

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成21年7月16日(2009.7.16)

【公表番号】特表2008-542359(P2008-542359A)

【公表日】平成20年11月27日(2008.11.27)

【年通号数】公開・登録公報2008-047

【出願番号】特願2008-514302(P2008-514302)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/91 (2006.01)

C 0 7 D 307/93 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 31/385 (2006.01)

A 6 1 K 31/5355 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 307/91

C 0 7 D 307/93 C S P

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 407/12

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 31/385

A 6 1 K 31/5355

A 6 1 K 31/41

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 19/08
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/06
 A 6 1 P 9/08
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 1/08
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年6月1日(2009.6.1)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

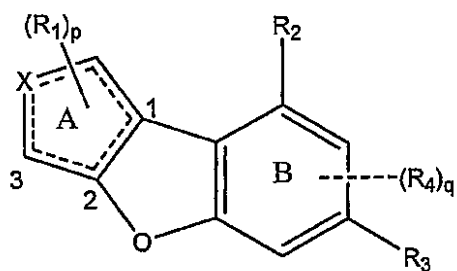
【特許請求の範囲】

【請求項1】

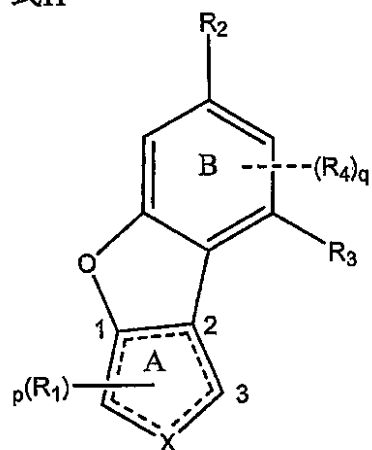
一般式(I)又は(II)：

【化1】

式I



式II



[式中、

【化 2】

====

は単結合又は二重結合を表し、

Xは、 $(CH_m)_n$ （ここで、mは0～2の整数であり、nは0～4の整数である）であり、

R₁は、各存在において、独立に、

a) ハロゲン、

b) 環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、

c) アリール、

d) R_a（ここで、R_aは、R_b、OR_b、C(O)OR_b及びOC(O)R_b（ここで、R_bは、N、O及びSからなる群から選択される1つ又は複数のヘテロ原子で置換された飽和又は不飽和、直鎖又は分枝C₁～C₈アルキルである）からなる群から選択される）、

e) R_c（ここで、R_cは、R、OR、OC(O)OR、C(O)OR、OC(O)R及びOC(O)N(R')₂（ここで、Rは、水素、飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキル-OR'、C₁～C₆アルキル-(OR')₂、C₁～C₆アルキル-C(O)OR'、及びC₁～C₆アルキル-C(O)N(R')₂からなる群から選択され、R'は、各存在において、独立に、水素及び飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状C₁～C₆アルキルからなる群から選択される）から選択される）、

f) オキシム、及び

g) N(R')₂（ここで、R'は、各存在において、先に定義された通りである）からなる群から選択され、

pは、0～14の整数であり、

R₂は、

a) R_a又はR_c（ここで、R_a及びR_cは、先に定義された通りである）、及び

b) OR''Z（ここで、R''は、直接結合、C(O)、R_e及びC(O)R_e（ここで、R_eは、飽和又は不飽和、直鎖又は分枝C₁～C₈アルキルである）からなる群から選択され、Zは、ONO₂、ハロゲン、P(O)(OR')₂、SR'、S(O)R'、S(O)(O)R'、N(R')₂（ここで、R'は、先に定義された通りである）、並びにN、O及びSからなる群から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含む6個までの原子の飽和又は不飽和複素環からなる群から選択される）

からなる群から選択され、

R₃は、

a) R_d（ここで、R_dは、水素、C(O)OR''、C(O)R''、CN及びNO₂（ここで、R''は、水素及び飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状C₁～C₁₂アルキルからなる群から選択される）からなる群から選択される）、

b) 非置換又は先に定義された通りの飽和若しくは不飽和複素環で置換された、飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状C₂～C₁₂アルキル、

c) アリールで置換された飽和又は不飽和、直鎖又は分枝C₁～C₁₂アルキル、及び

d) 先に定義された通りの飽和又は不飽和複素環（前記環は、非置換であるか又は少なくとも1つの飽和若しくは不飽和、直鎖、分枝若しくは環状C₁～C₆アルキル（前記アルキルは非置換又はアリールで置換されていてよい）で置換されている）

からなる群から選択され、

R₄は、各存在において、独立に、水素、NO₂及びNH₂からなる群から選択され、qは、0～2の整数である」の化合物、及び前記化合物の立体異性体、薬剤として許容される塩、エステル、多形体又は溶媒和物であって、

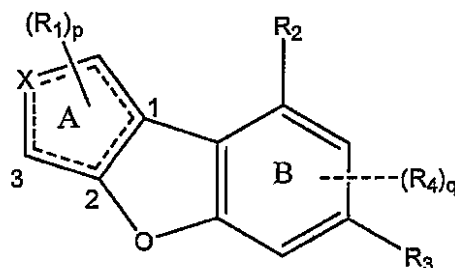
但し、Aはフェニル環ではなく、式(I)の化合物において、(a) n が1の場合は、 R_1 はC2位置においてフェニルではなく、(b) n が2である場合は、C2における R_1 はイソプロピルであり、従ってC5における R_1 はメチル以外であり、及び(c) n が2である場合は、 R_1 はC3においてメチル及びヒドロキシルであり、C6においてイソプロペニルであり、従って R_2 は、OH、 OCH_3 及び $OC(O)CH_3$ 以外であり、式(II)の化合物において、 n が2である場合は、C2における R_1 はイソプロピルであり、従ってC5における R_1 はメチル以外である化合物。

【請求項2】

式(I)：

【化3】

式I



の構造により表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

n が1～3の整数であり、 p が0～4の整数であり、 q が0～2の整数であり、環Aが飽和又は不飽和（環Aの任意の二重結合は、C1とC2又はC3とC4の間に位置する）であり、 R_1 が、各存在において、独立に、水素、ハロゲン、環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、オキシム、 NH_2 、 R 、 OR 及び $C(O)OR$ からなる群から選択され、 R_2 が、 R_c 、 OR 、 $OR''Z$ 、 $OC(O)R_b$ 、 OR_b 及び $OC(O)R$ からなる群から選択され、 R_3 が、 $C(O)R'''$ 、 $C(O)OR'''$ 、及び非置換又は複素環若しくはアリールで置換されている飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 C_{1-12} アルキルからなる群から選択され、 R_4 が、水素及び NO_2 からなる群から選択され、 R 、 R'' 、 R''' 、 R_b 、複素環及び Z が先に定義された通りである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

a) 式(I)の化合物（ここで、 n は1であり、環Aは飽和であり、 R_1 は、各存在において、独立に、水素及び CH_3 からなる群から選択され、 R_2 はOH及び $OC(O)CH=CHC(O)OH$ からなる群から選択され、 R_3 は1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択される）、

b) 式(I)の化合物（ここで、 n は2であり、環Aは飽和又は不飽和（任意の二重結合は、C1とC2又はC3とC4の間に位置する）であり、 R_1 は、各存在において、独立に、水素、環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、OH、イソプロピリデン、オキシム、ヨウ素及び CH_3 からなる群から選択され、 R_2 は、OH、 OCH_3 、 $OCH_2C(O)OH$ 、 OCH_2SCH_3 、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $OC(O)CH_3$ 、 $OP(O)(OC_2H_5)_2$ 、 OCH_2 -テトラゾール、 OCH_2CH_2 -モルホリン、 $OC(O)$ -ピペリジン、 $OC(O)(CH_2)_2NHCH_3$ 、 $OCH_2CH(OH)CH_2OH$ 、 $OC(O)CH=CHC(O)OH$ 、 $OC(O)(CH_2)_3Br$ 及び $OC(O)(CH_2)_3ONO_2$ からなる群から選択され、 R_3 は、2-フェネチル-[1, 3]-ジチオラン、2-メチル-[1, 3]-ジチオラン-2-イル、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)OCH_3$ 、1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、 R_4 は、水素及び NO_2 からなる群から選択される）、及び

c) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 3 であり、環 A は飽和であり、 R_1 は、水素、O H、ヨウ素、オキシム、 $C(O)OCH_3$ 、 NH_2 、 $OC(O)CH=CHC(O)OH$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $CH_2C(O)OCH_3$ 、 $C(O)OH$ 、 CH_2OH 、 CH_3 及び環 A の炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子からなる群から選択され、 R_2 は、OH、 OCH_2CH_2 —モルホリン、 $OCH_2C(O)OH$ 、 $OC(O)CH=CHC(O)OH$ 、 OCH_2 —テトラゾール、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $OCH_2C(O)N(C_2H_5)_2$ 、 $OC(O)CH_2OCH_2CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ 及び $O(CH_2)_3C(O)OH$ からなる群から選択され、 R_3 はペンチル、1, 1—ジメチルペンチル及び 1, 1—ジメチルヘプチルからなる群から選択され、 R_4 は水素及び NO_2 からなる群から選択される)

からなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

a) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 1 であり、環 A は飽和であり、

i) R_1 は、水素、C 2 位置における CH_3 、C 2 及び C 3 位置における CH_3 からなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルヘプチルである、

ii) R_1 は、C 2 位置における CH_3 であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルペンチルである、又は

iii) R_1 は、C 2 及び C 3 位置における CH_3 であり、 R_2 は、 $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルヘプチルである)、

b) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 2 であり、環 A は飽和であり、

i) R_1 は、C 3 位置における水素、OH、環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、ヨウ素又はオキシム、C 4 位置における gem—ジメチル、C 2 位置における CH_3 及び C 5 位置におけるイソプロピリデンの両方、環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子及び C 4 位置における gem—ジメチルの両方、並びに C 3 位置における OH 及び C 4 位置における gem—ジメチルの両方からなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルヘプチルである、

ii) R_1 は、C 4 位置における更なる gem—ジメチルを伴う又は伴わない C 3 位置における水素、OH、環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子又はオキシム、C 3 位置におけるヨウ素及び C 4 位置における gem—ジメチルからなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルペンチルである、

iii) R_1 は C 4 位置における水素又は gem—ジメチルであり、 R_2 は $OCH_2C(O)OH$ であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルヘプチル又は 1, 1—ジメチルペンチルである、

iv) R_1 は水素であり、 R_2 は、 $OCH_2CH(OH)CH_2OH$ 、 $OC(O)CH=CHC(O)OH$ 、 $OC(O)CH_3$ 、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $OP(O)(OC_2H_5)_2$ 、 OCH_2 —テトラゾール、 $OC(O)$ —ピペリジン、 $OC(O)(CH_2)_3Br$ 及び $OC(O)(CH_2)_3ONO_2$ からなる群から選択され、 R_3 は 1, 1—ジメチルペンチルである、

v) R_1 は水素であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 2—メチルー [1, 3] ジチオラン—2—イル、 $C(O)CH_3$ 、及び $C(O)OCH_3$ からなる群から選択される、

vi) R_1 は C 4 位置における更なる gem—ジメチルを伴う又は伴わない環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子又は C 3 位置におけるオキシムからなる群から選択され、 R_2 は OCH_2SCH_3 であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルペンチルである、

vii) R_1 は C 4 位置における gem—ジメチルであり、 R_2 は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ 又は $OC(O)(CH_2)_2NHCH_3$ であり、 R_3 は 1, 1—ジメチルペンチルである、

viii) R_1 は C 4 位置における gem—ジメチルであり、 R_2 は OH 又は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_3 は 2—フェネチルー [1, 3] ジチオラン—2

ーイルである、又は

i x) R_1 は C 3 位置における OH であり、 R_2 は $OC(O)CH_2O(CH_2)_2O(CH_2)_2OCH_3$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである)、

c) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 2 であり、環 A は C 3 と C 4 の間に位置する二重結合を有する不飽和であり、 R_1 は水素であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチル又は 1, 1-ジメチルヘプチルである)、

d) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 2 であり、環 A は飽和であり、 R_1 は水素であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチルであり、 R_4 は、 R_2 に対してオルト、パラ、又はオルト及びパラの両方の位置における NO_2 である)、

e) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 2 であり、環 A は C 1 と C 2 の間に位置する二重結合を有する不飽和であり、

i) R_1 は水素であり、 R_2 は OH 又は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチル又は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

i i) R_1 は環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子及び C 6 位置における gem-ジメチルであり、 R_2 は OH 又は OCH_3 であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

i i i) R_1 は環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子及び C 5 位置における gem-ジメチルであり、 R_2 は OCH_3 であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、又は

i v) R_1 は C 4 位置における gem-ジメチルであり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである)、

f) 式 (I) の化合物 (ここで、 n は 3 であり、環 A は飽和であり、

i) R_1 は水素、環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子及び C 3 位置における OH からなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチル又はジメチルペンチルである、

i i) R_1 は環 A の炭素分子 C 3 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子又は C 3 及び C 4 の両方の位置における OH であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチルである、

i i i) R_1 は水素であり、 R_2 は OCH_2CH_2 -モルホリンであり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチル又は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

i v) R_1 は水素であり、 R_2 は $OCH_2C(O)OH$ 又は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v) R_1 は C 3 位置における OH であり、 R_2 は、 $OCH_2C(O)OH$ 、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $O(CH_2)_3C(O)OH$ 、 $OCH_2C(O)N(C_2H_5)_2$ 、 $O(CH_2)_2$ -モルホリン及び OCH_2 -テトラゾールからなる群から選択され、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v i) R_1 は C 3 位置におけるヨウ素又は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_2 は $OC(O)CH=CHC(O)OH$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v i i) R_1 は C 3 位置における水素又は OH であり、 R_2 は OH であり、 R_3 はペンチルである、

v i i i) R_1 は C 3 位置におけるオキシム、ヨウ素、又は NH_2 、C 7 位置における $C(O)OCH_3$ 、 CH_2OH 、 $CH_2C(O)OCH_3$ 又は $C(O)OH$ 、並びに C 3 位置における OH 及び C 7 位置における $C(O)OH$ の両方からなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルであり、又は、

i x) R_1 は C 3 位置における OH であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルであり、及び R_4 は、 R_2 に対してオルト又はパラ位置における NO_2 である)

からなる群から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

前記化合物が、6-(1,1-ジメチルペンチル)-8a-メチル-2,3,3a,8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサシクロペンタ[α]インデン-4-オール; 6-(1,1-ジメチルヘプチル)-8a-メチル-2,3,3a,8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサシクロペンタ[α]インデン-4-オール; 6-(1,1-ジメチルヘプチル)-2,3,3a,8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサシクロペンタ[α]インデン-4-オール; 6-(1,1-ジメチルヘプチル)-1,8a-ジメチル-2,3,3a,8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサシクロペンタ[α]インデン-4-イル]エステル; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-6-ヨード-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-5a,8,9,9a-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-6-ヨード-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,8,9,9a-テトラヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1,6-ジオール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-7,7-ジメチル-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-7,7-ジメチル-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1,6-ジオール; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-7,7-ジメチル-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1,6-ジオール; [3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-酢酸; 3-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-プロパン-1,2-ジオール; 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1,6-ジオール; 3-(2-メチル-[1,3]ジチオラン-2-イル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 4-{2-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-エチル}-モルホリン; ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル]エステル; 酢酸 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルエステル; ジエチルリン酸モノ-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル]エステル; リン酸モノ-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル]エステル; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-7,7-ジメチル-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; [3-(1,1-ジメチルヘプチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-酢酸; 3-(1,1-ジメチルヘプチル)-8-イソプロピリデン-5a-メチル-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 1-(1-ヒドロキシ-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-3-イル)-エタノン; 1-ヒドロキシ-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-3-カルボン酸メチルエステル; 5-[3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシメチル]-1H-テトラゾール; ピペリジン-3-カルボン酸 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルエステル; 4-ブromo酪酸 3-(1,1-ジメチルペンチル)-5a,6,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルエ

ステル；4-ニトロオキシ-酪酸3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルエステル；7-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-メチルスルファニルメトキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-ヒドロキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-メチルスルファニルメトキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-ヒドロキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-3, 3-ジメチル-9-メチルスルファニルメトキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-9-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-(1, 1-ジメチルペンチル)-3, 3-ジメチル-9-メチルスルファニルメトキシ-2, 3, 4a, 9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；[3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-酢酸；ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル]エステル；7, 7-ジメチル-3-(2-フェネチル-[1, 3]ジチオラン-2-イル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-メチルアミノ-プロピオン酸3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルエステル；ブト-2-エン二酸モノ-[7, 7-ジメチル-3-(2-フェネチル-[1, 3]ジチオラン-2-イル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル]エステル；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-2, 4-ジニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-2-ニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-4-ニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール；2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール；2-(1, 1-ジメチルペンチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール；2-(1, 1-ジメチルペンチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール；2-(1, 1-ジメチルペンチル)-4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オン；2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オン；4-{2-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-エチル}-モルホリン；[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酢酸；ブト-2-エン二酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]

アズレン-4-イル] エステル; [2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酢酸; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 9a-テトラヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 8, 9-トリオール; ブト-2-エン二酸モノ-[9-(3-カルボキシ-アクリロイルオキシ)-2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; リン酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; 2-ペンチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-ペンチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 4-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酪酸; 2-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]N, N-ジエチルアセトアミド; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-9-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-9-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸メチルエステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4, 9-ジヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; [2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-イル]-酢酸メチルエステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサベンゾ[α]アズレン-9-オンオキシム; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヨード-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; [2-(2-メトキシ-エトキシ)-エトキシ]-酢酸 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イルエステル; ブト-2-エン二酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヨード-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸; 9-アミノ-2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; 9-アミノ-2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-デスオキシベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-3-ニトロ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-1-ニトロ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オール; ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1, 1-

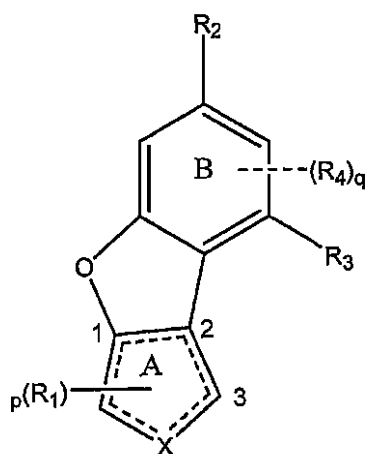
ジメチルヘプチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-イル] エステル; 3-(1, 1-ジメチルペンチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オール; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-メトキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-メトキシ-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1, 1-ジメチルペンチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-イル] エステル; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-ヒドロキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; 及び 3-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 7, 7-ジメチル-6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オールからなる群から選択される化合物。

【請求項 7】

式 (I I) :

【化 4】

式II



の構造により表される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

n が 1 ~ 3 の整数であり、環 A が不飽和であり、R₁ が水素、環 A の炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、及び R からなる群から選択され、R₂ が OR であり、R₃ が飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 C₁ ~ C₁₂ アルキルであり、R が先に定義された通りである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

n が 2 であり、環 A が不飽和であり、二重結合が C 1 と C 2 の間に位置し、R₁ が水素、環 A の炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、及び CH₃ からなる群から選択され、R₂ が OCH₃ であり、R₃ が 1, 1-ジメチルヘプチルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

n が 2 であり、環 A が不飽和であり、二重結合が C 1 と C 2 の間に位置し、R₁ が環 A の炭素分子 C 6 と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、及び C 3 又は C 4 位置における gem-ジメチルであり、R₂ が OCH₃ であり、R₃ が 1, 1-ジメチルヘプチルである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

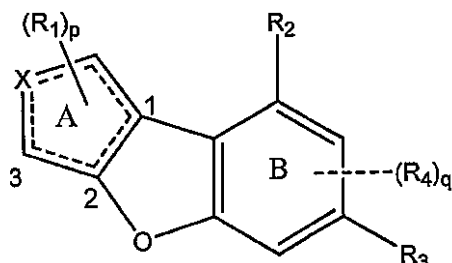
前記化合物が、9-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7-メトキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン、及び 9-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7-メトキシ-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンからなる群から選択される、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

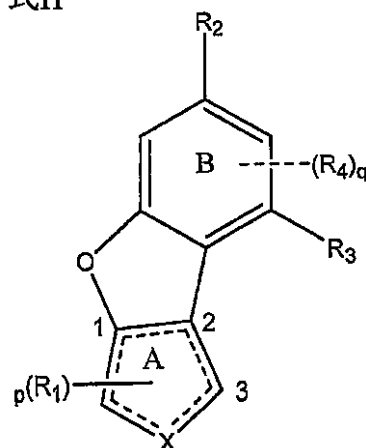
活性成分として、一般式 (I) 又は (II) :

【化 5】

式I



式II



[式中、

【化 6】

==

は単結合又は二重結合を表し、

Xは、 $(CH_m)_n$ (ここで、mは0～2の整数であり、nは0～4の整数である) であり、

R_1 は、各存在において、独立に、

a) ハロゲン、

b) 環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、

c) アリール、

d) R_a (ここで、 R_a は、 R_b 、 OR_b 、 $C(O)OR_b$ 及び $OC(O)R_b$ (ここで、 R_b は、N、O及びSからなる群から選択される1つ又は複数のヘテロ原子で置換された飽和又は不飽和、直鎖又は分枝 $C_1 \sim C_8$ アルキルである) からなる群から選択される)、

e) R_c (ここで、 R_c は、 R 、 OR 、 $OC(O)OR$ 、 $C(O)OR$ 、 $OC(O)R$ 及び $OC(O)N(R')_2$ (ここで、 R は、水素、飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- OR' 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-(OR')₂、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- $C(O)OR'$ 、及び $C_1 \sim C_6$ アルキル- $C(O)N(R')$ ₂ からなる群から選択され、 R' は、各存在において、独立に、水素及び飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択される) から選択される)、

f) オキシム、及び

g) $N(R')_2$ (ここで、 R' は、各存在において、先に定義された通りである) からなる群から選択され、

pは、0～14の整数であり、

R_2 は、

a) R_a 又は R_c (ここで、 R_a 及び R_c は、先に定義された通りである)、及び

b) $OR''Z$ (ここで、 R'' は、直接結合、 $C(O)$ 、 R_e 及び $C(O)R_e$ (ここで、 R_e は、飽和又は不飽和、直鎖又は分枝 $C_1 \sim C_8$ アルキルである) からなる群から選

択され、Zは、 ONO_2 、ハロゲン、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 SR' 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}'$ 、 $\text{S}(\text{O})(\text{O})\text{R}'$ 、 $\text{N}(\text{R}')_2$ （ここで、 R' は、先に定義された通りである）、並びにN、O及びSからなる群から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含む6個までの原子の飽和又は不飽和複素環からなる群から選択される）

からなる群から選択され、

R_3 は、

a) R_d （ここで、 R_d は、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}''$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}''$ 、 CN 及び NO_2 （ここで、 R'' は、水素及び飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$ アルキルからなる群から選択される）からなる群から選択される）、

b) 非置換又は先に定義された通りの飽和若しくは不飽和複素環で置換された、飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{12}$ アルキル、

c) アリールで置換された飽和又は不飽和、直鎖又は分枝 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$ アルキル、及び

d) 先に定義された通りの飽和又は不飽和複素環（前記環は、非置換であるか又は少なくとも1つの飽和若しくは不飽和、直鎖、分枝若しくは環状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル（前記アルキルは非置換又はアリールで置換されていてよい）で置換されている）

からなる群から選択され、

R_4 は、各存在において、独立に、水素、 NO_2 及び NH_2 からなる群から選択され、 q は、0～2の整数である」の化合物、及び前記化合物の立体異性体、薬剤として許容される塩、エステル、多形体又は溶媒和物の有効量を含み、更に、薬剤として許容される希釈剤又は担体を含む薬剤組成物であって、

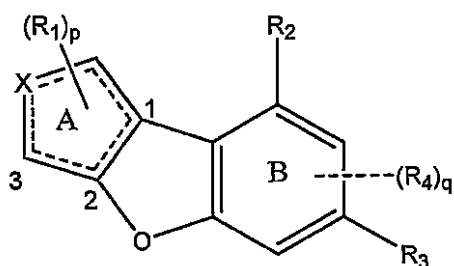
但し、Aは、フェニル環ではなく、式(I)の化合物において、(a) n が1の場合は、 R_1 はC2位置においてフェニルではなく、(b) n が2である場合は、C2における R_1 はイソプロピルであり、従ってC5における R_1 はメチル以外であり、及び(c) n が2である場合は、 R_1 はC3においてメチル及びヒドロキシルであり、C6においてイソプロペニルであり、従って R_2 は、 OH 、 OCH_3 及び $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 以外であり、式(II)の化合物において、 n が2である場合は、C2における R_1 はイソプロピルであり、従ってC5における R_1 はメチル以外である薬剤組成物。

【請求項13】

活性成分として、式(I)：

【化7】

式I



の構造により表される化合物を含む、請求項12に記載の薬剤組成物。

【請求項14】

n が1～3の整数であり、環 p が0～4の整数であり、 q が0～2の整数であり、Aが飽和又は不飽和（環Aの任意の二重結合は、C1とC2又はC3とC4の間に位置する）であり、 R_1 が、各存在において、独立に、水素、ハロゲン、環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、オキシム、 NH_2 、 R 、 OR 及び $\text{C}(\text{O})\text{OR}$ からなる群から選択され、 R_2 が、 R_c 、 OR 、 $\text{OR}''\text{Z}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}_b$ 、 OR_b 及び $\text{OC}(\text{O})\text{R}$ からなる群から選択され、 R_3 が、 $\text{C}(\text{O})\text{R}''$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}''$ 、及び非置換又は複素環若しくはアリールで置換されている飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$ アルキルからなる群から選択され、 R_4 が、水素及び NO_2 からなる群か

ら選択され、R、R''、R'''、R_b、複素環及びZが先に定義された通りである、請求項13に記載の薬剤組成物。

【請求項15】

前記活性成分が、

a) 式(I)の化合物(ここで、nは1であり、環Aは飽和であり、R₁は、各存在において、独立に、水素及びCH₃からなる群から選択され、R₂はOH及びOC(O)CH=CHC(O)OHからなる群から選択され、R₃は1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択される)、

b) 式(I)の化合物(ここで、nは2であり、環Aは飽和又は不飽和(任意の二重結合は、C1とC2又はC3とC4の間に位置する)であり、R₁は、各存在において、独立に、水素、環Aの炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、OH、イソプロピリデン、オキシム、ヨウ素及びCH₃からなる群から選択され、R₂は、OH、OCH₃、OCH₂C(O)OH、OCH₂SCH₃、OP(O)(OH)₂、OC(O)CH₃、OP(O)(OC₂H₅)₂、OCH₂-テトラゾール、OCH₂CH₂-モルホリン、OC(O)-ピペリジン、OC(O)(CH₂)₂NHCH₃、OCH₂CH(OH)CH₂OH、OC(O)CH=CHC(O)OH、OC(O)(CH₂)₃Br及びOC(O)(CH₂)₃ONO₂からなる群から選択され、R₃は2-フェネチル-[1, 3]-ジチオラン、2-メチル-[1, 3]-ジチオラン-2-イル、C(O)CH₃、C(O)OCH₃、1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、R₄は、水素及びNO₂からなる群から選択される)、及び

c) 式(I)の化合物(ここで、nは3であり、環Aは飽和であり、R₁は、水素、OH、ヨウ素、オキシム、C(O)OCH₃、NH₂、OC(O)CH=CHC(O)OH、C(O)OCH₃、CH₂C(O)OCH₃、C(O)OH、CH₂OH、CH₃及び環Aの炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子からなる群から選択され、R₂は、OH、OCH₂CH₂-モルホリン、OCH₂C(O)OH、OC(O)CH=CHC(O)OH、OCH₂-テトラゾール、OP(O)(OH)₂、OCH₂C(O)N(C₂H₅)₂、OC(O)CH₂OCH₂CH₂OCH₂CH₂OCH₃及びO(CH₂)₃C(O)OHからなる群から選択され、R₃はペンチル、1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、R₄は水素及びNO₂からなる群から選択される)

からなる群から選択される、請求項14に記載の薬剤組成物。

【請求項16】

前記活性成分が、

a) 式(I)の化合物(ここで、nは1であり、環Aは飽和であり、

i) R₁は、水素、C2位置におけるCH₃、C2及びC3位置におけるCH₃からなる群から選択され、R₂はOHであり、R₃は1, 1-ジメチルヘプチルである、

ii) R₁は、C2位置におけるCH₃であり、R₂はOHであり、R₃は1, 1-ジメチルペンチルである、又は

iii) R₁は、C2及びC3位置におけるCH₃であり、R₂は、OC(O)CH=CHC(O)OHであり、R₃は1, 1-ジメチルヘプチルである)、

b) 式(I)の化合物(ここで、nは2であり、環Aは飽和であり、

i) R₁は、C3位置における水素、OH、環Aの炭素分子C3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、C3位置におけるヨウ素又はオキシム、C4位置におけるgem-ジメチル、C2位置におけるCH₃及びC5位置におけるイソプロピリデンの両方、環Aの炭素分子C3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子及びC4位置におけるgem-ジメチルの両方、並びにC3位置におけるOH及びC4位置におけるgem-ジメチルの両方からなる群から選択され、R₂はOHであり、R₃は1, 1-ジメチルヘプチルである、

ii) R₁は、C4位置における更なるgem-ジメチルを伴う又は伴わないC3位置における水素、OH、環Aの炭素分子C3と一緒にカルボニル基を形成する酸素

分子、又はC 3 位置におけるオキシム、C 3 位置におけるヨウ素及びC 4 位置における gem-ジメチルからなる群から選択され、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルである、

i i i) R₁ はC 4 位置における水素又は gem-ジメチルであり、R₂ はOCH₂ C(O)OHであり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチル又は1, 1-ジメチルペンチルである、

i v) R₁ は水素であり、R₂ は、OCH₂CH(OH)CH₂OH、OC(O)CH=CHC(O)OH、OC(O)CH₃、OP(O)(OH)₂、OP(O)(OC₂H₅)₂、OCH₂-テトラゾール、OC(O)-ピペリジン、OC(O)(CH₂)₃Br 及びOC(O)(CH₂)₃ONO₂ からなる群から選択され、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルである、

v) R₁ は水素であり、R₂ はOHであり、R₃ は2-メチルー[1, 3]ジチオラン-2-イル、C(O)CH₃、及びC(O)OCH₃ からなる群から選択される、

v i) R₁ はC 4 位置における更なる gem-ジメチルを伴う又は伴わない環Aの炭素分子C 3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子又はC 3位置におけるオキシムからなる群から選択され、R₂ はOCH₂SCH₃であり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルである、

v i i) R₁ はC 4 位置における gem-ジメチルであり、R₂ はOC(O)CH=CHC(O)OH又はOC(O)(CH₂)₂NHCH₃であり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルである、

v i i i) R₁ はC 4 位置における gem-ジメチルであり、R₂ はOH又はOC(O)CH=CHC(O)OHであり、R₃ は2-フェネチルー[1, 3]ジチオラン-2-イルである、又は

i x) R₁ はC 3 位置におけるOHであり、R₂ はOC(O)CH₂O(CH₂)₂O(CH₂)₂OCH₃であり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチルである)、

c) 式(I)の化合物(ここで、nは2であり、環AはC 3とC 4の間に位置する二重結合を有する不飽和であり、R₁ は水素であり、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチル又は1, 1-ジメチルヘプチルである)、

d) 式(I)の化合物(ここで、nは2であり、環Aは飽和であり、R₁ は水素であり、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルであり、R₄ は、R₂ に対してオルト、パラ、又はオルト及びパラの両方の位置におけるNO₂である)、

e) 式(I)の化合物(ここで、nは2であり、環AはC 1とC 2の間に位置する二重結合を有する不飽和であり、

i) R₁ は水素であり、R₂ はOH又はOC(O)CH=CHC(O)OHであり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチル又は1, 1-ジメチルヘプチルである、

i i) R₁ は環Aの炭素分子C 3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子及びC 6位置における gem-ジメチルであり、R₂ はOH又はOCH₃であり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチルである、

i i i) R₁ は環Aの炭素分子C 3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、及びC 5位置における gem-ジメチルであり、R₂ はOCH₃であり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチルである、又は

i v) R₁ はC 4 位置における gem-ジメチルであり、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチルである)、

f) 式(I)の化合物(ここで、nは3であり、環Aは飽和であり、

i) R₁ は水素、環Aの炭素分子C 3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、及びC 3位置におけるOHからなる群から選択され、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルヘプチル又はジメチルペンチルである、

i i) R₁ は環Aの炭素分子C 3と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、又はC 3及びC 4の両方の位置におけるOHであり、R₂ はOHであり、R₃ は1, 1-ジメチルペンチルである、

i i i) R_1 は水素であり、 R_2 は OCH_2CH_2 - モルホリンであり、 R_3 は 1, 1-ジメチルペンチル又は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

i v) R_1 は水素であり、 R_2 は $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 又は $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v) R_1 は C 3 位置における OH であり、 R_2 は、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2$ - モルホリン及び OCH_2 - テトラゾールからなる群から選択され、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v i) R_1 は、C 3 位置における ヨウ素又は $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ であり、 R_2 は $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

v i i) R_1 は C 3 位置における水素又は OH であり、 R_2 は OH であり、 R_3 はペンチルである、

v i i i) R_1 は C 3 位置におけるオキシム、ヨウ素、又は NH_2 、C 7 位置における $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 CH_2OH 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 又は $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、並びに C 3 位置における OH 及び C 7 位置における $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ の両方からなる群から選択され、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルである、

i x) R_1 は C 3 位置における OH であり、 R_2 は OH であり、 R_3 は 1, 1-ジメチルヘプチルであり、 R_4 は、 R_2 に対してオルト又はパラ位置における NO_2 である) からなる群から選択される、請求項 15 に記載の薬剤組成物。

【請求項 17】

活性成分として、6-(1, 1-ジメチルペンチル)-8a-メチル-2, 3, 3a, 8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサ-シクロペンタ[α]インデン-4-オール；6-(1, 1-ジメチルヘプチル)-8a-メチル-2, 3, 3a, 8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサ-シクロペンタ[α]インデン-4-オール；6-(1, 1-ジメチルヘプチル)-2, 3, 3a, 8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサ-シクロペンタ[α]インデン-4-オール；6-(1, 1-ジメチルヘプチル)-1, 8a-ジメチル-2, 3, 3a, 8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサ-シクロペンタ[α]インデン-4-オール；6-(1, 1-ジメチルヘプチル)-1, 8a-ジメチル-2, 3, 3a, 8a-テトラヒドロ-1H-8-オキサ-シクロペンタ[α]インデン-4-イル] エステル；3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-6-ヨード-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5a, 8, 9, 9a-テトラヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-6-ヨード-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 8, 9, 9a-テトラヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1, 6-ジオール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1, 6-ジオール；3-(1, 1-ジメチルヘプチル)-7, 7-ジメチル-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1, 6-ジオール；[3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-酢酸；3-[3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イルオキシ]-プロパン-1, 2-ジオール；3-(1, 1-ジメチルペンチル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1, 6-ジオール；3-(2-メチル-[1, 3]ジチオラン-2-イル)-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-

ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-オール；4-〔2-〔3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルオキシ〕-エチル〕-モルホリン；ブト-2-エン二酸モノ-〔3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イル〕エステル；酢酸3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルエステル；ジエチルリン酸モノ-〔3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イル〕エステル；リン酸モノ-〔3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イル〕エステル；3-（1，1-ジメチルヘプチル）-7，7-ジメチル-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-オール；〔3-（1，1-ジメチルヘプチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルオキシ〕-酢酸；3-（1，1-ジメチルヘプチル）-8-イソプロピリデン-5a-メチル-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-オール；1-（1-ヒドロキシ-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-3-イル）-エタノン；1-ヒドロキシ-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-3-カルボン酸メチルエステル；5-〔3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルオキシメチル〕-1H-テトラゾール；ピペリジン-3-カルボン酸3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルエステル；4-ブromo酪酸3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルエステル；4-ニトロオキシ-酪酸3-（1，1-ジメチルペンチル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルエステル；7-（1，1-ジメチルヘプチル）-9-ヒドロキシ-3，3-ジメチル-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-（1，1-ジメチルヘプチル）-9-ヒドロキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-（1，1-ジメチルヘプチル）-9-ヒドロキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-（1，1-ジメチルペンチル）-9-メチルスルファニルメトキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-（1，1-ジメチルペンチル）-9-ヒドロキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン；7-（1，1-ジメチルペンチル）-9-ヒドロキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-（1，1-ジメチルペンチル）-9-ヒドロキシ-3，3-ジメチル-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；7-（1，1-ジメチルペンチル）-3，3-ジメチル-9-メチルスルファニルメトキシ-2，3，4a，9b-テトラヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンオキシム；〔3-（1，1-ジメチルヘプチル）-7，7-ジメチル-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルオキシ〕-酢酸；ブト-2-エン二酸モノ-〔3-（1，1-ジメチルヘプチル）-7，7-ジメチル-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イル〕エステル；7，7-ジメチル-3-（2-フェネチル-〔1，3〕ジチオラン-2-イル）-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-オール；3-メチルアミノ-プロピオン酸3-（1，1-ジメチルヘプチル）-7，7-ジメチル-5a，6，7，8，9，9a-ヘキサヒドロージベンゾフラン-1-イルエステル；ブト-2-エン二酸モノ-〔7，7-ジメチル-3-（2-フェネチル-〔1，3〕ジチオラン-2-イル）-5a，6，7，

8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-イル] エステル; 3-(1, 1-ジメチルペンチル)-2, 4-ジニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1, 1-ジメチルペンチル)-2-ニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 3-(1, 1-ジメチルペンチル)-4-ニトロ-5a, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-ジベンゾフラン-1-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 2-(1, 1-ジメチルペンチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルペンチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 2-(1, 1-ジメチルペンチル)-4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オン; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オン; 4-{2-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-エチル}-モルホリン; [2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酢酸; ブト-2-エン二酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; [2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酢酸; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 9a-テトラヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 8, 9-トリオール; ブト-2-エン二酸モノ-[9-(3-カルボキシ-アクリロイルオキシ)-2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; リン酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; 2-ペンチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-ペンチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 4-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ]-酪酸; 2-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-イルオキシ] N, N-ジエチルアセトアミド; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-(2H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-9-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸メチルエステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-4, 9-ジヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル)-5-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサ-ベンゾ[α]アズレン-4-オール; [2-(1, 1-ジ

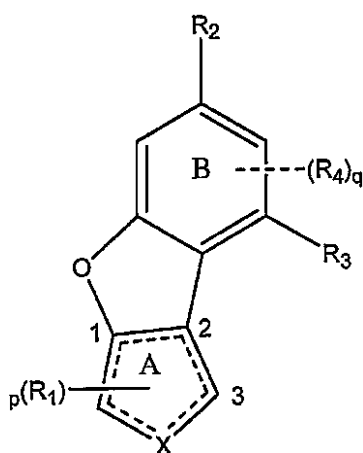
メチルヘプチル) - 4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-イル] - 酢酸メチルエステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 4-ヒドロキシ-4b, 5, 6, 7, 8, 9a-ヘキサヒドロ-10-オキサベンゾ[α]アズレン-9-オンオキシム; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-ヨード-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; [2-(2-メトキシ-エトキシ)-エトキシ] - 酢酸 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イルエステル; ブト-2-エン二酸モノ-[2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-ヨード-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-イル] エステル; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 4-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-5-カルボン酸; 9-アミノ-2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4-オール; 9-アミノ-2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-デスオキシベンゾ[α]アズレン-4-オール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 3-ニトロ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 2-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 1-ニトロ-5, 6, 7, 8, 9, 9a-ヘキサヒドロ-4bH-10-オキサベンゾ[α]アズレン-4, 9-ジオール; 3-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オール; ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-イル] エステル; 3-(1, 1-ジメチルペンチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オール; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-メトキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-メトキシ-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; ブト-2-エン二酸モノ-[3-(1, 1-ジメチルペンチル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-イル] エステル; 7-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 9-ヒドロキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン; 及び 3-(1, 1-ジメチルヘプチル) - 7, 7-ジメチル-6, 7, 8, 9-テトラヒドロジベンゾフラン-1-オールからなる群から選択される化合物を含む薬剤組成物。

【請求項18】

活性成分として、式(II)：

【化8】

式II



の構造により表される化合物を含む、請求項 12 に記載の薬剤組成物。

【請求項 19】

n が 1 ～ 3 の整数であり、環 A が不飽和であり、R₁ が水素、環 A の炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、及び R からなる群から選択され、R₂ が OR であり、R₃ が飽和又は不飽和、直鎖、分枝又は環状 C₁ ～ C₁₂ アルキルであり、R が先に定義された通りである、請求項 18 に記載の薬剤組成物。

【請求項 20】

n が 2 であり、環 A が不飽和であり、二重結合が C 1 と C 2 の間に位置し、R₁ が水素、環 A の炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、又は CH₃ であり、R₂ が OCH₃ であり、R₃ が 1, 1-ジメチルヘプチルである、請求項 19 に記載の薬剤組成物。

【請求項 21】

n が 2 であり、環 A が不飽和であり、二重結合が C 1 と C 2 の間に位置し、R₁ が環 A の炭素分子 C 6 と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、及び C 3 又は C 4 位置における gem-ジメチルであり、R₂ が OCH₃ であり、R₃ が 1, 1-ジメチルヘプチルである、請求項 20 に記載の薬剤組成物。

【請求項 22】

活性成分として、9- (1, 1-ジメチルヘプチル) -7-メトキシ-1, 1-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン及び 9- (1, 1-ジメチルヘプチル) -7-メトキシ-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オンからなる群から選択される化合物を含む、請求項 21 に記載の薬剤組成物。

【請求項 23】

前記希釈剤が、薬剤として許容される助溶媒を含む水溶液、天然又は合成のイオン又は非イオン界面活性剤で調製されるミセル溶液又はエマルジョン、又はその様な助溶媒とミセル若しくはエマルジョン溶液の組合せを含む、請求項 12 から 22 までのいずれか一項に記載の薬剤組成物。

【請求項 24】

前記担体が、エタノール、界面活性剤及び水の溶液を含む、請求項 23 に記載の薬剤組成物。

【請求項 25】

前記担体が、トリグリセリド、レシチン、グリセロール、乳化剤、及び水を含むエマルジョンである、請求項 23 に記載の薬剤組成物。

【請求項 26】

単位剤形にある、請求項 12 から 22 までのいずれか一項に記載の薬剤組成物。

【請求項 27】

経口投与に適した、請求項 26 に記載の薬剤組成物。

【請求項 28】

非経口投与に適した、請求項 26 に記載の薬剤組成物。

【請求項 29】

請求項 1 から 11 までのいずれか一項に記載の化合物の予防的に及び／又は治療的に有効な量を、投与を必要とする対象に投与することを含む、炎症、自己免疫疾患、疼痛、神経障害、神経変性疾患、神経炎症状態、眼障害、骨障害、心血管及び心臓炎症障害、食欲障害、嘔吐状態及びある種の癌の予防、緩和又は治療方法。

【請求項 30】

前記炎症及び自己免疫疾患が、関節リウマチ、若年性関節炎、変形性関節症、アレルギー及びアレルギー反応、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、重症筋無力症、I 型糖尿病、肝炎、乾癬、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、臓器移植における組織拒絶、吸収不良症候群、セリアック病、肺疾患、喘息、慢性気管支炎、慢性閉塞性肺疾患及びシェーグレン症候群を含む群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】

疼痛が、急性、慢性、末梢的、内臓、神経性、炎症性及び関連痛を含む群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 32】

前記神経障害、神経変性疾患及び神経炎症状態が、脳卒中、片頭痛、群発性頭痛、癇癇、パーキンソン病、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン舞踏病、プリオン随伴疾患、中枢神経系の中毒、筋肉の痙攣及び震え、髄膜炎、脳炎、脳虚血、並びにギランバレー症候群を含む群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 33】

前記心血管及び心臓炎症障害が、アテローム性動脈硬化症、心膜炎、心筋炎、心内膜炎、不整脈、高血圧症及び心筋虚血損傷を含む群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 34】

前記骨、眼、食欲の障害及び嘔吐状態が、骨代謝異常、パジェット病、骨粗鬆症、緑内障、拒食症、悪液質、嘔吐及び悪心からなる群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 35】

前記癌が、悪性脳腫瘍、皮膚腫瘍、肺腺癌、子宮、胸部及び前立腺の癌、リンパ腫、神経膠腫、甲状腺上皮腫、並びに神経芽細胞腫からなる群から選択される、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 36】

炎症、自己免疫疾患、疼痛、神経障害、神経変性疾患、眼障害、骨障害、心血管及び心臓炎症障害、食欲障害、嘔吐状態及びある種の癌を予防、緩和又は治療するための薬剤の調製のための請求項 1 から 11 までのいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 37】

前記炎症及び自己免疫疾患が、関節リウマチ、若年性関節炎、変形性関節症、アレルギー及びアレルギー反応、喘息、多発性硬化症、全身性エリテマトーデス、重症筋無力症、I 型糖尿病、肝炎、乾癬、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、臓器移植における組織拒絶、吸収不良症候群、セリアック病、肺疾患、喘息、慢性気管支炎、慢性閉塞性肺疾患及びシェーグレン症候群を含む群から選択される、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 38】

疼痛が、急性、慢性、末梢的、内臓、神経性、炎症性及び関連痛を含む群から選択される、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 39】

前記神経障害、神経変性疾患及び神経炎症状態が、脳卒中、片頭痛、群発性頭痛、癇癇、パーキンソン病、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン舞踏病、プリオン随伴疾患、中枢神経系の中毒、筋肉の痙攣及び震え、髄膜炎、脳炎、脳虚血、並びにギランバレー症候群を含む群から選択される、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 40】

前記心血管及び心臓炎症障害が、アテローム性動脈硬化症、心膜炎、心筋炎、心内膜炎、不整脈、高血圧症及び心筋虚血損傷を含む群から選択される、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 41】

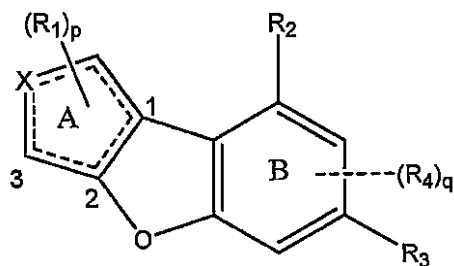
前記骨、眼、食欲の障害及び嘔吐状態が、骨代謝異常、パジェット病、骨粗鬆症、緑内障、拒食症、悪液質、嘔吐及び悪心からなる群から選択される、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 42】

一般式 (I) :

【化 9】

式I



〔式中、

【化 1 0】

は単結合を表し、

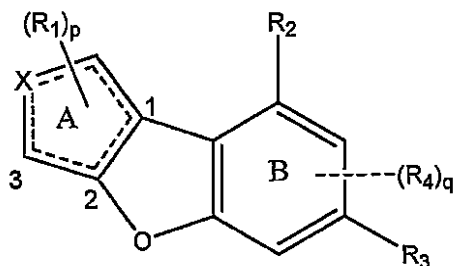
Xは CH_2 であり、 R_1 は、各存在において、独立に、水素及び CH_3 からなる群から選択され、 R_2 は、 OH 及び $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ からなる群から選択され、 R_3 は、1, 1-ジメチルペンチル及び1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、 R_4 は水素であり、 p は0～2の整数であり、 q は0の整数である化合物。

【請求項 4 3】

一般式 (I) :

【化 1 1】

式I



〔式中、

【化 1 2】

は単結合又は二重結合を表し、

Xは、 $(\text{CH}_m)_2$ (ここで、 m は0～2の整数である) であり、環Aは飽和又は不飽和 (任意の二重結合は、C 1とC 2又はC 3とC 4の間に位置する) であり、 R_1 は、各存在において、独立に、水素、環Aの炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、 OH 、イソプロピリデン、オキシム、ヨウ素、及び CH_3 からなる群から選択され、 R_2 は OH 、 OCH_3 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OCH_2SCH_3 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{OP}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 、 OCH_2 -テトラゾール、 OCH_2CH_2 -モルフォリン、 $\text{OC}(\text{O})$ -ピペリジン、 $\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_2\text{NHCH}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{OC}(\text{O})(\text{CH}$

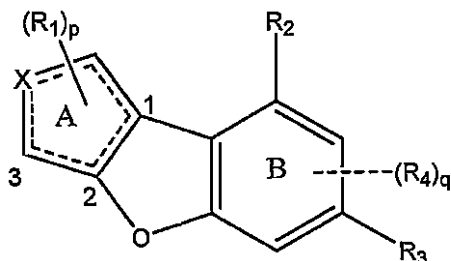
$\text{C}_2\text{H}_5\text{Br}$ 、及び $\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_3\text{ONO}_2$ からなる群から選択され、 R_3 は 2-フェネチル- [1, 3]-ジチオラン、2-メチル- [1, 3]-ジチオラン-2-イル、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、1, 1-ジメチルペンチル及び 1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、 R_4 は、水素及び NO_2 からなる群から選択され、 p は 0～3 の整数であり、 q は 0～2 の整数である化合物。

【請求項 44】

一般式 (I) :

【化 13】

式I



[式中、

【化 14】

は単結合を表し、

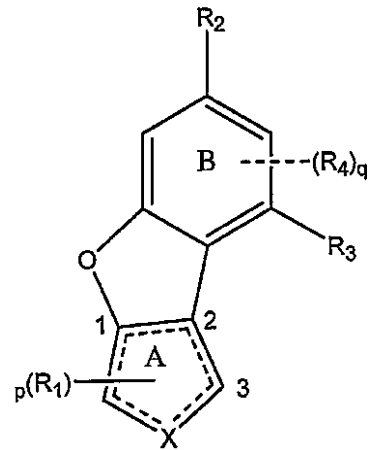
X は、 $(\text{CH}_m)_3$ (m は 0～2 の整数である) であり、 R_1 は、水素、 OH 、ヨウ素、オキシム、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 NH_2 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 CH_2OH 、 CH_3 及び環 A の炭素分子と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子からなる群から選択され、 R_2 は、 OH 、 OCH_2CH_2 -モルホリン、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{OH}$ 、 OCH_2 -テトラゾール、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 及び $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{C}(\text{O})\text{OH}$ からなる群から選択され、 R_3 はペンチル、1, 1-ジメチルペンチル及び 1, 1-ジメチルヘプチルからなる群から選択され、 R_4 は水素及び NO_2 からなる群から選択され、 p は 0～3 の整数であり、 q は 0～2 の整数である化合物。

【請求項 45】

一般式 (II) :

【化 1 5】

式II



【化 1 6】

====

は単結合又は二重結合を表し、

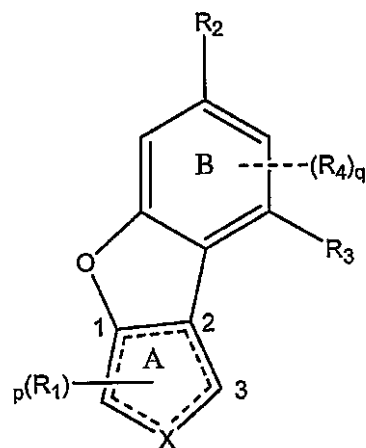
Xは、 $(CH_m)_2$ （ここで、mは0～2の整数である）であり、環Aは不飽和であり、二重結合はC1とC2の間に位置し、 R_1 は、水素、環Aの炭素分子と一緒になってカルボニル基を形成する酸素分子、及び CH_3 からなる群から選択され、 R_2 は、 OCH_3 であり、 R_3 は、1, 1-ジメチルヘプチルであり、 R_4 は水素であり、qは0であり、及びpは3である化合物。

【請求項 4 6】

一般式 (I I) :

【化 1 7】

式II



【化 1 8】

====

は単結合又は二重結合を表し、

Xは、 $(CH_m)_2$ （ここで、 m は0～2の整数である）であり、環Aは不飽和であり、二重結合はC1とC2の間に位置し、 R_1 は環Aの炭素分子C6と一緒にカルボニル基を形成する酸素分子、及びC3又はC4位置におけるgem-ジメチルであり、 R_2 は OCH_3 であり、 R_3 は1, 1-ジメチルヘプチルであり、 R_4 は水素であり、 q は0であり、及び p は3である化合物。