ [1-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジル)-1H-インドール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ 3-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-インドール-1-イルメチル]-安息香酸メチルエステル；および
- ・ 4-[5-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ [3.2.1] オクタン-6-カルボニル)-インドール-1-イルメチル]-ベンゾニトリル。

【請求項 24】

請求項 6 または 7 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が次式 (IIg) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

【化 9】



ここで、

X は、NR⁴、S または O であり；

R¹ および R² は、独立に、水素、ハロ、シアノ、トリハロメチル、C₁-C₆ アルキル、または C₁-C₆ アルキルオキシであり、ここでのアルキル基は独立に 1 以上の R⁷ で任意に置換され；

R³ は、水素、C₁-C₆ アルキル、C₃-C₁₀ シクロアルキル、C₁-C₆ アルキルオキシ、C₁-C₆ アルキルチオ、アリール、アリール C₁-C₆ アルキル、hetアリール、または hetアリールアル

キルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、アリール、hetアリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^4 は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、hetアリール、シクロアルキル、およびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^5 は水素であり、且つ R^6 はヒドロキシで任意に置換されたアダマンチル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール、hetアリールオキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシであり、ここでのアルキル、アリール、およびhetアリール基は独立に1以上の R^7 で任意に置換されるか；または

R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、6~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリールアルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^7 は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、 NR^9R^{10} 、シアノ、 $COOR^8$ 、 $CONR^9R^{10}$ 、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリールオキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシであり；

R^8 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリールアルキルであり、ここでのアルキル、アリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^9 および R^{10} は、独立に、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキルおよびhetシクロアルキル基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_8 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換され；

R^{11} は、水素、ハロ、オキソ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルである；

但し、hetシクロアルキルは、7-アザ[2,2,1]ビシクロヘプタンではない。

【請求項25】

請求項24に記載の組合せであって、前記11 β -HSD1阻害剤は前記式(IIg)の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

但し、前記式(IIg)において、

Xは、NR⁴、SまたはOであり；

R¹およびR²は、独立に、水素、ハロ、シアノ、トリハロメチル、C₁-C₆アルキル、またはC₁-C₆アルキルオキシであり、ここでのアルキル基は独立に1以上のR⁷で任意に置換され；

R³は、水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₁₀シクロアルキル、C₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリール、またはhetアリールアルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、アリール、hetアリール、およびhetアリールアルキル基は独立に1以上のR⁷で任意に置換され；

R⁴は、水素、C₁-C₈アルキル、C₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、アリールC₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、C₃-C₁₀シクロアルキル、C₃-C₁₀hetシクロアルキル、C₃-C₁₀シクロアルキルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボキシC₁-C₆アルキルであり、ここでのアルキル、アリール、hetアリール、シクロアルキル、およびhetシクロアルキル基は独立に1以上のR⁷で任意に置換され；

R⁵は水素であり、またR⁶は、ヒドロキシで任意に置換されたアダマンチル、C₁-C₆アルキルオキシ、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、アリールオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリール、hetアリールオキシ、またはhetアリールC₁-C₆アルキルオキシであり、ここでのアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に1以上のR⁷で任意に置換されるか；または

R⁵およびR⁶は、それらが結合している窒素と一緒にあって、5~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールアルキル、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、hetアリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリールC₁-C₆アルキルカルボニル、hetアリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリールC₁-C₆アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されると共に、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上のR⁷で任意に置換され；

R⁷は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、NR⁵R⁶、シアノ、COOR⁸、CONR⁵R⁶、C₁-C₈アルキル、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールオキシ、またはhetアリールオキシであり；

R⁸は、水素、C₁-C₆アルキル、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールアルキルであり、ここでのアルキル、アリール およびhetアリールアルキル基は独立に1以上のR⁷で任意に置換される；

但し、hetシクロアルキルは、7-アザ[2,2,1]ビシクロヘプタンではない。

【請求項 26】

請求項 24 または 25 に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

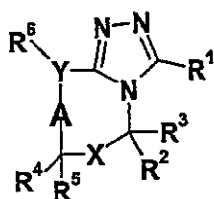
- ・(4-メチル-2-フェニル-チアゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・(2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・(4-メチル-2-ピラジン-2-イル-チアゾール-5-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・[4-メチル-2-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-チアゾール-5-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・(3-アザ-ビシクロ[3.2.2]ノナ-3-イル)-(2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル)-メタノン；

- ・ (1H-イミダゾール-4-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
 - ・ (3-アザ-ビシクロ[3.2.2]ノナ-3-イル)-(4-メチル-2-フェニル-チアゾール-5-イル)-メタノン；
 - ・ 2,4-ジメチル-チアゾール-5-カルボン酸シクロヘプチルアミド；
 - ・ アゼパン-1-イル-(2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル)-メタノン；
 - ・ 2,4-ジメチル-チアゾール-5-カルボン酸アダマンタン-1-イルアミド；
 - ・ (3-アザ-ビシクロ[3.2.2]ノナ-3-イル)-(1H-イミダゾール-4-イル)-メタノン；
 - ・ 2,4-ジメチル-チアゾール-5-カルボン酸(3-ヒドロキシ-アダマンタン-1-イル)-アミド；
- (1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；
- ・ [1-(6-メチル-ピリジン-2-イル)-1H-イミダゾール-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン；および
 - ・ [1-(4-クロロ-ベンジル)-5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル]-(1,3,3-トリメチル-6-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル)-メタノン

【請求項 27】

請求項 1 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が次式 (III) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その光学異性体、その光学異性体の混合物、そのラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

【化 10】



式(III)

ここで、

R¹は、C₅-C₁₀シクロアルキル、C₅-C₁₀hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、またはhetアリールC₁-C₆アルキルであり、ここでのシクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、hetアリール およびアリールアルキル基は独立に 1 以上の R⁷で任意に置換され；

R²および R³は、独立に、水素、C₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、アリールオキシ、hetアリールオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、またはhetアリールC₁-C₆アルキルオキシであり、ここでのアルキル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、およびhetアリールアルキル基は独立に 1 以上の R⁸で任意に置換されるか；または

R²および R³は、それらが結合している窒素と一緒にあって、3~6の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、hetアリール、アリールC₁-C₆アルキル、hetアリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキシ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、またはhetアリールC₁-C₆アルキルオキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R⁴および R⁵は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルオキシ、アリール、hetアリール、アリールオキシC₁-C₆アルキル、アリールオキシアリール、hetアリールオキシアリール、アリールオキシhetアリール、hetアリールオキシhetアリール、またはアリールC₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール およびhetアリール基は独立に 1 以上の R⁹で任意に置換されるか；または

R^4 および R^5 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、5～8の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 $NR^{10}R^{11}$ 、ハロ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R^4 と R^2 もしくは R^3 とが一緒になって、1～4の炭素原子を含む飽和または部分的に飽和されたブリッジを形成しており、該ブリッジは C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルの少なくとも一つで任意に置換されることができ；

R^6 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであるか；または

R^6 および R^4 もしくは R^5 は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって5～8の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された、または芳香族の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 $NR^{10}R^{11}$ 、ハロ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^7 および R^8 は、独立に、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリールオキシ、hetアリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキル-カルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^9 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、メチレンジオキソ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ、 $NR^{10}R^{11}$ 、またはアリールオキシ C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアリール基は1以上の R^{12} で任意に置換され；

R^{10} および R^{11} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール or アリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に1以上の R^{13} で任意に置換されるか；または

R^{10} および R^{11} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4～10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキル-カルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^{12} は、オキソまたはハロであり；

R^{13} は、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、 $NR^{14}R^{15}$ 、メチレンジオキソ、トリハロメチル、またはトリハロメトキシであり；

R^{14} および R^{15} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

Aは、単結合、二重結合または三重結合であり；

Xは、化学結合、 $(CR^{16}R^{17})_n$ 、または NR^{10} であり、ここでの R^{16} および R^{17} は独立に水素、オキソ、または C_1-C_6 アルキルであるか；または

Xは、 R^2 もしくは R^3 と一緒に二重結合であり；

Yは、 CR^{18} または窒素であり、ここでの R^{18} は水素、 C_1-C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルであるか；または

R^{18} と R^2 もしくは R^3 の何れかが一緒になって、1~4の炭素原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環系を形成しており、該環系は C_1-C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R^{18} と R^2 もしくは R^3 の何れかおよび R^4 もしくは R^5 の何れかと一緒になって、一つの8~12の炭素原子を含む一つの共通の炭素原子を有する飽和または部分低に飽和した環系を形成しており、該環系は C_1-C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1-C_6 アルキル、またはhetアリール C_1-C_6 アルキルの少なくとも一つで任意に置換されることができ；

nは、0、1または2である。

【請求項 28】

請求項 27に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その光学異性体、その光学異性体の混合物、そのラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

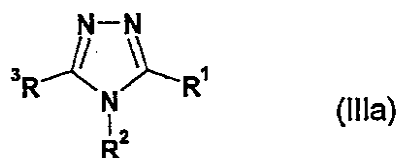
- ・ 3-(2-ブロモ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-フェニル-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ (2-メトキシ-ベンジル)-(3-フェニル-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-b]ピリダジン-6-イル)-アミン；
- ・ 3-(2-フルオロ-フェニル)-5-(4-メトキシ-フェノキシ)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-c]キナゾリン；
- ・ 3-フェニル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(3-クロロ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(3,4-ジクロロ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 5,5-ジメチル-3-チオフェン-2-イル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 3-(2-クロロ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 5,5-ジメチル-3-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 3-フラン-2-イル-5,5-ジメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 3-(3-ブロモ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(4-ブロモ-フェニル)-5,5-ジメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 4-(5,5-ジメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン-3-イル)-フェノール；
- ・ 3-(4-メトキシ-フェニル)-5,5,8,9-テトラメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 5,5-ジメチル-3-フェニル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；

- ・ 3-(5,5-ジメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン-3-イル)-フェノール；
- ・ 5,5-ジメチル-3-p-トリル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 5,5-ジメチル-3-チオフエン-2-イル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 7,10-ジメトキシ-5,5-ジメチル-3-フェニル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-フェニル)-6,6-ジメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリミジン；
- ・ 2-(6,6-ジメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリミジン-3-イル)-フェノール；
- ・ 3-(2-クロロ-フェニル)-6,6-ジメチル-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリミジン；
- ・ 4-ベンジル-3,5-ジ-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-p-トリル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(4-メトキシ-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-ピリジン-4-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(4-ブromo-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-フラン-2-イル-5,5,8,9-テトラメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン；
- ・ 6,6-ジメチル-3-(2-ニトロ-フェニル)-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリミジン；および
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-フェニル)-5,5-ジメチル-5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン。

【請求項 29】

請求項 27 に記載の組合せであって、前記 11β-HSD1 阻害剤が次式 (IIIa) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化 11】



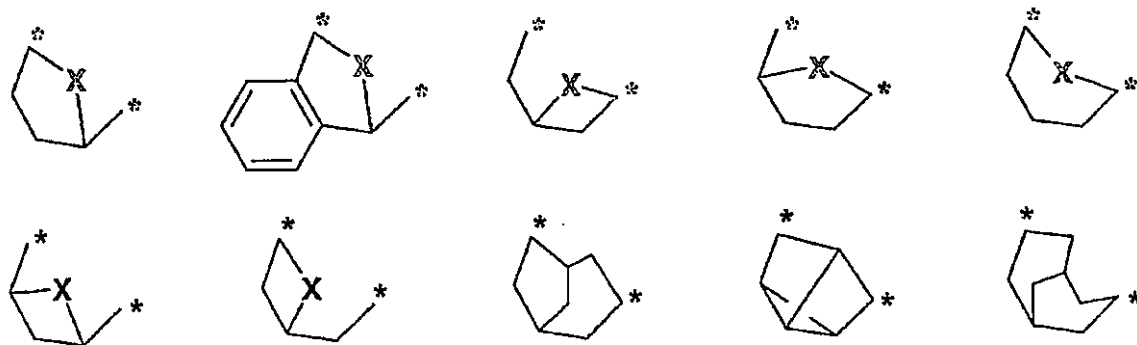
ここで、

R¹ は、アリールまたは het アリールであり、ここでのアリールおよび het アリール基は独立に 1 以上の R⁷ で任意に置換され；

R² および R³ は、それらが結合している原子と一緒にあって、C₅-C₁₀ シクロアルキルまたは C₅-C₁₀ het シクロアルキルを形成しており、ここでのシクロアルキルおよび het シクロアルキル環は独立に 1 以上の R⁸ で任意に置換されるか；または

R² および R³ は、星印 (*) でマークした炭素原子において下記の環システムの一つに結合され、

【化 1 2】



ここでの環系は独立に 1 以上の R^8 で任意に置換され；

R^7 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリールオキシ、hetアリールオキシ、 NR^9R^{10} 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^8 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、ハロ、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、 NR^9R^{10} 、トリハロメチル、トリハロメトキシ、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^9 および R^{10} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、またはアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に 1 以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^{11} は、 C_1 - C_6 アルキル、オキソ、またはハロであり；

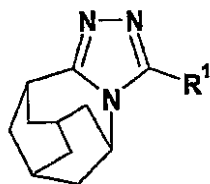
Xは、 $(CR^{12}R^{13})_n$ であり、ここでの R^{12} および R^{13} は独立に水素、オキソ、ヒドロキシまたは C_1 - C_6 アルキルであり；

n は、1または2である。

【請求項 30】

請求項 27 に記載の組合せであって、前記 11β-HSD1 阻害剤が次式 (IIIb) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

【化 1 3】



(IIIb)

ここで、

R^1 は、アリールまたはhetアリールであり、ここでのアリールおよびhetアリール基は独立に 1 以上の R^7 で任意に置換され；

R^7 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、アリールオキシ、hetアリールオキシ、 NR^9R^{10} 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリールオキシ C_1 - C_6 アルキル、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、hetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^9 および R^{10} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、またはアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキルおよびアリール基は独立に 1 以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^{11} は、 C_1 - C_6 アルキル、オキシまたはハロである。

【請求項 3 1】

請求項 2 9 または 3 0 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ；

- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(2-フェノキシメチル-フェニル)-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン-9-オン；
- ・ 3-(2-フェノキシメチル-フェニル)-6,7,8,9,10,11-ヘキサヒドロ-5H-5,9:7,11-ジメタノ[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゾニン；
- ・ 3-(5-ブromo-ピリジン-3-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(5-ヘキサ-1-イニル-ピリジン-3-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(6-モルホリン-4-イル-ピリジン-3-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリ

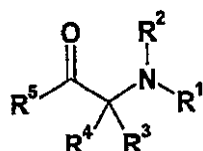
アゾロ [4,3-a]アゼピン；

- ・ 3-ピリジン-3-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-[1,2,4]トリアゾロ [4,3-a]アゼピン；
- ・ 3-(2-ベンジルオキシメチル-フェニル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-5,9-メタノ [1,2,4]トリアゾロ [4,3-a]アゼピン；および
- ・ 3-フェニル-[1,2,4]トリアゾロ [3,4-a]イソキノリン。

【請求項 3 2】

請求項 2 7 に記載の組合せであって、前記 11β -HSD1 阻害剤が次式 (IV) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その光学異性体、その光学異性体の混合物、ラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

【化 1 4】



式 (IV)

ここで、

R^1 および R^2 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} het-シクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、または hetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールおよび hetアリール基は独立に 1 以上の R^6 で任意に置換されるか；または

R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~8 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキシ、 C_1 - C_6 アルキル-オキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^3 および R^4 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルケニル、 C_1 - C_6 アルキニル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、または hetアリール C_1 - C_6 アルキルであり、ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、および hetアリール基は独立に 1 以上の R^7 で任意に置換され；

R^5 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、または hetアリールであり、ここでのアリール、hetアリール、シクロアルキル、および hetシクロアルキル基は独立に 1 以上の R^8 で任意に置換されるか；または

R^3 および R^5 は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4~10 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換されるか；または

R^2 、 R^3 および R^5 は、それらが結合している原子と一緒にあって、6~10 の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒ

ドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキル-オキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリール-カルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^6 は、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、アダマンチル、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、 NR^9R^{10} 、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり；

R^7 および R^8 は、独立に、水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、 NR^9R^{10} 、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、hetアリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキル-カルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシであり、ここでのアリールおよびhetアリール基は独立に C_3 - C_{10} シクロアルキルまたは C_3 - C_{10} hetシクロアルキルで任意に置換され；

R^9 および R^{10} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであるか；または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、5~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、hetアリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、hetアリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項 3 3】

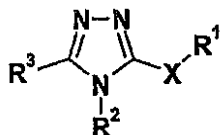
請求項 3 2 に記載の組合せであって、前記 11β -HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、光学異性体、光学異性体の混合物、ラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

- ・ 1-アダマンタン-1-イル-2-モルホリン-4-イル-エタノン；
- ・ 1-アダマンタン-1-イル-2-ベンジルアミノ-プロパン-1-オン；
- ・ 1-アダマンタン-1-イル-2-ベンジルアミノ-エタノン；
- ・ 2-ピロリジン-1-イル-1-(3-p-トリル-アダマンタン-1-イル)エタノン；
- ・ 1-アダマンタン-1-イル-2-モルホリン-4-イル-プロパン-1-オン；
- ・ 1-[4-(5-アダマンタン-1-イル-[1,2,3]トリアゾール-1-イル)-フェニル]-2-フェニルアミノ-エタノン；
- ・ 6-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-8-ベンジル-8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン-2-オン；
- ・ 2-tert-ブチルアミノ-1-(3-p-トリル-アダマンタン-1-イル)エタノン；
- ・ 2-モルホリン-4-イル-1-(3-p-トリル-アダマンタン-1-イル)エタノン；および
- ・ 1-アダマンタン-1-イル-2-[4-(4-ニトロ-フェニル)-ピペラジン-1-イル]エタノン。

【請求項 3 4】

請求項 1 に記載の組合せであって、前記 11β -HSD1阻害剤が次式 (V) の化合物、またはその薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ：

【化 15】



式 (V)

ここで、

Xは、OまたはSであり；

R^1 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 R^4R^5 Nカルボニル C_1 - C_6 アルキル、アリールカルボニル C_1 - C_6 アルキル、hetアリールカルボニル C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、およびhetアリール基は独立に1以上の R^6 で任意に置換され；

R^2 は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルケニル、アリール C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、およびhetアリール基は独立に1以上の R^7 で任意に置換され；

R^3 は、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、アリール R^8C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール R^8C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、およびhetアリール基は独立に1以上の R^9 で任意に置換され；

R^4 および R^5 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_5 - C_8 hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、またはhetアリールアルキル基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^4 および R^5 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキル-カルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキルカルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、 NO_2 、 NH_2 、シアノ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、トリハロメチル、トリハロメトキシ、ヒドロキシ、オキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_3 - C_{10} hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキル SO_2 、 $R^{15}R^{16}NSO_2$ 、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、hetアリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル NR^{15} 、カルボキシ C_1 - C_6 アルキル、またはカルボキシアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

R^8 は、酸素、 NR^{10} 、 $C(=O)NR^{10}$ 、または SO_nNR^{10} で、ここでのnは1または2であり；

R^{10} は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

R^{15} および R^{16} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルキル、 C_5 - C_8 hetシクロアルキル、アリール、またはhetアリールであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、またはhetアリール基は独立に1以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^{15} および R^{16} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4~8の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0~2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的

に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキル-カルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項 35】

請求項 34 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤は前記式 (V) の化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、光学異性体、光学異性体の混合物、ラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

但し、前記式 (V) において、

X は、O または S であり；

R^1 は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 NR^4R^5 カルボニル C_1 - C_6 アルキル、アリールカルボニル C_1 - C_6 アルキル、hetアリールカルボニル C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、およびhetアリール基は独立に 1 以上の R^6 で任意に置換され；

R^2 は、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルケニル、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、アルケニル、アリールおよびhetアリール基は独立に 1 以上の R^7 で任意に置換され；

R^3 は、 C_5 - C_8 シクロアルキル、 C_5 - C_8 hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、アリール R^8C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール R^8C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリールおよびhetアリール基は独立に 1 以上の R^9 で任意に置換され；

R^4 および R^5 は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_5 - C_{10} シクロアルキル、 C_5 - C_8 hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、hetアリール、アリールアルキル、またはhetアリールアルキル基は独立に 1 以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R^4 および R^5 は、それらが結合している窒素と一緒に、4~10の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される 0~2 の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系は C_1 - C_6 アルキル、アリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルオキシ C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリール C_1 - C_6 アルキル-カルボキシの少なくとも一つで任意に置換され；

R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{11} は、独立に、水素、ハロ、 NO_2 、 NH_2 、シアノ、トリハロメチル、トリハロメトキシ、ヒドロキシ、オキソ、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、hetアリール C_1 - C_6 アルキル、 $SO_2NR^{15}R^{16}$ 、 C_1 - C_6 アルキルオキシ、アリールオキシ、hetアリールオキシ、アリール C_1 - C_6 アルキルオキシ、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリール C_1 - C_6 アルキルカルボニル、アリールカルボニル N^{15} 、カルボキシ C_1 - C_6 アルキル、またはカルボキシアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

R^8 は、酸素、 NR^{10} 、 $C(=O)NR^{10}$ 、または SO_nNR^{10} で；ここでの n は 1 または 2 であり；

R^{10} は、水素、 C_1 - C_6 アルキル、アリール、hetアリール、アリール C_1 - C_6 アルキル、またはhetアリール C_1 - C_6 アルキルであり；

R^{15} および R^{16} は、独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_5 - C_{10} シクロアルキル、 C_5 - C_8 hetシクロアルキル、アリール、またはhetアリールであり；ここでのアルキル、シクロアルキル、hetシクロアルキル、アリール、またはhetアリール基は独立に 1 以上の R^{11} で任意に置換されるか；または

R¹⁵およびR¹⁶は、それらが結合している窒素と一緒にあって、4～8の炭素原子および窒素、酸素もしくは硫黄から選択される0～2の追加のヘテロ原子を含む飽和もしくは部分的に飽和された環式、二環式または三環式の環系を形成しており、該環系はC₁-C₆アルキル、アリール、アリールC₁-C₆アルキル、ヒドロキシ、オキシ、C₁-C₆アルキルオキシ、アリールC₁-C₆アルキルオキシ、C₁-C₆アルキルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アリールC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルキルカルボキシ、アリールカルボキシ、またはアリールC₁-C₆アルキル-カルボキシの少なくとも一つで任意に置換される。

【請求項36】

請求項34または35に記載の組合せであって、前記11β-HSD1阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、光学異性体、光学異性体の混合物、ラセミ混合物、またはその互変異性体である組合せ：

- ・3-(4-アリール-5-メルカプト-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(2,4-ジクロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・4-メチル-3-(4-メチル-2-フェニル-チアゾール-5-イル)-5-プロパ-2-イニルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・N-{1-[5-(4-tert-ブチル-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-エチル}-4-クロロ-ベンゼンスルホンアミド；
- ・4-メチル-3-メチルスルファニル-5-[3-(3-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-チオフェン-2-イル]-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・N-(4-クロロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-チオフェン-3-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-[4-メチル-5-(2-オキシ-2-フェニル-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-4H-ベンゾ[1,4]チアジン-3-オン；
- ・3-(4-フルオロ-ベンジルスルファニル)-5-(2-フルオロ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(2-フルオロ-フェニル)-4-メチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・4-メチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(2,4-ジクロロ-フェニル)-4-フラン-2-イルメチル-5-メチルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(4-tert-ブチル-フェニル)-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-フラン-2-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・4-メチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(5-メチル-イソオキサゾール-3-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(3-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(4-フルオロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-(4-tert-ブチル-ベンジルスルファニル)-4-メチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・4-メチル-3-(2-メチル-ベンジルスルファニル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・2-(5-ベンジルスルファニル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-4H-ベンゾ[1,4]チアジン-3-オン；
- ・2-[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-4H-ベンゾ[1,4]チアジン-3-オン；
- ・5-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ベンゾ[1,2,5]オキサジアゾール；

- ・ 1-(4-クロロ-フェニル)-2-[4-メチル-5-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-エタノン；
- ・ 3-[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；
- ・ 3-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2,8-ジメチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；
- ・ 4-アリル-5-(2,4-ジクロロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 3-(5-アリルスルファニル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-ベンジル-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 3-(4-アリル-5-メチルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(2,4-ジクロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 3-(4-アリル-5-メルカプト-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(4-クロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 3-(4-アリル-5-プロパ-2-イニルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(4-クロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 3-(5-アリルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(2,4-ジクロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 1-(2,4-ジクロロ-ベンジル)-3-[4-エチル-5-(2-オキソ-2-フェニル-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 3-(4-アリル-5-プロパ-2-イニルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-1-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-1H-ピリジン-2-オン；
- ・ 4-アリル-5-(4-メチル-2-フェニル-チアゾール-5-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 3-アリルスルファニル-4-メチル-5-(4-メチル-2-フェニル-チアゾール-5-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-アリル-5-[2-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-チアゾール-4-イル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ N-[5-(4-tert-ブチル-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド；
- ・ 4-メチル-3-[3-(4-メチル-ベンジルオキシ)-チオフエン-2-イル]-5-メチルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 5-[3-(2,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-チオフエン-2-イル]-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 3-[3-(2,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-チオフエン-2-イル]-4-メチル-5-メチルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-メチル-5-[3-(3-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-チオフエン-2-イル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ヨード-フェニル)-アセタミド；
- ・ 3-(5-アリルスルファニル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-2,7-ジメチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；
- ・ 3-(5-ベンジルスルファニル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-2,7-ジメチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；
- ・ 3-(5-ベンジルスルファニル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-2-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；
- ・ 4-ブチル-5-(3-クロロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 4-アリル-5-(3-クロロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ N-(5-{2-[5-(4-メトキシ-フェニル)-3-チオフエン-2-イル-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル]-2-オキソ-エチルスルファニル}-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-ベンズアミド；

- ・N-(5-{2-[3,5-Bis-(4-メトキシ-フェニル)-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル]-2-オキソ-エチルスルファニル}-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-3-メトキシ-ベンズアミド；
- ・N-(5-{2-[5-(4-メトキシ-フェニル)-3-チオフェン-2-イル-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル]-2-オキソ-エチルスルファニル}-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-4-(ピロリジン-1-スルホニル)-ベンズアミド；
- ・N-(5-{2-[5-(4-メトキシ-フェニル)-3-チオフェン-2-イル-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル]-2-オキソ-エチルスルファニル}-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-4-(ピペリジン-1-スルホニル)-ベンズアミド；
- ・N-(5-{2-[5-(4-メトキシ-フェニル)-3-チオフェン-2-イル-4,5-ジヒドロ-ピラゾール-1-イル]-2-オキソ-エチルスルファニル}-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-4-(モルホリン-4-スルホニル)-ベンズアミド；
- ・4-ベンジル-3-(4-フルオロ-ナフタレン-1-イルメチルスルファニル)-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・2-[4-アリル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-ナフタレン-1-イル-エタノン；
- ・1-(4-フルオロ-フェニル)-4-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-ブタン-1-オン
- 2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(5,6,7,8-テトラヒドロ-ナフタレン-2-イル)-エタノン；
- ・5-(2-カルバゾール-9-イル-エチル)-4-(2-メチル-アリル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・1-(4-メトキシ-フェニル)-2-[4-(2-メチル-アリル)-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-エタノン；
- ・2-{2-[4-アリル-5-(3-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセチルアミノ}-安息香酸メチルエステル；
- ・5-(2,4-ジクロロ-フェニル)-4-(2-メチル-アリル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・4-アリル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-(3-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・2-[4-アリル-5-(3-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(9H-フルオレン-2-イル)-エタノン；
- ・3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・2-[4-アリル-5-(3-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-エチル-フェニル)-エタノン；
- ・2-(4-アリル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[4-アリル-5-(4-tert-ブチル-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-クロロ-フェニル)-エタノン；
- ・2-(4-アリル-5-フェニルアミノメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2,4-ジフルオロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(4-アリル-5-フェノキシメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・2-(4-アリル-5-フェノキシメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-ブromo-フェニル)-エタノン；
- ・(4-アリル-5-ベンジルスルファニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-フェニル-アミン；
- ・2-(4-アリル-5-ベンゾトリアゾール-1-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；

- ・ 2-(4-アリル-5-フェニルアミノメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 1-(4-メトキシ-フェニル)-2-[4-(2-メチル-アリル)-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-エタノン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ [5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸イソプロピルエステル；
- ・ N-(4-クロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ N-(4-アセチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 4-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-フラン-2-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-2-[4-メチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-(4-フラン-2-イルメチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-[2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセチルアミノ]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-チアゾール-2-イル-アセタミド；
- ・ N-(4-クロロ-フェニル)-2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-エトキシ-フェニル)-2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ブromo-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-{5-[(2,6-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フルオロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ N-(4-Iodo-2-メチル-フェニル)-2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-エタノン；
- ・ N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-2-(4-フラン-2-イルメチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-クロロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]

ル]-N-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；

・2-[5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；

・2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-ナフタレン-1-イル-アセタミド；

・N-(5-エチル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；

・[5-(4-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸シクロヘキシルエステル；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(3-クロロ-フェニル)-アセタミド；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-m-トリル-アセタミド；

・N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・3-ベンジルスルファニル-4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・3-ブチルスルファニル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-エトキシ-フェニル)-アセタミド；

・N-(4-アセチル-フェニル)-2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2,4-ジメチル-フェニル)-アセタミド；

・N-(3-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；

・N-ナフタレン-1-イル-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-酢酸シクロヘキシルエステル；

・1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；

・N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-[5-(4-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；

・3-ベンジルスルファニル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・2-(4,5-ジベンジル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-チアジアゾール-2-イル-アセタミド；

・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-m-トリル-アセタミド；

- ・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-プロピオンアミド；
- ・3-(5-ベンジルスルファニル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-ピリジン；
- ・(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-酢酸エチルエステル；
- ・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-プロピオンアミド；
- ・1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-エタノン；
- ・2-[5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；
- ・N-(3-クロロ-2-メチル-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-(4-エチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N,N-ジフェニル-プロピオンアミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・N-(4-フルオロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・N-(4-アセチル-フェニル)-2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・N-(3-クロロ-2-メチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-p-トリル-プロピオンアミド；
- ・[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸エチルエステル；
- ・2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-ナフタレン-1-イル-プロピオンアミド；
- ・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-p-トリル-プロピオンアミド；
- ・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-フェニル-プロピオンアミド；
- ・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フェニル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；

- ・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-p-トリル-アセタミド；
- ・N-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・4-{2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセチルアミノ}-安息香酸エチルエステル；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-o-トリル-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メトキシ-2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-{5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-エタノン；
- ・N-(4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-2-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-エタノン；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-p-トリル-エタノン；
- ・2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(5-エチル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・4-{2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセチルアミノ}-安息香酸メチルエステル；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-アセタミド；
- ・2-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-(4-クロロ-フェニル)-アミン；
- ・N-(2-メトキシ-フェニル)-2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・2-(4-アリル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3,4-ジクロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；

- ・N-(5-クロロ-2-メチル-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・N-(4-メトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・N-(2,4-ジメチル-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・N-(4-エトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・4-[2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセチルアミノ]-安息香酸メチルエステル；
- ・N-(4-クロロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フェニル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ブロモ-4-メチル-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；
- ・2-[5-(2-プロモ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-エトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-ナフタレン-1-イル-アセタミド；
- ・4-[5-(4-tert-ブチル-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・4-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-プロモ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フルオロ-フェニル)-アセタミド；
- ・4-{2-[5-(2-プロモ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセチルアミノ}-安息香酸メチルエステル；
- ・N-(3-クロロ-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-エトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-{5-[(4-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-クロロ-2-メチル-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-プロモ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-フェニル-アセタミド；
- ・3-ベンジル-5-(2-クロロ-6-フルオロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；
- ・4-[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-フルオロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ブromo-フェニル)-アセタミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-プロピオンアミド；
- ・2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；
- ・{5-[(3-クロロ-4-メチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・3-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-フェニル-アセタミド；
- ・N-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・N-(4-クロロ-フェニル)-2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・3-ベンジル-5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・N-(4-エトキシ-フェニル)-2-[5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・{5-[(4-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・3-ベンジルスルファニル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・N-(2-クロロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・N-(2-メトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-エタノン；

- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-クロロ-フェニル)-2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ (5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-アミン；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ [4-アリル-5-(3-ブromo-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-フェニル-アミン；
- ・ 2-(4-フラン-2-イルメチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(3-ニトロ-フェニル)-エタノン；
- ・ 1-(4-ブromo-フェニル)-2-(4-フラン-2-イルメチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・ 4-{5-[2-(2-メトキシ-フェノキシ)-エチルスルファニル]-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル}-フェニルアミン；
- ・ 4-[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニルアミン；
- ・ [4-アリル-5-(1,3-ジオキソ-1H,3H-ベンゾ[de]イソキノリン-2-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸エチルエステル；
- ・ 2-{4-アリル-5-[(4-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；
- ・ 5-(3-ブromo-フェニル)-4-(2-メチル-アリル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 2-(4-アリル-5-ベンゾトリアゾール-1-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 1-(4-フルオロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・ 8-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-5-ニトロ-キノリン；
- ・ 3-(2-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-メチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-[4-アリル-5-(3-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(2,4-ジメチル-フェニル)-エタノン；
- ・ 1-(4-ブromo-フェニル)-2-(5-フラン-2-イル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(5-メチル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(p-トリルアミノ-メチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-エチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(5-エチル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フェニル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2,4-ジメチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-ブromo-フェニル)-2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 2-{5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ 2-{5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-p-トリル-エタノン；
- ・ {5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・ 2-{5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；
- ・ 2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・ [4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]- (4-フルオロ-フェニル)-アミン；
- ・ (5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル)- (4-フルオロ-フェニル)-アミン；
- ・ {4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・ N-(4-クロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ N-(4-アセチル-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-シクロヘキシル-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(2,4-ジメチル-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 4-[2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセチルアミノ]-安息香酸エチルエステル；
- ・ 2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 3-イソブチルスルファニル-4-メチル-5-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-[2-(4-メチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセチルアミノ]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 2-{4-エチル-5-[4-(モルホリン-4-スルホニル)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 4-メチル-3-フェネチルスルファニル-5-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-クロロ-フェニル)-アセタミド；

- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-プロピオンアミド；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2,5-ジクロロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-クロロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-プロピオンアミド；
- ・ N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-2-[5-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ [5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(5-エチル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-アセタミド；
- ・ N-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ [4-ベンジル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸エチルエステル；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-メチル-5-(3,4,5-トリメトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-(2-クロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ N-(2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・ 3-シクロヘキシル-4-メチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-(2-ブromo-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-アセチル-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メトキシ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-クロロ-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-フェニル-アセタミド；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メトキシ-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-シアノ-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル)-2-[5-(2-メトキ

シ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(4-ブromo-フェニル)-2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-フェニル-アセタミド；

・N-(3-クロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(4-アセチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(4-ブromo-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アセタミド；

・N-(2,4-ジメチル-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・4-[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸シクロヘキシルエステル；

・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-フェニル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；

・N-(3-クロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-[4-メチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；

・N-(4-ブromo-フェニル)-2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-アセタミド；

・N-(4-クロロ-フェニル)-2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-アセタミド；

・2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・1-(4-メトキシ-フェニル)-2-[4-メチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-エタノン；

・[5-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-(4-フルオロ-フェニル)-アミン；

・2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-p-トリル-エタノン；

・2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-2-{4-エチル-5-[(4-フルオロ-フェニルアミノ)-メチル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-アセタミド；

・4-アリル-5-(3-ブromo-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；

・N-(2-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-{4-エチル-5-[4-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-p-トリル-エタノン；

・2-{4-エチル-5-[4-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；

- ・ N-ビフェニル-2-イル-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-ブromo-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 4-ベンジル-5-シクロヘキシル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；
- ・ (5-ベンジル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-酢酸シクロヘキシルエステル；
- ・ 4-メチル-3-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-メチル-5-(ナフタレン-2-イルオキシメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メトキシ-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-ブromo-4-メチル-フェニル)-2-(4-メチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-エチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 3-(4-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；
- ・ 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(3,4-ジメチル-フェニル)-アセタミド；
- ・ (2,4-ジメチル-フェニル)-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-アミン
- 2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；

- ・ 2-[5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 4-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-5-(4-クロロ-フェノキシメチル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ブチルスルファニル-4-メチル-5-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 1-(5-クロロ-2-メトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・ 1-(4-クロロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・ N-(2,4-ジメトキシ-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-エトキシ-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-エチル-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-チアゾール-2-イル-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-p-トリル-エタノン；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-クロロ-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-クロロ-フェニル)-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；
- ・ 2-[5-(2-モルホリン-4-イル-エチルスルファニル)-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(2-メチル-5-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(4-プロモ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ N-(3-ニトロ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-フルオロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メトキシ-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
- ・ N-(2,5-ジクロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；
- ・ 2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3

-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-[4-ベンジル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；

・[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-酢酸シクロヘキシルエステル；

・2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；

・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-エチル-フェニル)-アセタミド；

・2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3,4-ジクロロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(5-シクロヘキシル-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；

・2-(4-ベンジル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メトキシ-2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(4-ベンジル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(5-メチル-チアゾール-2-イル)-アセタミド；

・2-(4-ベンジル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-チアゾール-2-イル-アセタミド；

・2-(4,5-ジベンジル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(4-ベンジル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・3-ベンジルスルファニル-5-(4-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・2-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；

・2-(4-ベンジル-5-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；

・2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；

・2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；

・N-(3-クロロ-フェニル)-2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・N-(4-クロロ-フェニル)-2-(5-メチル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；

・2-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メトキシ-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(5-シクロヘキシル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・N-(2,3-ジクロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(2,3-ジクロロ-フェニル)-2-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]

- ル]-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・2-[4-ベンジル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；
 - ・2-[4-ベンジル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-p-トリル-アセタミド；
 - ・2-{5-[(2,4-ジメチル-フェニルアミノ)-メチル]-4-フラン-2-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；
 - ・2-(4-メチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-p-トリル-アセタミド；
 - ・4-{4-エチル-5-[4-(ピペリジン-1-スルホニル)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル}-ベンゾニトリル；
 - ・N-(2-メトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
 - ・N-(4-アセチル-フェニル)-2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
 - ・2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-メチル-3-ニトロ-フェニル)-アセタミド；
 - ・2-[5-(4-アミノ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-ニトロ-フェニル)-エタノン；
 - ・N-{4-[5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-2-メトキシ-ベンズアミド；
 - ・2-(4-アリル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-フルオロ-フェニル)-エタノン；
 - ・2-(4-ベンジル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-フルオロ-フェニル)-アセタミド；
 - ・2-[5-(4-アミノ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-ニトロ-フェニル)-エタノン；
 - ・2-(4-アリル-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-クロロ-フェニル)-アセタミド；
 - ・(4-ベンジル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-酢酸エチルエステル；
 - ・4-[5-(4-tert-ブチル-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
 - ・2-{5-[(3-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-フェニル-エタノン；
 - ・{5-[(2-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸イソプロピルエステル；
 - ・2-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェノキシメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；
 - ・1-(4-クロロ-フェニル)-2-{5-[(2-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-エタノン；
 - ・4-[5-(2-クロロ-6-フルオロ-ベンジルスルファニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン
- 3-ベンジル-5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・3-ベンジルスルファニル-4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
 - ・N-(4-クロロ-3-ニトロ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-アセタミド；
 - ・2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-p-トリル-エタノン；
 - ・1-(4-メトキシ-フェニル)-2-(4-メチル-5-o-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル

スルファニル)-エタノン；

・[5-(2-ブロモ-フェニル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセトニトリル；

・[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセトニトリル；

・1-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-プロパン-2-オン；

・N-(2,3-ジクロロ-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(3-クロロ-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・N-(4-クロロ-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-[5-(4-メトキシ-フェノキシメチル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-フェニル-エタノン；

・2-{5-[(2-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；

・2-[5-(4-メトキシ-フェノキシメチル)-4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；

・N-(2,3-ジクロロ-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；

・{5-[(2-クロロ-フェニルアミノ)-メチル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸シクロヘキシルエステル；

・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-チアゾール-2-イル-アセタミド；

・2-(4-エチル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-メトキシ-フェニル)-アセタミド；

・2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-アセタミド；

・2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(2-メチル-4-ニトロ-フェニル)-アセタミド；

・N-(3-クロロ-2-メチル-フェニル)-2-[4-フラン-2-イルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-アセタミド；

・4-アリル-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；

・4-(2-メチル-アリル)-5-m-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；

・2-[4-アリル-5-(3-ブロモ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-N-(4-エチル-フェニル)-アセタミド；

・4-アリル-3-(3-ブロモ-フェニル)-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・2-[4-アリル-5-(3-ブロモ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル]-1-ピフェニル-4-イル-エタノン；

・4-(2-メチル-アリル)-5-(3-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；

；

・4-アリル-5-(2-カルバゾール-9-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール；

；

・5-(4-ブロモ-フェニル)-4-(2-メチル-アリル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール

;

- ・ 4-(2-メチル-アリル)-5-(3-メチル-2-ニトロ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール;
- ・ 5-(4-メトキシ-フェニル)-4-(2-メチル-アリル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール;
- ・ 2-(4-アリル-5-ベンゾトリアゾール-1-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-(4-ブromo-フェニル)-アセタミド;
- ・ 2-(4-アリル-5-ベンゾトリアゾール-1-イルメチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-ピリジン-2-イル-アセタミド;
- ・ {4-アリル-5-[3-(1,3-ジオキソ-1H,3H-ベンゾ[de]イソキノリン-2-イル)-プロピル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル}-酢酸エチルエステル; および
- ・ 4-アリル-5-(4-フェニル-ピペラジン-1-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール。

【請求項 37】

請求項 34 または 35 に記載の組合せであって、前記 11 β -HSD1 阻害剤が下記の群から選択される化合物、その薬学的に許容可能な酸もしくは塩基との塩、その何れかの光学異性体、ラセミ混合物を含むその光学異性体の混合物、またはその何れかの互変異性体である組合せ:

- ・ 4-[2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)エチル]モルホリン;
- ・ 1-ベンゾチアゾール-2-イル-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン;
- ・ N-シクロヘキシル-2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-N-メチル-アセタミド;
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-フェネチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン;
- ・ 1-(4-メトキシ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-フェネチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン;
- ・ 1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-フェニル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン;
- ・ 2-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エタノン;
- ・ 2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン;

- ・1-(4-メトキシ-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン；
- ・1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-2-(4-フェネチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・2-(4-エチル-5-フラン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・2-(4-エチル-5-フラン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・2-(4-エチル-5-フラン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン；
- ・2-(4-エチル-5-フラン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エタノン；
- ・2-(5-フラン-2-イル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-フェニル-エタノン；
- ・2-(5-フラン-2-イル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メトキシ-フェニル)-エタノン；
- ・2-(5-フラン-2-イル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-ピリジン-3-イル-エタノン；
- ・2-(5-フラン-2-イル-4-フェネチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-1-(4-メタンスルホニル-フェニル)-エタノン；
- ・1-アダマンタン-1-イル-2-(4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニル)-エタノン；
- ・3-[5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・4-[4-エチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・3-[5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-(5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-プロパン-1オール；
- ・3-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-プロパン-1オール；
- ・3-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・3-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・N-{4-[4-エチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・3-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；

- ・ 3-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-プロパン-1オール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 4-[5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[5-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 4-[5-(4-ベンジロキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ N-{4-[4-エチル-5-(4-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 4-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-5-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-(5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(5-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；

- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-[4-(5-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-アセタミド；
- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イル-5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ [1,3]ジオキソール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{4-[4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-フェノキシ-フェニル)-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-フェノキシ-フェニル)-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-フェノキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-ナフタレン-1-イル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-ナフタレン-1-イル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(4-エチル-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；
- ・ 4-エチル-3-ナフタレン-1-イル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-ナフタレン-1-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ [4-(5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-フェニル]-ジメチル-アミン
- {4-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン
- {4-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン
- 4-[5-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ {4-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン；
- ・ {4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン；
- ・ {4-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン；
- ・ {4-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェニル}-ジメチル-アミン；
- ・ 4-(4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ブロモ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-(4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-エチル-3-チオフェン-2-イル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-チオフェン-2-イル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-エチル-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(4-エチル-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；
- ・ 4-エチル-3-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-チオフエン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-メトキシ-フェニル)-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-(4-

メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・3-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・3-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-{4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；

- ・3-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-エチル-3-(4-メトキシ-フェニル)-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；

- ・3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-エチル-3-(4-メトキシ-フェニル)-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・N-{4-[4-エチル-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；

- ・4-エチル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-(4-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-エチル-3-(4-メトキシ-フェニル)-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；

- ・4-[5-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-(4-エチル-5-ピリジン-4-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；

- ・4-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・3-[5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・4-(4-エチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；

- ・3-[5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

- ・3-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-

イル]-ピリジン；

・3-[5-(4-プロモ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(4-[1,2,3]チアジアゾール-4-イル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・4-(4-エチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；

・3-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・N-[4-(4-エチル-5-ピリジン-3-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-アセタミド；

・3-[4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；

・3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・4-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・3-(4-クロロ-フェニル)-5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・4-{4-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；

・3-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・3-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

・4-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；

- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-{4-[5-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-クロロ-フェニル)-5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 5-[5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール-5-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 5-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-フェニル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-{5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル}-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル}-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-(4-{5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル}-フェニル)-アセタミド；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-5-[4-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-フェニル]-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(5-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-5-(4-ブロモ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-(5-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(5-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-[4-(5-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-アセタミド；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・ 3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{4-[4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-{4-[4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(1-フェニル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-5-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[5-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{4-[5-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[5-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；

- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3-クロロ-4-メチル-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-(4-エチル-5-ピリジン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；
- ・ 2-[5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン
- 2-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[5-(4-ブロモ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-[1,2,3]チアジアゾール-4-イル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 4-(4-エチル-5-ピリジン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-安息香酸メチルエステル；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-ピリジン；
- ・ 3-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(4-[1,2,3]チアジアゾール-4-イル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-(5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；

- ・ 3-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 4-[4-エチル-5-(2-メチルスルファニル-ピリジン-3-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[5-(4-ベンジロキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ N-{4-[4-エチル-5-(2-メチルスルファニル-ピリジン-3-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 3-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-2-メチルスルファニル-ピリジン；
- ・ 3-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{4-[4-メチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジルスルファニル-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；

- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-{4-[4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 4-エチル-3-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-エチル-3-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-5-(5-メチル-チオフェン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-{4-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ N-{4-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・4-[4-エチル-5-(1H-インドール-3-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・3-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・N-{4-[4-エチル-5-(1H-インドール-3-イルメチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・3-[4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・3-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-1H-インドール；
- ・2-[5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-[4-エチル-5-(4-[1,2,3]チアジアゾール-4-イル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-(5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-フェノール；
- ・2-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-[4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-フェノール；
- ・2-[4-エチル-5-(4-メタンスルホニル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・4-[4-エチル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・2-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・2-[5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

- ・ 2-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 2-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ N-{4-[4-エチル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-フェニル}-アセタミド；
- ・ 2-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 2-[4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 2-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；
- ・ 5-[5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(4-ブromo-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-(5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-(5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-[4-エチル-5-(4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール-5-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-安息香酸メチルエステル；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(3-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 5-[5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 4-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；
- ・ 3-ベンジル-5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[4-(5-ベンジル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-[1,2,3]チアジアゾール；
- ・ 3-ベンジル-5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-5-ベンジルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-5-(2,6-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

ール；

- ・ 3-ベンジル-4-エチル-5-(4-メチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-4-エチル-5-(2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-ベンジル-5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-(2-クロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 4-[5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-(6-クロロ-ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-(3,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-シクロヘキシルメチルスルファニル-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-(3,5-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-5-(4-トリフルオロメチル-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-5-(3-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(4-ベンジルオキシ-ベンジルスルファニル)-5-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-5-(4-メトキシ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-4-エチル-5-(5-メチル-2-ニトロ-ベンジルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 3-(2-ブromo-フェニル)-5-(2,4-ジクロロ-ベンジルスルファニル)-4-エチル-4H-[1,2,4]トリアゾール；
- ・ 2-[4-(3-メトキシ-プロピル)-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 2-[4-(3-メトキシ-プロピル)-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；
- ・ 2-[5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-1-メチル-ピペリジン；
- ・ 2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；
- ・ 2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；
- ・ 2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-1-メチル-ピペリジン；
- ・ 2-[4-シクロプロピル-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-

イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-シクロプロピル-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

・2-[4-シクロプロピル-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-1-メチル-ピペリジン；

・2-[5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(1-メチル-ピペリジン-2-イル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-1-メチル-ピペリジン；

・2-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-(3-メトキシ-プロピル)-5-(ピリジン-2-イルメチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-(2-メトキシ-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(ピリジン-2-イルメチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[4-シクロプロピル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-シクロプロピル-5-(ピリジン-2-イルメチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[4-シクロプロピル-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-5-(ピリジン-2-イルメチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(2-ヒドロキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(ピリジン-2-イルメチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル]-フェノール；

・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

・3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4-(3-メトキシ-プロ

ピル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・4-(2-メトキシ-エチル)-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[4-シクロプロピル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-シクロプロピル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・4-シクロプロピル-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[5-(2-メトキシ-フェニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・1-{2-[3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-[1,2,4]トリアゾール-4-イル]-エチル}-ピペリジン；

- ・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-シクロプロピルメチル-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・4-シクロプロピルメチル-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-(2-メトキシ-フェニル)-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[4-(3-メトキシ-プロピル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-(3-メトキシ-プロピル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-4-(3-メトキシ-プロピル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-(2-メトキシ-エチル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・4-(2-メトキシ-エチル)-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-(4-シクロプロピル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾニトリル；

- ・2-(4-シクロプロピル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ピリジン；

- ・4-シクロプロピル-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール；

- ・2-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ベンゾニトリル；

- ・2-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル]-ピリジン；

- ・1-{2-[3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-チオフェン-2-イル-[1,2,4]トリアゾール-4-イル]-エチル}-ピペリジン；

- ・2-(4-シクロプロピルメチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル

スルファニルメチル)-ベンゾニトリル；

・2-(4-シクロプロピルメチル-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ピリジン；および

・4-シクロプロピルメチル-3-(2-メトキシ-エチルスルファニル)-5-チオフェン-2-イル-4H-[1,2,4]トリアゾール。

【請求項 38】

請求項 1～37 の何れか 1 項に記載の組合せと、薬学的に許容可能なキャリアとを含有してなる薬学的組成物。

【請求項 39】

11β-HSD1阻害剤と、グルココルチコイド受容体アゴニストと、薬学的に許容可能なキャリアとを合体させることにより製造された薬学的組成物。

【請求項 40】

11β-HSD1阻害剤と、グルココルチコイド受容体アゴニストと、薬学的に許容可能なキャリアとを合体させることを含んでなる、薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 41】

請求項 1～37 の何れか 1 項に記載の組合せの使用であって、活性な細胞内グルココルチコイドのレベルを調節または低下させることが有益である疾患または障害を治療または予防するための薬学的組成物を調製するための使用。

【請求項 42】

請求項 1～37 の何れか 1 項に記載の組合せの使用であって、クッシング病、クッシング症候群、アレルギー性炎症疾患の適応症におけるグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果、呼吸器系疾患のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果、炎症性腸疾患のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；免疫系、結合組織および関節の障害のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；内分泌学的疾患のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；血液学的疾患のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；癌、化学療法に誘起された悪心のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果、筋肉および神経-筋肉接合部における疾患のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；手術および移植に関するグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果；脳アブサンス (brain ab sess)、悪心／嘔吐、感染、高カルシウム血症、副腎肥大、自己免疫性肝炎、脊髄疾患、小嚢性動脈瘤のグルココルチコイド受容体アゴニスト療法の有害な効果を低減するための、薬学的組成物を製造するための使用。

【請求項 43】

請求項 42 に記載の使用であって、前記適応症が、クッシング病、クッシング症候群、喘息、アトピー性皮膚炎、嚢胞性線維症、気腫、気管支炎、過敏症、肺炎、好酸球性肺炎、肺繊維症、クローン病、潰瘍性大腸炎、反応性関節炎、リウマチ性関節炎、シェーグレン症候群、全身性紅斑性狼瘡、ループス腎炎、ヘノッホ-シェーンライン紫斑病、ヴェーゲナー肉芽腫症、側頭動脈炎、全身性硬化症、脈管炎、類肉腫症、皮膚筋炎-多発性筋炎、尋常性天疱瘡、甲状腺機能亢進症、低アルドステロン血症、下垂体機能低下症、溶血性貧血、血小板減少症、発作性夜間血色素尿症、新生物性脊髄圧迫 (neoplastic compression of the spinal cord)、脳腫瘍、急性リンパ芽球性白血病、ホジキン病、化学療法に誘起された悪心、重症筋無力症、遺伝性筋障害、デュシェーン筋ジストロフィー、傷害、術後侵襲、外科的侵襲、腎移植、肝移植、肺移植、膵島移植、血液幹細胞移植、骨髄移植、心臓移植、副腎移植、気管移植、腸移植、角膜移植、皮膚移植、角膜移植、レンズ移植、脳アブサンス、悪心／嘔吐、感染、高カルシウム血症、副腎肥大、自己免疫性肝炎、脊髄疾患、および小嚢性動脈瘤からなる群から選択される使用。

【請求項 44】

請求項 1 に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート (butixicort)、クロベタゾール、フ

ルニソリド、フルカチゾン (flucatisone; および類似体)、モメタゾン (momethasone)、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858 およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 4 5】

請求項 2 ～ 5 の何れか 1 項に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート、クロベタゾール、フルニソリド、フルカチゾン (および類似体)、モメタゾン、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858 およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 4 6】

請求項 6 ～ 2 6 の何れか 1 項に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート、クロベタゾール、フルニソリド、フルカチゾン (および類似体)、モメタゾン、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858 およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 4 7】

請求項 2 7 ～ 3 1 の何れか 1 項に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート、クロベタゾール、フルニソリド、フルカチゾン (および類似体)、モメタゾン、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858 およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 4 8】

請求項 3 2 ～ 3 3 の何れか 1 項に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート、クロベタゾール、フルニソリド、フルカチゾン (および類似体)、モメタゾン、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858 およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 4 9】

請求項 3 4 ～ 3 7 の何れか 1 項に記載の組合せであって、前記グルココルチコイド受容体アゴニストが、ベタメタゾン、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾン、ブチキシコート、クロベタゾール、フルニソリド、フルカチゾン (および類似体)、モメタゾン、トリウムシノロンアセトニド、トリウムシノロンヘキサセトニド、GW-685698、NXC-1015、NXC-1020、NXC-1021、NS-126、P-4112、P-4114、RU-24858、およびT-25シリーズからなる群から選択される組合せ。

【請求項 5 0】

第一の単位投与量形態中のある量の11 β -HSD1阻害剤および薬学的に許容可能なキャリア、担体または希釈材と；第二の単位投与量形態中のある量のグルココルチコイド受容体アゴニストおよび薬学的に許容可能なキャリア、担体または希釈材と；容器とを具備してなるキット。

【請求項 5 1】

活性化細胞内グルココルチコイドのレベルを調節または低下させることが有益である疾

患または障害を治療または予防するための薬学的組成物を製造するための請求項1～37の何れか1項に記載の組合せの使用であって、該使用は、そのような治療を必要としている患者に対して、(i) 第一の量の11 β -HSD1阻害剤および(ii) 第二の量のグルココルチコイド受容体アゴニストを投与することを含んでなり、前記第一および第二の量と一緒に前記治療のために有効である方法。