

【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

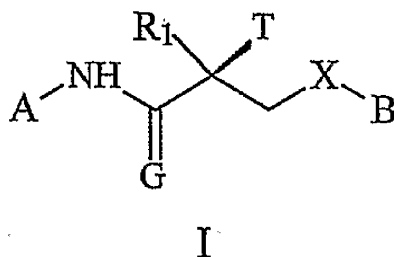
【補正の内容】

【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】



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、

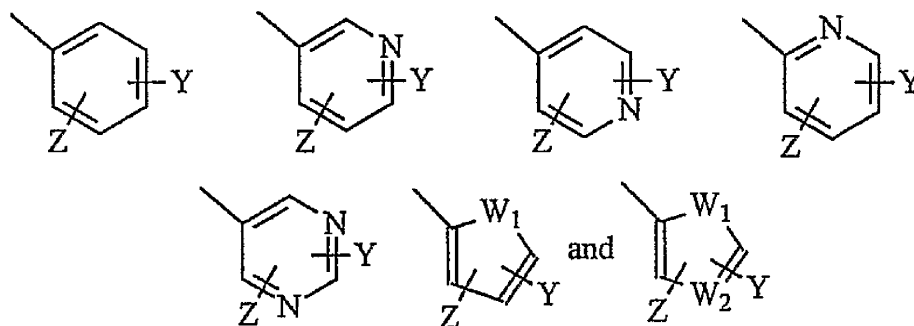
R₁ は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃ 又は CF₂CF₃ であり、

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、

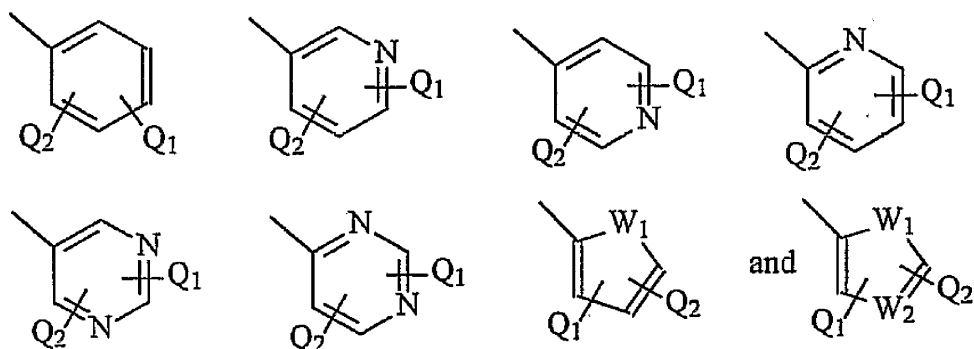
【化 7】



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、

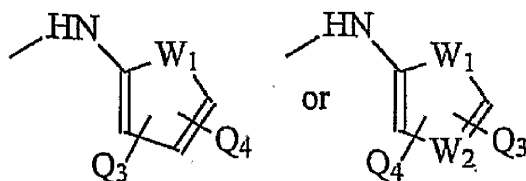
Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR 又は CONHR であり、

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 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、 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 又は SR であり、

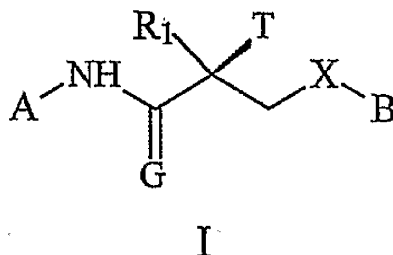
W_1 は、O、NH、NR、NO 又は S であり、

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】



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、

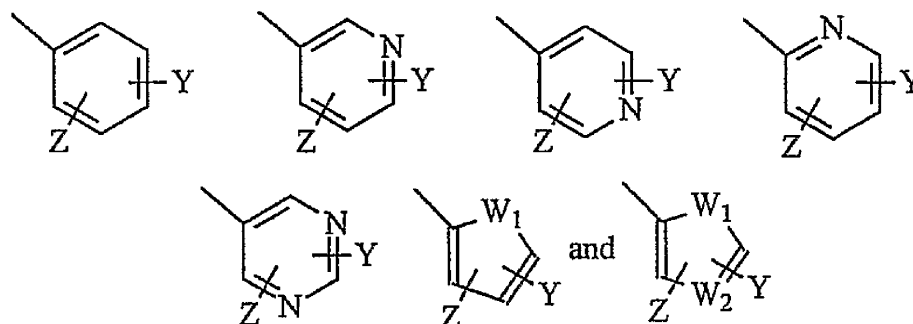
R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 又は CF_2CF_3 であり、

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、

Aは、

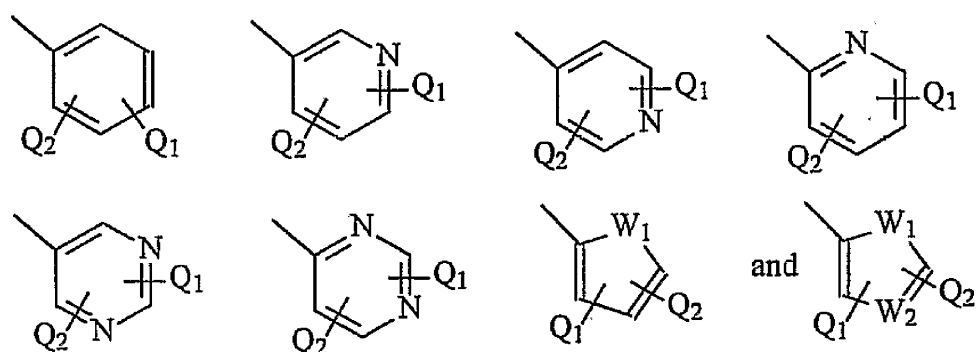
【化 7】



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。

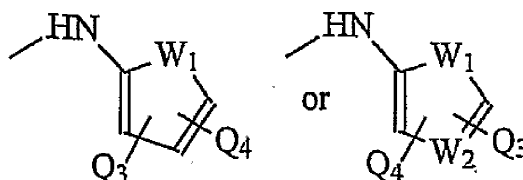
A 及び B は同時にはベンゼン環であり得ず、

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 、 NHCOR 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCNHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 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 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOR 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCNHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、又は SR 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 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。

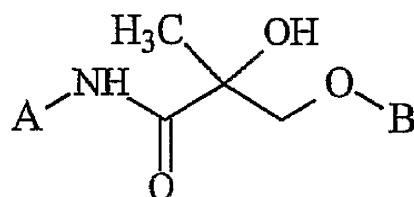
【請求項 11】

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 1 a 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】

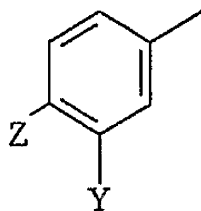


Ia

【請求項 13】

A が

【化 11】

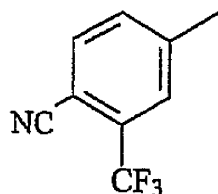


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 14】

A が

【化 12】

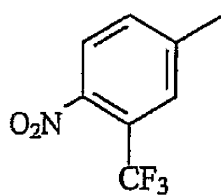


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 15】

A が

【化 13】

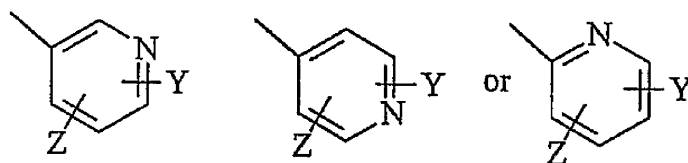


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 16】

A が

【化 14】

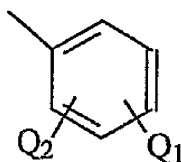


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 17】

B が

【化 15】

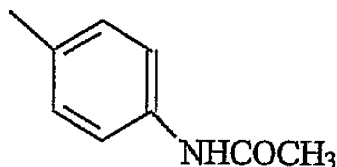


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 18】

B が

【化 1 6】

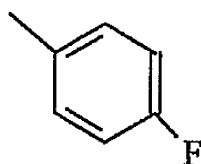


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 1 9】

B が

【化 1 7】

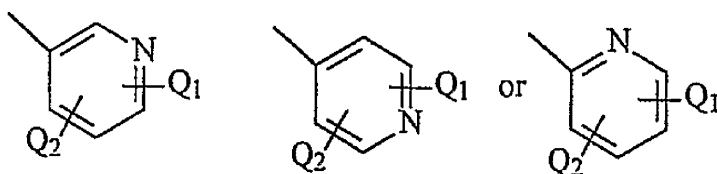


であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲン受容体調節剤化合物。

【請求項 2 0】

B が

【化 1 8】



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 2 1】

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 2 2】

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 2 3】

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って、

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 2 4】

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 2 5】

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 2 6】

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 2 7】

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 2 8】

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 2 9】

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 3 0】

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 3 1】

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 3 2】

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 3 3】

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 3 4】

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。

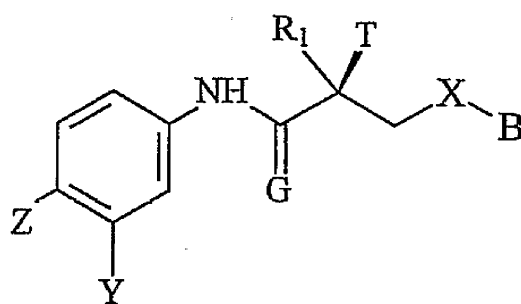
【請求項 36】

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、

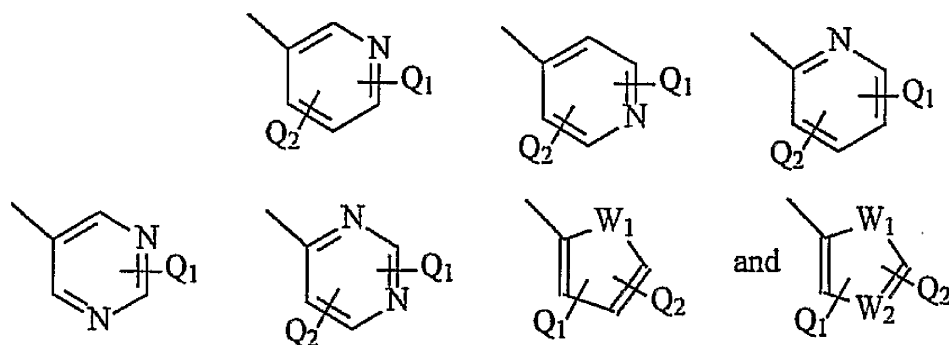
R₁ は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃ 又は CF₂CF₃ であり、

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、

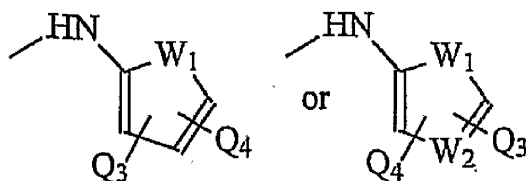
Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR 又は CONHR であり、

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、 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 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、 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 又は SR であり、

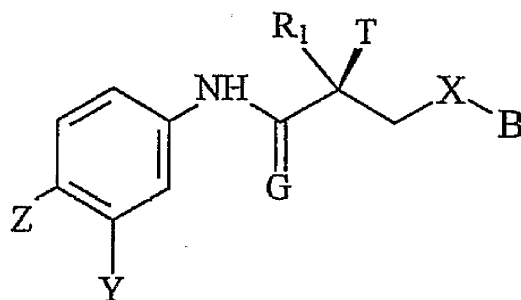
W_1 は、O、NH、NR、NO又はSであり、

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、 CH_2 、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

Gは、O又はSであり、

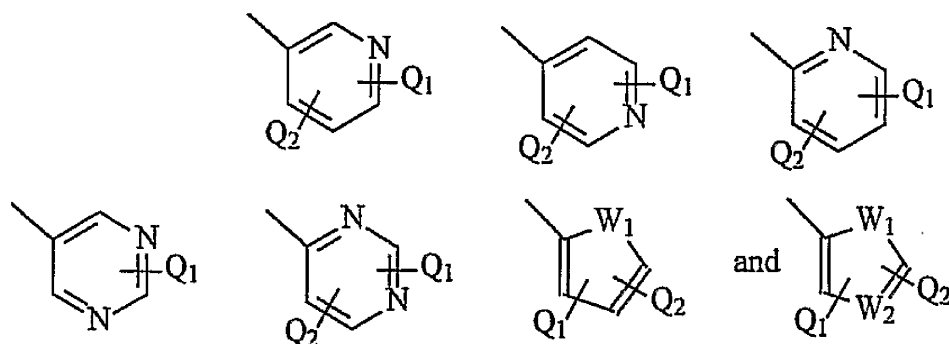
R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 又は CF_2CF_3 であり、

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、

Bは、

【化 19】



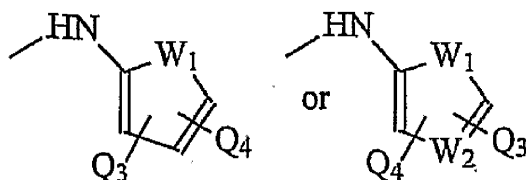
から選択される環であり、

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 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 、 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 、 $\text{OSO}_2 \text{R}$ 、 $\text{SO}_2 \text{R}$ 又は SR 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 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】

R_1 が CH_3 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 NO_2 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 CN 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 45】

Y が CF_3 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 46】

Q_1 が NHCOCH_3 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。

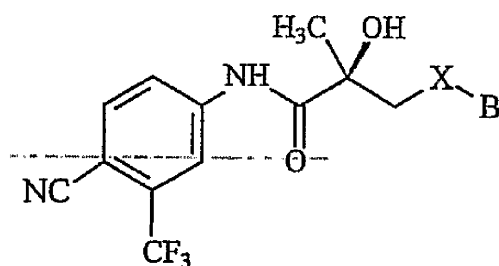
【請求項 47】

Q_1 が F 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 48】

次の化学構造式 3 で表され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。

【化 3】

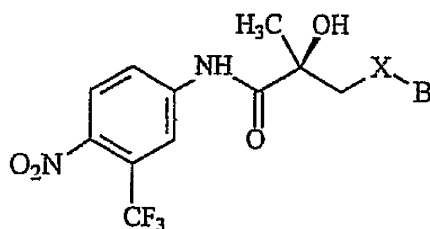


III

【請求項 49】

次の化学構造式 4 で表され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。

【化 4】

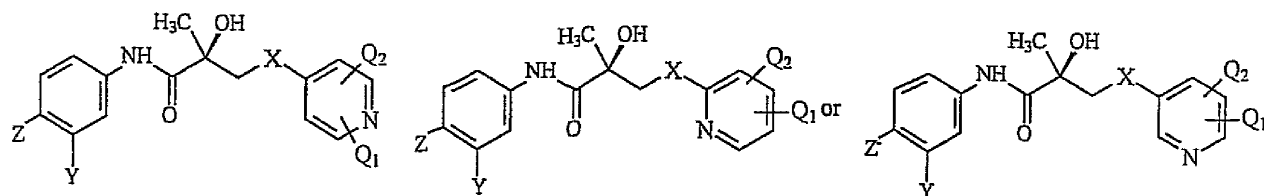


IV

【請求項 50】

次の化学構造式で表され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。

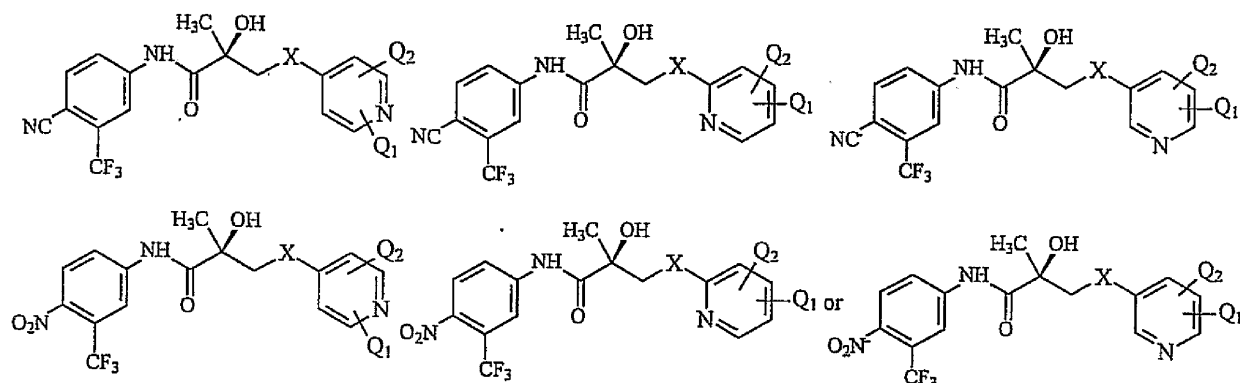
【化 20】



【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。

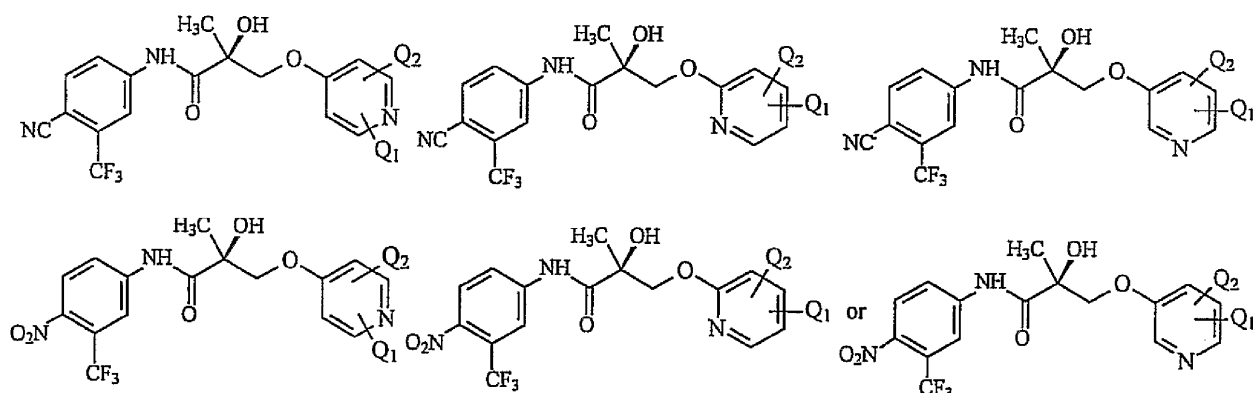
【化 2 1】



【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って、

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 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の使用。

【請求項 5 7】

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 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の使用。

【請求項 5 8】

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 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の使用。

【請求項 5 9】

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 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の使用。

【請求項 6 0】

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 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の使用。

【請求項 6 1】

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 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の使用。

【請求項 6 2】

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 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の使用。

【請求項 6 3】

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 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の使用。

【請求項 6 4】

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 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の使用。

【請求項 6 5】

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 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の使用。

【請求項 6 6】

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。

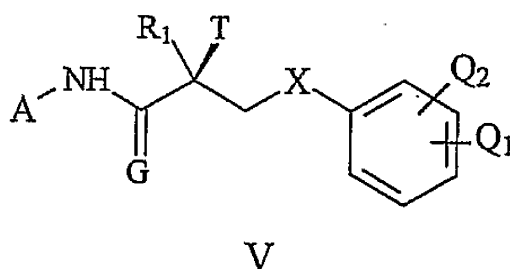
【請求項６８】

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】



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、

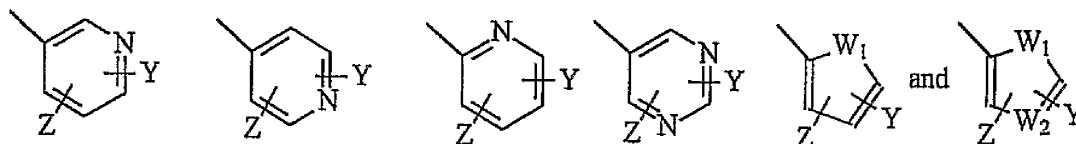
R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃であり、

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】



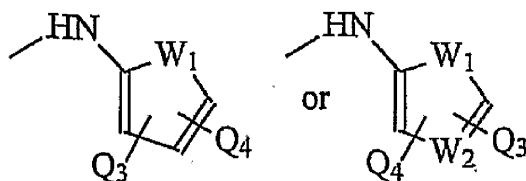
から選択される環であり、

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、NHCOCCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHC ONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCCH₃、NHCSCF₃、NHC SR、NH SO₂CH₃、NH SO₂R、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、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 $NHCONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $CONHR$ 、 $NHCSCH_3$ 、 $NHCSCF_3$ 、 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、又はSRであり、

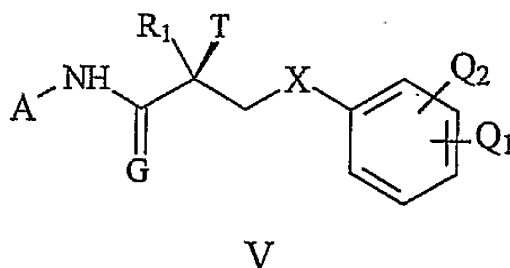
W_1 は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W_2 は、N又はNOである。

【請求項 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】



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、

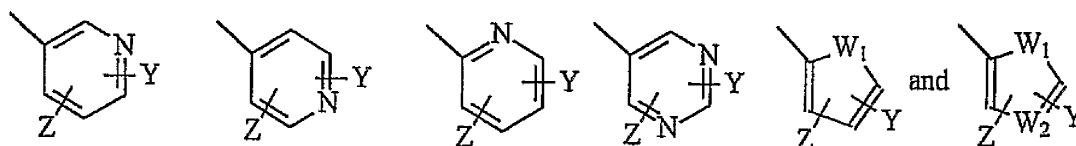
R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 又は CF_2CF_3 であり、

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、

A は、

【化 23】



から選択される環であり、

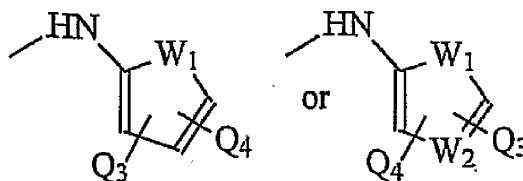
Z は、 NO_2 、CN、COOH、COR、 $NHCOR$ 又は $CONHR$ であり、

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 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 $NHCONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $CONHR$ 、 $NHCSCH_3$ 、 $NHCSCF_3$ 、 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、又はSRであり、

ONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSC₃H₃、NHCSCF₃、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、NHCNHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSC₃H₃、NHCSCF₃、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 7 1】

XがOであ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。

【請求項 7 2】

GがOであ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。

【請求項 7 3】

TがOHであ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。

【請求項 7 4】

R₁がCH₃であ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。

【請求項 7 5】

ZがNO₂であ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。

【請求項 7 6】

ZがCNであ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。

【請求項 7 7】

YがCF₃であ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。

【請求項 7 8】

Q₁がNHCOCH₃であ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。

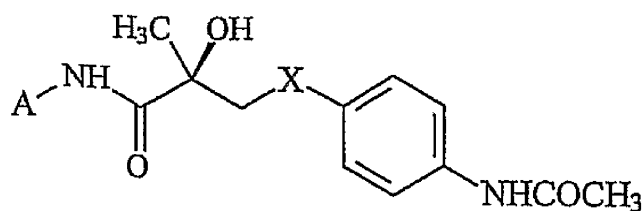
【請求項 7 9】

Q₁がFであ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。

【請求項 8 0】

次の化学構造式 6 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 6】

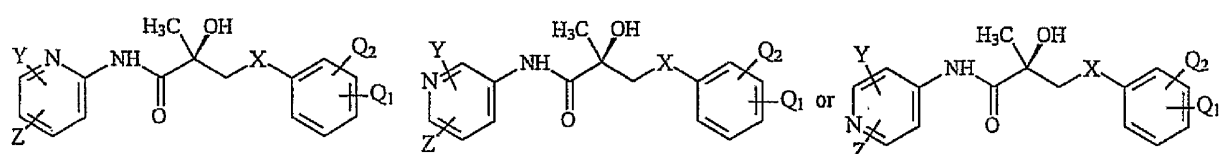


VI

【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。

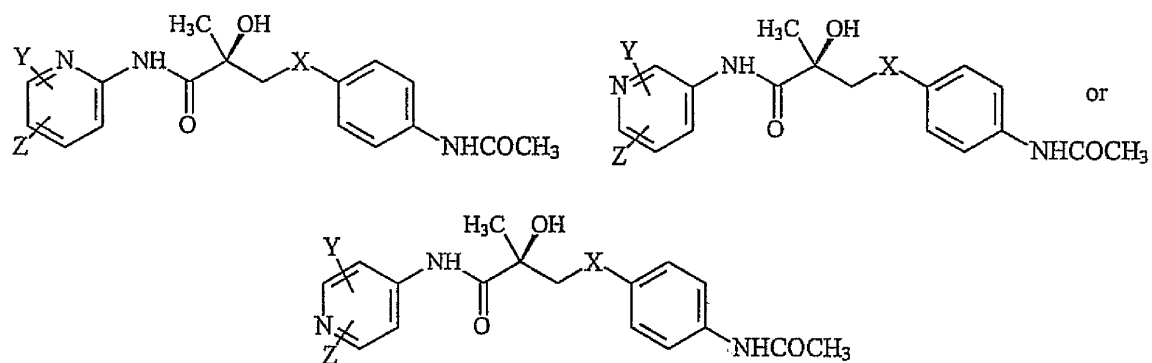
【化 2 4】



【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。

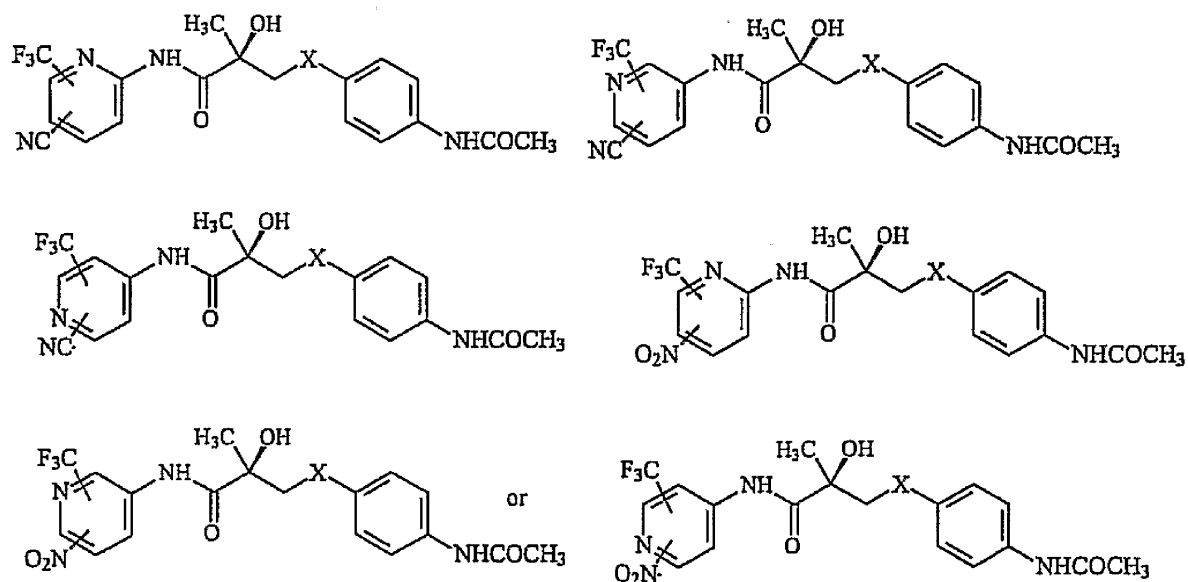
【化 2 5】



【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。

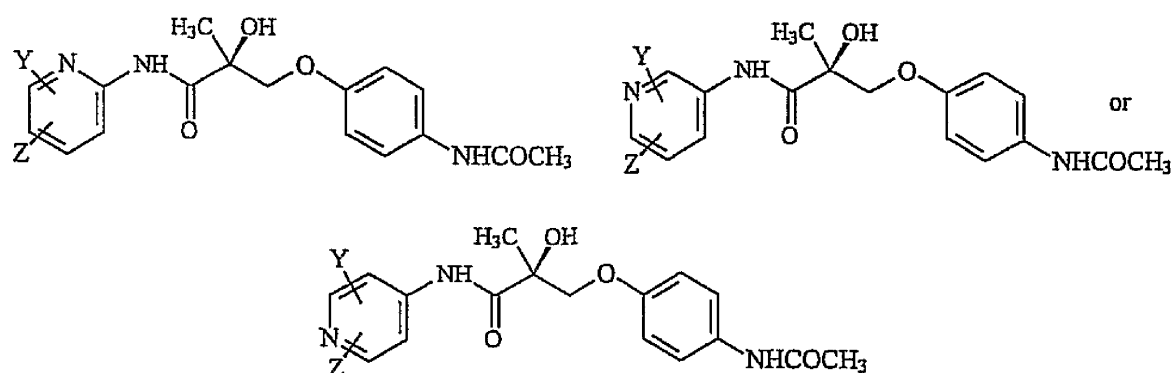
【化 2 6】



【請求項 8 4】

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。

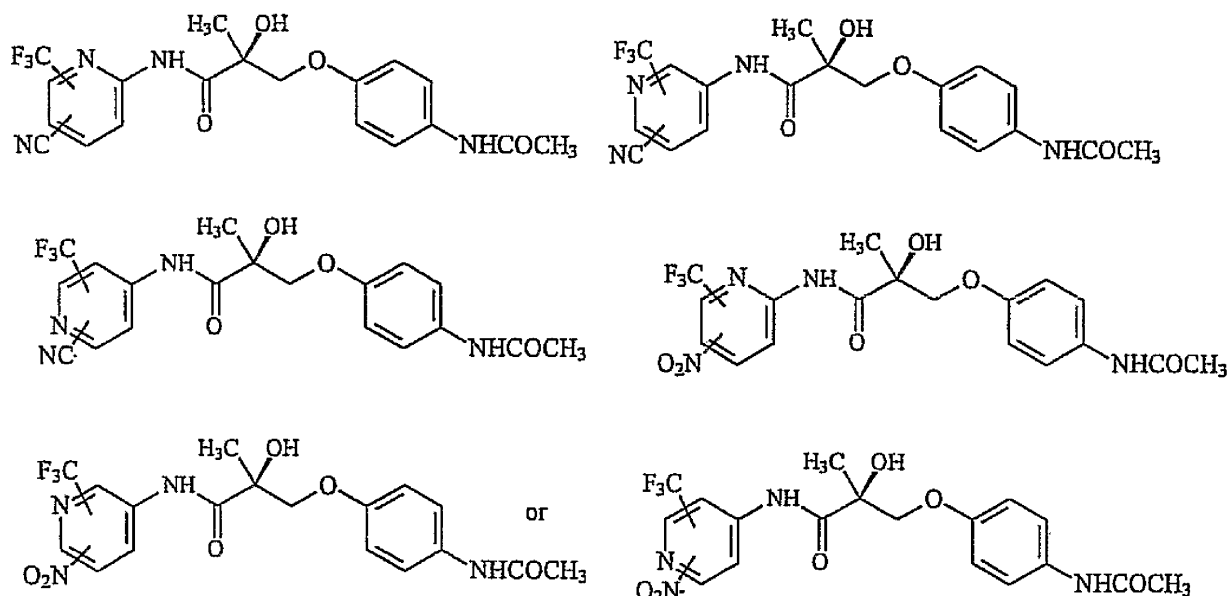
【化 2 7】



【請求項 8 5】

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。

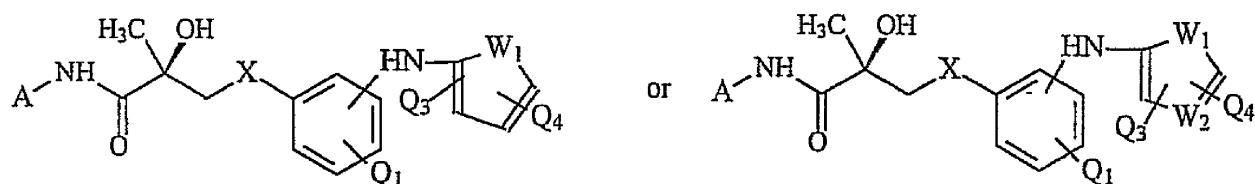
【化 2 8】



【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。

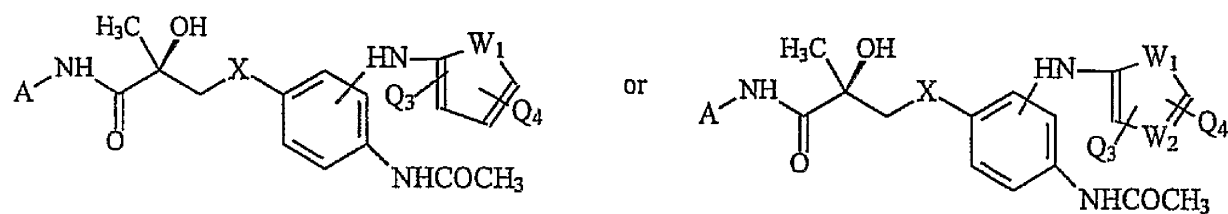
【化 2 9】



【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。

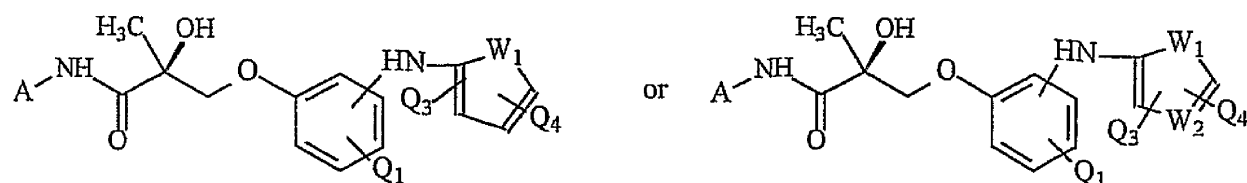
【化 3 0】



【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。

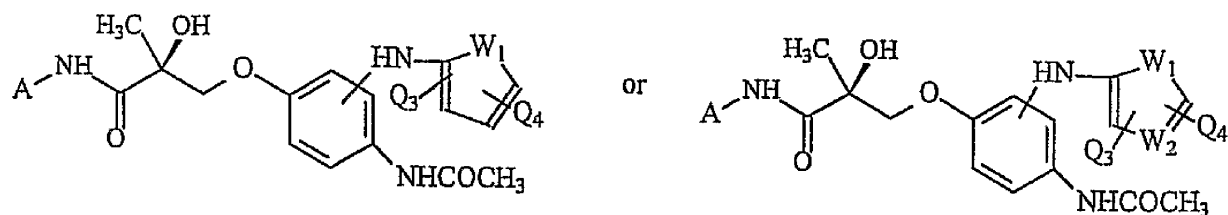
【化 3 1】



【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って、

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触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 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 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 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 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 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 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 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 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。