

【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 18 年 8 月 17 日 (2006.8.17)

【公表番号】特表 2006-505564(P2006-505564A)

【公表日】平成 18 年 2 月 16 日 (2006.2.16)

【年通号数】公開・登録公報 2006-007

【出願番号】特願 2004-544891(P2004-544891)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/4704	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/26	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	209/08	(2006.01)
C 0 7 D	215/22	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/167	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4704	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	5/26	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	209/08	
C 0 7 D	215/22	

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月3日(2006.7.3)

【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】

高齢男性のアンドロゲン減少に関連する病気（ADAM）を治療する薬剤を製造するための、選択的アンドロゲン受容体調節剤（SARM）化合物の使用。

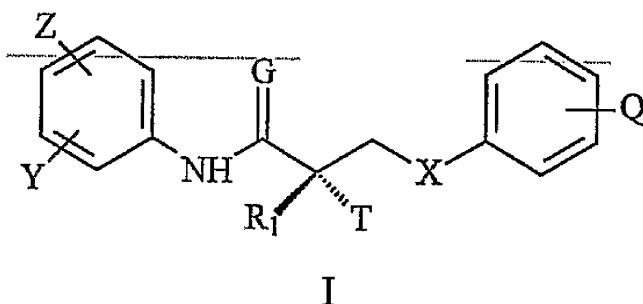
【請求項2】

前記薬剤が、前記SARM化合物の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物又はN酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶、又はそれらの任意の組み合わせを含むことを特徴とする請求項1に記載の使用。

【請求項3】

前記SARM化合物が、次の化学構造式Iで表されることを特徴とする請求項1に記載の使用。

【化1】



ただし、Gは、O、又はSであり、

Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又はNRであり、

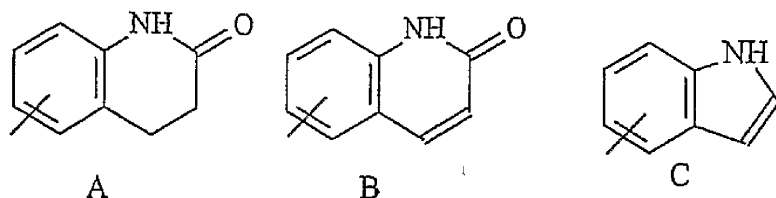
Tは、OH、OR、NHCOCH₃、又はNHCORであり、

Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、又はCONHRであり、

Yは、CF₃、I、Br、Cl、CN、CR₃、又はSnR₃であり、

Qは、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、NCS、SCN、NCO、又はOCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化8】



Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CH

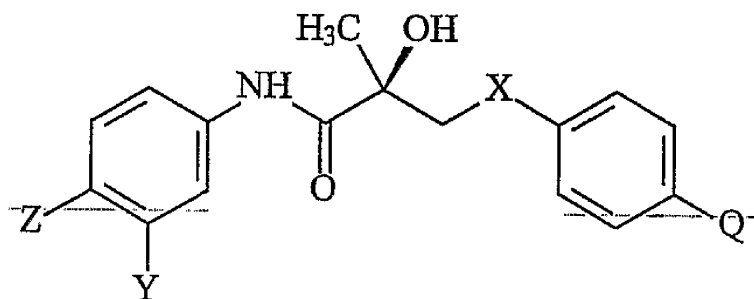
F_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルケニル、又は OH であり、

R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、又は CF_2CF_3 である。

【請求項 4】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 II で表されることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【化 2】



II

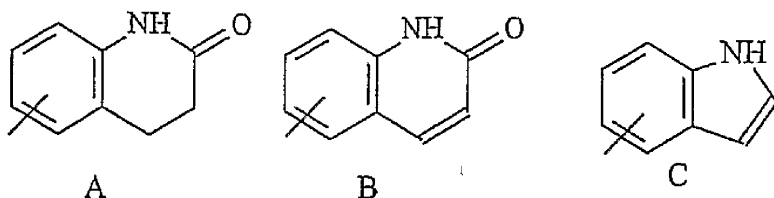
ただし、 X は、結合部、 O 、 CH_2 、 NH 、 Se 、 PR 、 NO 、又は NR であり、

Z は、 NO_2 、 CN 、 $COOH$ 、 COR 、 $NHCOR$ 、又は $CONHR$ であり、

Y は、 CF_3 、 I 、 Br 、 Cl 、 CN 、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Q は、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 $NHCONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $CONHR$ 、 $CONHR$ 、 $NHCSCH_3$ 、 $NHCSCHF_3$ 、 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、 OR 、 COR 、 $OCOR$ 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、 OCN である。或いは、 Q は、ベンゼン環と結合して構造式 A、B、又は C で表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



A

B

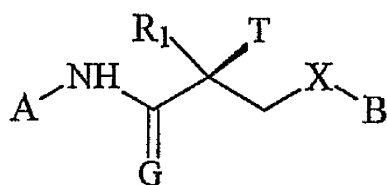
C

R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルケニル、又は OH である。

【請求項 5】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 III で表されることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【化 3】



III

ただし、Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又はNRであり、

Gは、O、又はSであり、

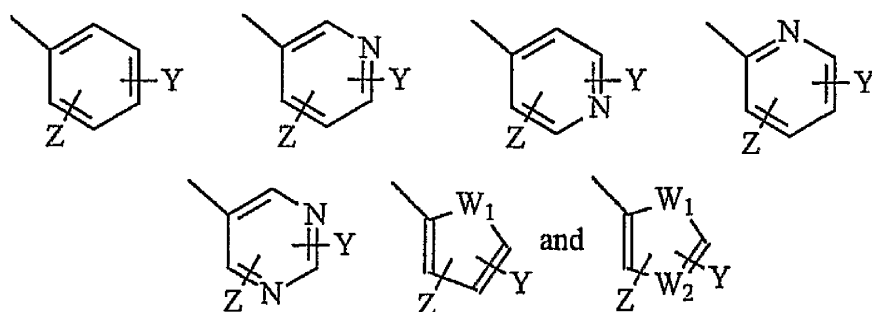
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、又はCF₂CF₃であり、

Tは、OH、OR、NHCOCH₃、又はNHCORであり、

Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

Aは、

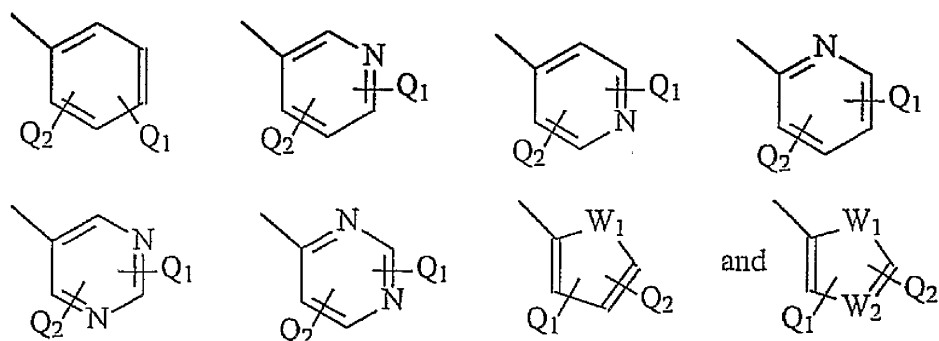
【化 9】



から選択される環であり、

Bは、

【化 10】



から選択される環であり、

A及びBは同時にはベンゼン環であり得ず、

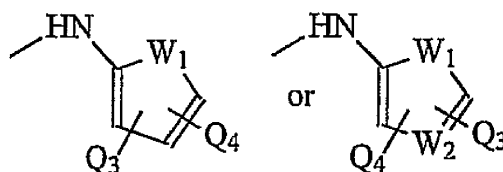
Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、又はCONHRであり、

Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、又はSnR₃であり、

Q₁及びQ₂は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、C

N、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 NHC
 $ONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $CONHR$ 、 $NHCSCH_3$ 、 $NHCSCF_3$
 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、 OR 、 COR 、 $OCOR$ 、 OSO_2R
 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、 OCN 、又は

【化11】



であり、

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 NHC
 $ONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $CONHR$ 、 $NHCSCH_3$ 、 $NHCSCF_3$
 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、 OR 、 COR 、 $OCOR$ 、 OSO_2R
 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN であり、

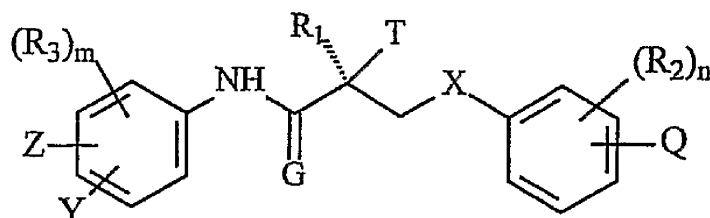
W_1 は、O、NH、NR、NO、又は S であり、

W_2 は、N、又は NO である。

【請求項6】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 IV で表されることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【化4】



IV

ただし、X は、結合部、O、 CH_2 、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、

G は、O、又は S であり、

T は、OH、OR、 $NHCOCH_3$ 、又は $NHCOR$ であり、

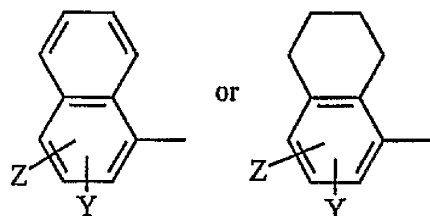
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又は OH であり、

R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、又は CF_2CF_3 であり、

R_2 は、F、Cl、Br、I、 CH_3 、 CF_3 、OH、CN、 NO_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、アルキル、アリルアルキル、OR、 NH_2 、NHR、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、F、Cl、Br、I、CN、 NO_2 、COR、COOH、CONHR、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 2】

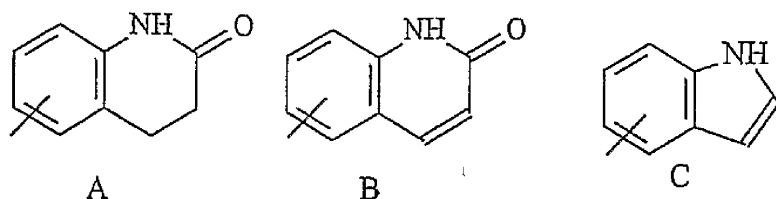


Zは、 NO_2 、 CN 、 COR 、 COOH 、又は CONHR であり、

Yは、 CF_3 、 F 、 Br 、 Cl 、 I 、 CN 、又は SnR_3 であり、

Qは、 H 、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OH 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN である。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



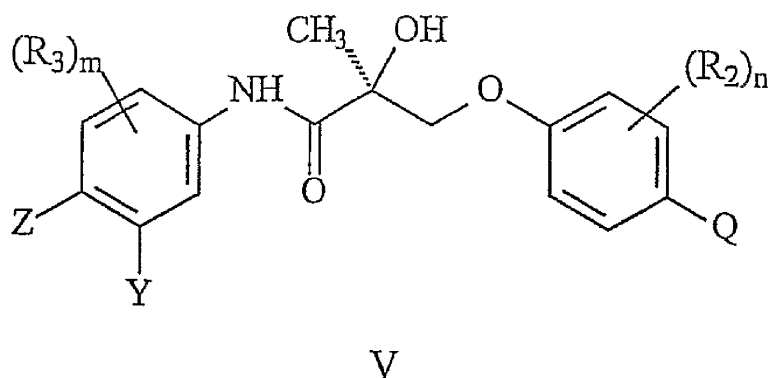
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 7】

前記SARM化合物が、次の化学構造式Vで表されることを特徴とする請求項1に記載の使用。

【化 5】

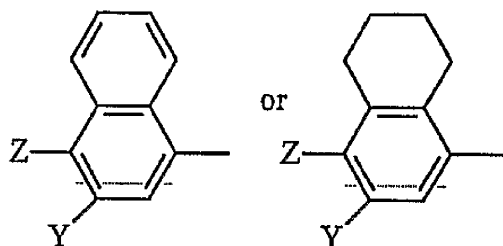


V

ただし、 R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 3】



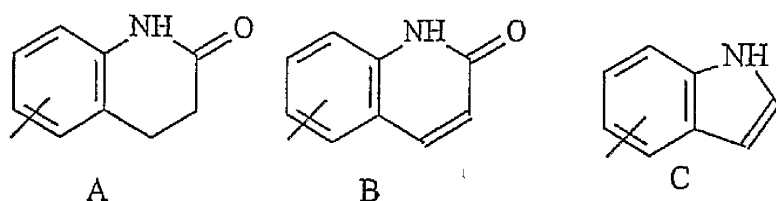
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

Z は、 NO_2 、CN、COR、COOH、又はCONHRであり、

Y は、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、又は SnR_3 であり、

Q は、H、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 CONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、又はOCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



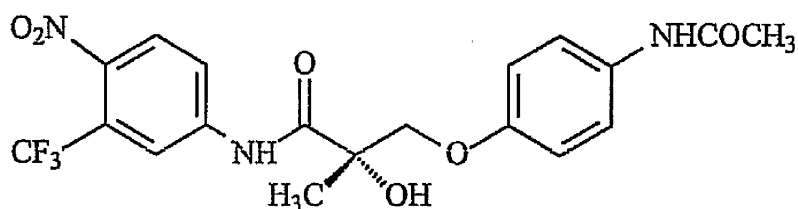
n は、1 ~ 4 の整数であり、

m は、1 ~ 3 の整数である。

【請求項 8】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIで表されることを特徴とする請求項1に記載の使用。

【化 6】

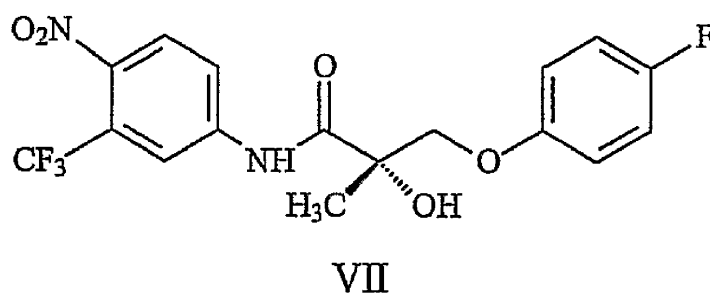


VI

【請求項 9】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIIで表されることを特徴とする請求項1に記載の使用。

【化 7】



【請求項 10】

前記 SARM が、アンドロゲン受容体アゴニストであることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 11】

前記 SARM が、アンドロゲン受容体アンタゴニストであることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 12】

前記 SARM が、筋肉又は骨にアゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 13】

前記 SARM が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 12 に記載の使用。

【請求項 14】

前記 SARM が、筋肉又は骨に効果を及ぼさないことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 15】

前記 SARM が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 14 に記載の使用。

【請求項 16】

前記 SARM が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 17】

前記 SARM が、中枢神経系に浸透することを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 18】

前記 SARM が、中枢神経系に浸透しないことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 19】

前記薬剤が、前記 SARM、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物、N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせと、薬学的に許容される担体とを含むことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 20】

前記薬剤が、
 静脈内注射、動脈内注射、又は筋肉内注射可能な液体か、
 皮下埋め込み可能なベレットか、
 経口投与可能な液体又は固体か、又は、
 皮膚の表面に塗布可能な液体又は固体であることを特徴とする請求項 19 に記載の使用。

【請求項 21】

前記薬剤が、ベレット、錠剤、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、

クリーム、坐薬、又は非経口的製剤であることを特徴とする請求項 19 に記載の使用。

【請求項 22】

前記 A D A M 関連症状が、性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、前立腺癌、又はそれらの任意の組み合わせであることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 23】

高齢男性のアンドロゲン減少に関連する病気 (A D A M) を治療する方法であって、ヒト以外の患者に選択的アンドロゲン受容体調節剤 (S A R M) 化合物を投与する過程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 24】

高齢男性のアンドロゲン減少に関連する病気 (A D A M) の治療、予防、抑制、阻害、又はその発生率の低減のための薬剤を製造するための、選択的アンドロゲン受容体調節剤 (S A R M) 化合物の使用。

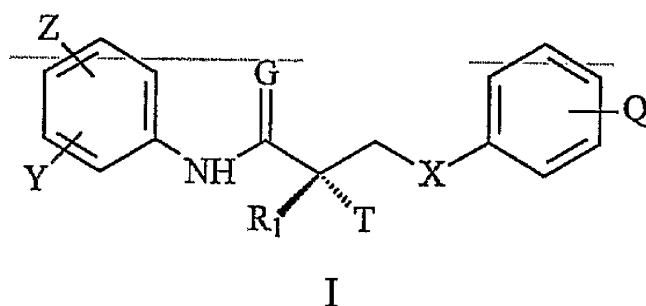
【請求項 25】

前記薬剤が、前記 S A R M 化合物の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物又は N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶、又はそれらの任意の組み合わせを含むことを特徴とする請求項 24 に記載の使用。

【請求項 26】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 I で表されることを特徴とする請求項 24 に記載の使用。

【化 1】



ただし、G は、O、又は S であり、

X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、

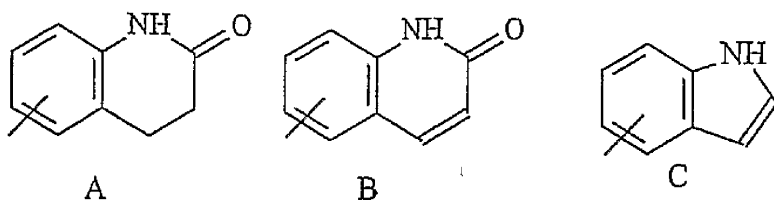
T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、又は CONHR であり、

Y は、CF₃、I、Br、Cl、CN、CR₃、又は SnR₃ であり、

Q は、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、NCS、SCN、NCO、又は OCN である。或いは、Q は、ベンゼン環と結合して構造式 A、B、又は C で表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



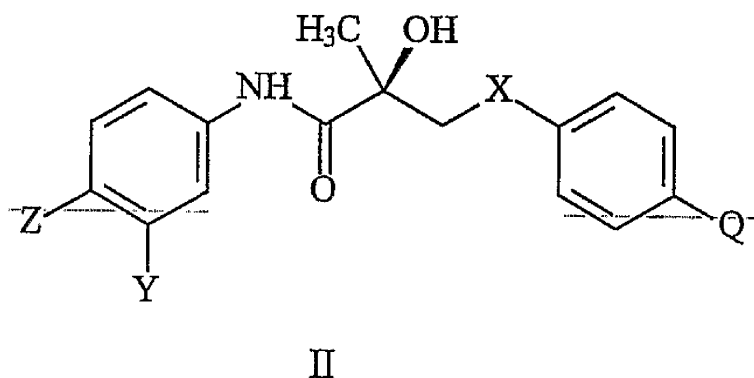
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、又は CF_2CF_3 である。

【請求項 27】

前記SARM化合物が、次の化学構造式IIで表されることを特徴とする請求項24に記載の使用。

【化 2】



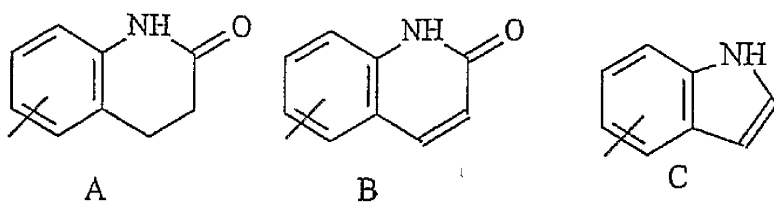
ただし、Xは、結合部、O、 CH_2 、NH、Se、PR、NO、又はNRであり、

Zは、 NO_2 、CN、COOH、COR、NHCOR、又はCONHRであり、

Yは、 CF_3 、I、Br、Cl、CN、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Qは、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCCH_3 、 NHCOCF_3 、NHCOR、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、CONHR、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、OCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】

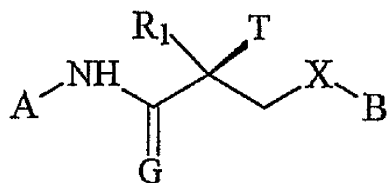


R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHである。

【請求項 28】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 III で表されることを特徴とする請求項 24 に記載の使用。

【化 3】



III

ただし、X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、
G は、O、又は S であり、

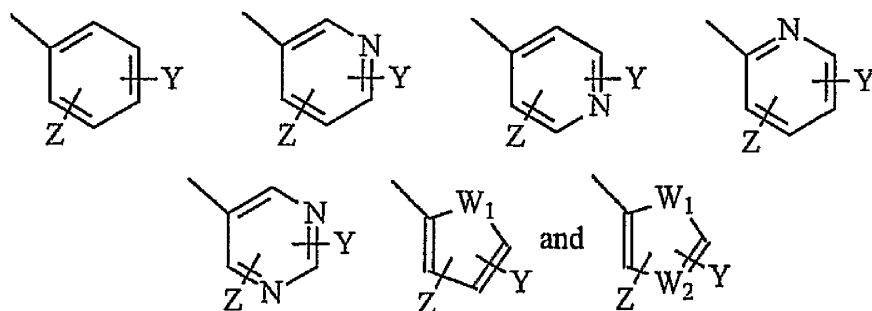
R₁ は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、又は CF₂CF₃ であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又は OH であり、

A は、

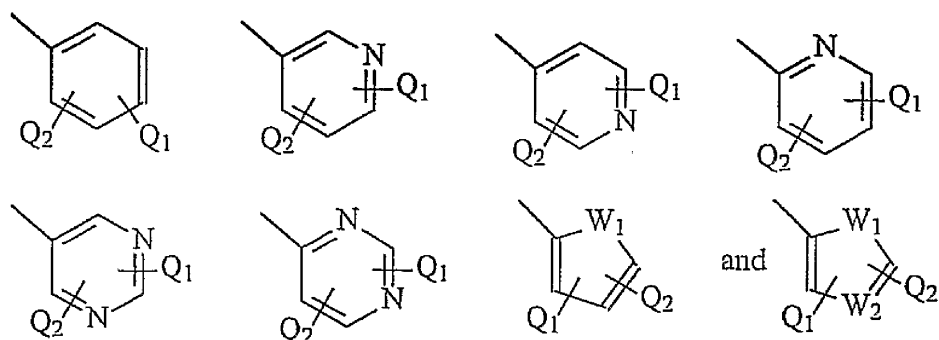
【化 9】



から選択される環であり、

B は、

【化 10】



から選択される環であり、

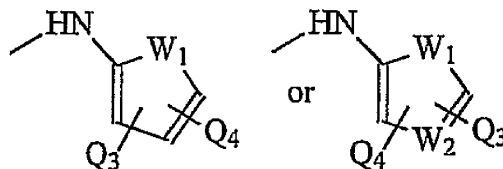
A 及び B は同時にはベンゼン環であり得ず、

Z は、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 COR 、 NHCOR 、又は CONHR であり、

Y は、 CF_3 、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CN 、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Q_1 及び Q_2 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、 OCN 、又は

【化 11】



であり、

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN であり、

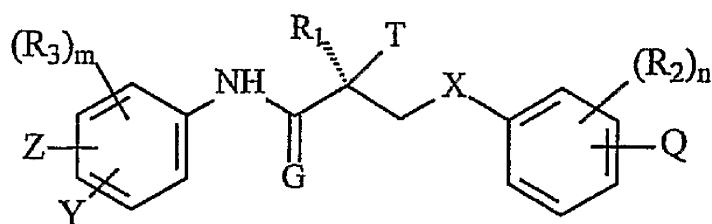
W_1 は、 O 、 NH 、 NR 、 NO 、又は S であり、

W_2 は、 N 、又は NO である。

【請求項 29】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 IV で表されることを特徴とする請求項 24 に記載の使用。

【化 4】



IV

ただし、X は、結合部、 O 、 CH_2 、 NH 、 Se 、 PR 、 NO 、又は NR であり、

G は、 O 、又は S であり、

T は、 OH 、 OR 、 NHCOCH_3 、又は NHCOR であり、

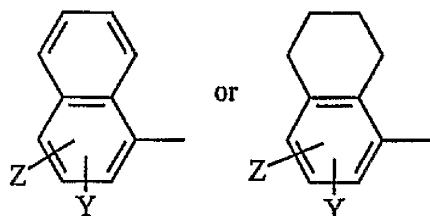
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ 、アリル、フェニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルケニル、又は OH であり、

R_1 は、 CH_3 、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CH}_2 \text{CH}_3$ 、又は $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ であり、

R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 2】

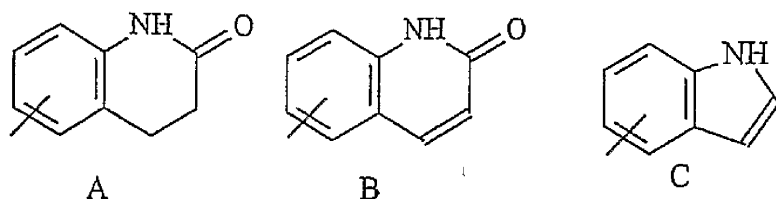


Zは、 NO_2 、 CN 、 COR 、 COOH 、又は CONHR であり、

Yは、 CF_3 、 F 、 Br 、 Cl 、 I 、 CN 、又は SnR_3 であり、

Qは、 H 、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OH 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN である。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



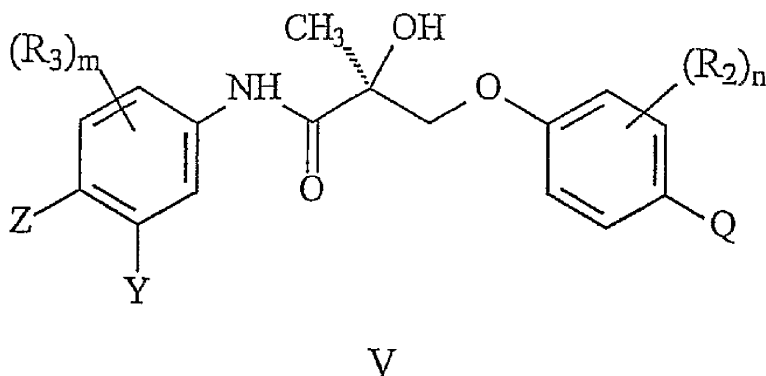
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 30】

前記SARM化合物が、次の化学構造式Vで表されることを特徴とする請求項24に記載の使用。

【化 5】

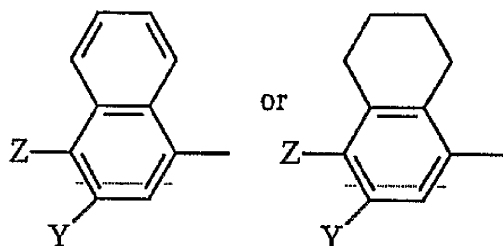


V

ただし、 R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 3】



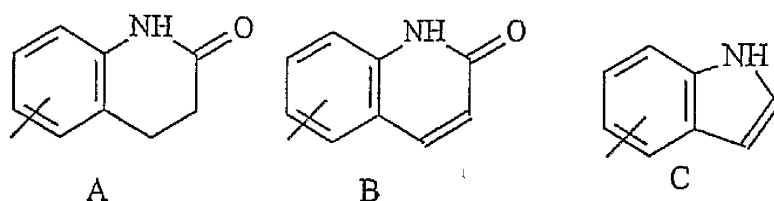
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

Zは、 NO_2 、CN、COR、COOH、又はCONHRであり、

Yは、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、又は SnR_3 であり、

Qは、H、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 CONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、又はOCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



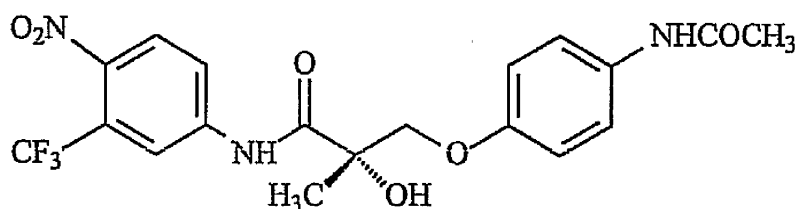
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 3 1】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIで表されることを特徴とする請求項24に記載の使用。

【化 6】

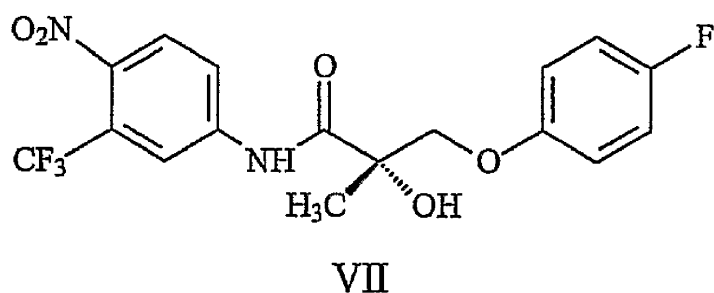


VI

【請求項 3 2】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIIで表されることを特徴とする請求項24に記載の使用。

【化 7】



【請求項 3 3】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アゴニストであることを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 3 4】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アンタゴニストであることを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 3 5】

前記 S A R M が、筋肉又は骨にアゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 3 6】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 3 7】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に効果を及ぼさないことを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 3 8】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 3 7 に記載の使用。

【請求項 3 9】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 4 0】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透することを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 4 1】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透しないことを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 4 2】

前記薬剤が、前記 S A R M、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物、N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせと、薬学的に許容される担体とを含むことを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 4 3】

前記薬剤が、
 静脈内注射、動脈内注射、又は筋肉内注射可能な液体か、
 皮下埋め込み可能なベレットか、
 経口投与可能な液体又は固体か、又は、
 皮膚の表面に塗布可能な液体又は固体であることを特徴とする請求項 4 2 に記載の使用。

【請求項 4 4】

前記薬剤が、ベレット、錠剤、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、

クリーム、坐薬、又は非経口的製剤であることを特徴とする請求項 4 2 に記載の使用。

【請求項 4 5】

前記 A D A M 関連症状が、性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、前立腺癌、又はそれらの任意の組み合わせであることを特徴とする請求項 2 4 に記載の使用。

【請求項 4 6】

高齢男性のアンドロゲン減少に関連する病気（A D A M）の治療、予防、抑制、阻害、又はその発生率の低減方法であって、

ヒト以外の患者に選択的アンドロゲン受容体調節剤（S A R M）化合物を投与する過程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 4 7】

高齢男性のアンドロゲン減少（A D A M）に起因する性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、前立腺癌、又はそれらの任意の組み合わせの治療のための薬剤を製造するための、選択的アンドロゲン受容体調節剤（S A R M）化合物の使用。

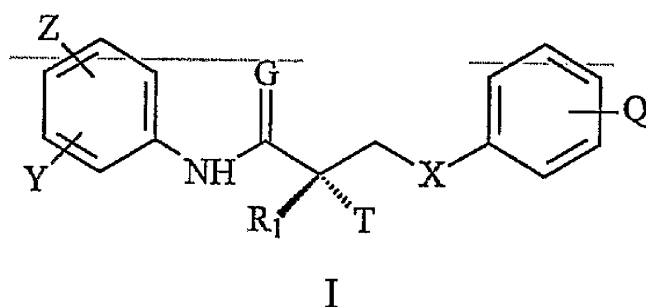
【請求項 4 8】

前記薬剤が、前記 S A R M 化合物の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物又は N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶、又はそれらの任意の組み合わせを含むことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 4 9】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 I で表されることを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【化 1】



ただし、G は、O、又は S であり、

X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、

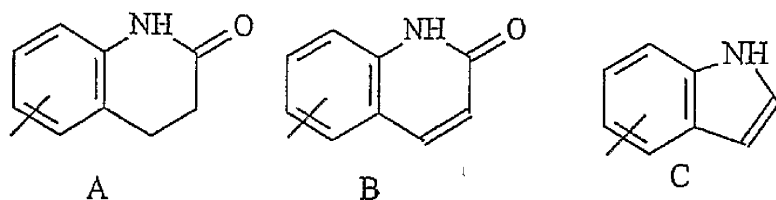
T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、又は CONHR であり、

Y は、CF₃、I、Br、Cl、CN、CR₃、又は SnR₃ であり、

Q は、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、NCS、SCN、NCO、又は OCN である。或いは、Q は、ベンゼン環と結合して構造式 A、B、又は C で表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



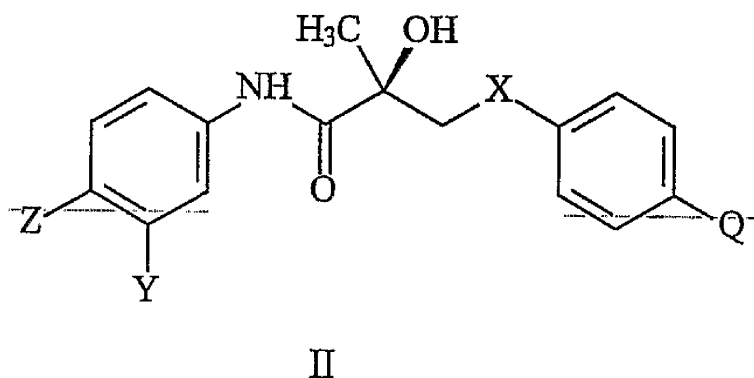
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、又は CF_2CF_3 である。

【請求項 50】

前記SARM化合物が、次の化学構造式IIで表されることを特徴とする請求項47に記載の使用。

【化 2】



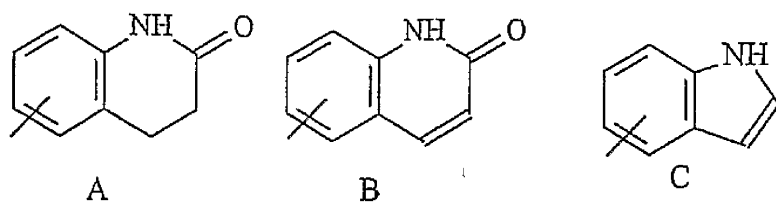
ただし、Xは、結合部、O、 CH_2 、NH、Se、PR、NO、又はNRであり、

Zは、 NO_2 、CN、COOH、COR、NHCOR、又はCONHRであり、

Yは、 CF_3 、I、Br、Cl、CN、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Qは、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCCH_3 、 NHCOCF_3 、NHCOR、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、CONHR、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHC SR 、 $\text{NH SO}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2\text{R}$ 、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、OCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】

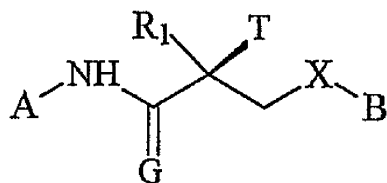


R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHである。

【請求項 51】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 III で表されることを特徴とする請求項 47 に記載の使用。

【化 3】



III

ただし、X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、
G は、O、又は S であり、

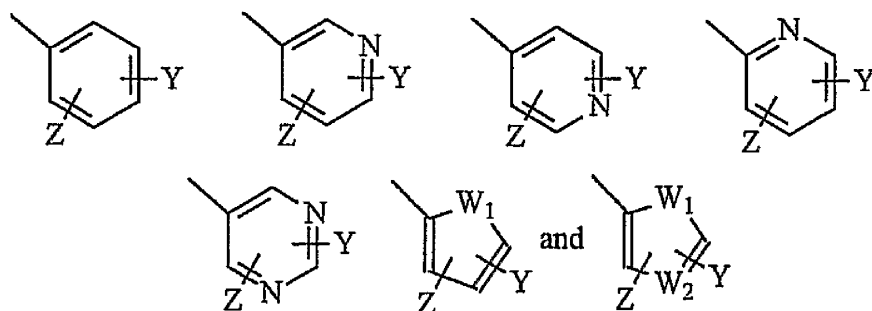
R₁ は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、又は CF₂CF₃ であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又は OH であり、

A は、

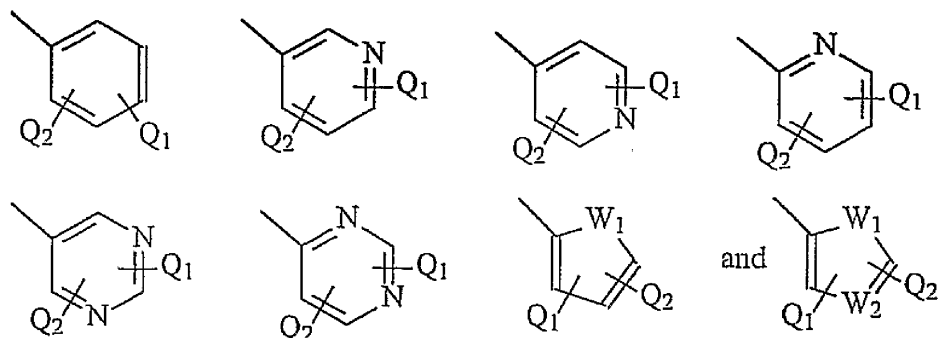
【化 9】



から選択される環であり、

B は、

【化 10】



から選択される環であり、

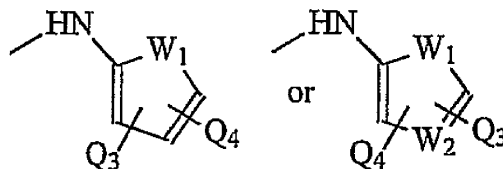
A 及び B は同時にはベンゼン環であり得ず、

Zは、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 COR 、 NHCOR 、又は CONHR であり、

Yは、 CF_3 、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CN 、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Q_1 及び Q_2 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、 OCN 、又は

【化11】



であり、

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN であり、

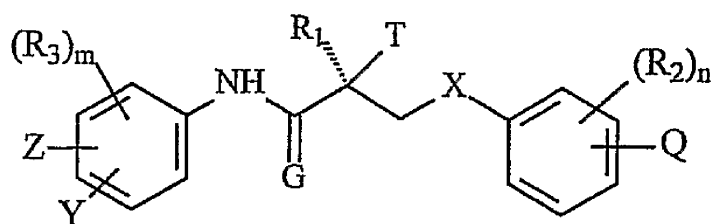
W_1 は、 O 、 NH 、 NR 、 NO 、又は S であり、

W_2 は、 N 、又は NO である。

【請求項52】

前記SARM化合物が、次の化学構造式IVで表されることを特徴とする請求項47に記載の使用。

【化4】



IV

ただし、Xは、結合部、 O 、 CH_2 、 NH 、 Se 、 PR 、 NO 、又は NR であり、

Gは、 O 、又は S であり、

Tは、 OH 、 OR 、 NHCOCH_3 、又は NHCOR であり、

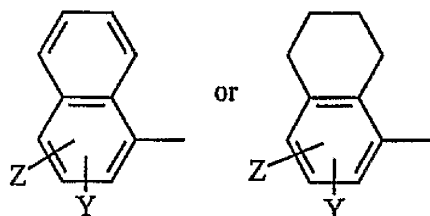
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ 、アリル、フェニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルケニル、又は OH であり、

R_1 は、 CH_3 、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CH}_2 \text{CH}_3$ 、又は $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ であり、

R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 2】

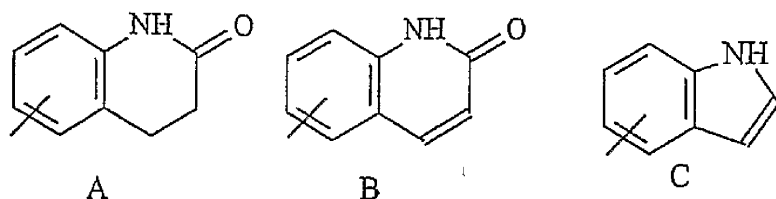


Zは、 NO_2 、 CN 、 COR 、 COOH 、又は CONHR であり、

Yは、 CF_3 、 F 、 Br 、 Cl 、 I 、 CN 、又は SnR_3 であり、

Qは、 H 、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OH 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN である。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



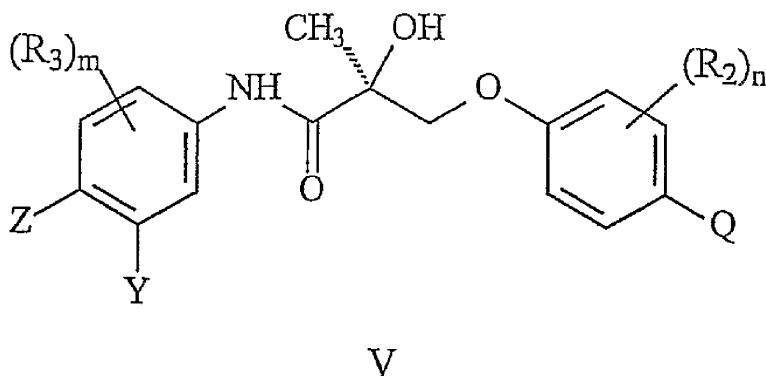
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 5 3】

前記SARM化合物が、次の化学構造式Vで表されることを特徴とする請求項47に記載の使用。

【化 5】

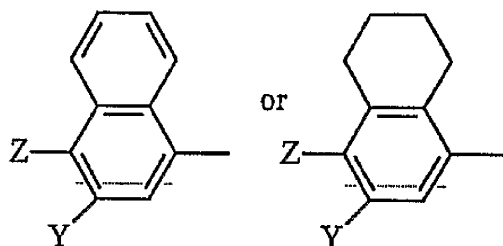


V

ただし、 R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 3】



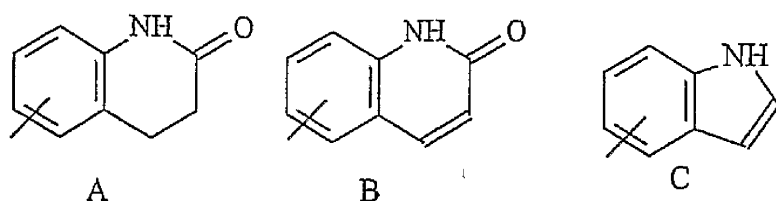
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

Zは、 NO_2 、CN、COR、COOH、又はCONHRであり、

Yは、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、又は SnR_3 であり、

Qは、H、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 CONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、又はOCNである。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



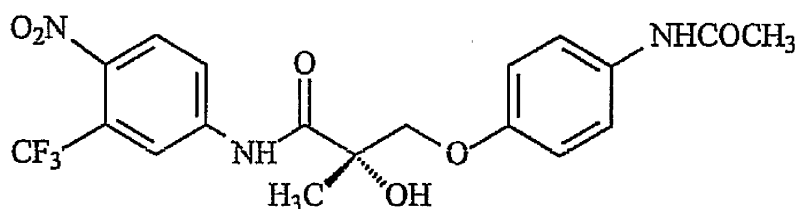
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 5 4】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIで表されることを特徴とする請求項47に記載の使用。

【化 6】

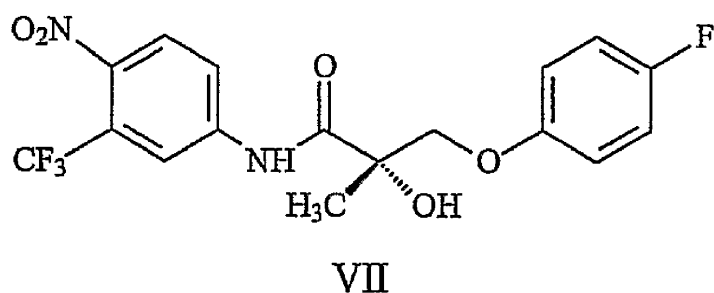


VI

【請求項 5 5】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIIで表されることを特徴とする請求項47に記載の使用。

【化 7】



【請求項 5 6】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アゴニストであることを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 5 7】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アンタゴニストであることを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 5 8】

前記 S A R M が、筋肉又は骨にアゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 5 9】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 5 8 に記載の使用。

【請求項 6 0】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に効果を及ぼさないことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 6 1】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 6 0 に記載の使用。

【請求項 6 2】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 6 3】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透することを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 6 4】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透しないことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 6 5】

前記薬剤が、前記 S A R M、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物、N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせと、薬学的に許容される担体とを含むことを特徴とする請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 6 6】

前記薬剤が、
 静脈内注射、動脈内注射、又は筋肉内注射可能な液体か、
 皮下埋め込み可能なベレットか、
 経口投与可能な液体又は固体か、又は、
 皮膚の表面に塗布可能な液体又は固体であることを特徴とする請求項 6 5 に記載の使用。

【請求項 6 7】

前記薬剤が、ベレット、錠剤、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、

クリーム、坐薬、又は非経口的製剤であることを特徴とする請求項 65 に記載の使用。

【請求項 68】

高齢男性のアンドロゲン減少 (ADAM) に起因する性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、前立腺癌、又はそれらの任意の組み合わせの治療方法であって、

ヒト以外の患者に選択的アンドロゲン受容体調節剤 (SARM) 化合物を投与する過程を含むことを特徴とする使用。

【請求項 69】

男性患者の性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、及び前立腺癌から選択される高齢男性のアンドロゲン減少 (ADAM) 関連症状の予防、抑制、阻害、又はその発生率の低減のための薬剤を製造するための、選択的アンドロゲン受容体調節剤 (SARM) 化合物の使用。

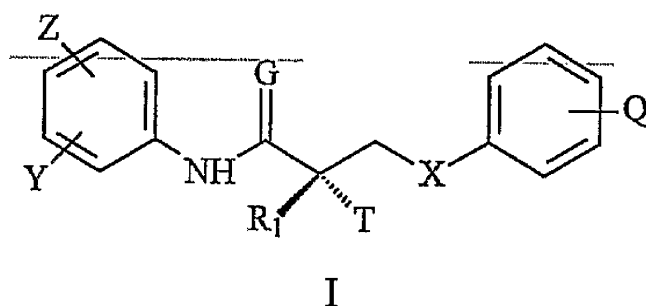
【請求項 70】

前記薬剤が、前記 SARM 化合物の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物又は N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶、又はそれらの任意の組み合わせを含むことを特徴とする請求項 69 に記載の使用。

【請求項 71】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 I で表されることを特徴とする請求項 69 に記載の使用。

【化 1】



ただし、G は、O、又は S であり、

X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、

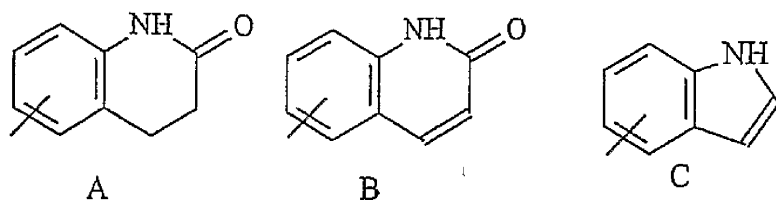
T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、又は CONHR であり、

Y は、CF₃、I、Br、Cl、CN、CR₃、又は SnR₃ であり、

Q は、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、NCS、SCN、NCO、又は OCN である。或いは、Q は、ベンゼン環と結合して構造式 A、B、又は C で表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



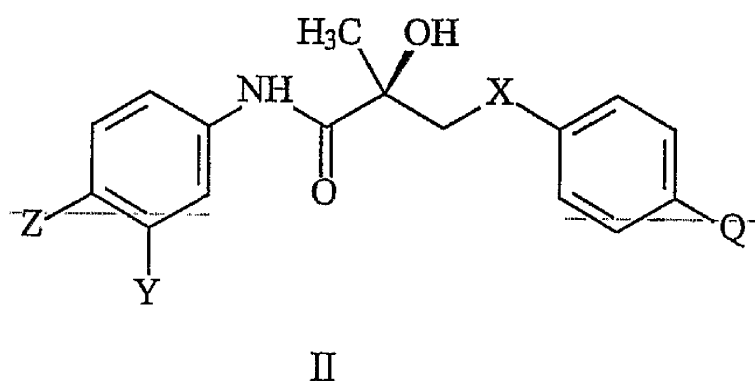
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、又は CF_2CF_3 である。

【請求項 7 2】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 II で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【化 2】



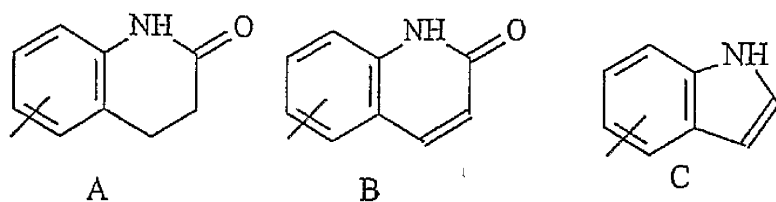
ただし、X は、結合部、O、 CH_2 、NH、Se、PR、NO、又はNRであり、

Z は、 NO_2 、CN、COOH、COR、NHCOR、又はCONHRであり、

Y は、 CF_3 、I、Br、Cl、CN、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Q は、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCCH_3 、 NHCOCF_3 、NHCOR、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、CONHR、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHC SR 、 $\text{NH SO}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2\text{R}$ 、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、OCNである。或いは、Q は、ベンゼン環と結合して構造式 A、B、又は C で表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】

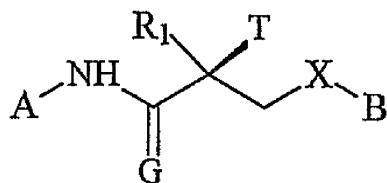


R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHである。

【請求項 73】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 III で表されることを特徴とする請求項 69 に記載の使用。

【化 3】



III

ただし、X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、又は NR であり、
G は、O、又は S であり、

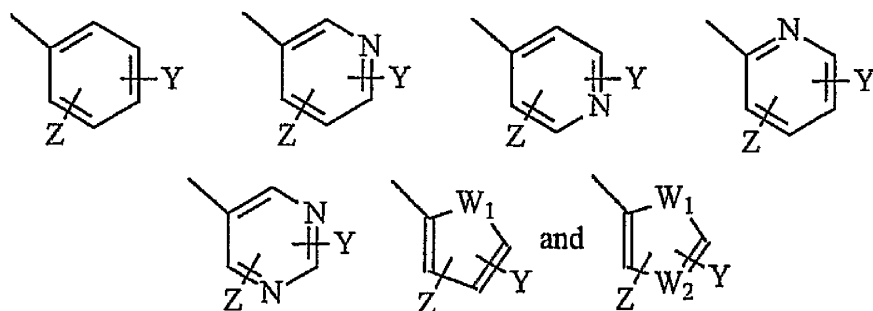
R₁ は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、又は CF₂CF₃ であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、又は NHCOR であり、

R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又は OH であり、

A は、

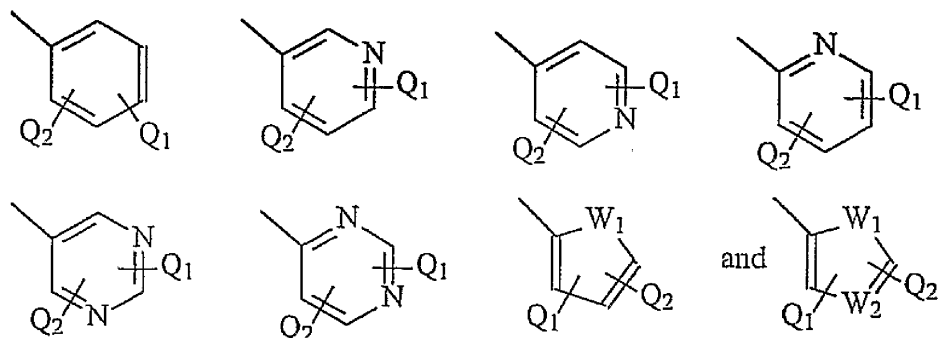
【化 9】



から選択される環であり、

B は、

【化 10】



から選択される環であり、

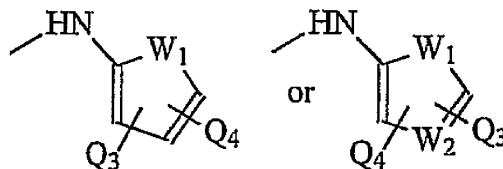
A 及び B は同時にはベンゼン環であり得ず、

Z は、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 COR 、 NHCOR 、又は CONHR であり、

Y は、 CF_3 、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CN 、 CR_3 、又は SnR_3 であり、

Q_1 及び Q_2 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、 OCN 、又は

【化 11】



であり、

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHC ONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHC SCH_3 、 NHC SCF_3 、 NHCSR 、 $\text{NH SO}_2 \text{CH}_3$ 、 $\text{NH SO}_2 \text{R}$ 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN であり、

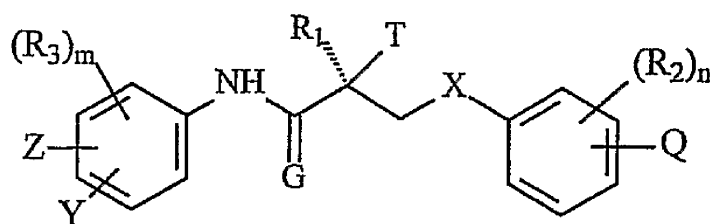
W_1 は、 O 、 NH 、 NR 、 NO 、又は S であり、

W_2 は、 N 、又は NO である。

【請求項 74】

前記 SARM 化合物が、次の化学構造式 IV で表されることを特徴とする請求項 69 に記載の使用。

【化 4】



IV

ただし、X は、結合部、 O 、 CH_2 、 NH 、 Se 、 PR 、 NO 、又は NR であり、

G は、 O 、又は S であり、

T は、 OH 、 OR 、 NHCOCH_3 、又は NHCOR であり、

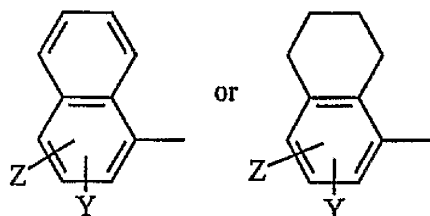
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ 、アリル、フェニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルケニル、又は OH であり、

R_1 は、 CH_3 、 $\text{CH}_2 \text{F}$ 、 CHF_2 、 CF_3 、 $\text{CH}_2 \text{CH}_3$ 、又は $\text{CF}_2 \text{CF}_3$ であり、

R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものであり、

【化 1 2】

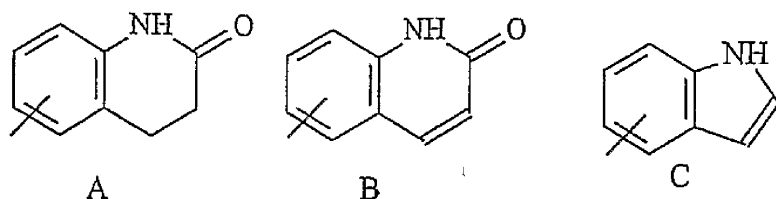


Zは、 NO_2 、 CN 、 COR 、 COOH 、又は CONHR であり、

Yは、 CF_3 、 F 、 Br 、 Cl 、 I 、 CN 、又は SnR_3 であり、

Qは、 H 、アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 CONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OH 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 NCS 、 SCN 、 NCO 、又は OCN である。或いは、Qは、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



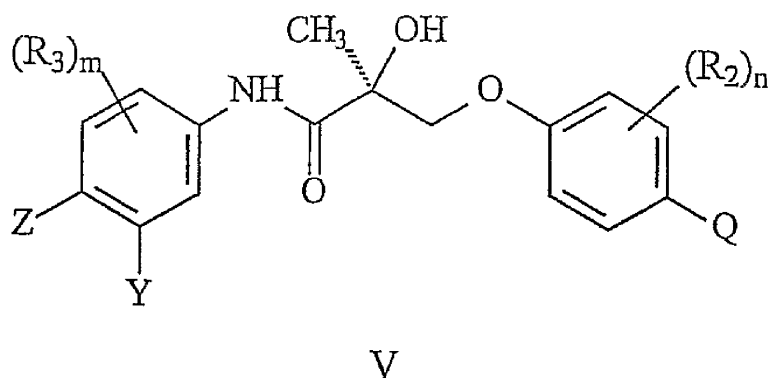
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項 7 5】

前記SARM化合物が、次の化学構造式Vで表されることを特徴とする請求項69に記載の使用。

【化 5】

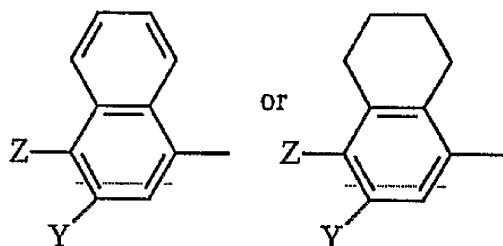


V

ただし、 R_2 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CH_3 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 NO_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、 OR 、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、又は SR であり、

R_3 は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NO_2 、 COR 、 COOH 、 CONHR 、 CF_3 、又は SnR_3 である。或いは、 R_3 は、ベンゼン環と結合して次の構造式で表される縮合環系を形成するものである。

【化 1 3】



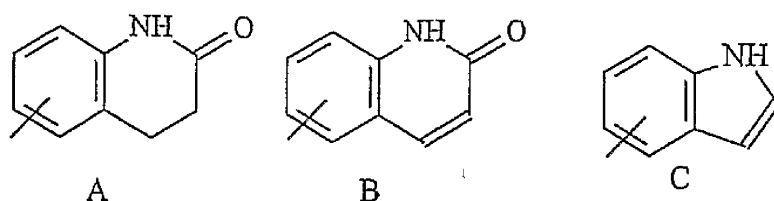
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、F、Cl、Br、I、アルケニル、又はOHであり、

Z は、 NO_2 、CN、COR、COOH、又はCONHRであり、

Y は、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、又は SnR_3 であり、

Q は、H、アルキル、F、Cl、Br、I、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 CONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR、NCS、SCN、NCO、又はOCNである。或いは、Q は、ベンゼン環と結合して構造式A、B、又はCで表される縮合環系を形成するものである。

【化 8】



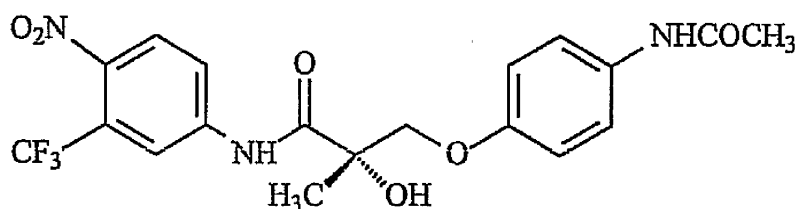
n は、1 ~ 4 の整数であり、

m は、1 ~ 3 の整数である。

【請求項 7 6】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIで表されることを特徴とする請求項69に記載の使用。

【化 6】

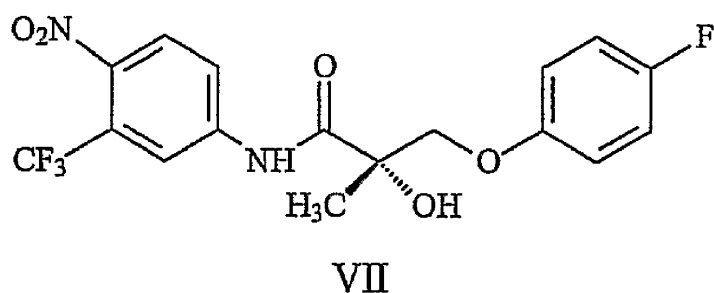


VI

【請求項 7 7】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIIで表されることを特徴とする請求項69に記載の使用。

【化 7】



【請求項 7 8】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アゴニストであることを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 7 9】

前記 S A R M が、アンドロゲン受容体アンタゴニストであることを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 0】

前記 S A R M が、筋肉又は骨にアゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 1】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 8 0 に記載の使用。

【請求項 8 2】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に効果を及ぼさないことを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 3】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 8 2 に記載の使用。

【請求項 8 4】

前記 S A R M が、前立腺に効果を及ぼさない、又はアンタゴニストの効果を及ぼすことを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 5】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透することを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 6】

前記 S A R M が、中枢神経系に浸透しないことを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 7】

前記薬剤が、前記 S A R M、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬学的に許容される塩、医薬品、水和物、N 酸化物、プロドラッグ、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせと、薬学的に許容される担体とを含むことを特徴とする請求項 6 9 に記載の使用。

【請求項 8 8】

前記薬剤が、
 静脈内注射、動脈内注射、又は筋肉内注射可能な液体か、
 皮下埋め込み可能なベレットか、
 経口投与可能な液体又は固体か、又は、
 皮膚の表面に塗布可能な液体又は固体であることを特徴とする請求項 8 7 に記載の使用。

【請求項 8 9】

前記薬剤が、ベレット、錠剤、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、

クリーム、坐薬、又は非経口的製剤であることを特徴とする請求項 87 に記載の使用。

【請求項 90】

男性患者の性的不全、性欲減退、勃起不全、性腺機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認知・気分の変化、うつ病、貧血、脱毛症、肥満症、良性前立腺肥大症、及び前立腺癌から選択される高齢男性のアンドロゲン減少（A D A M）関連症状の予防、抑制、阻害、又はその発生率の低減方法であって、

ヒト以外の患者に選択的アンドロゲン受容体調節剤（S A R M）化合物を投与する過程を含むことを特徴とする使用。