

【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 12 月 13 日 (2007.12.13)

【公表番号】特表 2007-509962 (P2007-509962A)

【公表日】平成 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報 2007-015

【出願番号】特願 2006-538255 (P2006-538255)

【国際特許分類】

C 07 J	73/00	(2006.01)
A 61 K	31/58	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	19/10	(2006.01)
A 61 P	19/00	(2006.01)
A 61 P	1/02	(2006.01)
A 61 P	3/02	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	15/08	(2006.01)
A 61 P	15/12	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	3/06	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	7/06	(2006.01)
A 61 P	7/00	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	37/04	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	21/04	(2006.01)
A 61 P	25/28	(2006.01)
A 61 P	15/10	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	25/24	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	25/02	(2006.01)
A 61 P	19/06	(2006.01)
A 61 P	31/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	17/02	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)

【 F I 】

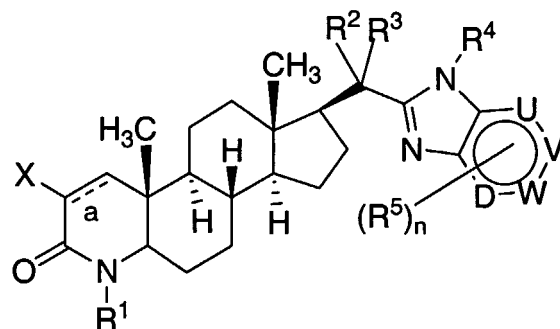
C 07 J	73/00	C S P
A 61 K	31/58	
A 61 P	21/00	
A 61 P	19/10	

A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	3/02	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	15/12	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	17/06	

【手続補正書】**【提出日】**平成19年10月23日(2007.10.23)**【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】**

下記構造式 I の化合物および該化合物の製薬上許容される塩または立体異性体。

【化 1】



I

[式中、

a は、二重結合および単結合から選択され；

X は、水素またはハロゲンであり；

n は、0、1、2、3 または 4 であり；

U、V、W および D はそれぞれ独立に、CH および N から選択され；ただし、U、V、W および D のうちの少なくとも一つは CH であり；

R¹ は、水素、CF₃、カルボニル (C₁ - 3 アルキル)、ヒドロキシル、C₁ - 4 アルコキシ、ハロゲン、C₁ - 3 アルキル、ヒドロキシメチルおよび (C₀ - 6 アルキル)₂ アミノから選択され；前記アルキルおよびアルコキシはそれぞれ、1 ~ 7 個のフッ素原子で置換されていても良く；

R² および R³ は独立に、水素、ハロゲン、C₁ - 8 アルキル、アミノ C₀ - 6 アルキル、C₁ - 6 アルキルアミノ C₀ - 6 アルキル、(C₁ - 6 アルキル)₂ アミノ C₀ - 6 アルキル、C₁ - 6 アルコキシ C₀ - 6 アルキル、ヒドロキシカルボニル C₀ - 6 アルキル、ヒドロキシ C₀ - 6 アルキル、C₁ - 6 アルコキシカルボニル C₀ - 6 アルキル、ヒドロキシカルボニル C₁ - 6 アルキルオキシ、シアノ、パーフルオロ C₁ - 4 アルキル、パーフルオロ C₁ - 4 アルコキシ、C₀ - 6 アルキルカルボニル、C₁ - 6 アルキルカルボニルオキシ、C₁ - 6 アルキルカルボニルアミノ、C₁ - 6 アルキルスルホニルアミノ、C₁ - 6 アルコキシカルボニルアミノ、C₁ - 6 アルキルアミノカルボニルアミノ、(C₁ - 6 アルキル)₂ アミノカルボニルアミノおよび (C₁ - 6 アルキル)₂ アミノカルボニルオキシから選択され；

R² および R³ がこれらが結合している炭素原子と一体となって、C₃ - 6 シクロアルキル基またはオキソ基を形成していても良く；

R² および R³ はそれぞれ独立に、1 個以上の R⁶ で置換されていても良く；

R⁴ は、水素、ハロゲン、C₁ - 10 アルキル (カルボニル)₀ - 1、アリール C₀ - 8 アルキル、アミノ C₀ - 8 アルキル、C₁ - 3 アシルアミノ C₀ - 8 アルキル、C₁ - 6 アルキルアミノ C₀ - 8 アルキル、C₁ - 6 ジアルキルアミノ C₀ - 8 アルキル、アリール C₀ - 6 アルキルアミノ C₀ - 6 アルキル、C₁ - 4 アルコキシアミノ C₀ - 8 アルキル、ヒドロキシ C₁ - 6 アルキルアミノ C₀ - 8 アルキル、C₁ - 4 アルコキシ C₀ - 6 アルキル、ヒドロキシカルボニル C₀ - 6 アルキル、C₁ - 4 アルコキシカルボニル C₀ - 6 アルキル、ヒドロキシカルボニル C₀ - 6 アルキルオキシ、ヒドロキシ C₁ - 6 アルキルアミノ C₀ - 6 アルキルまたはヒドロキシ C₀ - 6 アルキルから選択され；

R⁴ は、水素、OH、(C₁ - 6) アルコキシ、ハロゲン、CO₂H、CN、O (C = O) C₁ - C₆ アルキル、NO₂、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、-O (0 - 1) (C₁ - 10) パーフルオロアルキルおよび NH₂ から選択される 1 以上の基で置換されていても良く；

R⁵ は、ハロゲン、(カルボニル)₀ - 1 C₁ - 10 アルキル、(カルボニル)₀ - 1 C₂ - 10 アルケニル、(カルボニル)₀ - 1 C₂ - 10 アルキニル、(カルボニル)₀ - 1 アリール C₁ - 10 アルキル、C₃ - 8 シクロアルキル C₀ - 10 アルキル、(C₃ - 8) 複素環 C₀ - 10 アルキル、C₁ - 4 アシルアミノ C₀ - 10 アルキル、C₀ - 1

$C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、ジ - ($C_1 - 1_0$ アルキル) アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、(アリーール $C_0 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニルアミノ、($C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノカルボニルアミノ、(アリーール $C_1 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニルアミノ、 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニルアミノ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニルアミノ、($C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、(アリーール $C_1 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノカルボニル、(アリーール $C_1 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニル、 $C_1 - 1_0$ アルコキシ(カルボニル) $_0 - 1_0$ $C_0 - 1_0$ アルキル、カルボキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、カルボキシ $C_0 - 1_0$ アルキル、カルボキシアリーール、カルボキシ $C_3 - 8$ シクロアルキル、カルボキシ $C_3 - 8$ 複素環、 $C_1 - 1_0$ アルコキシ、 $C_1 - 1_0$ アルキルオキシ $C_0 - 1_0$ アルキル $C_1 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシアミノ、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシアミノ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシアミノ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシアミノ、($C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノカルボニルオキシ、(アリーール $C_0 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニルオキシ、($C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニルオキシ、($C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル) $_1 - 2$ アミノカルボニルオキシ、ヒドロキシ $C_0 - 1_0$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_0 - 1_0$ アルコキシ、ヒドロキシカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキルオキシ、 $C_1 - 1_0$ アルキルチオ、 $C_1 - 1_0$ アルキルスルフィニル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルスルフィニル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルスルフィニル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル、 $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、アリーール $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、シアノ、ニトロ、パーフルオロ $C_1 - 6$ アルキルおよびパーフルオロ $C_1 - 6$ アルコキシから選択され；

R^5 は、少なくとも 1 個の置換基 R^6 で置換されていても良く；

R^6 は、ハロゲン、(カルボニル) $_0 - 1_0$ $C_1 - 1_0$ アルキル、(カルボニル) $_0 - 1_0$ $C_2 - 1_0$ アルケニル、(カルボニル) $_0 - 1_0$ $C_2 - 1_0$ アルキニル、(カルボニル) $_0 - 1_0$ アリーール $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 8$) 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 8$) ヘテロシクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 4$ アシルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、ジ - ($C_1 - 1_0$ アルキル) アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、(アリーール $C_0 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ ヘテロシクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_0 - 1_0$ アルキルカルビミドイル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ アミノカルボニル、 $C_1 - 1_0$ アルコキシ(カルボニル) $_0 - 1_0$ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ アルキルオキシ $C_0 - 1_0$ アルキ

ル、 $(C_{1-10} \text{ アルキル})_2$ アミノカルボニルオキシ、ヒドロキシカルボニル C_{0-10} アルコキシ、 $(C_{1-10} \text{ アルキル})_2$ アミノカルボニルオキシ、(アリーール C_{0-10} アルキル) $_{1-2}$ アミノカルボニルオキシ、ヒドロキシ C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルスルホニル、 C_{1-10} アルキルスルホニルアミノ、アリーール C_{1-10} アルキルスルホニルアミノ、 C_{3-8} 複素環 C_{1-10} アルキルスルホニルアミノ、 C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{1-10} アルキルスルホニルアミノ、パーフルオロ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-10} アルキルスルホニルアミノ、シアノ、ニトロおよびパーフルオロ C_{1-6} アルキルから選択され；

R^6 は、OH、 NO_2 、 (C_{1-6}) アルコキシ、ハロゲン、 CO_2H 、CN、 $O(C=O)C_1 \sim C_6$ アルキル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシおよび $-O(C_{0-1})(C_{1-10})$ パーフルオロアルキルから選択される 1 個以上の基で置換されていても良い。]

【請求項 2】

X がフッ素である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が水素である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、水素、 CF_3 、ヒドロキシルおよび 1 ~ 7 個のフッ素原子で置換されていても良い C_{1-3} アルキルから選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が、水素および C_{1-3} アルキルから選択される請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 がメチルである請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

U、V、W および D がそれぞれ独立に CH および N から選択され；ただし、U、V、W および D のうちの少なくとも 2 つがそれぞれ CH である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^5 が、ハロゲン、(カルボニル) $_{0-1}$ C_{1-10} アルキル、(カルボニル) $_{0-1}$ C_{2-10} アルケニル、(カルボニル) $_{0-1}$ C_{2-10} アルキニル、 C_{1-10} アルケニルアミノ、(カルボニル) $_{0-1}$ アリーール C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10} アルキル、(C_{3-8}) 複素環 C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキル、 C_{1-4} アシルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、ジ- $(C_{1-10}$ アルキル) アミノ C_{0-10} アルキル、アリーール C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、(アリーール C_{0-10} アルキル) $_2$ アミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} 複素環 C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、(C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10} アルキル) $_2$ アミノ C_{0-10} アルキル、(C_{3-8} 複素環 C_{0-10} アルキル) $_2$ アミノ C_{0-10} アルキル、(C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキル) $_2$ アミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノカルボニルアミノ、(C_{1-10} アルキル) $_2$ アミノカルボニルアミノ、(アリーール C_{1-10} アルキル) $_{1-2}$ アミノカルボニルアミノ、 C_{0-10} アルキルアミノカルボニルアミノ、 C_{3-8} 複素環 C_{0-10} アルキルアミノカルボニルアミノ、 C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノカルボニルアミノ、 C_{0-10} アルキルカルボニルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10} アルキルカルボニルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} 複素環 C_{0-10} アルキルカルボニルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキルカルボニルアミノ C_{0-10} アルキル、(C_{1-10} アルキル) $_2$ アミノカルボニル C_{0-10} アルキル、(アリーール C_{1-10} アルキル) $_{1-2}$ アミノカルボニル C_{0-10} アルキル、 C_{0-10} アルキルアミノカルボニル C_{0-10} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{0-10}

$C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、アリアル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノカルボニル $C_0 - 1_0$ アルキル、カルボキシ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ アルコキシ (カルボニル) $C_0 - 1_0$ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、アリアル $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルオキシ、アリアル $C_0 - 1_0$ アルキルカルボニルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、アミノ $C_0 - 1_0$ アルキルカルビミドイル $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_0 - 1_0$ アルキルカルボキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_1 - 1_0$ アルキル (カルボニル) $C_0 - 1_0$ オキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_0 - 1_0$ アルキル (カルボニル) $C_0 - 1_0$ オキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_3 - 8$ ヘテロシクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル (カルボニル) $C_0 - 1_0$ オキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキル (カルボニル) $C_0 - 1_0$ オキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、アリアル $C_0 - 1_0$ アルキル (カルボニル) $C_0 - 1_0$ オキシ $C_0 - 1_0$ アルキルアミノ、 $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、アリアル $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_3 - 8$ 複素環 $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_3 - 8$ ヘテロシクロアルキル $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_3 - 8$ シクロアルキル $C_1 - 1_0$ アルキルスルホニルアミノ、シアノ、ニトロ、パーフルオロ $C_1 - 6$ アルキルおよびパーフルオロ $C_1 - 6$ アルコキシから選択され；

R^5 が、少なくとも 1 個の置換基 R^6 で置換されていても良い請求項 7 に記載の化合物

【請求項 9】

R^2 および R^3 がそれぞれ独立に、水素、ハロゲン、 $C_1 - 8$ アルキル、アミノ $C_0 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ アルキルアミノ $C_0 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ アルコキシ $C_0 - 6$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_0 - 6$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_1 - 6$ アルキルオキシ、ヒドロキシ $C_0 - 6$ アルキル、 $C_0 - 6$ アルキルカルボニル、 $C_1 - 6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - 6$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - 6$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1 - 6$ アルキルアミノカルボニルアミノから選択され；

R^2 および R^3 がそれらが結合している炭素原子と一体となって、 $C_3 - 6$ シクロアルキル基またはオキソ基を形成していても良く；

R^2 および R^3 がそれぞれ独立に、1 個以上の R^6 で置換されていても良い請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

X が水素である請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

X がフッ素である請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 12】

U、V、W および D のうちの少なくとも 2 個がそれぞれ CH である請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

U、V、W および D がそれぞれ CH である請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 14】

a が二重結合である請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 15】

以下から選択される請求項 1 に記載の化合物：

17 - (1H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イルメチル) - 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン；

17 - (7H - プリン - 8 - イルメチル) 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン；

17 - (1H - ベンズイミダゾール - 2 - イルメチル) - 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン；

[illegible]

)] 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(1 - エチル - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) メチル
)] - 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(3 - トリフルオロエチル - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 -
 イル) メチル)] - 4 - メチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(5 - メチルカルボキシリル - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチ
 ル] - 4 - エチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(5 - カルボキシリル - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチル] -
 4 - エチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(5 - カルボキサミド - 1 - ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチル] - 4
 - エチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 17 - [(5 - N , N - ジメチルカルボキサミド - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 -
 イル) メチル] - 4 - エチル - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ;
 20 - フルオロ - 20 - (1 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 3 - イル) - 4 -
 メチル) - 4 - アザ - 5 - アンドロスト - 1 - エン - 3 - オン ; および
 17 - [(5 - フルオロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチル] - 4 - メ
 チル - 4 - アザ - 5 - アンドロスタン - 3 - オン ;

ならびに該化合物の製薬上許容される塩および立体異性体。

【請求項 16】

アンドロゲン受容体が介在する機能の調節を必要とする哺乳動物でのアンドロゲン受容体が介在する機能を調節するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 17】

アンドロゲン受容体の機能の活性化を必要とする哺乳動物でのアンドロゲン受容体の機能を活性化するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 18】

アンドロゲン受容体が介在する前記機能が、骨または筋肉組織で活性化し、前立腺または子宮では遮断される、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

低筋緊張、骨粗鬆症、骨減少症、糖質コルチコイド誘発骨粗鬆症、歯周病、骨折、骨再建術後の骨損傷、サルコペニア、虚弱、皮膚老化、男性性腺機能低下症、女性における閉経後症状、アテローム性動脈硬化、高コレステロール血症、高脂血症、肥満、再生不良性貧血、造血障害、関節炎状態および関節修復、HIV 性の消耗、前立腺癌、癌悪液質、筋ジストロフィー、アルツハイマー病、認識衰退、性機能不全、睡眠時無呼吸、良性前立腺肥大、腹部脂肪蓄積、メタボリック症候群、II 型糖尿病、抑鬱、早発閉経および自己免疫疾患から選択されるアンドロゲン欠乏が原因であり、アンドロゲン置換によって改善することができるか、アンドロゲン置換によって向上させることができる哺乳動物での状態を治療するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 20】

前記状態が骨粗鬆症である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

骨粗鬆症の治療を必要とする哺乳動物での骨粗鬆症を治療するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 22】

(1) 単独またはプロゲスチンもしくはプロゲスチン誘導体との併用でのエストロゲンまたはエストロゲン誘導体 ;

- (2) ビスホスホン酸化合物；
- (3) 抗エストロゲンもしくは選択的エストロゲン受容体調節剤；
- (4) ν 3 インテグリン受容体拮抗薬；
- (5) カテプシン K 阻害薬；
- (6) H M G - C o A レダクターゼ阻害薬；
- (7) 破骨細胞空胞 A T P a s e 阻害剤；
- (8) 破骨細胞受容体への V E G F 結合の拮抗薬；
- (9) ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 の活性化剤；
- (10) カルシトニン；
- (11) カルシウム受容体拮抗薬；
- (12) 副甲状腺ホルモンまたはその類縁体；
- (13) 成長ホルモン分泌促進剤；
- (14) ヒト成長ホルモン；
- (15) インシュリン様成長因子；
- (16) p 3 8 タンパク質キナーゼ阻害薬；
- (17) 骨形態発生タンパク質；
- (18) B M P 拮抗作用の阻害薬；
- (19) プロスタグランジン誘導体；
- (20) ビタミン D またはビタミン D 誘導体；
- (21) ビタミン K またはビタミン K 誘導体；
- (22) イブリフラボン；
- (23) フッ化物塩；
- (24) カルシウム補給補助食品；および
- (25) オステオプロテゲリン

から選択される薬剤をさらに含む、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

1) 単独またはプロゲスチンもしくはプロゲスチン誘導体との併用での前記エストロゲンまたはエストロゲン誘導体が、ノルエチンドロンおよびメドロキシプロゲステロン酢酸から選択される少なくとも 1 個の薬剤との併用での接合エストロゲン、ウマエストロゲン、1 7 - エストラジオール、エストロン、1 7 - エチニルエストラジオールから選択され；

2) 前記ビスホスホン酸化合物が、アレンドロン酸塩、クロドロロン酸塩、エチドロロン酸塩、イバンドロン酸塩、インカドロロン酸塩、ミノドロロン酸塩、ネリドロロン酸塩、オルパドロロン酸塩、パミドロロン酸塩、ピリドロロン酸塩、リセドロロン酸塩、チルドロン酸塩およびゾレドロロン酸塩から選択され；

3) 前記抗エストロゲンまたは選択的エストロゲン受容体調節剤が、ラロキシフェン、クロミフェン、ズクロミフェン、エンクロミフェン、ナフォキシデン、C I - 6 8 0、C I - 6 2 8、C N - 5 5 9 4 5 - 2 7、M e r - 2 5、U - 1 1 5 5 5 A、U - 1 0 0 A、タモキシフェン、ラソフォキシフェン、トレミフェン、アゾルキシフェン、E M - 8 0 0、E M - 6 5 2、T S E 4 2 4、ドロロキシフェン、イドキシフェンおよびレボルメロキシフェンからなる群から選択され；

4) 前記 H M G - C o A レダクターゼ阻害薬が、ロバスタチン、シンバスタチン、ジヒドロキシ開環酸シンバスタチン、プラバスタチン、フルバスタチン、アトルバスタチン、セリバスタチン、ロスバスタチン、ピタバスタチンおよびニスバスタチンから選択され；

5) カルシトニンが、鼻噴霧剤としてのサケカルシトニンであり；

6) 骨形態発生タンパク質が、B M P 2、B M P 3、B M P 5、B M P 6、B M P 7、T G F - および G D F 5 から選択され；

7) インシュリン様成長因子が、単独または I G F 結合タンパク質 3 との併用での I G F I および I G F I I から選択され；

8) 前記プロスタグランジン誘導体が、プロスタグランジン受容体 E P 1、E P 2、E

P 4、F PおよびI Pの作働薬から選択され；

9) 前記線維芽細胞成長因子が、a F G Fおよびb F G Fから選択され；

10) 副甲状腺ホルモン(P T H)またはP T H類縁体が、P T H皮下注射、ヒトP T H(1 - 84)、ヒトP T H(1 - 34)および自然もしくは置換のある他の部分配列から選択され；

11) ビタミンDまたはビタミンD誘導体が、天然ビタミンD、25 - O H - ビタミンD₃、1, 25(OH)₂ ビタミンD₃、1 - O H - ビタミンD₃、1 - O H - ビタミンD₂、ジヒドロタキステロール、26, 27 - F 6 - 1, 25(OH)₂ ビタミンD₃、19 - ノル - 1, 25(OH)₂ ビタミンD₃、22 - オキサカルシトリオール、カルシボトリオール、1, 25(OH)₂ - 16 - エン - 23 - イン - ビタミンD₃(R o 23 - 7553)、E B 1089, 20 - エピ - 1, 25(OH)₂ ビタミンD₃、K H 1060、E D 71、1, 24(S) - (OH)₂ ビタミンD₃および1, 24(R) - (OH)₂ ビタミンD₃から選択され；

12) 前記カルシウム補給補助食品が、炭酸カルシウム、クエン酸カルシウムおよび天然カルシウムから選択され；

13) 前記フッ化物塩が、フッ化ナトリウムおよびフルオロリン酸モノナトリウム(M F F P)およびそれらの製薬上許容される塩から選択される、請求項22に記載の医薬組成物。

【請求項24】

前記ビスホスホン酸化合物が、アレンドロン酸モノナトリウム・3水和物またはアレンドロン酸モノナトリウム・1水和物である請求項23に記載の医薬組成物。

【請求項25】

前記薬剤が、単独またはプロゲスチンもしくはプロゲスチン誘導体との併用でのエストロゲンまたはエストロゲン誘導体；ビスホスホン酸化合物；抗エストロゲンもしくは選択的エストロゲン受容体調節剤；v 3インテグリン受容体拮抗薬；カテプシンK阻害薬；破骨細胞空胞A T P a s e阻害剤；カルシトニン；オステオプロテグリン；および副甲状腺ホルモンまたはその類縁体から選択される、請求項22に記載の医薬組成物。

【請求項26】

治療上有効量の請求項1に記載の化合物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項27】

単独またはプロゲスチンもしくはプロゲスチン誘導体との併用でのエストロゲンまたはエストロゲン誘導体；ビスホスホン酸化合物；抗エストロゲンもしくは選択的エストロゲン受容体調節剤；v 3インテグリン受容体拮抗薬；カテプシンK阻害薬；H M G - C o Aレダクターゼ阻害薬；破骨細胞空胞A T P a s e阻害剤；破骨細胞受容体へのV E G F結合の拮抗薬；ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体の活性化剤；カルシトニン；カルシウム受容体拮抗薬；副甲状腺ホルモンまたはその類縁体；成長ホルモン分泌促進剤；ヒト成長ホルモン；インシュリン様成長因子；p 38タンパク質キナーゼ阻害薬；骨形態発生タンパク質；B M P拮抗作用の阻害薬；プロスタグランジン誘導体；ビタミンDまたはビタミンD誘導体；ビタミンKまたはビタミンK誘導体；イプリフラボン；フッ化物塩；カルシウム補給補助食品；およびオステオプロテグリンから選択される有効成分をさらに含む請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項28】

前記ビスホスホン酸化合物がアレンドロン酸塩である請求項27に記載の医薬組成物。

【請求項29】

骨吸収の阻害を必要とする哺乳動物での骨吸収を阻害するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項1に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項30】

骨ミネラル濃度の増加を必要とする哺乳動物での骨ミネラル濃度を増加するための医薬

組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 3 1】

脊椎性または非脊椎性骨折のリスク低減を必要とする哺乳動物での脊椎性または非脊椎性骨折のリスクを低減するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 3 2】

骨代謝マーカーを有効にする必要がある哺乳動物での骨代謝マーカーを有効にする医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含み、ここで前記骨代謝マーカーが、I 型コラーゲンの尿 C - テロペプチド分解産物 (CTX)、I 型コラーゲンの尿 N - テロペプチド架橋 (NTX)、DXA および DPD から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 3 3】

請求項 1 に記載の化合物と製薬上許容される担体を組み合わせることで製造される医薬組成物。

【請求項 3 4】

請求項 1 に記載の化合物と製薬上許容される担体とを組み合わせる段階を有する医薬組成物の製造方法。

【請求項 3 5】

関節炎状態の治療または予防を必要とする哺乳動物での関節炎状態を治療または予防するための医薬組成物であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体を含む、前記医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記関節炎状態が、関節リウマチおよび骨関節炎から選択される請求項 3 5 に記載の医薬組成物。