

【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30年11月8日(2018.11.8)

【公開番号】特開2018-135335(P2018-135335A)

【公開日】平成30年8月30日(2018.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2018-033

【出願番号】特願2018-42934(P2018-42934)

【国際特許分類】

C 0 7 C 49/84 (2006.01)  
C 0 7 C 49/83 (2006.01)  
C 0 7 C 49/517 (2006.01)  
C 0 7 C 49/513 (2006.01)  
C 0 7 C 225/20 (2006.01)  
C 0 7 C 43/215 (2006.01)  
C 0 7 C 43/23 (2006.01)  
C 0 7 C 62/14 (2006.01)  
C 0 7 C 62/06 (2006.01)  
C 0 7 C 233/60 (2006.01)  
C 0 7 C 233/32 (2006.01)  
C 0 7 C 39/17 (2006.01)  
C 0 7 C 255/47 (2006.01)  
C 0 7 C 235/82 (2006.01)  
C 0 7 C 62/38 (2006.01)  
C 0 7 C 323/20 (2006.01)  
C 0 7 C 233/76 (2006.01)  
C 0 7 C 233/31 (2006.01)  
C 0 7 C 275/26 (2006.01)  
C 0 7 C 275/64 (2006.01)  
C 0 7 C 323/31 (2006.01)  
C 0 7 C 317/22 (2006.01)  
C 0 7 C 279/16 (2006.01)  
C 0 7 C 311/13 (2006.01)  
C 0 7 C 335/14 (2006.01)  
C 0 7 C 311/19 (2006.01)  
A 6 1 P 37/06 (2006.01)  
A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
C 0 7 D 241/24 (2006.01)  
C 0 7 D 213/50 (2006.01)  
C 0 7 D 213/82 (2006.01)  
C 0 7 D 233/60 (2006.01)  
C 0 7 D 249/08 (2006.01)  
C 0 7 D 295/112 (2006.01)  
C 0 7 D 213/75 (2006.01)  
C 0 7 D 233/64 (2006.01)  
C 0 7 D 207/335 (2006.01)  
C 0 7 D 213/38 (2006.01)  
C 0 7 D 213/81 (2006.01)

C 0 7 D 213/89 (2006.01)  
 C 0 7 D 295/205 (2006.01)  
 C 0 7 D 211/62 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/68 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/122 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/136 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/085 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/05 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/192 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/135 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/167 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/165 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/277 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/166 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4965 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4402 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4406 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4164 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/495 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/417 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/17 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4409 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/145 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4465 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/155 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/443 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/455 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 49/84 C S P C  
 C 0 7 C 49/83  
 C 0 7 C 49/517  
 C 0 7 C 49/513  
 C 0 7 C 225/20  
 C 0 7 C 43/215  
 C 0 7 C 43/23 C  
 C 0 7 C 62/14  
 C 0 7 C 62/06  
 C 0 7 C 233/60  
 C 0 7 C 233/32  
 C 0 7 C 39/17  
 C 0 7 C 255/47

C 0 7 C	235/82	
C 0 7 C	62/38	
C 0 7 C	323/20	
C 0 7 C	233/76	
C 0 7 C	233/31	
C 0 7 C	275/26	
C 0 7 C	275/64	
C 0 7 C	323/31	
C 0 7 C	317/22	
C 0 7 C	279/16	
C 0 7 C	311/13	
C 0 7 C	335/14	
C 0 7 C	311/19	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
C 0 7 D	241/24	
C 0 7 D	213/50	
C 0 7 D	213/82	
C 0 7 D	233/60	1 0 4
C 0 7 D	249/08	5 1 4
C 0 7 D	295/112	
C 0 7 D	213/75	
C 0 7 D	233/64	1 0 5
C 0 7 D	207/335	
C 0 7 D	213/38	
C 0 7 D	213/81	
C 0 7 D	213/89	
C 0 7 D	295/205	
C 0 7 D	211/62	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	307/68	
A 6 1 K	31/12	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/122	
A 6 1 K	31/136	
A 6 1 K	31/085	
A 6 1 K	31/05	
A 6 1 K	31/192	
A 6 1 K	31/135	
A 6 1 K	31/167	
A 6 1 K	31/165	
A 6 1 K	31/277	
A 6 1 K	31/10	
A 6 1 K	31/166	
A 6 1 K	31/4965	
A 6 1 K	31/4402	
A 6 1 K	31/4406	

A 6 1 K 31/4164  
 A 6 1 K 31/495  
 A 6 1 K 31/417  
 A 6 1 K 31/17  
 A 6 1 K 31/4409  
 A 6 1 K 31/145  
 A 6 1 K 31/4465  
 A 6 1 K 31/18  
 A 6 1 K 31/155  
 A 6 1 K 31/443  
 A 6 1 K 31/444  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 K 31/455

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月1日(2018.10.1)

【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

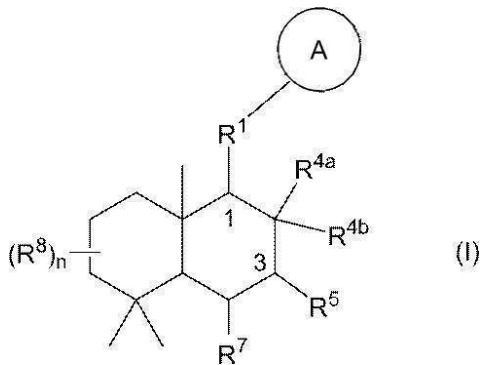
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化213】



の化合物またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩であって；

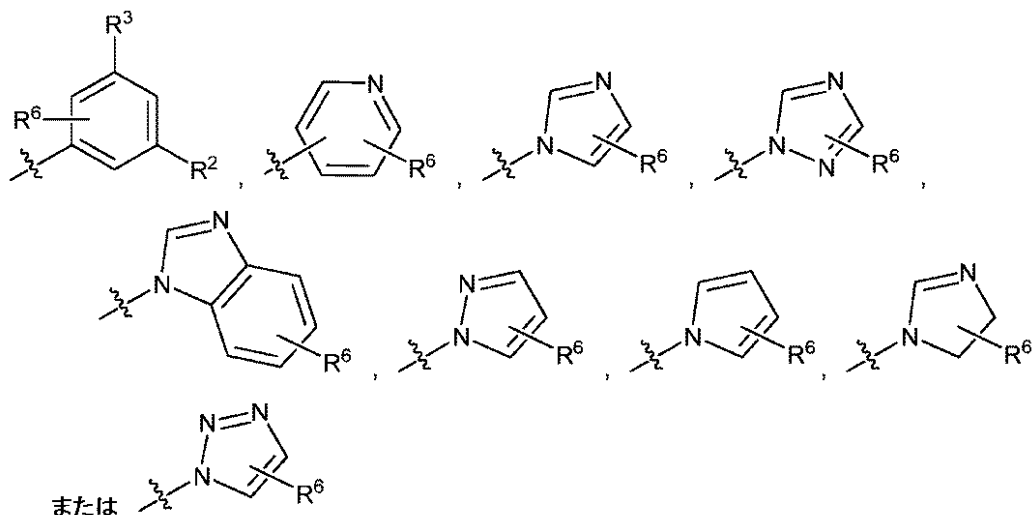
式(I)において；

【化214】



は：

## 【化215】



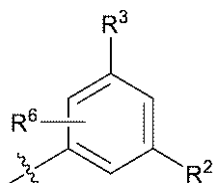
から選択され；

$n$  は、1、2、3、4、5、または6であり；

$R^1$  は、 $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}-$ 、 $-R^{9a}-C(O)-R^{9b}-$ 、 $-R^{9a}-S(O)_t-R^{9b}-$ （ここで  $t$  は、0、1もしくは2である）、 $-R^{9a}-O-R^{9b}-$ 、 $-R^{9a}-C(O)N(R^{11a})-R^{9b}-$ 、 $-R^{9a}-N(R^{11a})C(O)-R^{9b}-$  または  $-R^{9a}-N(R^{11a})-R^{9b}-$  であり；

ただし、 $A$  が

## 【化215A】



である場合、 $R^1$  は  $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}-$  ではなく；

$R^2$  および  $R^3$  は各々独立して、水素、アルキルまたは  $-R^9-OR^{11}$  から選択され、ただし、 $R^6$  が水素である場合、 $R^2$  および  $R^3$  のうちの少なくとも一方は、 $-R^9-OR^{11}$  であり；

$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  は各々独立して、水素、アルキル、 $-R^9-OR^{11}$  または  $-C(O)OR^{11}$  から選択されるか、あるいは  $R^{4a}$  は、水素、アルキル、 $-R^9-OR^{11}$ 、または  $-C(O)OR^{11}$  から選択され、そして  $R^{4b}$  は、数字1の炭素への直接結合、または数字3の炭素への直接結合であり；

$R^5$  は独立して、水素、オキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^9-OR^{11}$ 、 $-R^9-C(O)R^{11}$ 、 $-R^9-C(O)OR^{11}$ 、 $-R^9-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})-R^{14}-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)-R^9-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)N(R^{11})-OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(=NR^{11})N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})S(O)_pR^{11}$ （ここで  $p$  は、1もしくは2である）、 $-R^9-N(R^{11})C(S)N(R^{11})R^{12}$  または  $-R^9-N(R^{11})C(O)-R^9-N(R^{11})S(O)_p$

$R^{12}$  (ここで  $p$  は、1 もしくは 2 である) から選択され;

$R^6$  および  $R^8$  の各々は独立して、水素、アルキル、ハロまたはハロアルキルから選択され;

$R^7$  は、水素、アルキル、ハロまたはハロアルキルであり;

$R^9$ 、 $R^{9a}$  および  $R^{9b}$  の各々は独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり;

各  $R^{10}$  は独立して、水素、アルキル、 $-OR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$  または  $-N(R^{11})C(O)R^{11}$  であり;

$R^{11}$ 、 $R^{11a}$  および  $R^{12}$  の各々は独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルであり;そして

$R^{14}$  は、直鎖または分枝鎖のアルキレン鎖であり;

ただし、式 (I) の化合物は、以下の化合物:

(1S, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - (3 - メトキシ - 5 - メチルフェノキシメチル) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

(1S, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - (3, 5 - ジメトキシフェノキシメチル) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

(1S, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - [3, 5 - ビス(プロパン - 2 - イルオキシ)フェノキシメチル] - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

(1R, 2R, 8aS) - 1 - ((3, 5 - ジメトキシフェニルスルホニル)メチル) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - オール;

(1R, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - { [(3 - メトキシ - 5 - メチルフェニル)スルファニル]メチル} - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

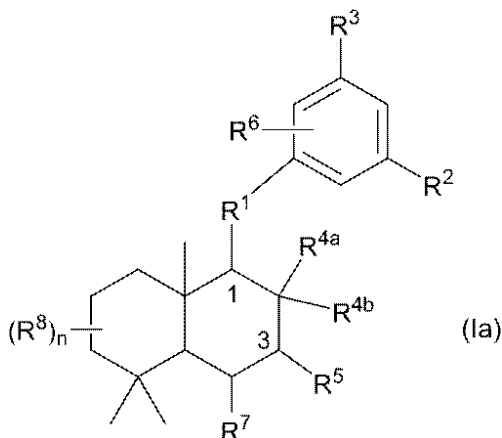
(1R, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - { [(3 - メトキシフェニル)スルファニル]メチル} - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール; および

(1R, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - { [(3, 5 - ジメトキシフェニル)スルファニル]メチル} - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オールを含まない、化合物またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】

式 (Ia) :

【化 216】



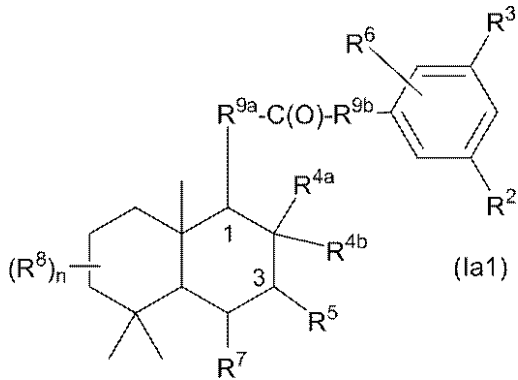
を有する、請求項 1 に記載の化合物であって；

式 (I a) において、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 1 において上で定義されたとおりである、化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 3】

$R^1$  が  $-R^{9a}-C(O)-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 (I a 1) ；

【化 2 1 7】



の化合物であり；

式 (I a 1) において、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 2 において上で定義されたとおりであり；そして

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 4】

(2R, 3R, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-メトキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；  
 (2R, 3R, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；  
 (3S, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；  
 (2R, 3R, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3, 5-ジメトキシフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；  
 (4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-メトキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - カルボニトリル；  
 (3R, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-メトキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オン；  
 (3S, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オン；  
 (3R, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3, 5-ジメトキシフェニル)カルボニル] - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オン；  
 2 - [(1S, 2S, 4aS, 8aR) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 - (3, 5-ジメトキシフェニル)エタン - 1 - オン；  
 2 - [(1S, 2S, 4aS, 8aR) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 - (3-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)エタン - 1 - オン；  
 2 - [(1S, 2S, 4aS, 8aR) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 - (3, 5-ジヒドロキシフェニル)エタン - 1 - オン；  
 (3S, 4S, 4aS, 8aS) - 4 - [(3-メトキシ-5-メチルフェニル)カルボ

ニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - カルボキサミド  
 ;  
 ( 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カル  
 ボニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - カルボキサミ  
 ド ;  
 ( 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - メトキシ - 5 - メチルフェニル ) カルボ  
 ニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - カルボン酸 ;  
 ( 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カル  
 ボニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - カルボン酸 ;  
 2 - { [ ( 3 R, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシフェニル ) カル  
 ボニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] カルボ  
 ニル } ピリジン ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 R, 4 a S, 8 a S ) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3 - [ (   
 ピリジン - 2 - イル ) カルボニル ] - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボニル } ベ  
 ンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 ( 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - N - ( 3 - アミノプロピル ) - 4 - [ ( 3 - メトキシ  
 - 5 - メチルフェニル ) カルボニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナ  
 フタレン - 2 - アミン ;  
 3 - { [ ( 1 S, 4 a S, 8 a S ) - 3 - アミノ - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デ  
 カヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボニル } - 5 - メチルフェノール ;  
 ( 2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシフェニル ) カルボ  
 ニル ] - N - [ ( 4 - メトキシフェニル ) メチル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル -  
 デカヒドロナフタレン - 2 - アミン ;  
 ( 2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシフェニル ) カルボ  
 ニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - アミン ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 3 - アミノ - 2, 5, 5, 8 a - テト  
 ラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール  
 ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 3 - [ ( 1 H - イミダゾール - 5 - イ  
 ルメチル ) アミノ ] - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イ  
 ル ] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3  
 - [ ( 1 H - ピロール - 2 - イルメチル ) アミノ ] - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ]  
 カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3  
 - [ ( ピリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ] - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボ  
 ニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3  
 - [ ( ピリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ] - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボ  
 ニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 5 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 3 - [ ( 1 H - イミダゾール - 2 - イ  
 ルメチル ) アミノ ] - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イ  
 ル ] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール ;  
 ( 2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - メトキシ - 5 - メチルフェニル )  
 カルボニル ] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - アミン ;  
 3 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 3 - アミノ - 2, 5, 5, 8 a - テト  
 ラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボニル } - 5 - メチルフェノール ;  
 3 - { [ ( 1 S, 2 S, 3 R, 4 a S, 8 a S ) - 3 - [ ( 1 H - イミダゾール - 5 - イ  
 ルメチル ) アミノ ] - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イ  
 ル ] カルボニル } - 5 - メチルフェノール ;

5 - { [ ( 1 S , 2 S , 3 R , 4 a S , 8 a S ) - 3 - [ ( 3 - アミノプロピル ) アミノ ] - 2 , 5 , 5 , 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル ] カルボニル }  
 ベンゼン - 1 , 3 - ジオール ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 アセトアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] -  
 4 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 4 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] -  
 3 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 3 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] -  
 2 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 2 - メチルベンズアミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] ナ  
 フタレン - 2 - カルボキサミド ;

N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ナフタレン - 2 - カルボキサミド ;

N - [ ( 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カル  
 ボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] ピラジ  
 ン - 2 - カルボキサミド ;

N - { [ ( 2 R , 3 R , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニ  
 ル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル  
 ] メチル } アセトアミド ;

N - { [ ( 2 S , 3 R , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニ  
 ル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル  
 ] メチル } アセトアミド ;

N - { [ ( 2 S , 3 R , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニ  
 ル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル  
 ] メチル } ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

N - { [ ( 2 S , 3 R , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニ  
 ル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル  
 ] メチル } ベンズアミド ;

3 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 1 - ( ピリジン - 3 - イル ) 尿素 ;

1 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]

- 3 - エチル尿素 ;  
 1 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 3 - メトキシ尿素 ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ベンズアミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 1 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 3 - メチル尿素 ;  
 3 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] - 1 - ( ピリジン - 3 - イル ) 尿素 ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] アセトアミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ピリジン - 2 - カルボキサミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ピリジン - 4 - カルボキサミド ;  
 3 - { [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] カルバモイル } ピリジン - 1 - イウム - 1 - オーレート ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 3 - アミノプロパンアミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 ピペリジン - 4 - カルボキサミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ] ピ  
 リジン - 3 - カルボキサミド ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 - 6 - アミノピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 1 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 グアニジン ;  
 N - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル ) カルボニル ] - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ]  
 メタンスルホンアミド ;  
 1 - [ ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S , 8 a S ) - 4 - [ ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル

) カルボニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル] グアニジン;

N - [(2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S) - 4 - [(3, 5 - ジヒドロキシフェニル) カルボニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル] メタンスルホンアミド;

1 - [(2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S) - 4 - [(3, 5 - ジヒドロキシフェニル) カルボニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル] - 3 - メチルチオ尿素;

2 - [( { [(2 R, 3 S, 4 S, 4 a S, 8 a S) - 4 - [(3, 5 - ジヒドロキシフェニル) カルボニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - イル] カルバモイル } メチル) スルファモイル] 安息香酸;

5 - { [(1 S, 2 R, 3 S, 4 a S, 8 a S) - 3 - (1 H - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール;

5 - { [(1 S, 2 R, 3 S, 4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール;

5 - { [(1 S, 2 R, 3 S, 4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル] - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] カルボニル } ベンゼン - 1, 3 - ジオール;

(1 R, 2 R, 4 a S, 8 a S) - 1 - [(3 - メトキシ - 5 - メチルフェニル) カルボニル] - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

2 - [(1 R, 2 R, 4 a S, 8 a S) - 2 - ヒドロキシ - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 - (3, 5 - ジメトキシフェニル) エタン - 1 - オン;

(1 R, 2 R, 4 a S, 8 a S) - 1 - [(3, 5 - ジメトキシフェニル) カルボニル] - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

[(1 S, 4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 1, 4, 4 a, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル] (3 - メトキシ - 5 - メチルフェニル) メタノン;

3 - { [(4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 1, 4, 4 a, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル] カルボニル } - 5 - メチルフェノール;

3 - { [(4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 3, 4, 4 a, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル] カルボニル } - 5 - メチルフェノール;

[(1 S, 4 a S, 8 a S) - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - 1, 4, 4 a, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル] (3, 5 - ジメトキシフェニル) メタノン; または

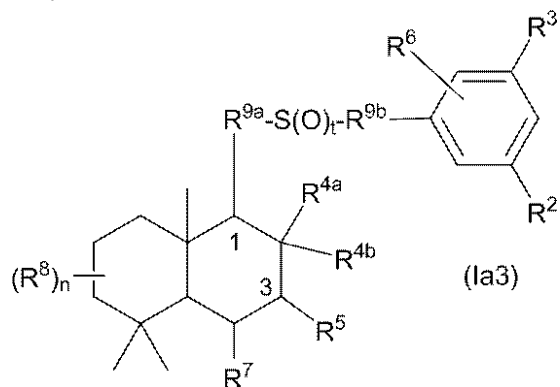
(2 R, 4 a S, 8 a S) - 4 - [(3, 5 - ジメトキシフェニル) カルボニル] - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - 1, 2, 4 a, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロナフタレン - 2 - オール

から選択される請求項 3 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 5】

$R^1$  が  $-R^9-S(O)_t-R^9-$  であり、ここで前記化合物が式 (I a 3) :

## 【化 2 1 9】



の化合物であり；

式 (I a 3) において、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 2 において上で定義されたとおりであり；

$t$  は、0、1 または 2 であり；そして

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 6】

(1 R, 2 R, 3 R, 4 a S, 8 a S) - 3 - アミノ - 1 - { [(3, 5 - ジメトキシフェニル)スルファニル]メチル} - 2, 5, 5, 8 a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；または

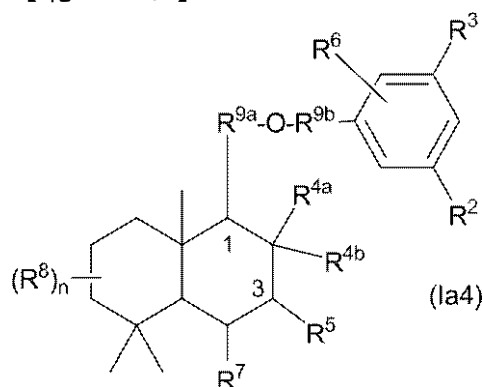
(4 S, 4 a S, 8 a S) - 4 - { [(3, 5 - ジメトキシベンゼン)スルホニル]メチル} - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール

から選択される請求項 5 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 7】

$R^1$  が  $-R^{9a}-O-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 (I a 4)：

## 【化 2 2 0】



の化合物であり；

式 (I a 4) において、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 2 において上で定義されたとおりであり；そして

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 8】

(4 S, 4 a S, 8 a S) - 4 - (3 - メトキシ - 5 - メチルフェノキシメチル) - 3, 4 a, 8, 8 - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール；

(1S, 2R, 4aS, 8aS) - 1 - [3, 5 - ビス(ベンジルオキシ) - フェノキシメチル] - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;  
 3 - { [(1S, 4aS, 8aS) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 1, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル]メトキシ} - 5 - メチルフエノール; または

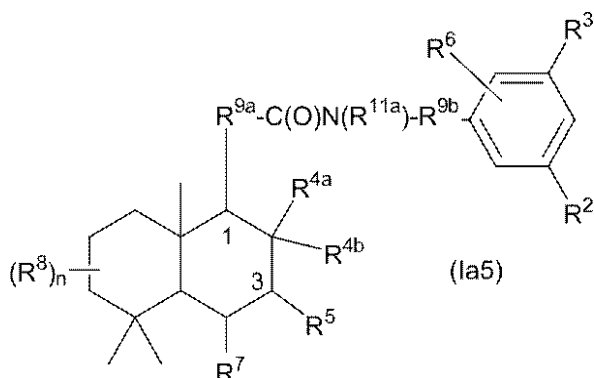
3 - { [(1S, 4aS, 8aS) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 1, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル]メトキシ} - 5 - メトキシフェノール

から選択される請求項7に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項9】

R<sup>1</sup> が - R<sup>9a</sup> - C(O)N(R<sup>11a</sup>) - R<sup>9b</sup> - であり、ここで前記化合物が式 (I a 5) :

【化221】



の化合物であり;

式 (I a 5) において、n、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、請求項2において上で定義されたとおりであり;

R<sup>9a</sup> および R<sup>9b</sup> は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり;そして

R<sup>11a</sup> は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルキルである、請求項2に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項10】

2 - [(1S, 2S, 4aS, 8aR) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 1 - イル] - N - (3, 5 - ジヒドロキシフェニル)アセトアミド;

2 - [(1S, 2R, 3R, 4aS, 8aR) - 3 - ブロモ - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロ - ナフタレン - 1 - イル] - N - (3, 5 - ジヒドロキシフェニル) - N - メチルアセトアミド;

2 - [(1S, 4aS, 8aS) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 1, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロナフタレン - 1 - イル] - N - (3, 5 - ジヒドロキシフェニル) - N - メチルアセトアミド;

(4aS, 8aS) - N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 3, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロナフタレン - 1 - カルボキサミド;

(4aS, 8aS) - N - (3 - ヒドロキシ - 5 - メトキシフェニル) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 3, 4, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロナフタレン - 1

- カルボキサミド ; または

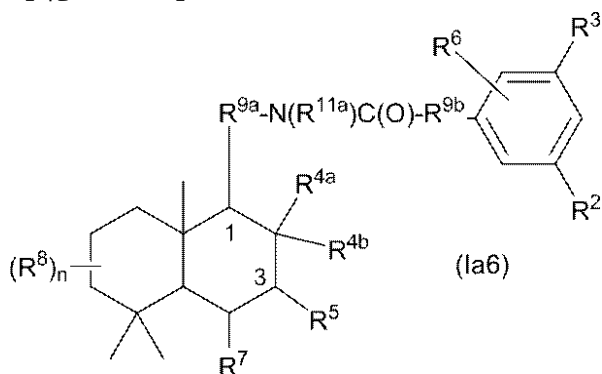
( 4 a S , 8 a S ) - N - ( 3 , 5 - ジヒドロキシフェニル ) - 2 , 5 , 5 , 8 a - テトラメチル - 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 7 , 8 , 8 a - オクタヒドロナフタレン - 1 - カルボキサミド

から選択される請求項 9 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 1】

$R^{11a}$  が  $-R^{9a}-N(R^{11a})C(O)-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 ( I a 6 ) :

【化 2 2 2】



の化合物であり ;

式 ( I a 6 ) において、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 2 において上で定義されたとおりであり ;

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり ; そして

$R^{11a}$  は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルである、請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 2】

N - ( ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S ) - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - 4 - ( ( 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド ) メチル ) - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ) ニコチンアミド ;

4 - メチル - N - ( ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S ) - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - 4 - ( ( 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド ) メチル ) - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

N - ( ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a S ) - 4 - ( ( 4 - フルオロベンズアミド ) メチル ) - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル ) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

4 - メチル - N - ( ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a R ) - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチル - 4 - ( 2 - ( 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド ) エチル ) - デカヒドロナフタレン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - カルボキサミド ; または

N - ( ( 2 R , 3 S , 4 S , 4 a R ) - 4 - ( 2 - ( 4 - フルオロベンズアミド ) エチル ) - 3 , 4 a , 8 , 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル ) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド

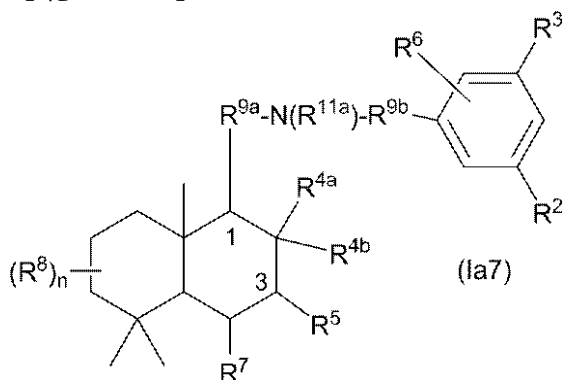
から選択される請求項 1 1 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 13】

$R^1$  が  $-R^{9a}-N(R^{11a})-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 (Ia7)

:

## 【化 223】



の化合物であり；

式 (Ia7) において、 $n$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 2 において上で定義されたとおりであり；

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；そして

$R^{11a}$  は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルキルである、請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

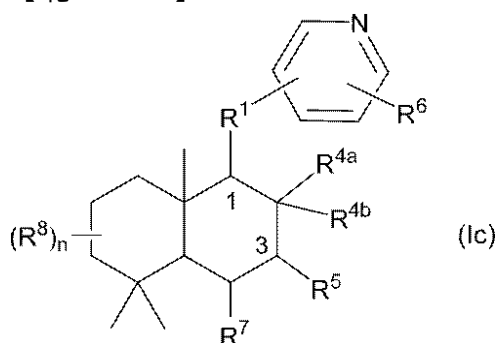
## 【請求項 14】

(2R, 4aS, 8aS) - 1 - { [(3-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)アミノ]メチル} - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - デカヒドロナフタレン - 2 - オールから選択される請求項 13 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 15】

式 (Ic) :

## 【化 224】



を有する、請求項 1 に記載の化合物であって；

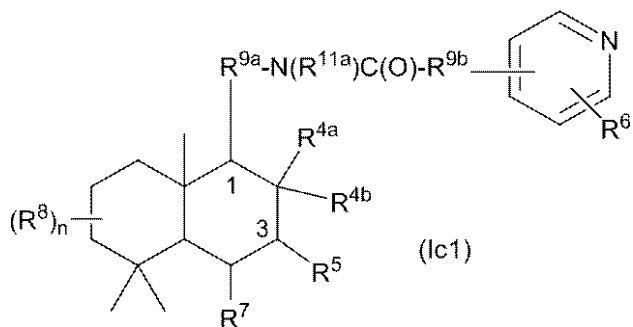
式 (Ic) において、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 1 において上で定義されたとおりである、化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 16】

$R^1$  が  $-R^{9a}-N(R^{11a})C(O)-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 (

I c 1 ) :

【化 2 2 5】



の化合物であり；

式 ( I c 1 ) において、 $n$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 9 において上で定義されたとおりであり；

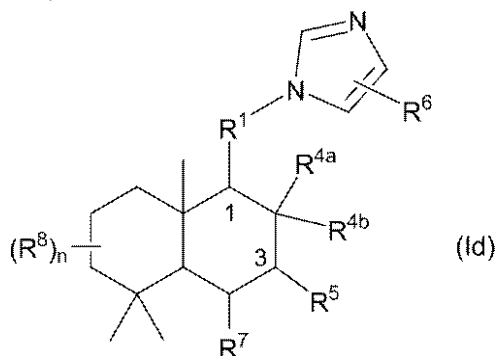
$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；そして

$R^{11a}$  は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルキルである、請求項 15 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 17】

式 ( I d ) :

【化 2 2 6】



を有する、請求項 1 に記載の化合物であって；

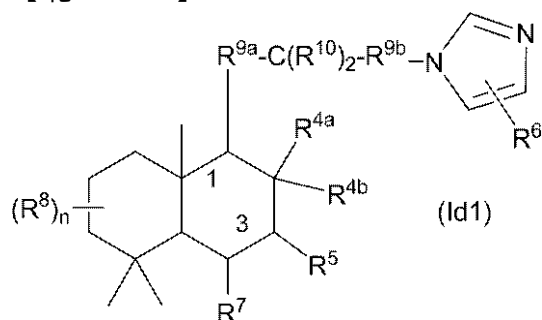
式 ( I d ) において、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 1 において上で定義されたとおりである、化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 18】

$R^1$  が  $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 ( I d 1 )

:

## 【化 2 2 7】



の化合物であり；

式 ( I d 1 ) において、 $n$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 11 において上で定義されたとおりであり；

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

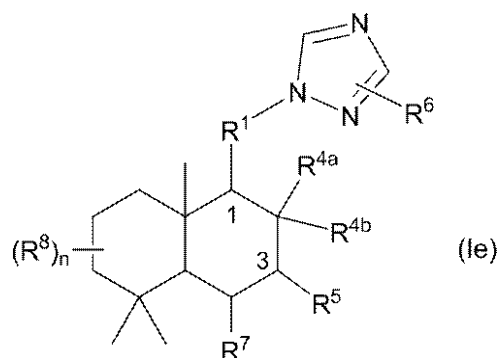
各  $R^{10}$  は独立して、水素、アルキル、 $-OR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$  または  $-N(R^{11})C(O)R^{11}$  であり；そして

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は各々独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルである、請求項 17 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩

## 【請求項 19】

式 ( I e ) ；

## 【化 2 2 8】



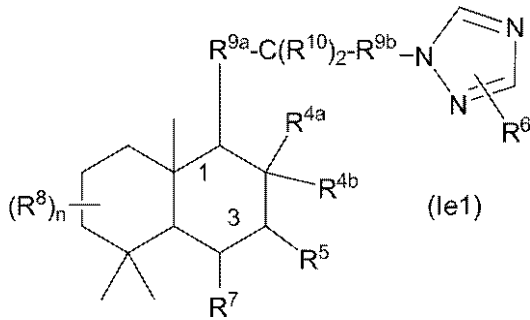
を有する、請求項 1 に記載の化合物であって；

式 ( I e ) において、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 1 において上で定義されたとおりである、化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 20】

$R^1$  が  $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 ( I e 1 ) ；

## 【化 2 2 9】



の化合物であり；

式 ( I e 1 ) において、 $n$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 13 において上で定義されたとおりであり；

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各  $R^{10}$  は独立して、水素、アルキル、 $-OR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$  または  $-N(R^{11})C(O)R^{11}$  であり；そして

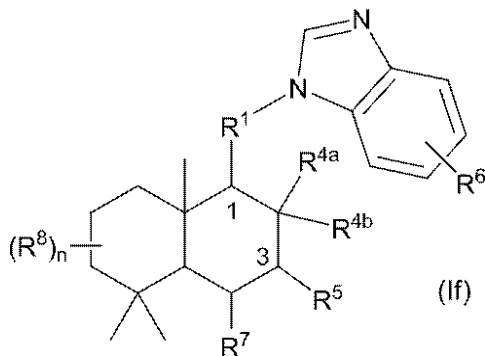
$R^{11}$  および  $R^{12}$  は各々独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルである、請求項 19 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩

。

## 【請求項 2 1】

式 ( I f ) ；

## 【化 2 3 0】



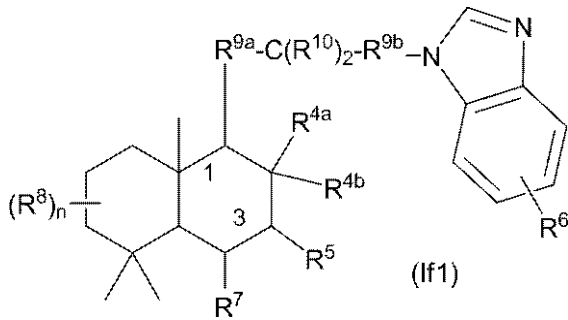
を有する、請求項 1 に記載の化合物であって；

式 ( I f ) において、 $n$ 、 $R^1$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 1 において上で定義されたとおりである、化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2 2】

$R^1$  が  $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}-$  であり、ここで前記化合物が式 ( I f 1 ) ；

## 【化 2 3 1】



の化合物であり；

式 (If1) において、 $n$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、請求項 15 において上で定義されたとおりであり；

$R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は各々独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各  $R^{10}$  は独立して、水素、アルキル、 $-OR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$  または  $-N(R^{11})C(O)R^{11}$  であり；そして

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は各々独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルである、請求項 21 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

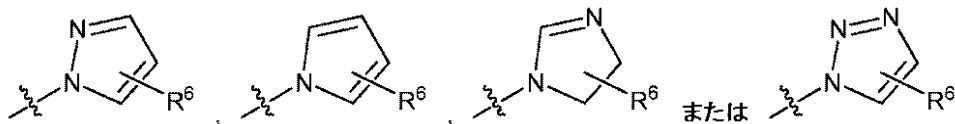
## 【請求項 23】

## 【化 2 3 2】



は：

## 【化 2 3 3】



から選択され；

$n$  は、1、2、3、4、5、または 6 であり；

$R^1$  は、 $-R^{9a}-C(R^{10})_2-R^{9b}$ 、 $-R^{9a}-C(O)-R^{9b}$ 、 $-R^{9a}-S(O)_t-R^{9b}$  (ここで  $t$  は、0、1 もしくは 2 である)、 $-R^{9a}-O-R^{9b}$ 、または  $-R^{9a}-C(O)N(R^{11a})-R^{9b}$  または  $-R^{9a}-N(R^{11a})C(O)-R^{9b}$  であり；

$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  は各々独立して、水素、アルキル、 $-R^9-OR^{11}$  または  $-C(O)OR^{11}$  から選択され；

$R^5$  は独立して、水素、オキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に

じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^9-OR^{11}$ 、 $-R^9-C(O)R^{11}$ 、 $-R^9-C(O)OR^{11}$ 、 $-R^9-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})-R^{14}-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)-R^9-N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(O)N(R^{11})-OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})C(=NR^{11})N(R^{11})R^{12}$ 、 $-R^9-N(R^{11})S(O)_pR^{11}$ （ここで p は、1 もしくは 2 である）、 $-R^9-N(R^{11})C(S)N(R^{11})R^{12}$  または  $-R^9-N(R^{11})C(O)-R^9-N(R^{11})S(O)_pR^{12}$ （ここで p は、1 もしくは 2 である）から選択され；

$R^6$  および  $R^8$  の各々は独立して、水素、アルキル、ハロまたはハロアルキルから選択され；

$R^7$  は、水素、アルキル、ハロまたはハロアルキルであり；

$R^9$ 、 $R^{9a}$  および  $R^{9b}$  の各々は独立して、直接結合、または直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各  $R^{10}$  は独立して、水素、アルキル、 $-OR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{11})R^{12}$ 、 $-N(R^{11})R^{12}$  または  $-N(R^{11})C(O)R^{11}$  であり；

$R^{11}$ 、 $R^{11a}$  および  $R^{12}$  の各々は独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールまたは必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルであり；そして

$R^{14}$  は、直鎖または分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 1 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 24】

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - (イソニコチンアミドメチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル)ニコチンアミド；

N - ((1S, 2S, 3R, 8aS) - 2, 5, 5, 8a - テトラメチル - 3 - (ニコチンアミド)デカヒドロナフタレン - 1 - イル)メチル)ニコチンアミド；

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - (イソニコチンアミドメチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド；

4 - メチル - N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - 4 - (ニコチンアミドメチル)デカヒドロナフタレン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - カルボキサミド；

4 - メチル - N - ((2R, 3S, 4S, 4aR) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチル - 4 - (2 - (ニコチンアミド)エチル)デカヒドロナフタレン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - カルボキサミド；

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - ((1H - イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル)ニコチンアミド；

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - ((1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)メチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル)ニコチンアミド；または

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - ((1H - ベンゾ[d]イミダゾール - 1 - イル)メチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル)ニコチンアミド

から選択される請求項 16、請求項 18、請求項 20 または請求項 22 に記載の化合物、またはその立体異性体あるいは薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 25】

(2R, 4R, 4aS, 8aS) - 4 - [(3, 5-ジメトキシフェニル)カルボニル] - 4a, 8, 8 - トリメチル - 3 - メチリデン - デカヒドロナフタレン - 2 - オール;

(4aS, 5S, 8aS) - 5 - [(3-メトキシ-5-メチルフェニル)メチル] - 1, 1, 4a - トリメチル - 6 - メチリデン - デカヒドロナフタレン;

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - ((フラン - 2 - カルボキサミド)メチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル)ニコチンアミド;

N - ((2R, 3S, 4S, 4aS) - 4 - ((フラン - 2 - カルボキサミド)メチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド; および

N - ((2R, 3S, 4S, 4aR) - 4 - (2 - (フラン - 2 - カルボキサミド)エチル) - 3, 4a, 8, 8 - テトラメチルデカヒドロナフタレン - 2 - イル) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド

からなる群より選択される化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 26】

請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、あるいは薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能な賦形剤を含有する、組成物。

## 【請求項 27】

疾患、障害または状態の処置の必要がある哺乳動物において、該疾患、障害または状態を処置するための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物、もしくはその薬学的に受容可能な塩、または立体異性体、あるいは請求項 26 に記載の組成物を含有し、該疾患、障害または状態は、自己免疫性の疾患、障害または状態、炎症性の疾患、障害または状態、あるいは腫瘍性または細胞増殖性の疾患、障害または状態である、組成物。