

【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 7 月 26 日 (2007.7.26)

【公表番号】特表 2007-501287 (P2007-501287A)

【公表日】平成 19 年 1 月 25 日 (2007.1.25)

【年通号数】公開・登録公報 2007-003

【出願番号】特願 2006-533745 (P2006-533745)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/12 C S P

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 31/18

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 6 月 7 日 (2007.6.7)

【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

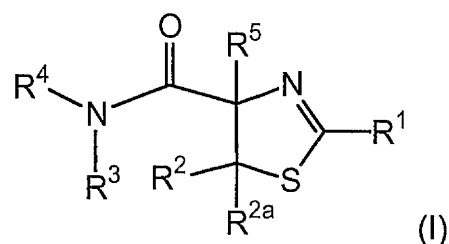
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



式中、

R^1 はアリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され；

ここでヘテロアリール基は炭素原子を介して結合し；

ここでアリールまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、アルキル、ハロゲンで置換されたアルキル、低級アルキルエステル、シアノ、 $N(R^A)_2C(O)-$ 、低級アルキル- $C(O)-NR^A-$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ およびトリフルオロメチルスルホニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されてもよく；

ここでフェニルは場合によりハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノまたはジ(低級アルキル)アミノから独立して選択される 1 もしくは複数の置換基で置換されてもよく、

R^A は水素または低級アルキルから独立して選択され、

R^2 および R^{2a} は各々独立して、水素、低級アルキルおよびハロゲンで置換された低級アルキルからなる群から選択され、

R^3 は水素および低級アルキルからなる群から選択され、

R^4 はアリールおよびヘテロアリールからなる群から選択され；

ここでヘテロアリール基は炭素原子を介して結合し；

ここでアリールまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、アルキル、ハロゲンで置換されたアルキル、低級アルキルエステル、シアノ、 $N(R^A)_2C(O)-$ 、低級アルキル- $C(O)-NR^A-$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ およびトリフルオロメチルスルホニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されてもよく；

ここでフェニルは場合によりハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノまたはジ(低級アルキル)アミノから独立して選択される 1 もしくは複数の置換基で置換されてもよく、

R^5 は水素、低級アルキルおよびハロゲンで置換された低級アルキルからなる群から選択される、

の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 2】

R^1 がアリールからなる群から選択され；ここでアリール基は場合によりハロゲン、アルキル、ハロゲンで置換されたアルキル、低級アルキルエステル、シアノ、 $N(R^A)_2C(O)-$ 、低級アルキル- $C(O)-NR^A-$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ およびトリフルオロメチルスルホニルから独立して選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されてもよく；ここでフェニルは場合によりハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノまたはジ(低級アルキル)アミノから独立して選択される 1 もしくは複数の置換基で置換されてもよく、

R^2 が水素、低級アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^{2a} が水素、低級アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^3 が水素および低級アルキルからなる群から選択され、

R^4 がアリールからなる群から選択され；ここでアリール基は場合によりハロゲン、アルキル、ハロゲンで置換されたアルキル、低級アルキルエステル、シアノ、 $N(R^A)_2C(O)-$ 、低級アルキル- $C(O)-NR^A-$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}$ 、低級アルキル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ 、フェニル- $S(O)_{0.2}-NR^A-$ およびトリフルオロメチルスルホニルから独立して選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されてもよく；ここでフェニルは場合によりハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノまたはジ(低級アルキル)アミノから独立して選択される 1 もしくは複数の置換基で置換されてもよく、

R^5 が水素、低級アルキルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択される、
請求項 1 に記載の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 3】

R^1 がアリールからなる群から選択され、ここでアリール基は場合によりハロゲンで置換されてもよく、

R^2 が水素および低級アルキルからなる群から選択され、

R^{2a} が水素および低級アルキルからなる群から選択され、

R^3 が水素であり、

R^4 がアリールからなる群から選択され；ここでアリール基はハロゲン、シアノ、ニトロ、低級アルキル - 、ハロゲンで置換された低級アルキルおよびトリフルオロメチルスルホニルから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され、

R^5 が水素および低級アルキルからなる群から選択される、

請求項 2 に記載の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 4】

R^1 が 3 - フルオロフェニル、4 - フルオロフェニル、3 - クロロフェニルおよび 4 - クロロフェニルからなる群から選択され、

R^2 が水素およびメチルからなる群から選択され、

R^{2a} が水素およびメチルからなる群から選択され、

R^3 が水素であり、

R^4 が 4 - クロロフェニル、4 - シアノフェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - シアノ - フェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - ニトロ - フェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - クロロ - フェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル、2 , 5 - ジフルオロ - 4 - シアノ - フェニル、2 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニルおよび 4 - トリフルオロメチルスルホニル - フェニルからなる群から選択され、

R^5 が水素およびメチルからなる群から選択される、

請求項 3 に記載の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 5】

R^1 が 4 - フルオロフェニル、3 - クロロフェニルおよび 4 - クロロフェニルからなる群から選択され、

R^2 が水素およびメチルからなる群から選択され、

R^{2a} が水素およびメチルからなる群から選択され、

R^3 が水素であり、

R^4 が 3 - トリフルオロメチル - 4 - シアノ - フェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - ニトロ - フェニル、3 - トリフルオロメチル - 4 - クロロ - フェニルおよび 4 - トリフルオロメチルスルホニル - フェニルからなる群から選択され、

R^5 が水素およびメチルからなる群から選択される、

請求項 4 に記載の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 6】

R^1 が 4 - フルオロフェニルおよび 4 - クロロフェニルからなる群から選択され、

R^2 が水素であり、

R^{2a} が水素であり、

R^3 が水素であり、

R^4 が 3 - トリフルオロメチル - 4 - ニトロ - フェニルおよび 3 - トリフルオロメチル - 4 - クロロ - フェニルからなる群から選択され、

R^5 が水素およびメチルからなる群から選択される、

請求項 5 に記載の化合物、またはその製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 7】

製薬学的に許容され得る担体および請求項 1 に記載の化合物を含んでなる製薬学的組成物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物および製薬学的に許容され得る担体を混合することにより作成される製薬学的組成物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物および製薬学的に許容され得る担体を混合することを含んでなる製薬学的組成物の作成法。

【請求項 1 0】

請求項 1 に記載の化合物を有効成分として含んでなる個体におけるアンドロゲン受容体により媒介される障害を処置するための製薬学的製剤。

【請求項 1 1】

請求項 1 に記載の化合物を有効成分として含んでなる前立腺ガン、良性の前立腺肥大（B P H）、多毛症、脱毛症、神経性食欲不振、乳ガン、ざ瘡、A I D S、悪液質、男性避妊および男性機能からなる群から選択される状態の処置用の製薬学的製剤。

【請求項 1 2】

処置が必要な個体における（a）前立腺ガン、（b）良性の前立腺肥大、（c）多毛症、（d）脱毛症、（e）神経性食欲不振、（f）乳ガン、（g）ざ瘡、（h）A I D S、（i）悪液質を処置するための、（j）男性避妊のための、または（k）男性機能を強化するための薬剤の調製のための請求項 1 に記載の化合物の使用。