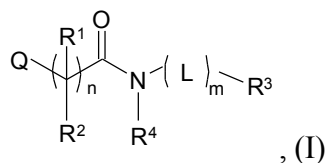


1. Сполука, що має формулу



її N-оксидні форми, фармацевтично прийнятні адитивні солі і стереохімічно ізомерні форми, де

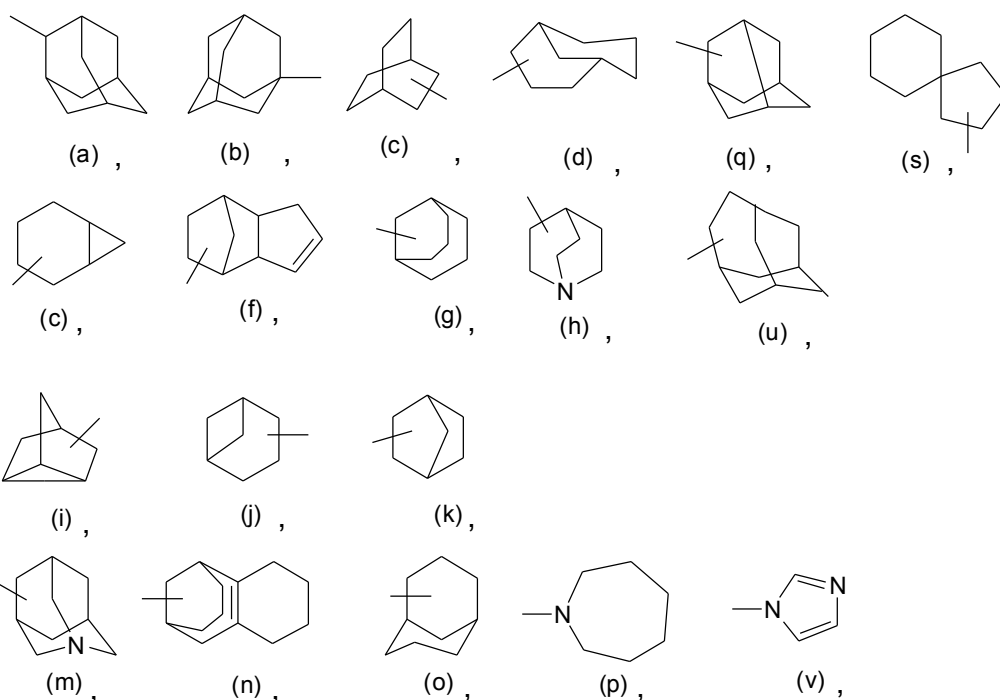
n являє собою ціле число, що становить 1;

m являє собою ціле число, що становить 0 або 1;

R¹ і R² кожен незалежно являє собою C₁₋₄алкіл; або

R¹ і R² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C₃₋₆циклоалкіл;

R³ являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де зазначений одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, фенілу, галогену, оксо, карбонілу, 1,3-діоксолілу і гідрокси;

R⁴ являє собою водень, C₁₋₄алкіл або C₂₋₄алкеніл;

Q являє собою C₃₋₈циклоалкіл, Het¹ або Ar², де зазначені C₃₋₈циклоалкіл, Het¹ або Ar² є необов'язково заміщеними одним або, де можливо, більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, гідрокси, нітро, Het⁴, фенілу, фенілокси, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу, NR⁵R⁶, C₁₋₄алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з C₁₋₄алкілу, гідроксикарбонілу, Het², C₁₋₄алкілу або NR⁷R⁸, C₂₋₄алкенілу, заміщеного одним замісником,

вибраним з феніл- C_{1-4} алкілоксикарбонілу, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу або Net^5 -карбонілу, і

C_{1-4} алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з галогену, диметиламіну, триметиламіну, аміну, ціано, Net^6 , Net^7 -карбонілу, C_{1-4} алкілоксикарбонілу або гідроксикарбонілу;

R^5 і R^6 кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси- C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, C_{1-4} алкілу і C_{1-4} алкілокси, або R^5 і R^6 кожен незалежно являє собою C_{1-4} алкіл, заміщений фенілом;

R^7 і R^8 кожен незалежно вибраний з водню або C_{1-4} алкілу;

R^9 і R^{10} кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу або C_{1-4} алкілоксикарбонілу;

L являє собою C_{1-4} алкіл, необов'язково заміщений одним або, де можливо, більшою кількістю замісників, вибраних з C_{1-4} алкілу або фенілу;

Net^1 являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, піперидинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, піридазинілу, індолілу, ізоіндолілу, індолінілу, фуранілу, бензофуранілу, тiazолілу, оксазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, бензотіофенілу, тіофенілу, 1,8-нафтиридинілу, 1,6-нафтиридинілу, хінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрохінолінілу, ізохінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрізохінолінілу, хіноксалінілу, хіназолінілу, фталазинілу, 2H-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2H-бензопіранілу,

2H-бензотіопіранілу, 3,4-дигідро-2H-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Net^2 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піридинілу, піридазинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, 2H-піролілу, піролілу, 2-піролінілу, 3-піролінілу, піролідинілу або морфолінілу, зазначений Net^2 необов'язково заміщений одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, C_{1-4} алкілу або C_{1-4} алкілокси;

Net^4 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу, тριαзолілу, тетразолілу або морфолінілу, зазначений Net^4 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C_{1-4} алкілу або C_{1-4} алкілокси;

Net^5 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net^5 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких

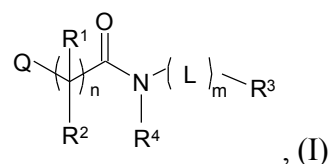
незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Net⁶ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net⁶ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Net⁷ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net⁷ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Ar² являє собою карбоциклічний радикал, що містить один або більше циклів, вибраних з групи, що складається з фенілу, біфенілу, бензоциклобутенілу, бензоциклогептанілу, бензосуберенілу, інденілу, 2,3-дигідроінденілу, флуоренілу, 1,2-дигідронафтилу, 5,6,7,8-тетрагідронафтилу і нафтилу.

2. Сполука, що має формулу



її N-оксидні форми, фармацевтично прийнятні адитивні солі і стереохімічно ізомерні форми, де

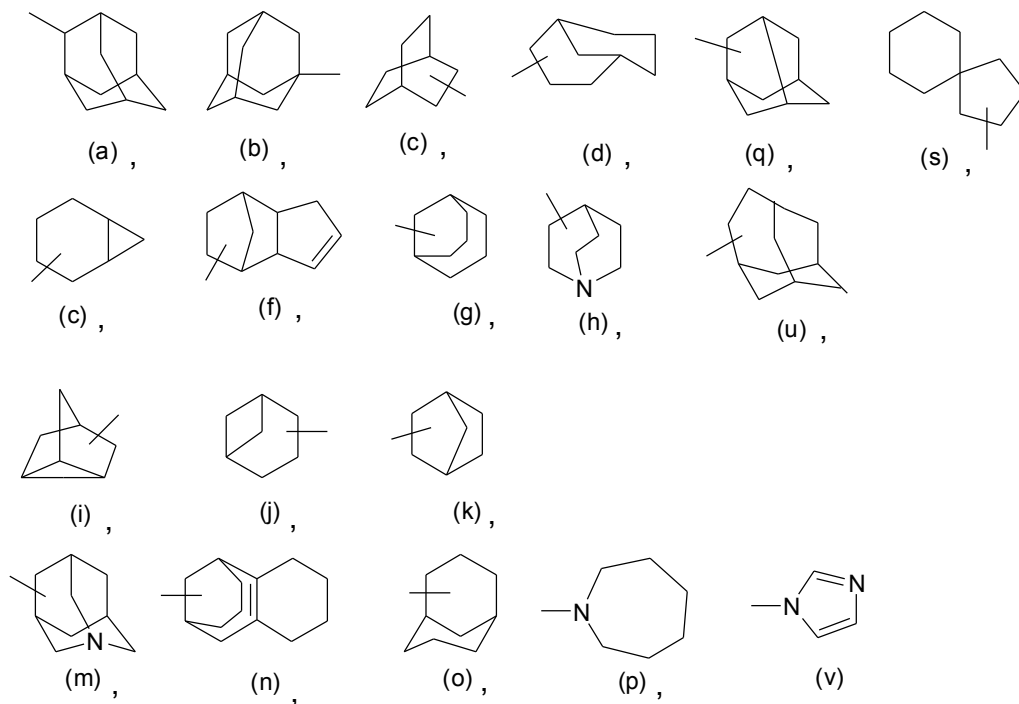
n являє собою ціле число, що становить 1;

m являє собою ціле число, що становить 0 або 1;

R¹ і R² кожен незалежно являє собою C₁₋₄алкіл; або

R¹ і R² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють карбоніл або C₃₋₆циклоалкіл;

R³ являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де зазначений одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси, фенілу, галогену, оксо, карбонілу, 1,3-діоксолілу і гідрокси;

R^4 являє собою водень або C_{1-4} алкіл;

Q являє собою C_{3-8} циклоалкіл, Het^1 або Ar^2 , де зазначені C_{3-8} циклоалкіл, Het^1 або Ar^2 є необов'язково заміщеними одним або, де можливо, більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси, гідрокси, нітро, Het^4 , фенілу, фенілокси, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу, NR^5R^6 , C_{1-4} алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Het^2 і NR^7R^8 ,

C_{1-4} алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома галогеновими замісниками;

R^5 і R^6 кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, C_{1-4} алкілу і C_{1-4} алкілокси, або R^5 і R^6 кожен незалежно являє собою C_{1-4} алкіл, заміщений фенілом;

R^7 і R^8 кожен незалежно вибраний з водню або C_{1-4} алкілу;

L являє собою C_{1-4} алкіл, необов'язково заміщений одним або, де можливо, більшою кількістю замісників, вибраних з C_{1-4} алкілу або фенілу;

Het^1 являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, піперидинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, піридазинілу, індолілу, ізоіндолілу, індолінілу, фуранілу, бензофуранілу,

тіазолілу, оксазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, бензотіофенілу, тіофенілу, 1,8-нафтиридинілу, 1,6-нафтиридинілу, хінолінілу, ізохінолінілу, хіноксалінілу, хіназолінілу, фталазинілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Net² являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піридинілу, піридазинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, 2Н-піролілу, піролілу, 2-піролінілу, 3-піролінілу, піролідинілу або морфолінілу;

Net⁴ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net⁴ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

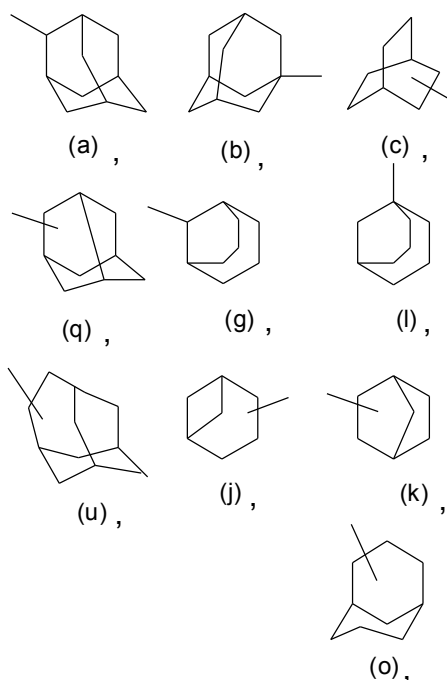
Ar² являє собою карбоциклічний радикал, що містить один або більше циклів, вибраних з групи, що складається з фенілу, біфенілу, інденілу, 2,3-дигідроінденілу, флуоренілу, 5,6,7,8-тетрагідронафтилу і нафтилу.

3. Сполука за пп. 1 або 2, де

R¹ і R² кожен незалежно являє собою, C₁₋₄алкіл; або

R¹ і R² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C₃₋₆циклоалкіл;

R³ являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де зазначений одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, вибраних з групи, що складається з C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, галогену, карбонілу, гідрокси і 1,3-діоксолілу;

Q являє собою Net або Ar², де зазначений Net або Ar² є необов'язково заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C₁₋₄алкілу, C₁₋

4алкілокси, гідрокси, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, NR^5R^6 , C_{1-4} алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Net^2 і NR^7R^8 , і C_{1-4} алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, диметиламіну, аміну, ціано, Net^6 , Net^7 -карбонілу або гідроксикарбонілу;

R^5 і R^6 кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома галогеновими замісниками;

L являє собою C_{1-4} алкіл;

Net^1 являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, бензотіофенілу, хінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрохінолінілу, ізохінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрізохінолінілу, 2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензопіранілу, 2Н-бензотіопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Net^2 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піперазинілу, піридинілу, піролідинілу або морфолінілу, зазначений Net^2 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю C_{1-4} алкільних замісників;

Net^6 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піролідинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net^6 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю гідроксизамісників;

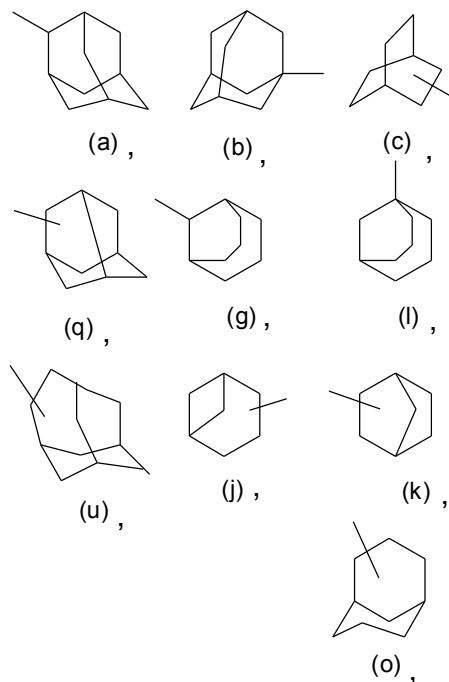
Ar^2 являє собою карбоциклічний радикал, що містить один або більше циклів, вибраних з групи, що складається з фенілу, бензоциклобутенілу, бензоциклогептанілу, бензосуберенілу, інденілу, 2,3-дигідроінденілу, 5,6,7,8-тетрагідронафтилу і нафтилу.

4. Сполука за будь-яким з пп. 1-2, де

R^1 і R^2 кожен незалежно являє собою водень, C_{1-4} алкіл; або

R^1 і R^2 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C_{3-6} циклоалкіл;

R^3 являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де зазначений одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, вибраних з групи, що складається з C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси, галогену, карбонілу, гідрокси і 1,3-діоксолілу;

Q являє собою Het^1 або Ar^2 , де зазначений Het^1 або Ar^2 є необов'язково заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси, гідрокси, C_{1-4} алкілоксикарбонілу, Het^4 , NR^5R^6 , C_{1-4} алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Het^2 і NR^7R^8 , C_{2-4} алкілу, заміщеного одним замісником, вибраним з феніл C_{1-4} алкілоксикарбонілу або Het^5 -карбонілу, і

C_{1-4} алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, диметиламіну, аміну, ціано, Het^6 , Het^7 -карбонілу або гідроксикарбонілу;

R^5 і R^6 кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, C_{1-4} алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома галогеновими замісниками;

L являє собою C_{1-4} алкіл;

Het^1 являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, бензотіофенілу, хінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрохінолінілу, ізохінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрізохінолінілу, 2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензопіранілу, 2Н-бензотіопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Het^2 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піперазинілу,

піридинілу, піролідінілу або морфолінілу, зазначений Het^2 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю C_{1-4} алкільних замісників;

Het^4 являє собою тетразоліл;

Het^5 являє собою морфолініл;

Het^6 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піролідінілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Het^6 необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю гідроксизамісників,

Het^7 являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперазинілу або морфолінілу;

Ar^2 являє собою карбоциклічний радикал, що містить один або більше циклів, вибраних з групи, що складається з фенілу, бензоциклобутенілу, бензоциклогептанілу, бензосуберенілу, інденілу, 2,3-дигідроінденілу, 5,6,7,8-тетрагідронафтилу і нафтилу.

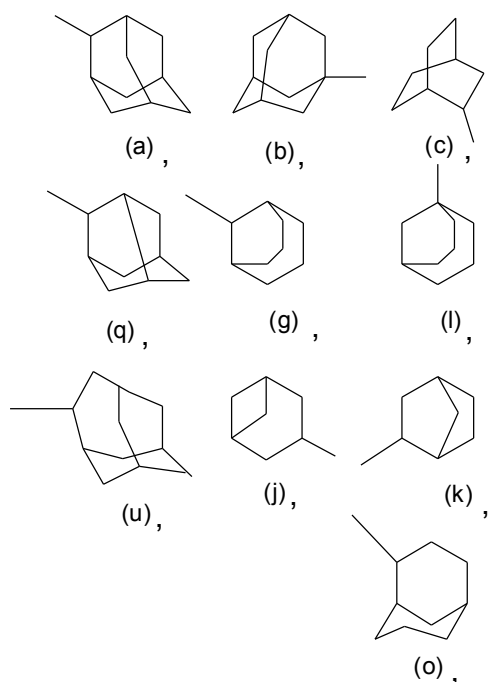
5. Сполука за будь-яким з пп. 1-2, де

n являє собою ціле число, що становить 1;

R^1 і R^2 кожен незалежно являє собою водень, C_{1-4} алкіл; або

R^1 і R^2 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C_{3-6} циклоалкіл;

R^3 являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де зазначений одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, вибраних з групи, що складається з C_{1-4} алкілу, C_{1-4} алкілокси, галогену, карбонілу і гідрокси;

Q являє собою Het^1 або Ar^2 , де зазначений Het^1 або Ar^2 є необов'язково заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C_{1-4} алкілу,

C_{1-4} алкілокси, гідрокси, NR^5R^6 ,

C_{1-4} алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Net^2 або NR^7R^8 ,

C_{2-4} алкенілу, заміщеного одним замісником, вибраним з феніл C_{1-4} алкілоксикарбонілу або Net^5 -карбонілу, і

C_{1-4} алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, вибраними з галогену, Net^6 , C_{1-4} алкілоксикарбонілу або гідроксикарбонілу;

R^5 і R^6 кожен незалежно вибраний з водню, C_{1-4} алкілу;

L являє собою C_{1-4} алкіл;

Net^1 являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, 1,2,3,4-тетрагідрохінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолінілу, 2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Net^2 являє собою піридиніл, піролідиніл або морфолініл,

Net^6 являє собою морфолініл;

Ar^2 являє собою феніл, бензоциклобутеніл, бензоциклогептаніл, бензосубереніл, 2,3-дигідроінденіл, 5,6,7,8-тетрагідронафтил, нафтил або інденіл.

6. Сполука за п. 5, де R^3 має формулу (а) або (b) та є необов'язково заміщеним.

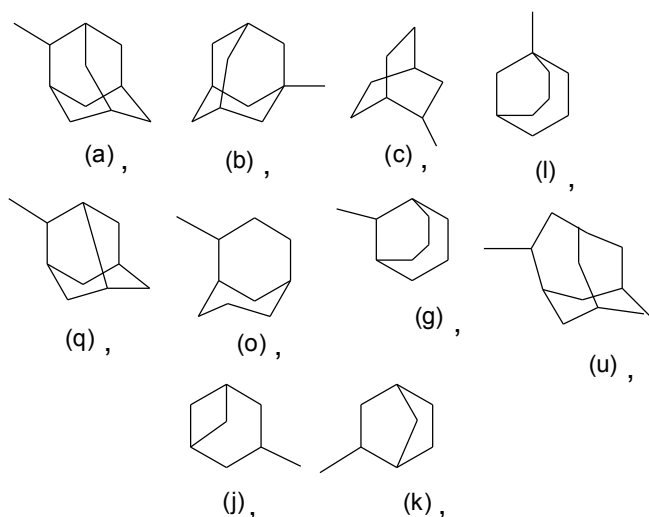
7. Сполука за п. 1, де

n являє собою ціле число, що становить 1;

R^1 і R^2 кожен незалежно являє собою C_{1-4} алкіл; або

R^1 і R^2 разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C_{13-6} циклоалкіл;

R^3 являє собою одновалентний радикал, що має одну з наступних формул



де одновалентний радикал може необов'язково бути заміщеним одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, вибраних з групи, що складається з C_{1-}

4алкілу, C₁₋₄лкілокси, галогену і гідрокси;

R⁴ являє собою водень або C₁₋₄алкіл;

Q являє собою Het¹ або Ar², де зазначені Het¹ або Ar² є необов'язково заміщеними одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, гідрокси, нітро, NR⁵R⁶,

C₁₋₄алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома, трьома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Het² або NR⁷R⁸, C₂₋₄алкенілу, заміщеного фенілC₁₋₄алкілоксикарбонілом, і C₁₋₄алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, вибраними з галогену, Het⁶, Het⁷-карбонілу, C₁₋₄алкілоксикарбонілу або гідроксикарбонілу;

R⁵ і R⁶ кожен незалежно являє собою водень, C₁₋₄алкіл або C₁₋₄алкіл, заміщений фенілом;

L являє собою C₁₋₄алкіл;

Het¹ являє собою гетероцикл, вибраний з піридинілу, тіофенілу, 2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2Н-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Het² являє собою піперидиніл, піролідиніл або морфолініл;

Het⁶ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперазинілу або морфолінілу;

Ar² являє собою феніл, бензоциклобутеніл, бензоциклогептаніл, бензосубереніл, 2,3-дигідроінденіл, 1,2-дигідронафтил, 5,6,7,8-тетрагідронафтил, нафтил або інденіл.

8. Сполука за п. 7, де R³ має формулу (а) та є необов'язково заміщеним.

9. Сполука за п. 1, де сполукою є

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-етилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-метоксибензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-гідроксибензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3,5-диметилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)-3-(фенілметокси)бензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-(карбоксиметокси)бензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-[2-(4-

морфолініл)етокси]бензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-фтортрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-метокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-метокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметилбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметилбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3(карбоксиметокси)бензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3-[2-(4-морфолініл)етокси]бензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3,5-диметоксибензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3-метилбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3-метоксибензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3-гідроксибензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-3,5-диметилбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-4-фторбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)-1-фенілциклопропанкарбоксамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-2,6-дифторбензолацетамід;

N-(трицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α,α -диметил-2-тіофенацетамід;

N-(5-гідроксі-2-адамантил)-2-метил-2-(5-метилпіридин-3-іл)пропанамід;

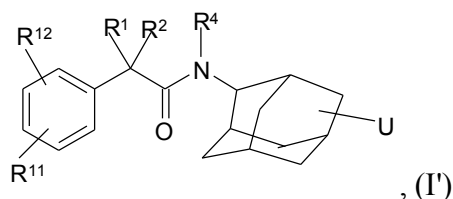
N-(5-гідроксі-2-адамантил)-2-метил-2-(6-метилпіридин-2-іл)пропанамід;

3-(3-{2-[(5-фтор-2-адамантил)аміно]-1,1-диметил-2-оксоетил}-5-метилфеніл)пропіонова кислота;

4-(3-{2-[(5-гідроксі-2-адамантил)аміно]-1,1-диметил-2-оксоетил}-5-метилфеніл)бутанова кислота;

або їх N-оксид, фармацевтично прийнятна адитивна сіль або стереохімічно ізомерна форма.

10. Сполука за формулою (I')



її N-оксидні форми, фармацевтично прийнятні адитивні солі і стереохімічно ізомерні форми, де

R¹ і R² кожен незалежно являє собою водень, C₁₋₄алкіл, NR⁹R¹⁰, C₁₋₄алкілокси або Het³-O-C₁₋₄алкіл; або

R¹ і R² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C₃₋₆циклоалкіл,

R⁴ являє собою водень, C₁₋₄алкіл, C₂₋₄алкеніл;

U являє собою водень, C₁₋₄алкіл, C₁₋₄алкілокси, феніл, галоген, оксо, карбоніл або гідрокси;
R⁵ і R⁶ кожен незалежно вибраний з водню, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілоксиC₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, C₁₋₄алкілкарбонілу, C₁₋₄алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, C₁₋₄алкілу і C₁₋₄алкілокси, або R⁵ і R⁶ кожен незалежно являє собою C₁₋₄алкіл, заміщений фенілом;

R⁷ і R⁸ кожен незалежно вибраний з водню або C₁₋₄алкілу;

R⁹ і R¹⁰ кожен незалежно вибраний з водню, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілоксикарбонілу;

R¹¹ і R¹² кожен незалежно вибраний з водню, галогену, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, гідрокси, нітро, Het⁴, фенілу, фенілокси, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу, NR⁵R⁶,

C₁₋₄алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Het² і NR⁷R⁸, C₂₋₄алкенілу, заміщеного одним замісником, вибраним з фенілC₁₋₄алкілоксикарбонілу, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу, Het⁵-карбонілу і C₁₋₄алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з галогену, диметиламіну, триметиламіну, аміну, ціано, Het⁶, Het⁷-карбонілу, C₁₋₄алкілоксикарбонілу або гідроксикарбонілу;

Het² являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піридинілу, піридазинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, 2Н-піролілу, піролілу, 2-піролінілу, 3-піролінілу, піролідинілу або морфолінілу, зазначений Het² необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Het³ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з 2Н-піранілу, 4Н-піранілу, фуранілу, тетрагідро-2Н-піранілу, піридинілу, піперидинілу або фуранілу;

Het⁴ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу, триазолілу, тетразолілу або морфолінілу, зазначений Het⁴ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Het⁵ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Het⁵ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Het⁶ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Het⁶ необов'язково є

заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

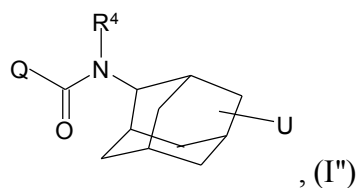
Het⁷ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Het⁷ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси.

11. Сполука за п. 10, де R¹ і R² кожен незалежно являє собою C₁₋₄алкіл; або

R¹ і R² разом з атомом вуглецю, до якого вони прикріплені, утворюють C₃₋₆циклоалкіл;

12. Сполука за п. 10, де R¹ і R² кожен незалежно вибраний з C₁₋₄алкілу.

13. Сполука формули (I'')



її N-оксидні форми, фармацевтично прийнятні адитивні солі і стереохімічно ізомерні форми, де

R⁴ являє собою водень, C₁₋₄алкіл, C₂₋₄алкеніл;

U являє собою водень, C₁₋₄алкіл, C₁₋₄алкілокси, феніл, галоген, оксо, карбоніл або гідрокси;

Q являє собою Het¹ або Ar², де зазначені Het¹ або Ar² є необов'язково заміщеними одним або, де можливо, більшою кількістю замісників, вибраних з галогену, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілокси, гідрокси, нітро, Het⁴, фенілу, фенілокси, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, гідроксикарбонілу, NR⁵R⁶, C₁₋₄алкілокси, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з гідроксикарбонілу, Het² і NR⁷R⁸, і

C₁₋₄алкілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з галогену або гідроксикарбонілу;

R⁵ і R⁶ кожен незалежно вибраний з водню, C₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілоксіC₁₋₄алкілу, C₁₋₄алкілоксикарбонілу, C₁₋₄алкілкарбонілу, C₁₋₄алкілкарбонілу, заміщеного одним або, де можливо, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно вибраний з галогену, C₁₋₄алкілу і C₁₋₄алкілокси, або R⁵ і R⁶ кожен незалежно являє собою C₁₋₄алкіл, заміщений фенілом;

R⁷ і R⁸ кожен незалежно вибраний з водню або C₁₋₄алкілу;

Het¹ являє собою біциклічний гетероцикл, вибраний з індолілу, ізоіндолілу, індолінілу, бензофуранілу, бензотіофенілу, 1,8-нафтиридинілу, 1,6-нафтиридинілу, хінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідрохінолінілу, ізохінолінілу, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолінілу, хіназолінілу, фталазинілу, 2H-бензопіранілу, 3,4-дигідро-2H-бензопіранілу, 2H-бензотіопіранілу, 3,4-

дигідро-2Н-бензотіопіранілу або 1,3-бензодіоксолілу;

Net² являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піперидинілу, піридинілу, піридазинілу, піримідинілу, піразинілу, піперазинілу, 2Н-піролілу, піролілу, 2-піролілу, 3-піролінілу, піролідинілу або морфолінілу, зазначений Net² необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Net⁴ являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний з піридазинілу, піримідинілу, піролідинілу, піразинілу, піперазинілу або морфолінілу, зазначений Net⁴ необов'язково є заміщеним одним або, де можливо, двома або більшою кількістю замісників, кожен з яких незалежно вибраний з гідрокси, карбонілу, C₁₋₄алкілу або C₁₋₄алкілокси;

Ar² являє собою карбоциклічний радикал, що містить два цикли, вибраний з групи, що складається з бензоциклобутенілу, бензоциклогептанілу, бензосуберенілу, інденілу, 2,3-дигідроінденілу, 5,6,7,8-тетрагідронафтилу.

14. Сполука за п. 1, де сполука вибрана з:

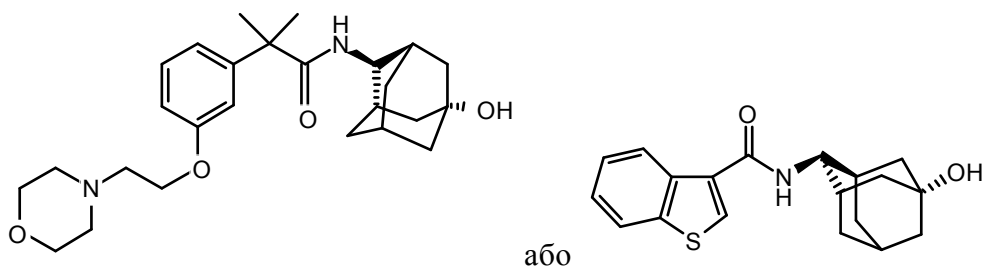
(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметилбензолацетамід;

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-метоксибензолацетамід; або

(1 α ,2 β ,3 β ,5 β ,7 β)-N-(5-гідрокситрицикло[3.3.1.1^{3,7}]дец-2-ил)- α , α -диметил-3-метилбензолацетамід;

або їх N-оксид, фармацевтично прийнятна адитивна сіль або стереохімічно ізомерна форма.

15. Сполука за п. 1, де сполука вибрана з



або її N-оксид, фармацевтично прийнятна адитивна сіль або стереохімічно ізомерна форма.

16. Фармацевтична композиція, що включає фармацевтично прийнятний носій і, як активний інгредієнт, ефективну кількість сполуки, що інгібує 11 β -HSD1, описаної в будь-якому з пп. 1-15.

17. Спосіб одержання фармацевтичної композиції, як визначено в п. 16, який відрізняється тим, що фармацевтично прийнятний носій ретельно перемішують з

ефективною кількістю сполуки, що інгібірує 11 β -HSDI, описаної в будь-якому з пп. 1-15.

18. Сполука за будь-яким з пп. 1-13 для використання як лікарський засіб.

19. Спосіб одержання лікарського засобу для лікування патології, пов'язаної з надлишком утворення кортизолу, такої як, наприклад, ожиріння, діабет, серцево-судинні захворювання, пов'язані з ожирінням, деменція, когнітивний розлад, остеопороз і глаукома, з застосуванням сполуки за будь-яким з пп. 1-15.

20. Спосіб одержання 1-гідрокси-4-аміноадамантану, який характеризується тим, що включає

- i) відновне амінування відповідного кетону (XIII);
- ii) розділення отриманих у такий спосіб стереомерів аміну формули (XVIII); і
- iii) дебензилювання сполук формули (XVIII)

