

【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19年1月25日(2007.1.25)

【公表番号】特表2006-516286(P2006-516286A)

【公表日】平成18年6月29日(2006.6.29)

【年通号数】公開・登録公報2006-025

【出願番号】特願2006-501034(P2006-501034)

【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	31/275	(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	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	31/167
A 6 1 K	31/275
A 6 1 P	3/04
A 6 1 P	5/26
A 6 1 P	7/06
A 6 1 P	15/00
A 6 1 P	15/10
A 6 1 P	15/12
A 6 1 P	17/14
A 6 1 P	19/00
A 6 1 P	19/10
A 6 1 P	21/00
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/22
A 6 1 P	25/24
A 6 1 P	35/00

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月29日(2006.11.29)

【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】

女性のアンドロゲン欠乏(ADIF)に関連する病気を治療する薬剤を製造するための、前記ADIFに関連する病気を治療するのに効果的な量の選択的アンドロゲン受容体(SARM)化合物の使用。

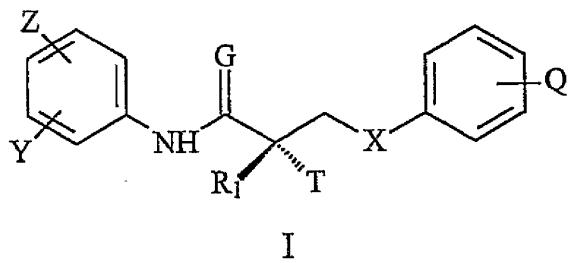
【請求項2】

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、N酸化物、結晶、多形体、プロドラッグ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、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

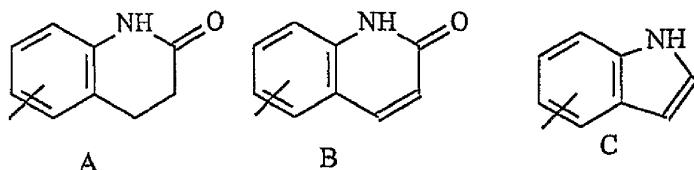
Tは、OH、OR、-NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>又はNHCORであり、

Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>2</sub>、NHCSCH<sub>2</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】



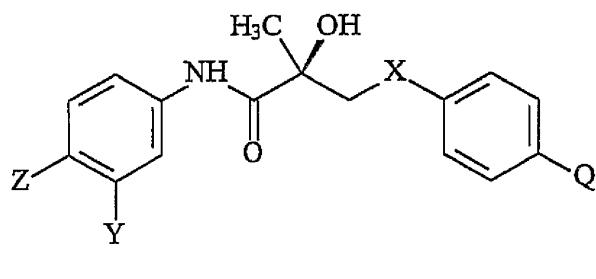
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>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。

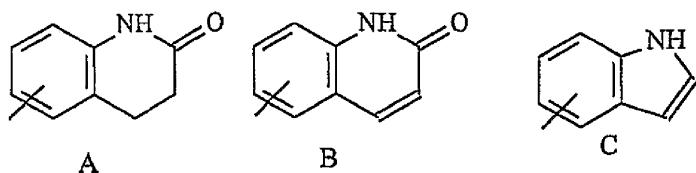
## 【化2】



II

ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、Yは、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又是SnR<sub>3</sub>であり、Qは、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又是SRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化12】

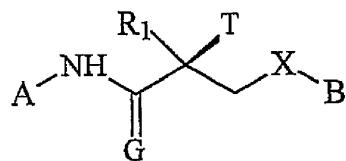


Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHである。

## 【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

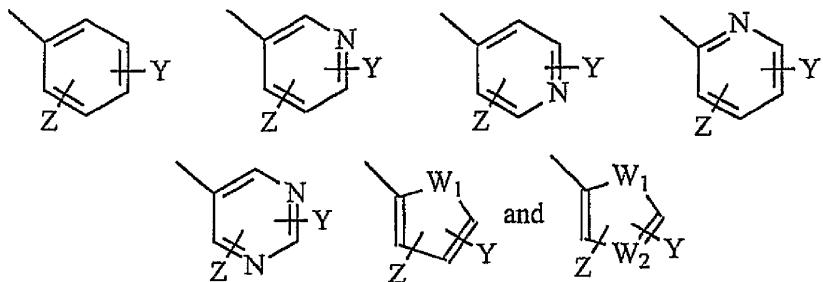
ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Gは、O又はSであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、

Tは、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub>又はNHCORであり、

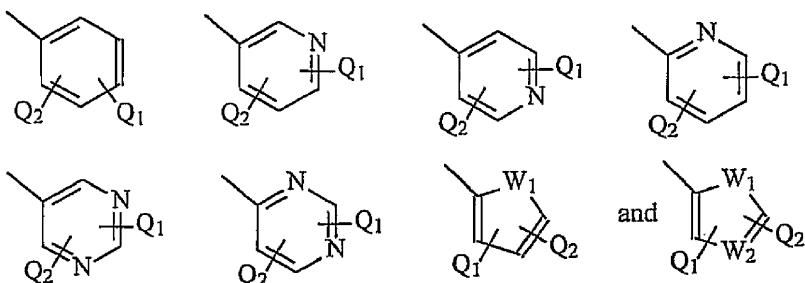
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

A は、  
【化 1 3】



から選択される環であり、

B は、  
【化 1 4】



から選択される環であり、

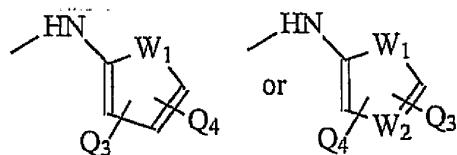
ただし、A 及び B は同時にベンゼン環であり得ず、

Z は、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR 又はCONHR であり、

Y は、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub> であり、

Q<sub>1</sub> 及び Q<sub>2</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R、SR 又は、

【化 1 5】



であり、Q<sub>3</sub> 及び Q<sub>4</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又は SR であり、

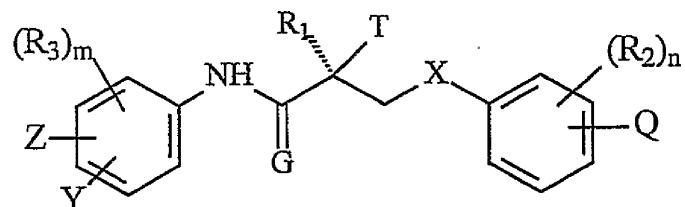
W<sub>1</sub> は、O、NH、NR、NO 又は S であり、

W<sub>2</sub> は、N 又は NO である。

【請求項 6】

前記 SAR M 化合物が、次の化学構造式 I 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4】



IV

ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Gは、O又はSであり、

Tは、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub>又はNHCORであり、

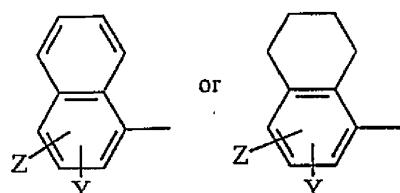
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、

R<sub>2</sub>は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub>又はSRであり、

R<sub>3</sub>は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub>、又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、R<sub>3</sub>は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化16】

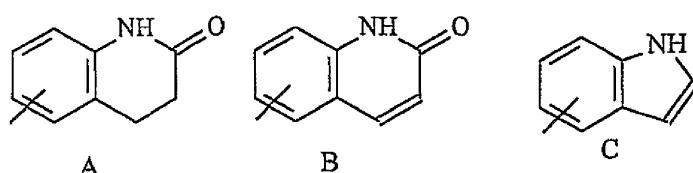


Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化12】



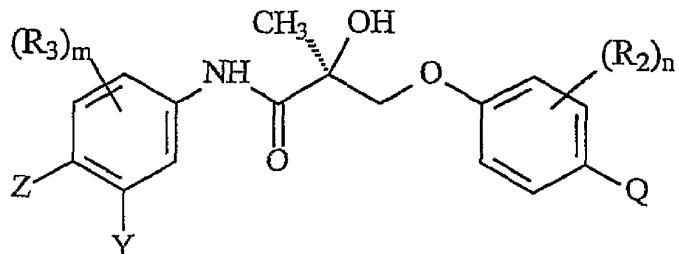
nは、1～4の整数であり、

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】

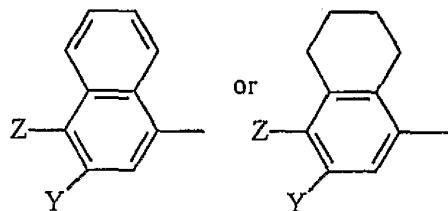


V

ただし、R<sub>2</sub>は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub>又はSRであり、

R<sub>3</sub>は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub>又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、R<sub>3</sub>は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化17】



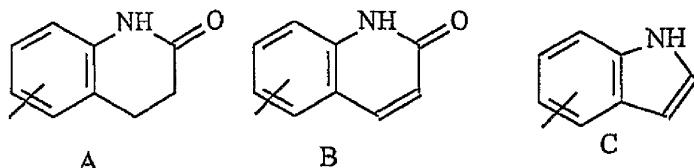
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】



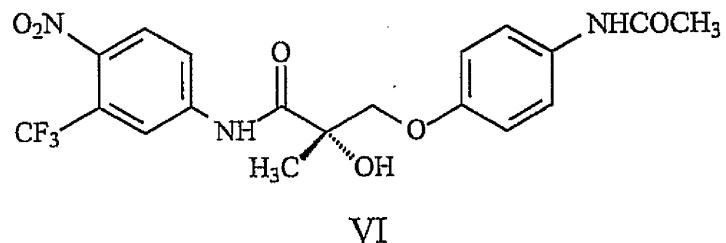
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項8】

前記 S A R M 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。

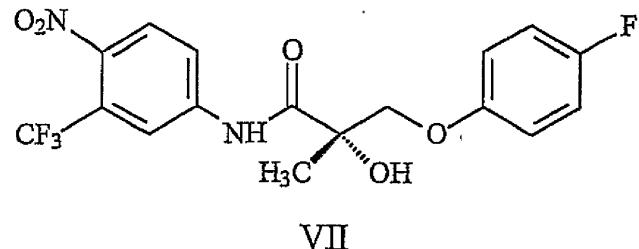
【化 6】



【請求項 9】

前記 S A R M 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。

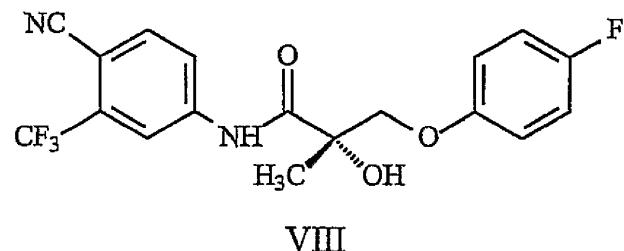
【化 7】



【請求項 10】

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

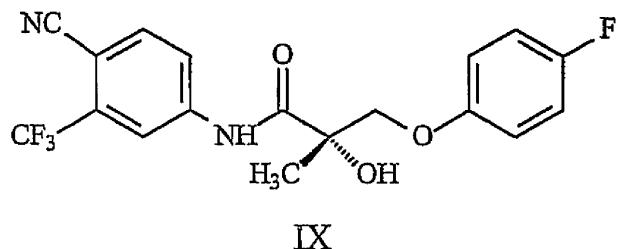
【化 8】



【請求項 11】

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

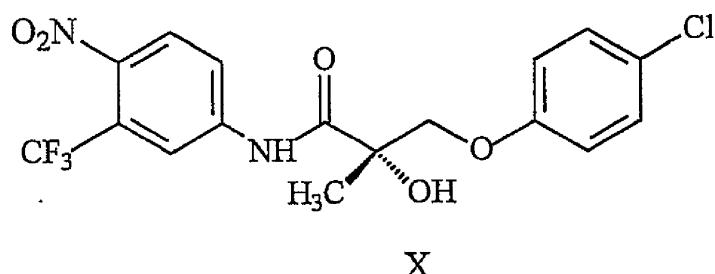
【化9】



【請求項 1 2】

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

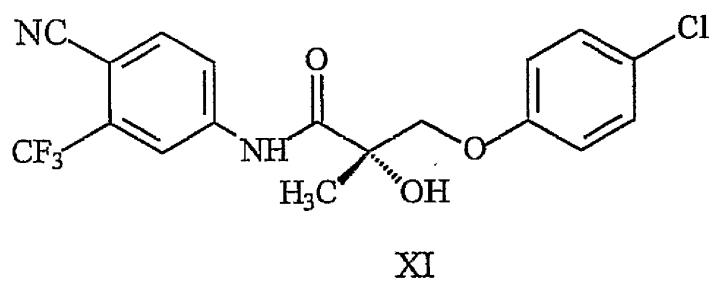
【化 1 0】



【請求項 1 3】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 XI 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 1】



【請求項 1 4】

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 1 に記載の使用。

【請求項 1 5】

前記 S A R M が、インビボで、アンドロゲン受容体に対する非ステロイド性リガンドとしてのアンドロゲン活性及びタンパク同化作用を有することを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 6】

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 1 に記載の使用。

【請求項 1 7】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対してアゴニスト作用を有することを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 8】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対しての影響が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 S A R M が、中枢神経系 (C N S) 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 20】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) 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 21】

前記薬剤が、前記 S A R M 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、結晶、多形体、プロドラッグ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 22】

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、  
皮下移植可能なペレットか、  
経口投与可能な液体又は固体か、又は、  
皮膚の表面に局所適用な液体又は固体であることを特徴とする請求項 21 に記載の使用。  
。

【請求項 23】

前記薬剤が、ペレット、錠剤、カプセル剤、液剤、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、座剤又は非経口製剤であることを特徴とする請求項 21 に記載の使用。

【請求項 24】

前記 A D I F に関する病気が、性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌、或い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 25】

前記薬剤が、老齢の患者に投与可能であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 26】

女性のアンドロゲン欠乏 (A D I F) に関する病気を、予防、抑止、抑制、又は発生を減少させる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。

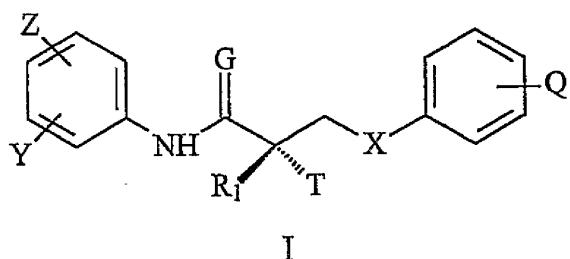
【請求項 27】

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、N 酸化物、結晶、多形体、プロドラッグ、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 26 に記載の使用。

【請求項 28】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 1 で表されることを特徴とする請求項 26 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、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO 又は NR であり、

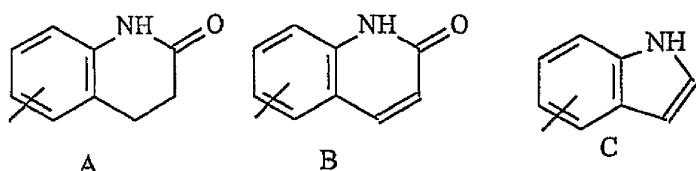
Tは、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub>又はNHCORであり、

は、 $\text{N}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{N}_2$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{COR}$ 、 $\text{NHCOR}$ 又は $\text{C}_6\text{H}_5\text{CONHR}$ であり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSNR<sub>3</sub>であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又は SR である。或いは、Q は、次の構造式 A、B 又は C で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり。

【化 1 2 】



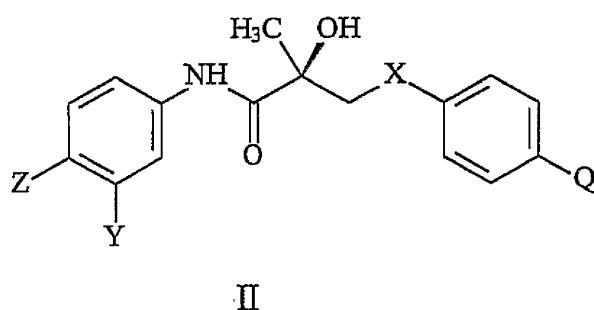
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

R<sub>1</sub> は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>F<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> 又は CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> である

### 【請求項 29】

前記 S A R M 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 26 に記載の使用。

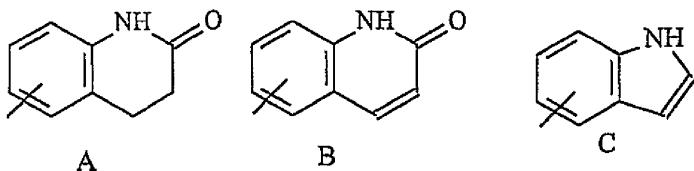
【化 2】



ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、 $\text{CF}_3$ 、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSnR<sub>3</sub>であり、Qは、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSC<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHC<sub>2</sub>SR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】

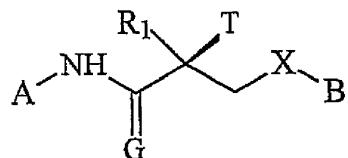


Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHである。

【請求項30】

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26に記載の使用。

【化3】



III

ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

Gは、O又はSであり、

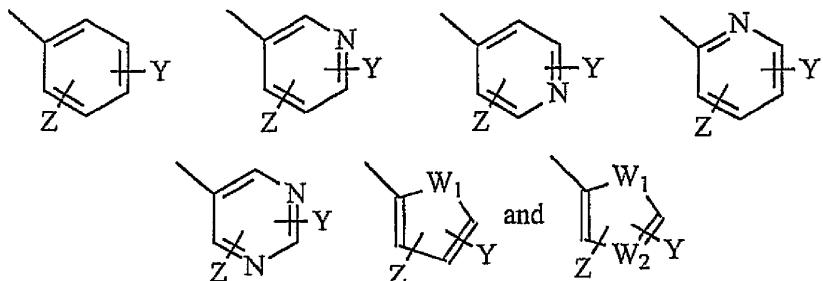
R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり

Tは、OH、OR、-NHCOC<sub>3</sub>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<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

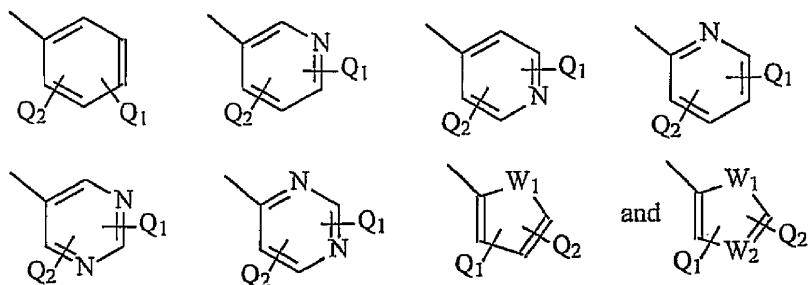
Aは、

【化13】



から選択される環であり、

B は、  
【化 14】



から選択される環であり、

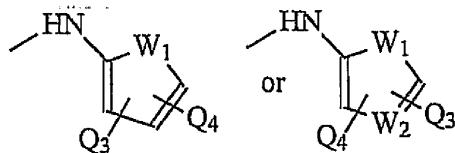
ただし、A 及び B は同時にベンゼン環であり得ず、

Z は、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR 又はCONHR であり、

Y は、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub> であり、

Q<sub>1</sub> 及びQ<sub>2</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R、SR 又は、

【化 15】



であり、Q<sub>3</sub> 及びQ<sub>4</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSR であり、

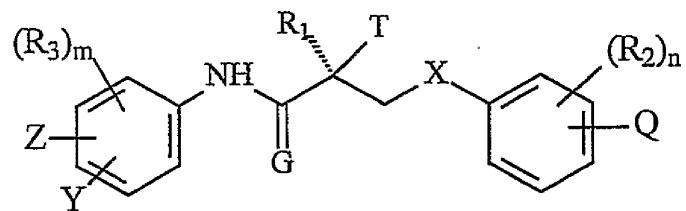
W<sub>1</sub> は、O、NH、NR、NO 又はS であり、

W<sub>2</sub> は、N 又はNO である。

【請求項 31】

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26に記載の使用。

【化 4】



IV

ただし、X は、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO 又はNR であり、  
G は、O 又はS であり、

T は、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub> 又はNHCOR であり、

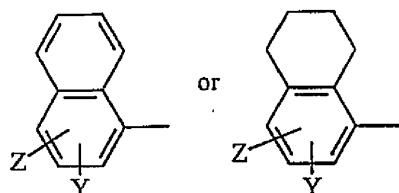
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、

R<sub>2</sub>は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub>又はSRであり、

R<sub>3</sub>は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub>、又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、R<sub>3</sub>は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化16】

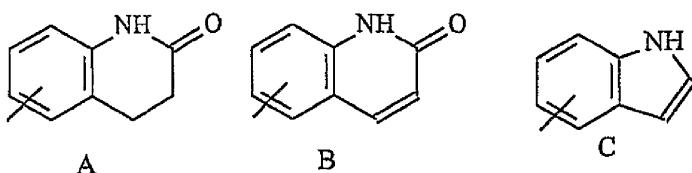


Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Br、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】



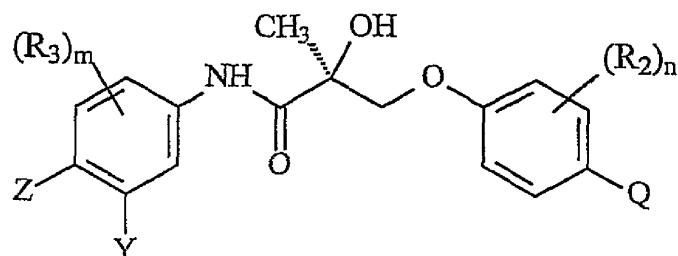
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項32】

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26に記載の使用。

## 【化5】

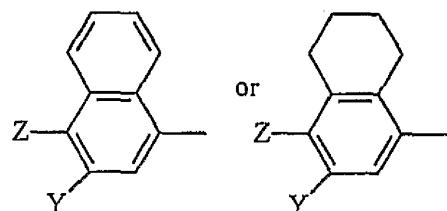


V

ただし、 $R_2$  は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub> 又はSRであり、

$R_3$  は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、 $R_3$  は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化17】



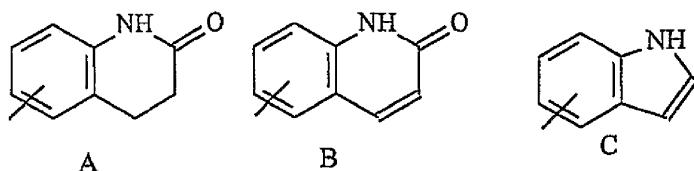
$R$  は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

$Z$  は、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH 又はCONHRであり、

$Y$  は、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN 又はSnR<sub>3</sub>であり、

$Q$  は、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSRである。或いは、 $Q$  は、次の構造式A、B 又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化12】



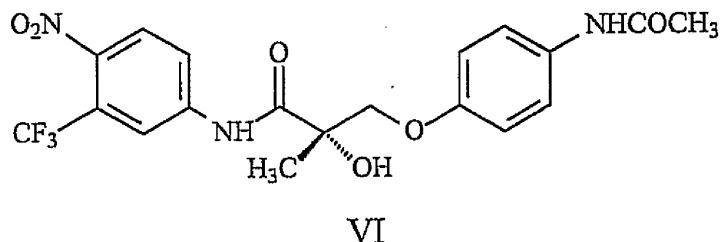
$n$  は、1 ~ 4 の整数であり、

$m$  は、1 ~ 3 の整数である。

## 【請求項33】

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26に記載の使用。

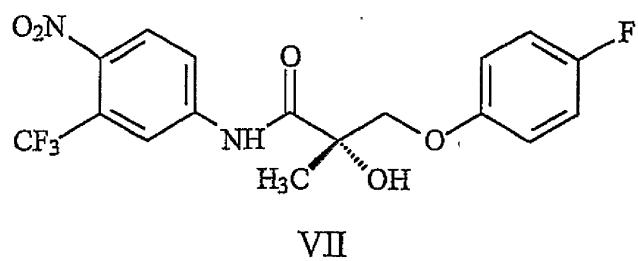
## 【化6】



## 【請求項34】

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26に記載の使用。

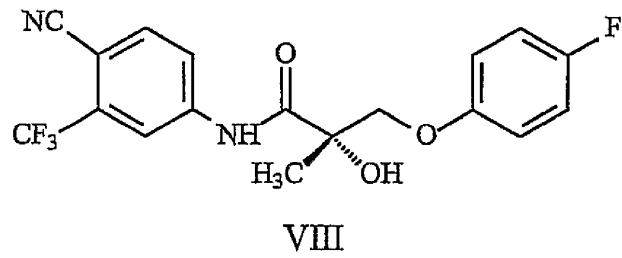
## 【化7】



## 【請求項35】

前記SARM化合物が、次の化学構造式VIIIで表されることを特徴とする請求項26に記載の使用。

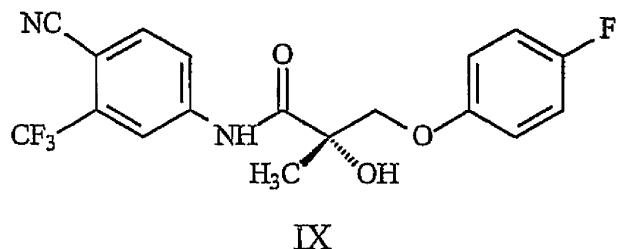
## 【化8】



## 【請求項36】

前記SARM化合物が、次の化学構造式IXで表されることを特徴とする請求項26に記載の使用。

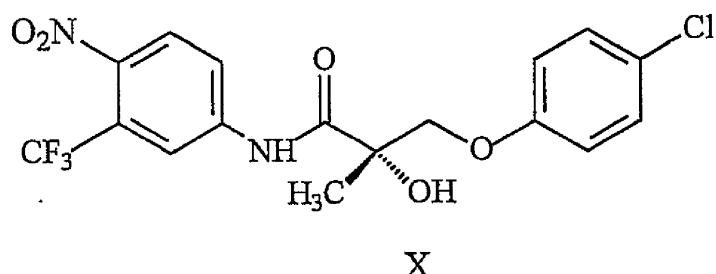
【化9】



【請求項 3 7】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 X で表されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

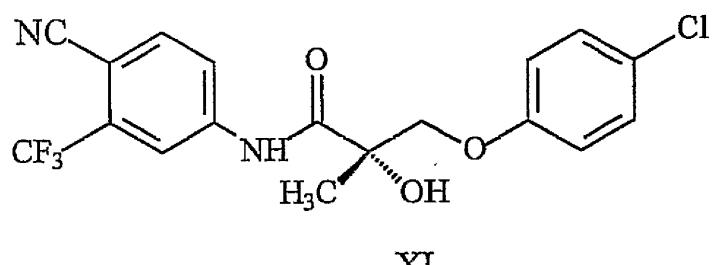
【化10】



【請求項 3 8】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 XI で表されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【化11】



【請求項 3 9】

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 6 に記載の使用。

【請求項 4 0】

前記 S A R M が、インビボで、アンドロゲン受容体に対する非ステロイド性リガンドとしてのアンドロゲン活性及びタンパク同化作用を有することを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 4 1】

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 6 に記載の使用。

【請求項 4 2】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対してアゴニスト作用を有することを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 4 3】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対しての影響がないことを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 4 4】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透することを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 4 5】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透しないことを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 4 6】

前記薬剤が、前記 S A R M 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、結晶、多形体、プロドラッグ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 6 に記載の使用。

【請求項 4 7】

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、

皮下移植可能なペレットか、

経口投与可能な液体又は固体か、又は、

皮膚の表面に局所適用な液体又は固体であることを特徴とする請求項 4 6 に記載の使用。

【請求項 4 8】

前記薬剤が、ペレット、錠剤、カプセル剤、液剤、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、座剤又は非経口製剤であることを特徴とする請求項 4 6 に記載の使用。

【請求項 4 9】

前記 A D I F に関連する病気が、性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌、或い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 6 に記載の使用。

【請求項 5 0】

前記薬剤が、老齢の患者に投与可能であることを特徴とする請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 5 1】

アンドロゲン欠乏 (A D I F) に起因する性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌の女性患者を治療する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) 化合物使用。

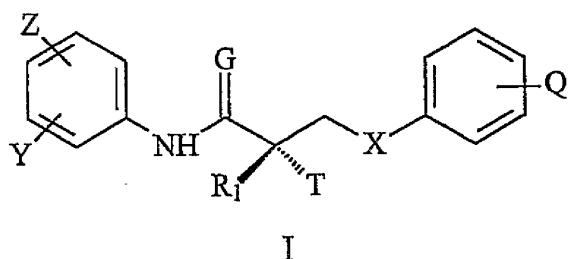
【請求項 5 2】

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、N 酸化物、結晶、多形体、プロドラッグ、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 5 1 に記載の使用。

【請求項 5 3】

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 5 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、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO 又は NR であり、

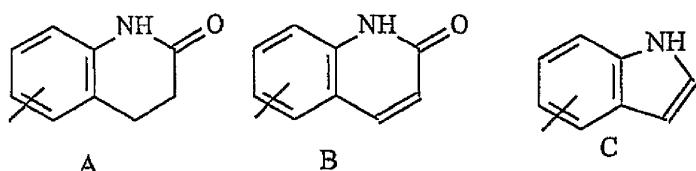
Tは、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub>又はNHCORであり、

は、 $\text{N}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{N}_2$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{C}_6\text{H}_5\text{COR}$ 、 $\text{NHCOR}$ 又は $\text{C}_6\text{H}_5\text{CONHR}$ であり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSNR<sub>3</sub>であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又は SR である。或いは、Q は、次の構造式 A、B 又は C で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり。

【化 1 2 】



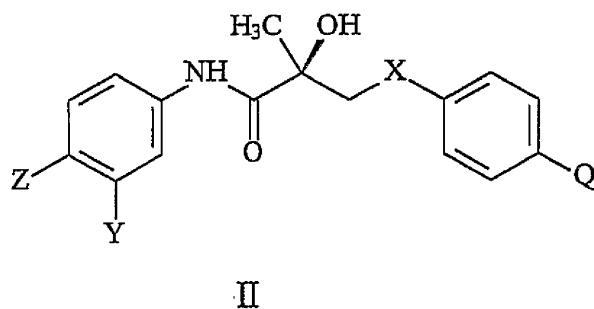
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

R<sub>1</sub> は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>F<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> 又は CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> である

### 【請求項 5 4】

前記 S A R M 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 51 に記載の使用。

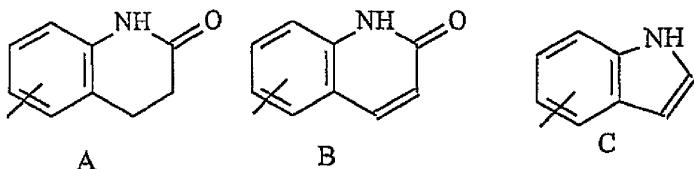
## 【化 2】



ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、 $\text{CF}_3$ 、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSnR<sub>3</sub>であり、Qは、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSC<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHC<sub>2</sub>SR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】

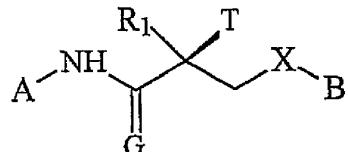


Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHである。

【請求項55】

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51に記載の使用。

【化3】



III

ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

Gは、O又はSであり、

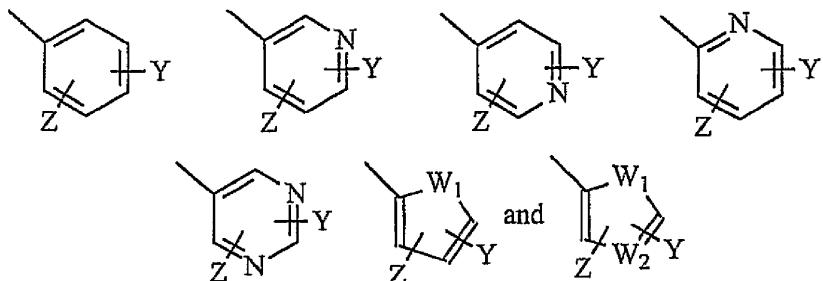
R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり

Tは、OH、OR、-NHCOC<sub>3</sub>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<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

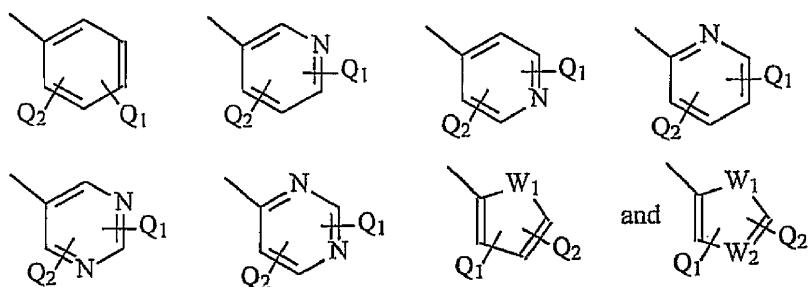
Aは、

【化13】



から選択される環であり、

B は、  
【化 14】



から選択される環であり、

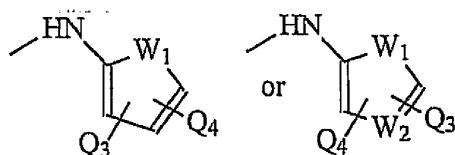
ただし、A 及び B は同時にベンゼン環であり得ず、

Z は、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR 又はCONHR であり、

Y は、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub> であり、

Q<sub>1</sub> 及びQ<sub>2</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R、SR 又は、

【化 15】



であり、Q<sub>3</sub> 及びQ<sub>4</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSR であり、

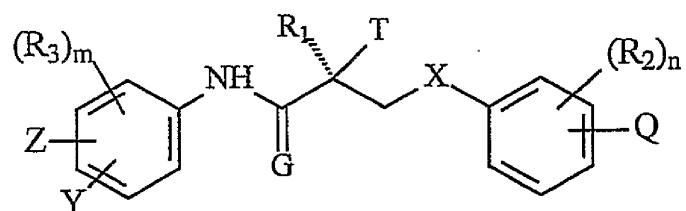
W<sub>1</sub> は、O、NH、NR、NO 又はS であり、

W<sub>2</sub> は、N 又はNO である。

【請求項 5 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5 1に記載の使用。

【化 4】



IV

ただし、X は、結合部、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO 又はNR であり、  
G は、O 又はS であり、

T は、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub> 又はNHCOR であり、

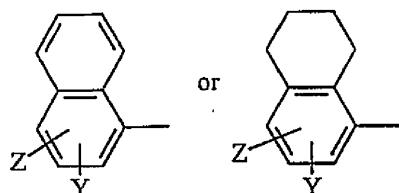
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、

R<sub>2</sub>は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub>又はSRであり、

R<sub>3</sub>は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub>、又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、R<sub>3</sub>は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化16】

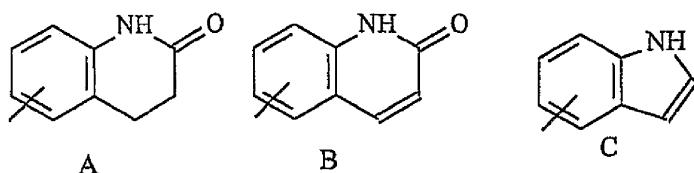


Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSRF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】



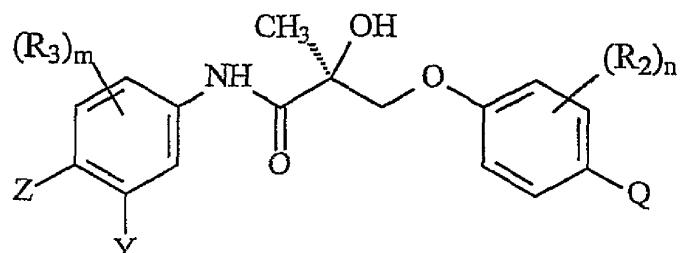
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項57】

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51に記載の使用。

## 【化5】

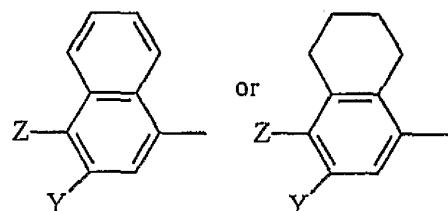


V

ただし、 $R_2$  は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub> 又はSRであり、

$R_3$  は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub> である。或いは、 $R_3$  は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化17】



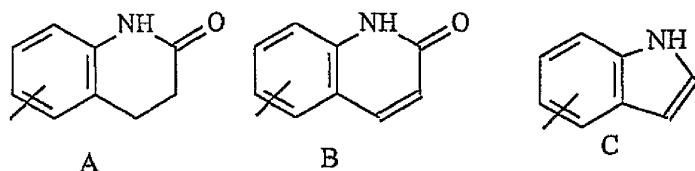
$R$  は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

$Z$  は、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH 又はCONHR であり、

$Y$  は、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN 又はSnR<sub>3</sub> であり、

$Q$  は、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSR である。或いは、 $Q$  は、次の構造式A、B 又はC で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化12】



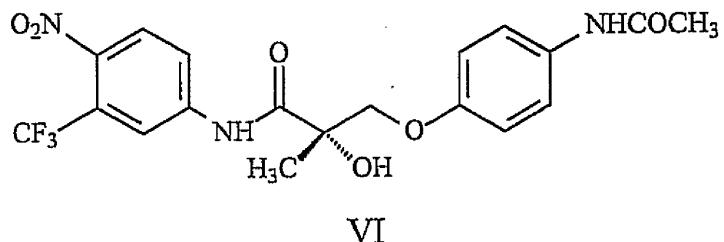
$n$  は、1 ~ 4 の整数であり、

$m$  は、1 ~ 3 の整数である。

## 【請求項58】

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51に記載の使用。

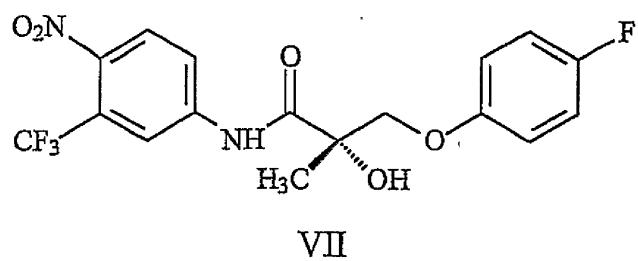
【化6】



【請求項 5 9】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 V I I で表されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

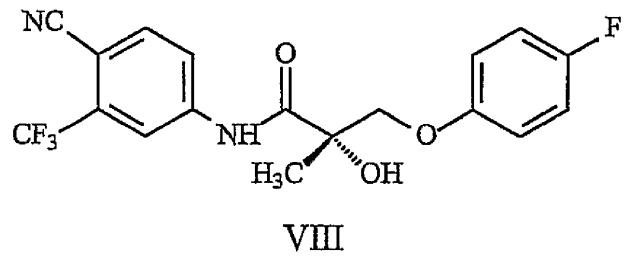
【化7】



【請求項 6 0】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 V I I I で表されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

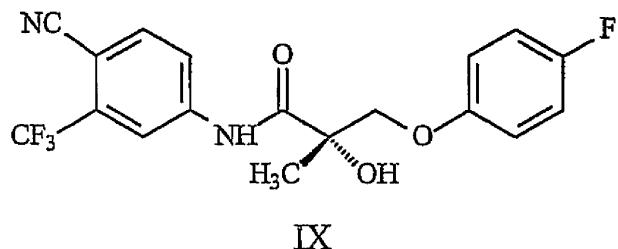
【化8】



【請求項 6 1】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 I X で表されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

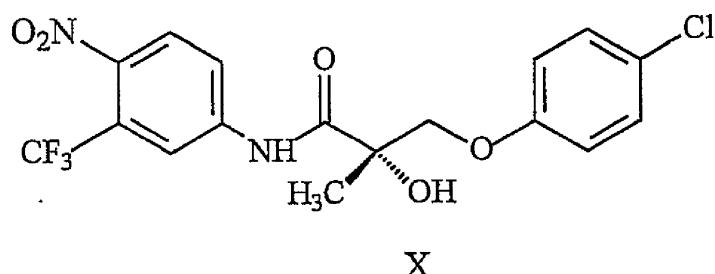
【化9】



【請求項 6 2】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 X で表されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

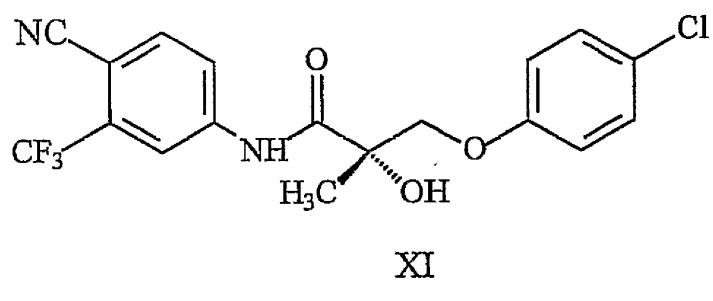
【化10】



【請求項 6 3】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 XI で表されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【化11】



【請求項 6 4】

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 5 1 に記載の使用。

【請求項 6 5】

前記 S A R M が、インビボで、アンドロゲン受容体に対する非ステロイド性リガンドとしてのアンドロゲン活性及びタンパク同化作用を有することを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 6 6】

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 5 1 に記載の使用。

【請求項 6 7】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対してアゴニスト作用を有することを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 6 8】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対しての影響がないことを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 6 9】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透することを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 7 0】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透しないことを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 7 1】

前記薬剤が、前記 S A R M 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、結晶、多形体、プロドラッグ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 5 1 に記載の使用。

【請求項 7 2】

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、

皮下移植可能なペレットか、

経口投与可能な液体又は固体か、又は、

皮膚の表面に局所適用な液体又は固体であることを特徴とする請求項 7 1 に記載の使用。

。

【請求項 7 3】

前記薬剤が、ペレット、錠剤、カプセル剤、液剤、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、座剤又は非経口製剤であることを特徴とする請求項 7 1 に記載の使用。

【請求項 7 4】

前記 A D I F に関連する病気が、性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌、或い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 5 1 に記載の使用。

【請求項 7 5】

前記薬剤が、老齢の患者に投与可能であることを特徴とする請求項 5 1 に記載の使用。

【請求項 7 6】

性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌からなる群から選択される女性のアンドロゲン欠乏 (A D I F) に関連する病気を、予防、抑止、抑制、又は発生を減少させる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) 化合物使用。

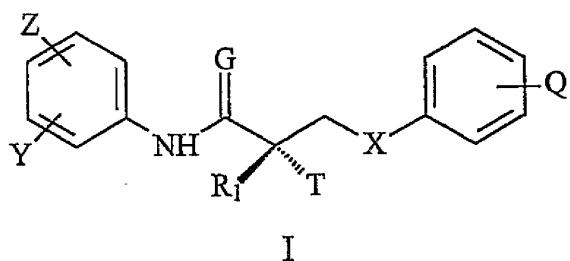
【請求項 7 7】

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、N 酸化物、結晶、多形体、プロドラッグ、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 7 6 に記載の使用。

【請求項 7 8】

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 7 6 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、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

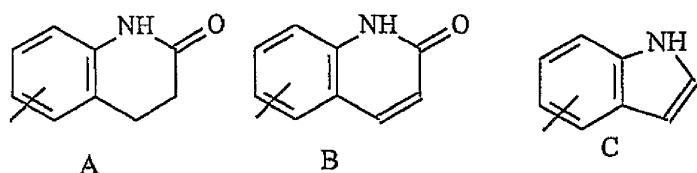
Tは、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub>又はNHCORであり、

Zは、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{COOH}$ 、 $\text{COR}$ 、 $\text{NHCOR}$ 又は $\text{CONHR}$ であり、

Yは、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{CR}_3$ 又は $\text{SnR}_3$ であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、CN、 $\text{CR}_3$ 、 $\text{SnR}_3$ 、 $\text{NR}_2$ 、 $\text{NHCOCCH}_3$ 、 $\text{NHCOCF}_3$ 、 $\text{NHCOR}$ 、 $\text{NHCONHR}$ 、 $\text{NHCOOR}$ 、 $\text{OCOCONHR}$ 、 $\text{CONHR}$ 、 $\text{NHCSCCH}_3$ 、 $\text{NHCSCF}_3$ 、 $\text{NHCSCR}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}$ 、 $\text{OR}$ 、 $\text{COR}$ 、 $\text{OCOR}$ 、 $\text{OSO}_2\text{R}$ 、 $\text{SO}_2\text{R}$ 又はSRである。或いは、Q は、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化 1 2 】



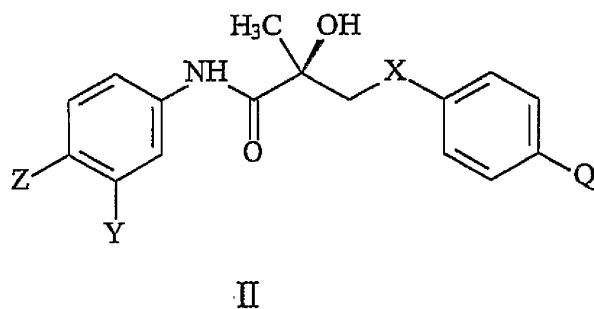
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

R<sub>1</sub> は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>F<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> 又は CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> である

### 【請求項 7 9】

前記 S A R M 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 7 6 に記載の使用。

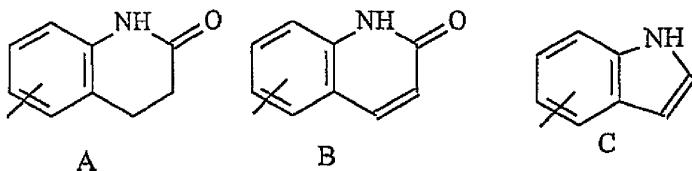
## 【化 2】



ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、 $\text{CF}_3$ 、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub>又はSnR<sub>3</sub>であり、Qは、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSC<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHC<sub>2</sub>SR、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】

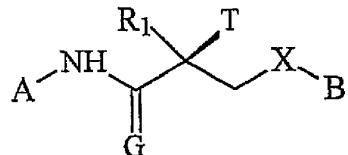


Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHである。

【請求項80】

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76に記載の使用。

【化3】



III

ただし、Xは、結合部、O、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO又はNRであり、

Gは、O又はSであり、

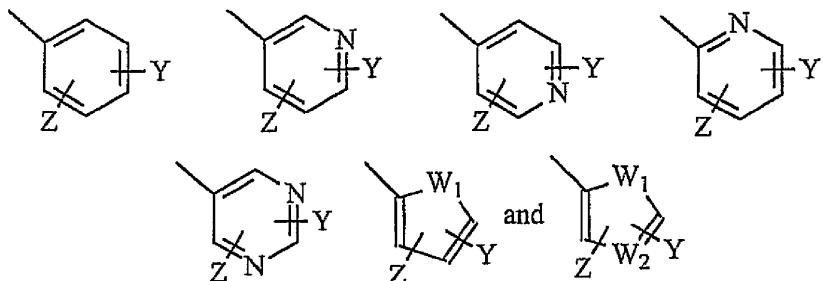
R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり

、Tは、OH、OR、-NHCOC<sub>3</sub>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<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり

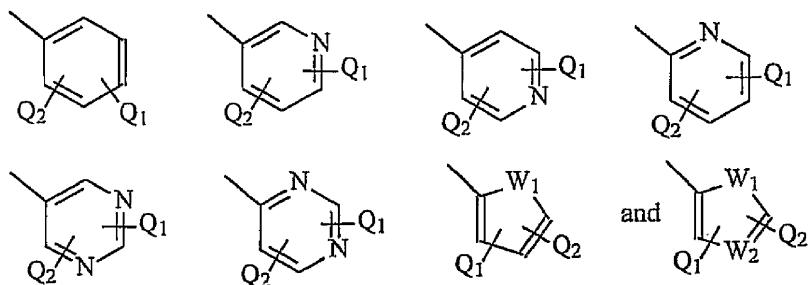
、Aは、

【化13】



から選択される環であり、

B は、  
【化 14】



から選択される環であり、

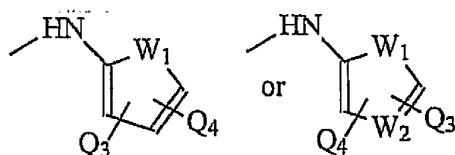
ただし、A 及び B は同時にベンゼン環であり得ず、

Z は、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COR、NHCOR 又はCONHR であり、

Y は、CF<sub>3</sub>、F、I、Br、Cl、CN、CR<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub> であり、

Q<sub>1</sub> 及びQ<sub>2</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R、SR 又は、

【化 15】



であり、Q<sub>3</sub> 及びQ<sub>4</sub> は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCS<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSR であり、

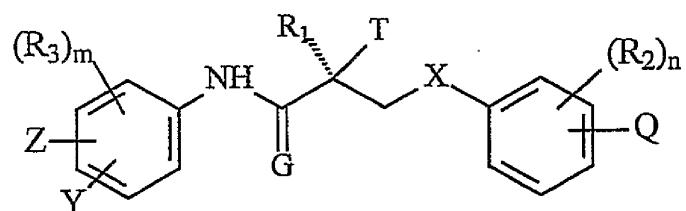
W<sub>1</sub> は、O、NH、NR、NO 又はS であり、

W<sub>2</sub> は、N 又はNO である。

【請求項 8 1】

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7 6に記載の使用。

【化 4】



IV

ただし、X は、結合部、CH<sub>2</sub>、NH、Se、PR、NO 又はNR であり、  
G は、O 又はS であり、

T は、OH、OR、-NHCOCH<sub>3</sub> 又はNHCOR であり、

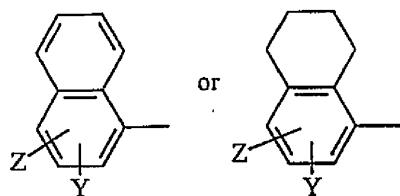
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はCF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、

R<sub>2</sub>は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub>又はSRであり、

R<sub>3</sub>は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub>、又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、R<sub>3</sub>は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化16】

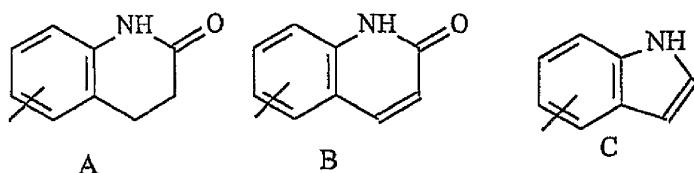


Zは、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN又はSnR<sub>3</sub>であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSRF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R又はSRである。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

【化12】



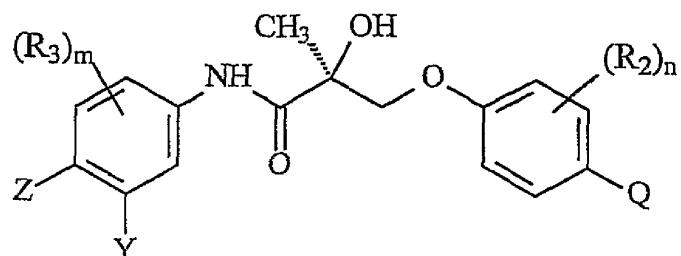
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数である。

【請求項82】

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76に記載の使用。

## 【化5】

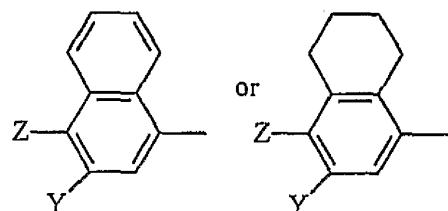


V

ただし、 $R_2$  は、F、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、アルキル、アリールアルキル、OR、NH<sub>2</sub>、NHR、NR<sub>2</sub> 又はSRであり、

$R_3$  は、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、COR、COOH、CONHR、CF<sub>3</sub> 又はSnR<sub>3</sub>である。或いは、 $R_3$  は、次の構造式で表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化17】



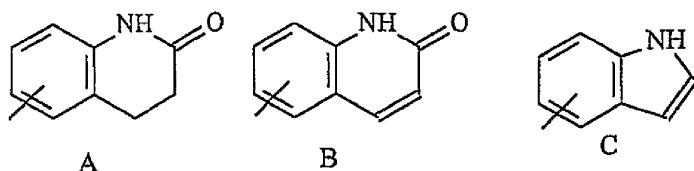
$R$  は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル又はOHであり、

$Z$  は、NO<sub>2</sub>、CN、COR、COOH 又はCONHRであり、

$Y$  は、CF<sub>3</sub>、F、Br、Cl、I、CN 又はSnR<sub>3</sub>であり、

$Q$  は、H、アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、CR<sub>3</sub>、SnR<sub>3</sub>、NR<sub>2</sub>、NHCOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、NHCOCF<sub>3</sub>、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH<sub>3</sub>、NHCSCF<sub>3</sub>、NHCSR、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、NHSO<sub>2</sub>R、OH、OR、COR、OCOR、OSO<sub>2</sub>R、SO<sub>2</sub>R 又はSRである。或いは、 $Q$  は、次の構造式A、B 又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり、

## 【化12】



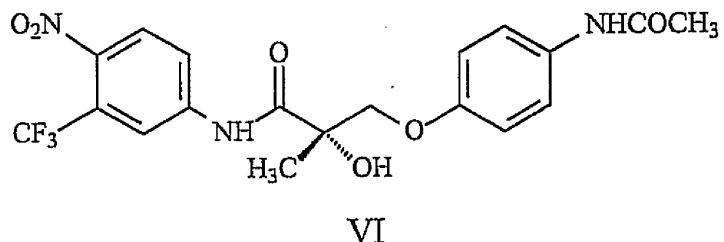
$n$  は、1 ~ 4 の整数であり、

$m$  は、1 ~ 3 の整数である。

## 【請求項83】

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76に記載の使用。

【化6】

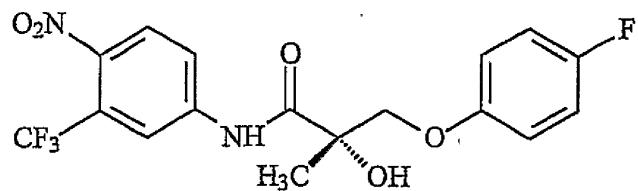


VI

【請求項 8 4】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 V I I で表されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【化7】

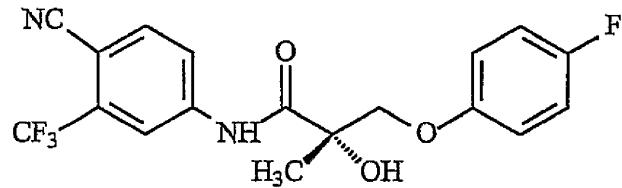


VII

【請求項 8 5】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 V I I I で表されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【化8】

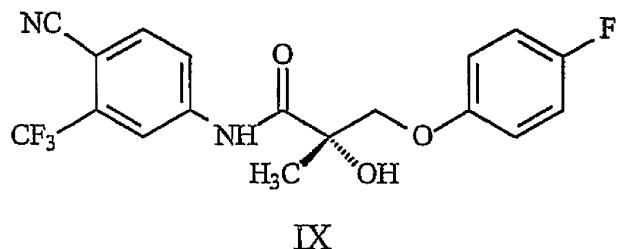


VIII

【請求項 8 6】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 I X で表されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

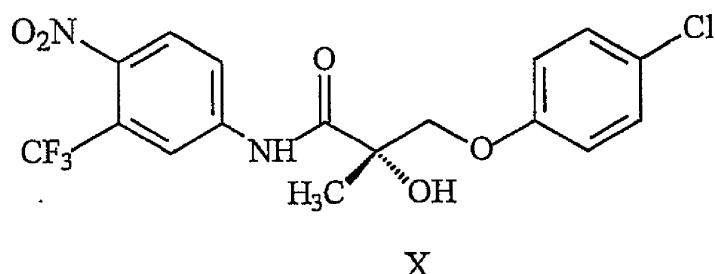
【化9】



【請求項 8 7】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 X で表されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

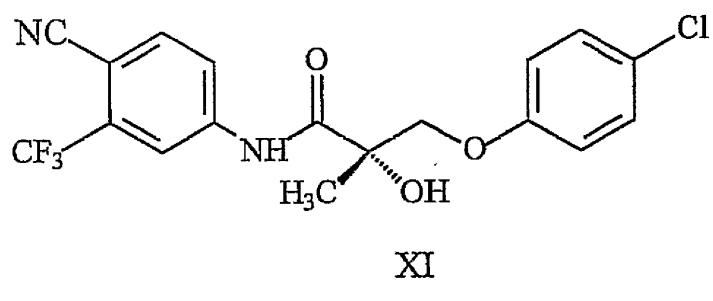
【化10】



【請求項 8 8】

前記 S A R M 化合物が、次の化学構造式 XI で表されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【化11】



【請求項 8 9】

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 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 0】

前記 S A R M が、インビボで、アンドロゲン受容体に対する非ステロイド性リガンドとしてのアンドロゲン活性及びタンパク同化作用を有することを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 1】

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 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 2】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対してアゴニスト作用を有することを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 3】

前記 S A R M が、筋肉又は骨に対しての影響がないことを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 4】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透することを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 5】

前記 S A R M が、中枢神経系 (C N S) に浸透しないことを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 6】

前記薬剤が、前記 S A R M 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、結晶、多形体、プロドラッグ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 7 6 に記載の使用。

【請求項 9 7】

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、  
皮下移植可能なペレットか、  
経口投与可能な液体又は固体か、又は、  
皮膚の表面に局所適用な液体又は固体であることを特徴とする請求項 9 6 に記載の使用。  
。

【請求項 9 8】

前記薬剤が、ペレット、錠剤、カプセル剤、液剤、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、座剤又は非経口製剤であることを特徴とする請求項 9 6 に記載の使用。

【請求項 9 9】

前記 A D I F に関連する病気が、性的不全、性欲減退、性線機能低下症、筋肉減少症、骨減少症、骨粗鬆症、認識力・気分の変調、疲労、うつ病、貧血、筋力低下、脱毛症、肥満、多囊胞卵巣、子宮内膜症、乳癌、子宮癌、又は卵巣癌、或い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 7 6 に記載の使用。

【請求項 1 0 0】

前記薬剤が、老齢の患者に投与可能であることを特徴とする請求項 7 6 に記載の使用。