

【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9月21日(2006.9.21)

【公表番号】特表2006-518328(P2006-518328A)

【公表日】平成18年8月10日(2006.8.10)

【年通号数】公開・登録公報2006-031

【出願番号】特願2004-544889(P2004-544889)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/28	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/16	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
C 0 7 D	213/75	(2006.01)
C 0 7 D	213/84	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/44
A 6 1 P	3/04
A 6 1 P	5/28
A 6 1 P	7/06
A 6 1 P	13/08
A 6 1 P	15/00
A 6 1 P	15/10
A 6 1 P	15/16
A 6 1 P	17/14
A 6 1 P	19/10
A 6 1 P	25/24
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	27/02
A 6 1 P	35/00
C 0 7 D	213/75
C 0 7 D	213/84

Z

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月28日(2006.6.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

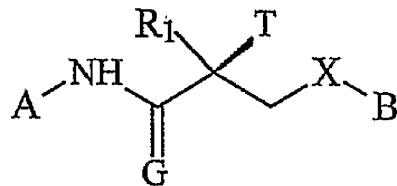
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次の化学構造式 1 で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化 1】



I

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、

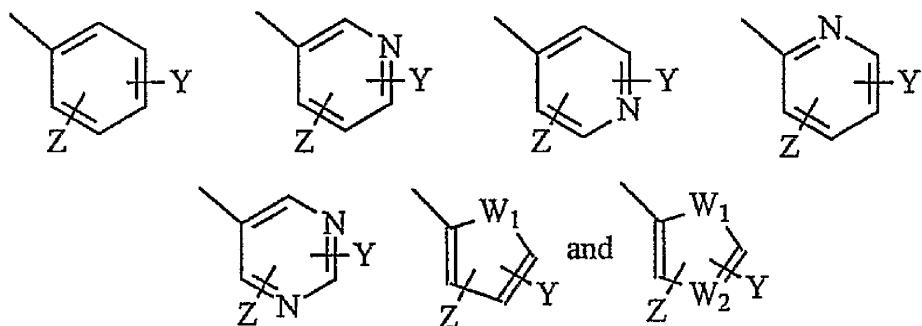
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり

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、

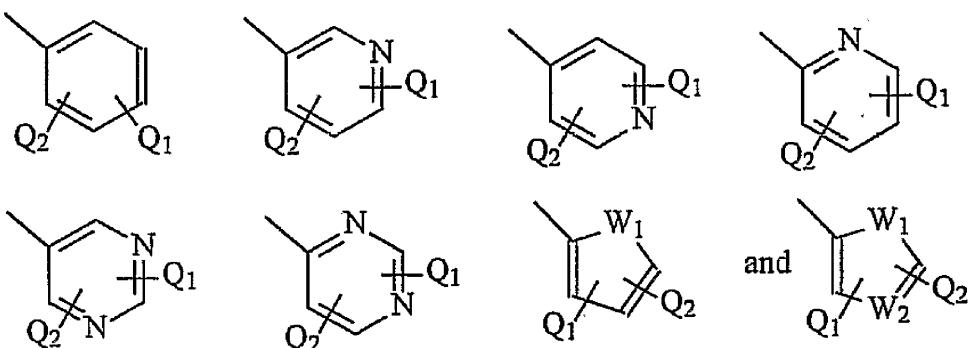
【化 7】



から選択される環であり、

Bは、

【化 8】



から選択される環である。

A及びBは同時にベンゼン環であり得ず、

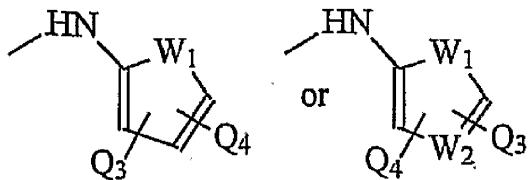
Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

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、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHC
ONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS
CF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂
R、SO₂R、SR又は

【化9】



である。

Q₃ 及び Q₄ は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、C
N、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHC
ONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS
CF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂
R、SO₂R又はSRであり、

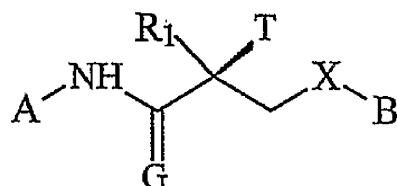
W₁ は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W₂ は、N又はNOである。

【請求項2】

次の化学構造式1で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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。

【化1】



I

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、

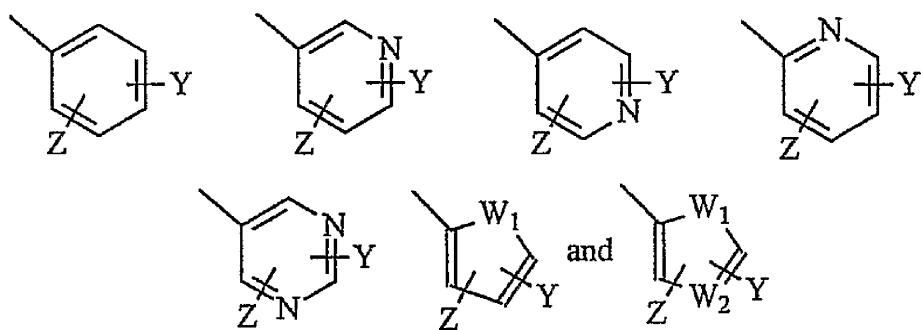
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり

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、CH
F₂、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、

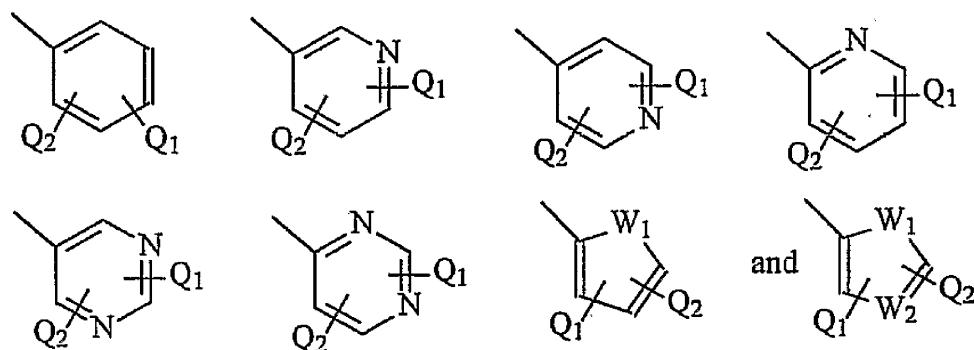
【化7】



から選択される環であり、

Bは、

【化8】



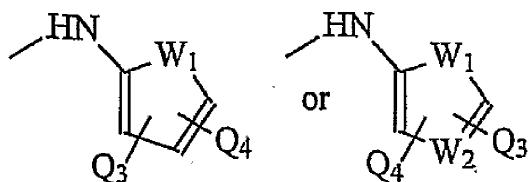
から選択される環である。

A及びBは同時に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、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₅、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR又は

【化9】



である。

Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₅、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、又はSRであり、

W₁は、O、NH、NR、NO、又はSであり、W₂は、N、又はNOである。

【請求項3】

XがOであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合

物。

【請求項4】

GがOであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項5】

TがOHであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項6】

R₁がCH₃であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項7】

ZがNO₂であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項8】

ZがCNであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項9】

YがCF₃であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項10】

Q₁がNHCOCH₃であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

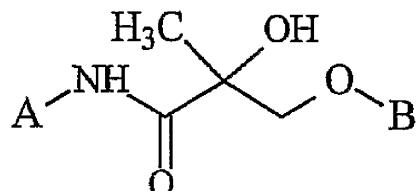
【請求項11】

Q₁がFであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項12】

化学構造式1aで表されることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化10】

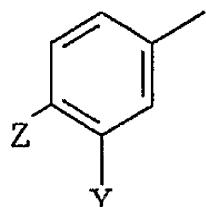


Ia

【請求項13】

Aが

【化11】

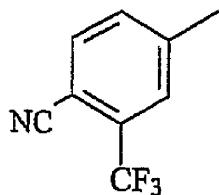


であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 4】

A が

【化 1 2】

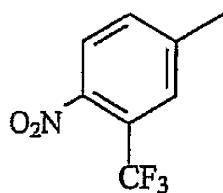


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 5】

A が

【化 1 3】

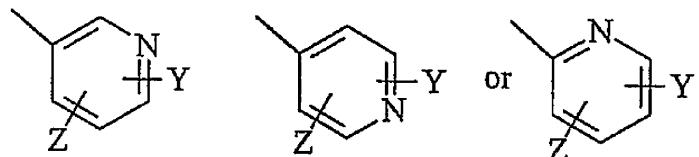


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 6】

A が

【化 1 4】

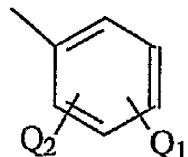


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 7】

B が

【化 1 5】

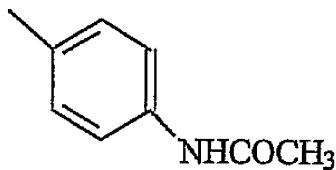


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 8】

B が

【化16】

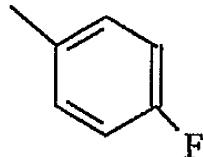


であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項19】

Bが

【化17】

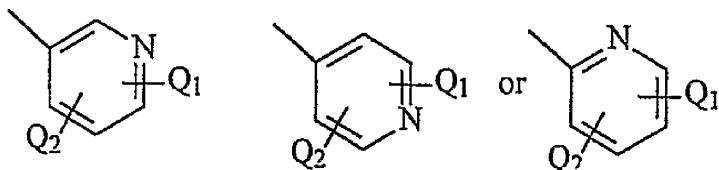


であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項20】

Bが

【化18】



であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項21】

請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項22】

効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする医薬組成物。

【請求項23】

選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物をアンドロゲン受容体に結合させる方法であつて、

前記アンドロゲン受容体に、前記選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物を前記アンドロゲン受容体に結合させるのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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を接触させる過程を含むことを特徴とする方法。

【請求項24】

精子形成を抑制する薬剤を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体化合物、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の使用。

【請求項 25】

男性用の避妊薬を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 26】

ホルモン療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 27】

ホルモン補充療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 28】

ホルモンに関連する病気の治療のための薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 29】

前立腺癌の治療のための薬剤を製造するための、前立腺癌を治療するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 30】

前立腺癌の予防のための薬剤を製造するための、前立腺癌を予防するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 31】

前立腺癌の進行を遅らせる薬剤を製造するための、前立腺癌の進行を遅らせるのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 32】

前立腺癌の再発を予防する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を予防するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 33】

前立腺癌の再発を治療する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を治療するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 34】

ドライアイを治療する薬剤を製造するための、ドライアイを治療するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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使用。

【請求項35】

ドライアイを予防する薬剤を製造するための、ドライアイを予防するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

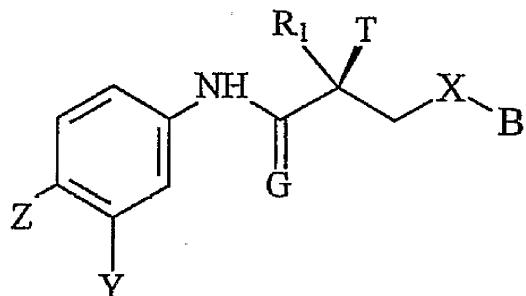
【請求項36】

癌細胞のアポトーシスを誘導する薬剤を製造するための、癌細胞のアポトーシスを促進するのに効果的な量の請求項1に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項37】

次の化学構造式2で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化2】



II

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、

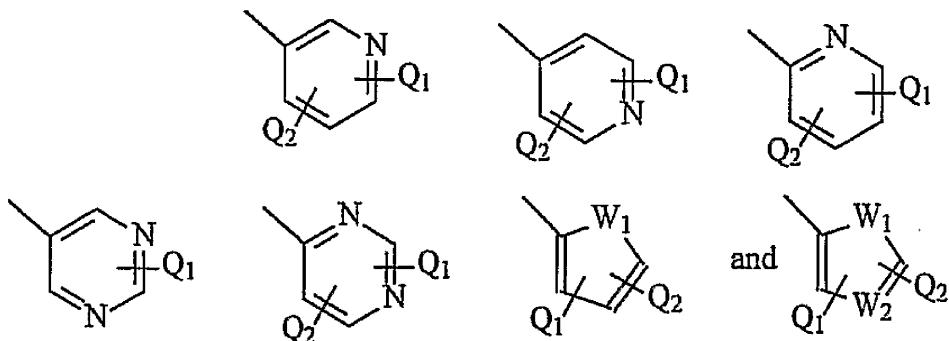
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり

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、

Bは、

【化19】



から選択される環であり、

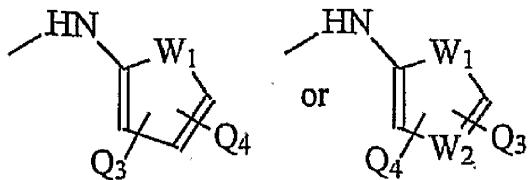
Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃又はSNR₃である。

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、C₂H₅、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₅、NHCOCF₃、NHCOR、NHC₂H、NHCOR、OCONHR、CONHR、NHCSC₂H₅、NHCSCF₃、NHC₂SR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR又は

【化9】



である。

Q₃ 及び Q₄ は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、C₂H₅、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₅、NHCOCF₃、NHCOR、NHC₂H、NHCOR、OCONHR、CONHR、NHCSC₂H₅、NHCSCF₃、NHC₂SR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R又はSRであり、

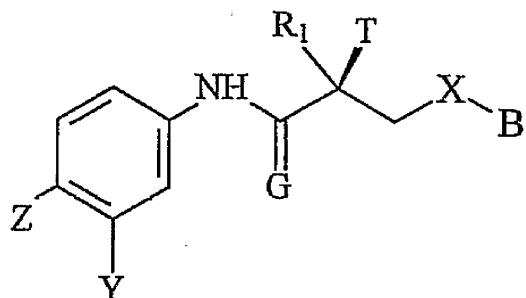
W₁ は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W₂ は、N又はNOである。

【請求項38】

次の化学構造式2で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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。

【化2】



II

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、

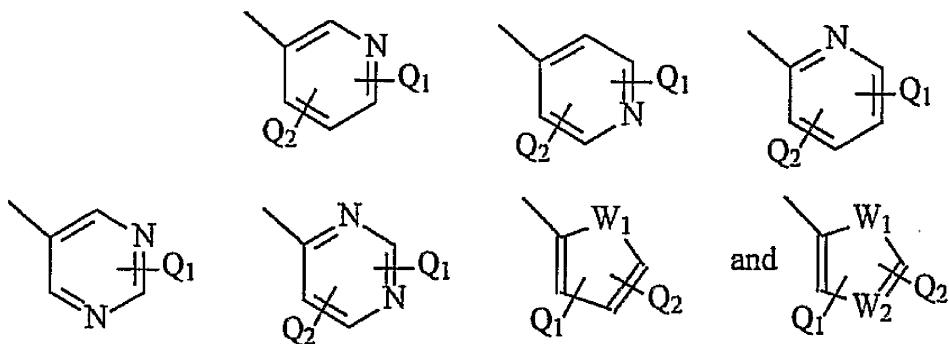
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり

Tは、OH、OR、-NHCOC₂H₅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、

Bは、

【化19】



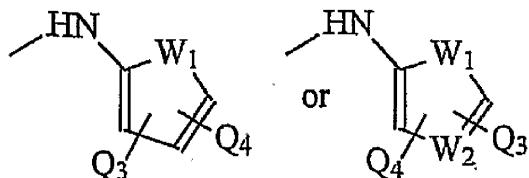
から選択される環であり、

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、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR又は

【化9】



である。

Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R又はSRであり、

W₁は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W₂は、N又はNOである。

【請求項39】

XがOであることを特徴とする請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項40】

GがOであることを特徴とする請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項41】

TがOHであることを特徴とする請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項42】

R₁がCH₃であることを特徴とする請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項43】

ZがNO₂であることを特徴とする請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項44】

Z が C N であることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 4 5】

Y が C F₃ であることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 4 6】

Q₁ が N H C O C H₃ であることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

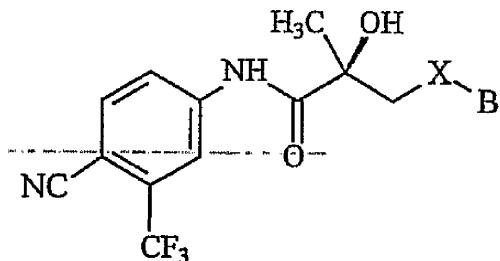
【請求項 4 7】

Q₁ が F であることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 4 8】

次の化学構造式 3 で表されることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化 3】

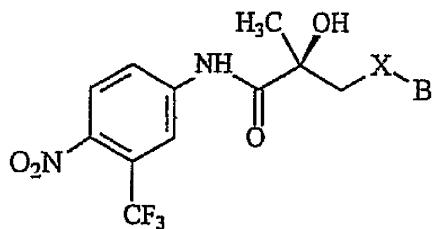


III

【請求項 4 9】

次の化学構造式 4 で表されることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化 4】

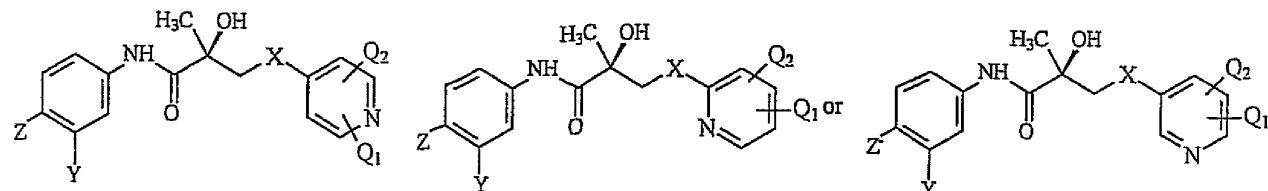


IV

【請求項 5 0】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

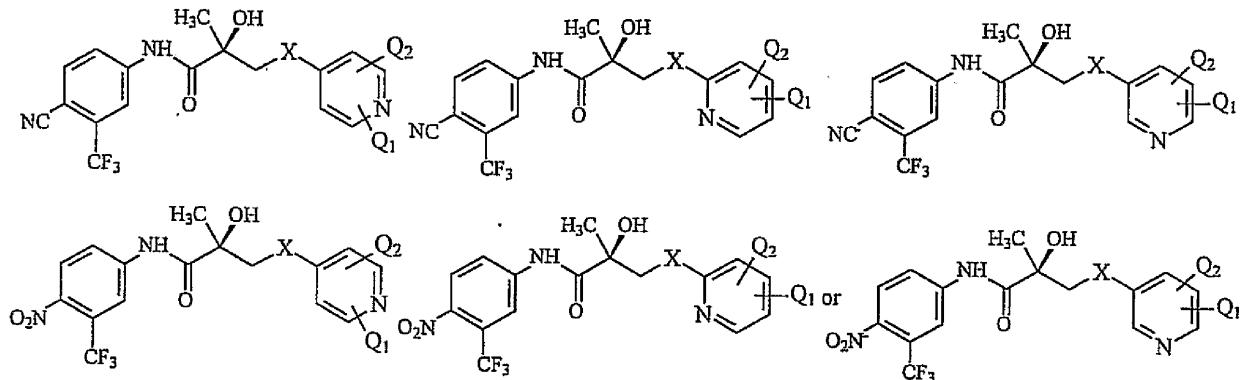
【化 2 0】



【請求項 5 1】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

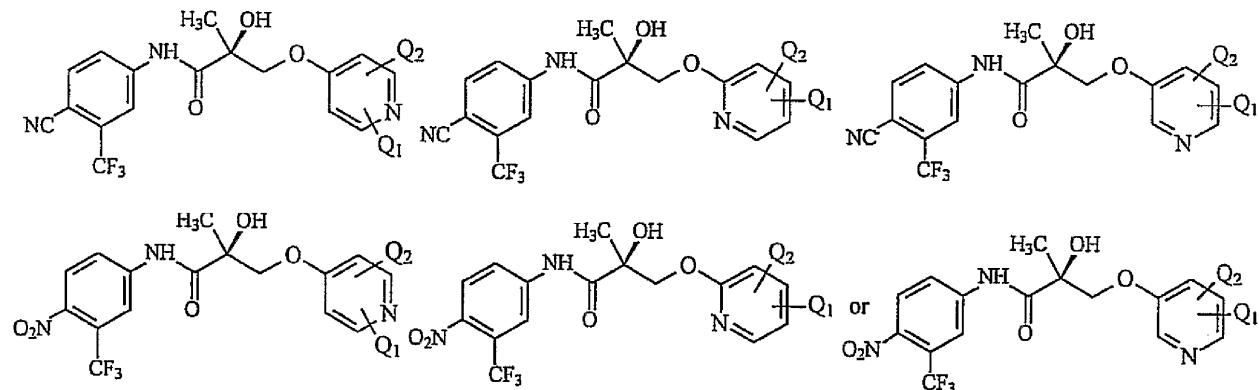
【化 2 1】



【請求項 5 2】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化 2 2】



【請求項 5 3】

請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項 5 4】

効果的な量の請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項 5 5】

選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物をアンドロゲン受容体に結合させる方法であつて、

前記アンドロゲン受容体に、前記選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物を前記アンドロゲン受容体に結合させるのに効果的な量の請求項 3 7 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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を接触させる過程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 5 6】

精子形成を抑制する薬剤を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求

項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項57】

男性用の避妊薬を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項58】

ホルモン療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項59】

ホルモン補充療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項60】

ホルモンに関連する病気の治療のための薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項61】

前立腺癌の治療のための薬剤を製造するための、前立腺癌を治療するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項62】

前立腺癌の予防のための薬剤を製造するための、前立腺癌を予防するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項63】

前立腺癌の進行を遅らせる薬剤を製造するための、前立腺癌の進行を遅らせるのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項64】

前立腺癌の再発を予防する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を予防するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項65】

前立腺癌の再発を治療する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を治療するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項66】

ドライアイを治療する薬剤を製造するための、ドライアイを治療するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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使用。

【請求項67】

ドライアイを予防する薬剤を製造するための、ドライアイを予防するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

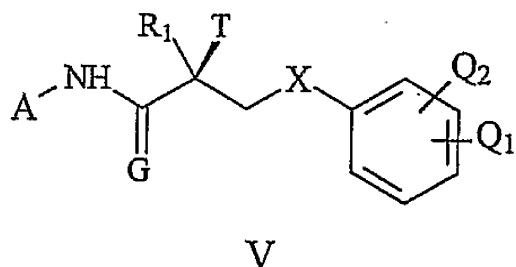
【請求項68】

癌細胞のアポトーシスを誘導する薬剤を製造するための、癌細胞のアポトーシスを促進するのに効果的な量の請求項37に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項69】

次の化学構造式5で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化5】



V

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、

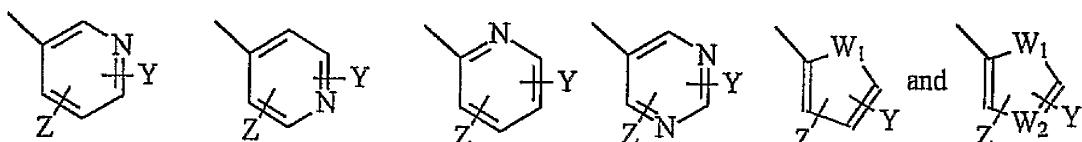
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり、

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23】



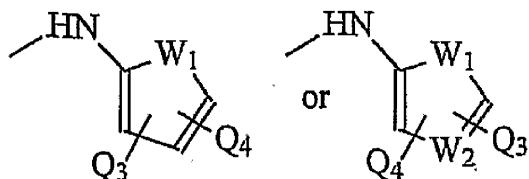
から選択される環であり、

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である。

Q₁及びQ₂は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCOR、NHCOR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR又は

【化9】



である。

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSRF、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、又はSRであり、

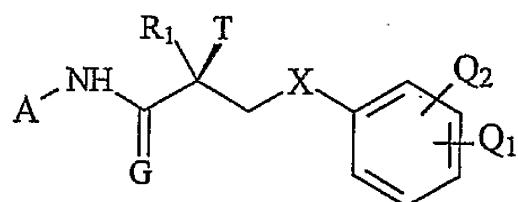
W₁ は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W₂ は、N又はNOである。

【請求項70】

次の化学構造式5で表される選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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。

【化5】



V

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、

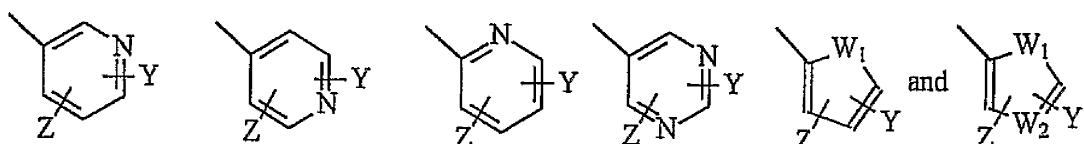
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり、

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23】



から選択される環であり、

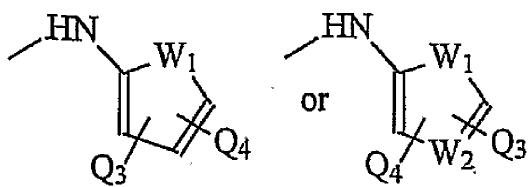
Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

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、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、又はSRであり、

ONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS₂F₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR又は

【化9】



であり、

Q₃ 及び Q₄ は、互いに独立して、水素、アルキル、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS₂F₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R又はSRであり、

W₁ は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W₂ は、N又はNOである。

【請求項71】

XがOであることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項72】

GがOであることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項73】

TがOHであることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項74】

R₁がCH₃であることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項75】

ZがNO₂であることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項76】

ZがCNであることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項77】

YがCF₃であることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項78】

Q₁がNHCOCH₃であることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

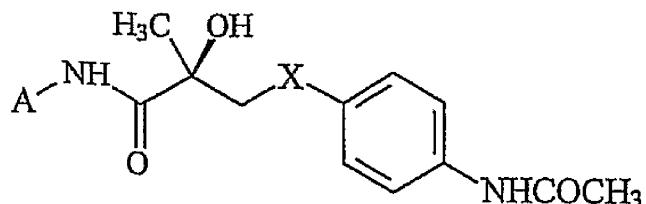
【請求項79】

Q₁がFであることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項80】

次の化学構造式6で表されることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化6】

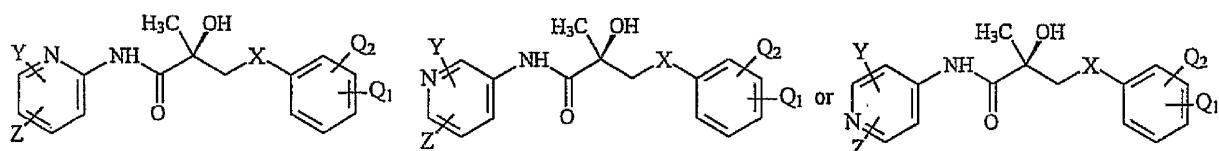


VI

【請求項 8 1】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

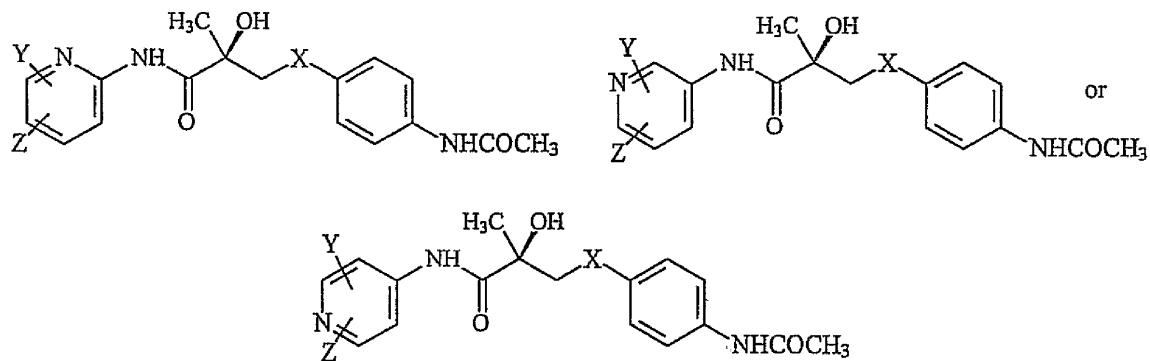
【化24】



【請求項 8 2】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

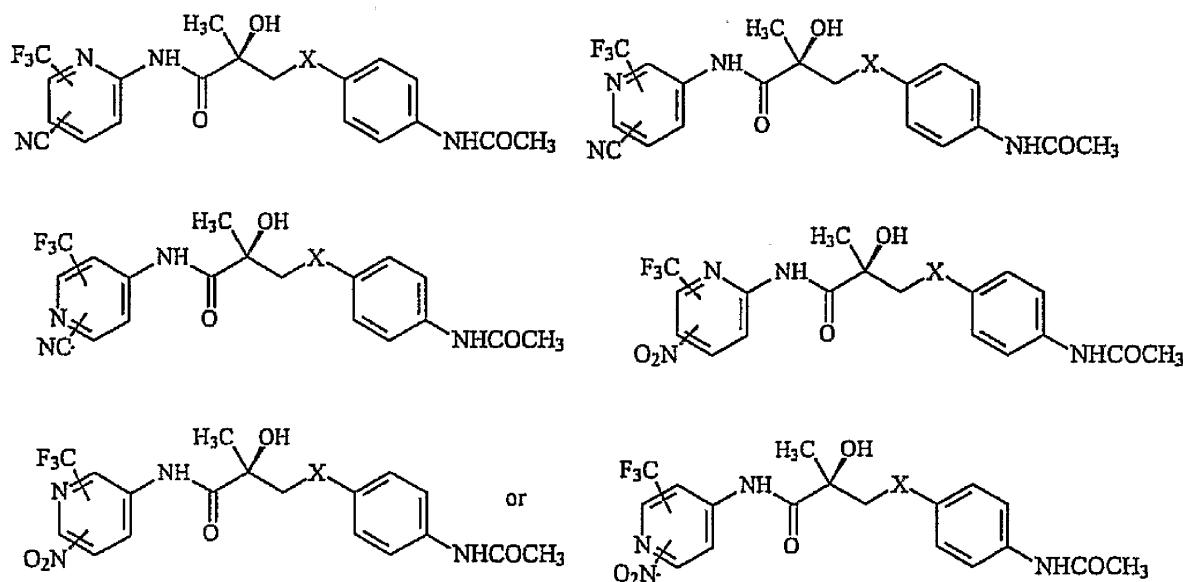
【化25】



【請求項 8 3】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

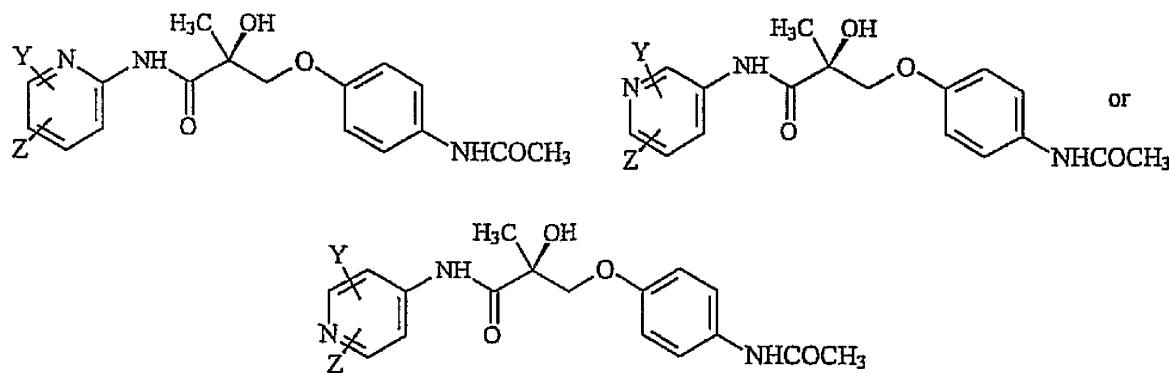
【化26】



【請求項84】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

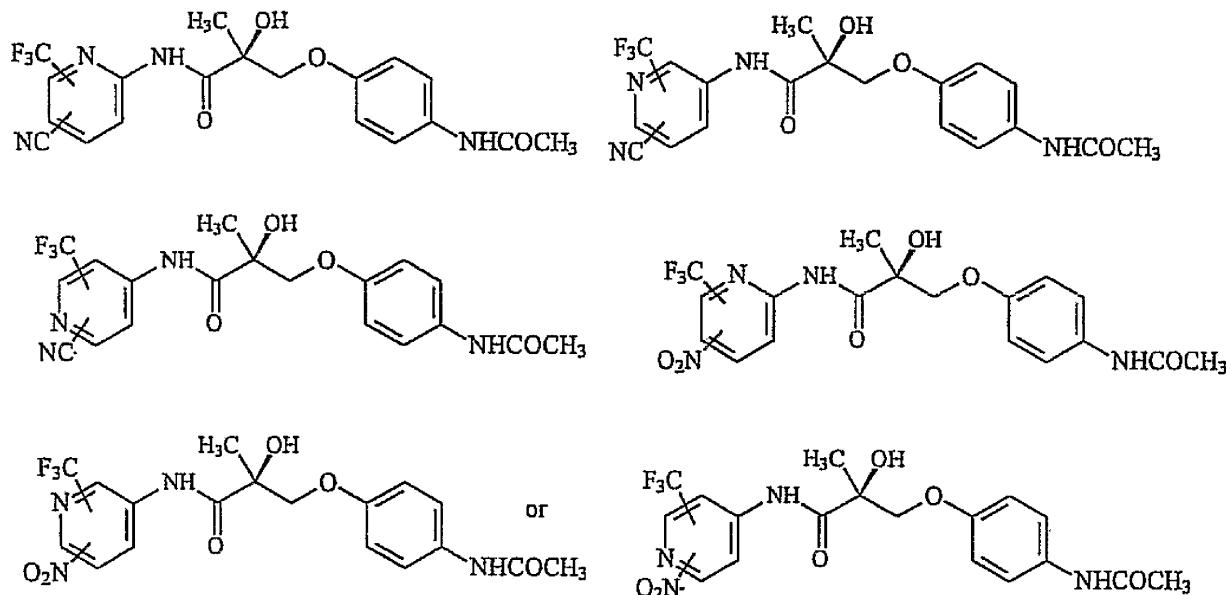
【化27】



【請求項85】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項69に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

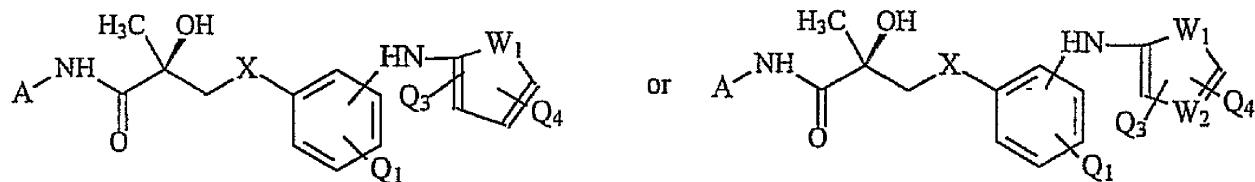
【化 2 8】



【請求項 8 6】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

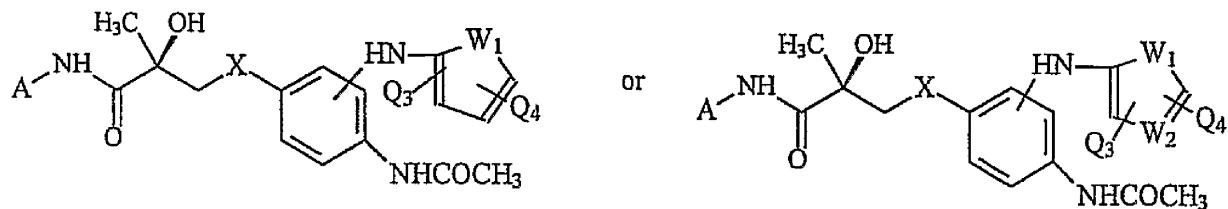
【化 2 9】



【請求項 8 7】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

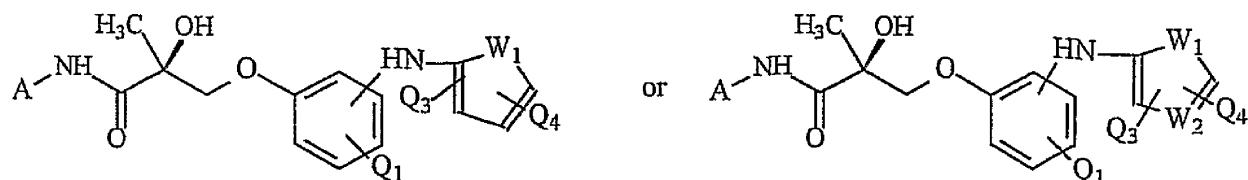
【化 3 0】



【請求項 8 8】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

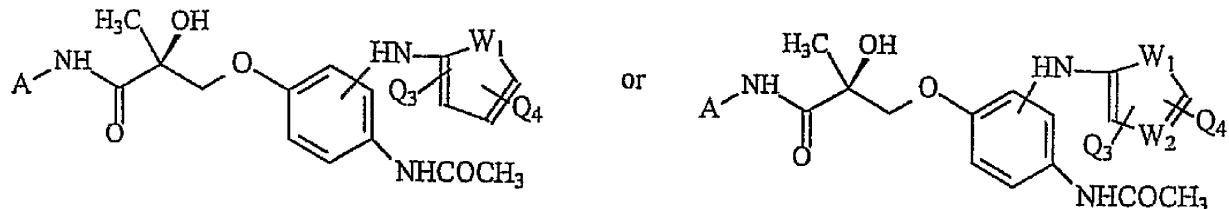
【化 3 1】



【請求項 8 9】

次の化学構造式で表されることを特徴とする請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【化 3 2】



【請求項 9 0】

請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項 9 1】

効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、適切な担体又は希釈液とを含んでいることを特徴とする組成物。

【請求項 9 2】

選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物をアンドロゲン受容体に結合させる方法であつて、

前記アンドロゲン受容体に、前記選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物を前記アンドロゲン受容体に結合させるのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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を接觸させる過程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 9 3】

精子形成を抑制する薬剤を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体化合物、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の使用。

【請求項 9 4】

男性用の避妊薬を製造するための、精子形成を抑制するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 9 5】

ホルモン療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 9 6】

ホルモン補充療法に用いる薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態に変化をもたらすのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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の使用。

【請求項 9 7】

ホルモンに関連する病気の治療のための薬剤を製造するための、アンドロゲン依存状態

に変化をもたらすのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 9 8】

前立腺癌の治療のための薬剤を製造するための、前立腺癌を治療するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 9 9】

前立腺癌の予防のための薬剤を製造するための、前立腺癌を予防するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 1 0 0】

前立腺癌の進行を遅らせる薬剤を製造するための、前立腺癌の進行を遅らせるのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 1 0 1】

前立腺癌の再発を予防する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を予防するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 1 0 2】

前立腺癌の再発を治療する薬剤を製造するための、前立腺癌の再発を治療するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 1 0 3】

ドライアイを治療する薬剤を製造するための、ドライアイを治療するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせ使用。

【請求項 1 0 4】

ドライアイを予防する薬剤を製造するための、ドライアイを予防するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。

【請求項 1 0 5】

癌細胞のアポトーシスを誘導する薬剤を製造するための、癌細胞のアポトーシスを促進するのに効果的な量の請求項 6 9 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物、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、プロドラング、多形体、結晶或いはそれらの任意の組み合わせの使用。