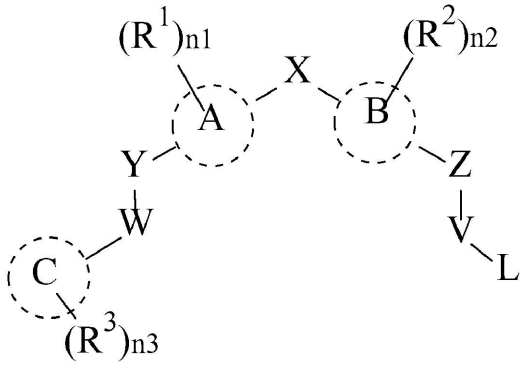
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和5年4月4日(2023.4.4)

【国際公開番号】WO2020/198710
【公表番号】特表2022-521824(P2022-521824A)
【公表日】令和4年4月12日(2022.4.12)
【年通号数】公開公報(特許)2022-065
【出願番号】特願2021-557651(P2021-557651)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ 45/06(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/421(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4164(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4245(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/42(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/415(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/505(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4166(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/08(2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/10(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/18(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16(2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/14(2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/10(2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/04(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/426(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/44(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4965(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/341(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4155(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/277(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/167(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ 45/06
Ａ６１Ｋ 31/421
Ａ６１Ｋ 31/4164
Ａ６１Ｋ 31/4245
Ａ６１Ｋ 31/42
Ａ６１Ｋ 31/415
Ａ６１Ｋ 31/505
Ａ６１Ｋ 31/4166
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 43/00 １２１

Ａ６１Ｐ　３５/００
Ａ６１Ｐ　１３/０８
Ａ６１Ｐ　１５/００
Ａ６１Ｐ　１３/１０
Ａ６１Ｐ　　１/１８
Ａ６１Ｐ　　１/１６
Ａ６１Ｐ　１７/１４
Ａ６１Ｐ　１７/１０
Ａ６１Ｐ　２１/００
Ａ６１Ｐ　２７/０２
Ａ６１Ｐ　３５/０４
Ａ６１Ｋ　３１/４２６
Ａ６１Ｋ　３１/４４
Ａ６１Ｋ　３１/４９６５
Ａ６１Ｋ　３１/３４１
Ａ６１Ｋ　３１/４４３９
Ａ６１Ｋ　３１/４１５５
Ａ６１Ｋ　３１/２７７
Ａ６１Ｋ　３１/１６７
Ａ６１Ｋ　３１/４９６
Ａ６１Ｐ　４３/００　１２３

【手続補正書】
【提出日】令和５年３月２７日(２０２３.３.２７)
【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（ＩＩＩＡ）の化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体、もしくはプロドラッグであるアンドロゲン受容体モジュレーターと、第２の治療活性剤と、を含む、薬学的組成物または組み合わせであって、
【化１】

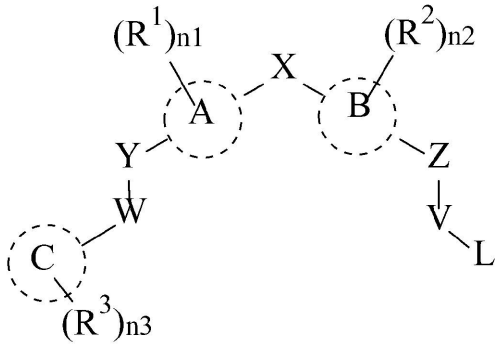


（ＩＩＩＡ）

式中、
Ａ及びＢが、各々独立して、フェニル、ピリジル、ピリミジル、またはチオフェンから選択され、

Ｃが、３～１０員環であり、
Ｘが、結合、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{6}）$_{t}$－、または－ＮＲ^{7}であり、
Ｙが、結合、－（ＣＲ^{8}Ｒ^{9}）$_{m}$－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（＝Ｏ）－、－ＳＯ$_{2}$－、－ＮＲ^{7}－、または－Ｎ（ＣＯＣＨ$_{3}$）－であり、
Ｗが、結合、－（ＣＲ^{8a}Ｒ^{9a}）$_{m}$－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｎ（Ｒ^{7}）ＣＯ－、－ＣＯＮＲ^{7}－、または－ＮＳＯ$_{2}$Ｒ^{7}－であり、
Ｚが、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－ＮＣＨ$_{3}$－、または－Ｎ（ＣＯＣＨ$_{3}$）－であり、
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲン、－ＮＨ$_{2}$、－ＣＨＣｌ$_{2}$、－ＣＣｌ$_{3}$、もしくは－ＣＦ$_{3}$であるか、または
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲンもしくは－ＮＨ$_{2}$であり、
Ｒ^{1}及びＲ^{2}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルコキシ、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルコキシ）、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＯＨ、－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－ＣＯＮＲ^{13}Ｒ^{14}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、任意に置換された－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、または任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}であり、
Ｒ^{3}が、ハロゲン、オキソ、＝Ｓ、＝ＮＲ^{16}、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、－Ｓ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、または－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）から選択され、
Ｒ^{5}及びＲ^{6}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＯＨ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、もしくはＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシであるか、またはＲ^{5}及びＲ^{6}が、一緒になって、任意に置換された３～６員カルボシクリルもしくはヘテロシクリルを形成し、
Ｒ^{7}が、水素、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$アルケニル、またはＣ$_{2}$－Ｃ$_{6}$アルキニルであり、
Ｒ^{8}及びＲ^{9}が、各々独立して、水素、ハロゲン、またはＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキルであり、
Ｒ^{8a}及びＲ^{9a}が、各々独立して、水素、－ＯＨ、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、もしくは－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}であるか、またはＲ^{8a}及びＲ^{8b}が、一緒になって、任意に置換された３～６員カルボシクリルもしくはヘテロシクリルを形成し、
Ｒ^{13}、Ｒ^{14}、及びＲ^{15}が、各々独立して、水素、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、もしくはＣ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニルであるか、またはＲ^{14}及びＲ^{15}が、一緒になって、３～６員ヘテロシクリルを形成し、
Ｒ^{16}が、水素、任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、任意に置換されたＣ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、任意に置換されたＣ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$シクロアルキル、またはフェニルであり、
各ｍが、独立して、０、１、または２であり、
ｎ１及びｎ２が、各々独立して、０、１、または２であり、

ｎ３が、１、２、３、４、または５であり、
ｔが、０、１、または２である、薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項２】
前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、式（ＩＶＡ）の化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体、もしくはプロドラッグであって、
【化２】

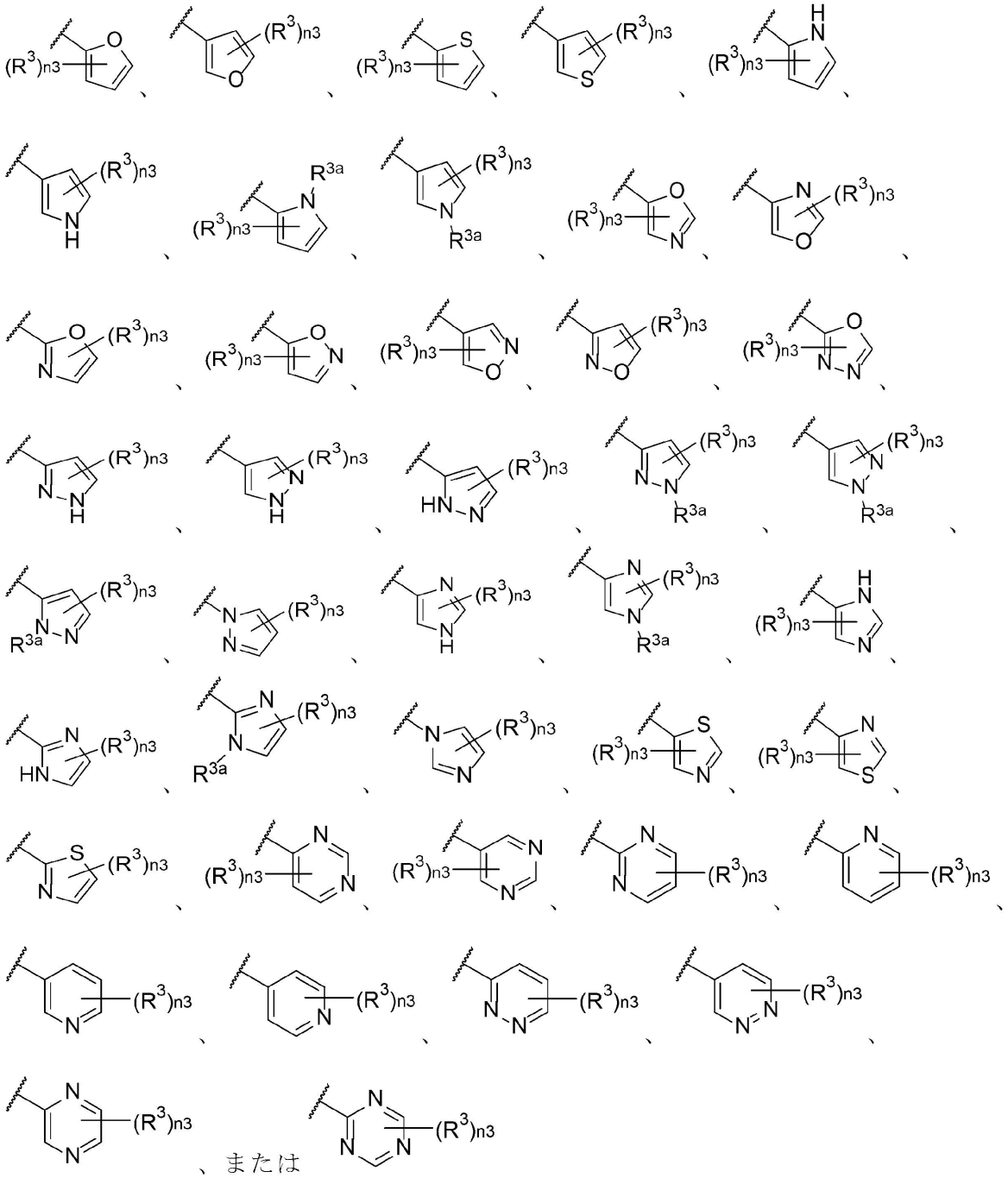


（ＩＶＡ）

式中、
Ａ及びＢが、各々独立して、フェニル、ピリジル、ピリミジル、またはチオフェンから選択され、
Ｃが、３～１０員環であり、
Ｘが、結合、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{6}）$_{t}$－、または－ＮＲ^{7}であり、
Ｙ及びＺが、各々独立して、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－ＮＣＨ$_{3}$－、または－Ｎ（ＣＯＣＨ$_{3}$）－であり、
Ｗが、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｎ（Ｒ^{7}）ＣＯ－、または－ＣＯＮＲ^{7}－であり、
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲン、－ＮＨ$_{2}$、もしくは－ＣＦ$_{3}$であるか、または
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲンもしくは－ＮＨ$_{2}$であり、
Ｒ^{1}及びＲ^{2}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルコキシ、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルコキシ）、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＯＨ、－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－ＣＯＮＲ^{13}Ｒ^{14}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、任意に置換された－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、任意に置換された－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}であり、
Ｒ^{3}が、ハロゲン、オキソ、＝Ｓ、＝ＮＲ^{16}、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、－Ｓ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＮＲ^{13}Ｒ^{14}、－ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）ＮＲ^{14}ＳＯ$_{2}$Ｒ^{16}、－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＮＲ^{14}ＣＯＲ^{16}、－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＣＯＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{14}Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、または－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル）－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）から選択され、
Ｒ^{5}及びＲ^{6}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＯＨ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、もしくはＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシであるか、ま

たはR^5及びR^6が、一緒になって、任意に置換された３～６員カルボシクリルもしくはヘテロシクリルを形成し、
　R^7が、ＨまたはC_1－C_6アルキルであり、
　R^{13}、R^{14}、及びR^{15}が、各々独立して、水素、C_1－C_3アルキル、C_2－C_3アルケニル、もしくはC_2－C_3アルキニルであるか、またはR^{14}及びR^{15}が、一緒になって、３～６員ヘテロシクリルを形成し、
　R^{16}が、水素、C_1－C_3アルキル、C_2－C_3アルケニル、またはC_2－C_3アルキニルであり、
　ｎ１及びｎ２が、各々独立して、０、１、または２であり、
　ｎ３が、１、２、３、４、または５であり、
　ｔが、０、１、または２である、請求項１に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項３】
　Ｃが、５～１０員ヘテロアリールまたはアリールである、請求項２に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項４】
　Ｃが、環員としてＯ、Ｓ、またはＮから選択される１、２、または３個のヘテロ原子を含む５～７員ヘテロアリールである、請求項３に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項５】
（R^3）ｎ３で置換されているＣが、ピラゾール、イミダゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、オキサゾロン、イソオキサゾール、チアゾール、ピリジル、ピラジン、フラン、またはピリミジルである、請求項４に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項６】
（R^3）ｎ３で置換されているＣが、

【化３】

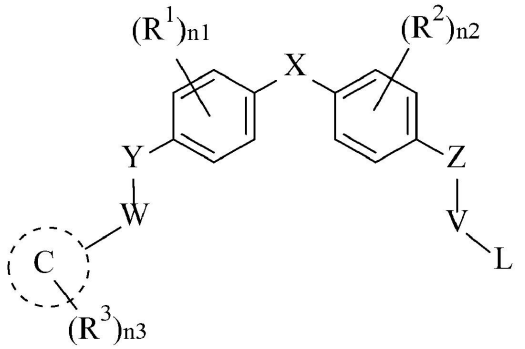


から選択され、式中、Ｒ３ａが、Ｃ１－Ｃ３アルキルである、請求項５に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項７】

前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、式（Ａ－Ｉ）の化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体、もしくはプロドラッグであって、

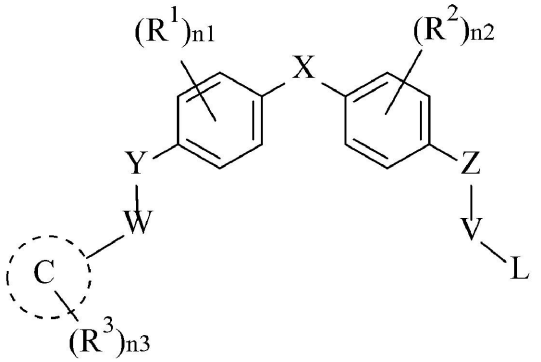
【化４】



（Ａ－Ｉ）

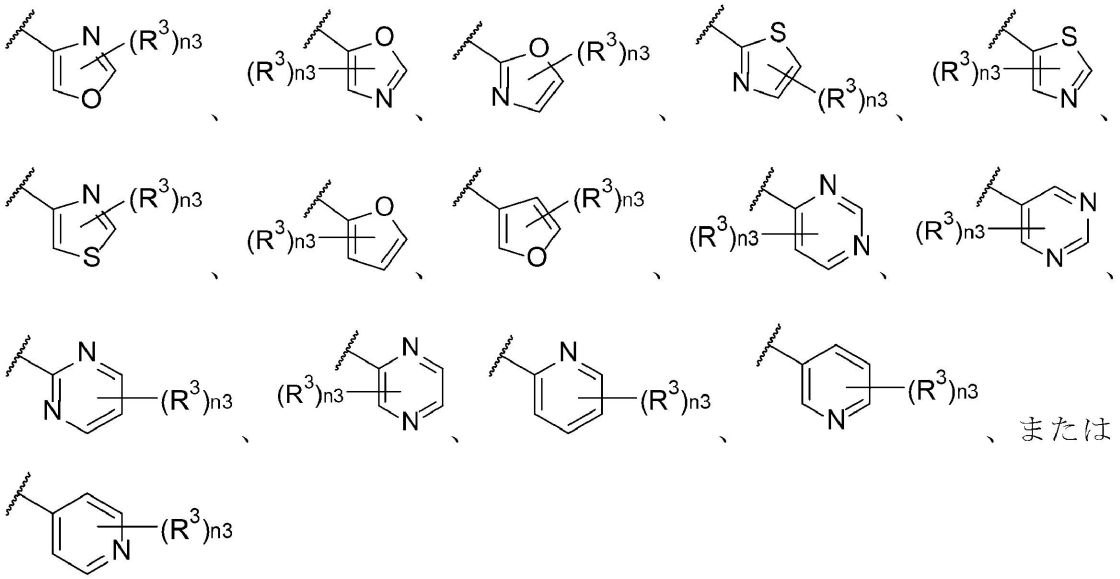
式中、
Ｃが、環員としてＯ、Ｓ、またはＮから選択される１、２、または３個のヘテロ原子を含む５～７員単環式ヘテロアリールであり、
Ｘが、結合、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{6}）$_{t}$－、または－ＮＲ^{7}であり、
Ｙが、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＨ－、－ＮＣＨ$_{3}$－、または－Ｎ（ＣＯＣＨ$_{3}$）－であり、
Ｚが、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、または－ＮＨ－であり、
Ｗが、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｎ（Ｒ^{7}）ＣＯ－、または－ＣＯＮＲ^{7}－であり、
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲン、－ＮＨ$_{2}$、もしくは－ＣＦ$_{3}$であるか、または
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－であり、Ｌが、ハロゲンもしくは－ＮＨ$_{2}$であり、
Ｒ^{1}及びＲ^{2}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、メチル、または－ＣＯＮＨ$_{2}$であり、
Ｒ^{3}が、－ＣＮ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－ＣＦ$_{3}$、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、－Ｓ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＮＨ$_{2}$、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＦ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）$_{2}$、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＣＯＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、または－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＣＯＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）から選択され、
Ｒ^{5}及びＲ^{6}が、各々独立して、水素、ハロゲン、－ＯＨ、またはＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキルであり、
Ｒ^{7}が、ＨまたはＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルであり、
ｎ１及びｎ２が、各々独立して、０、１、または２であり、
ｎ３が、１、２、３、４、または５であり、
ｔが、０、１、または２である、請求項１に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項８】
前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、式（Ｇ－ＩＩ）の化合物またはその薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体、もしくはプロドラッグであって、

【化５】



（Ｇ－ＩＩ）

式中、
Ｃが、
【化６】



であり、
Ｘが、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{6}）$_{t}$－であり、
Ｙが、－Ｏ－であり、
Ｚが、－Ｏ－であり、
Ｗが、－ＣＨ$_{2}$－または－Ｃ（ＣＨ$_{3}$）Ｈ－であり、
Ｖが、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－であり、
Ｌが、ハロゲンであり、
Ｒ^{1}及びＲ^{2}が、各々独立して、Ｃｌまたは－ＣＮであり、
少なくとも一方のＲ^{3}が、－ＣＮ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、または－ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$から選択され、他方のＲ^{3}が、存在する場合、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{3}$アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルコキシ、－Ｓ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）、－ＮＨ$_{2}$、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＦ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$ＮＨＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$Ｎ（ＣＨ$_{3}$）ＳＯ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）$_{2}$、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$アルキル）

、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＣＯＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、または－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＣＯＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）から選択され、

Ｒ^{5}及びＲ^{6}が、各々独立して、水素またはメチルであり、

ｎ１及びｎ２が、各々独立して、０、１、または２であり、

ｎ３が、１または２であり、

ｔが、１である、請求項１に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項９】

少なくとも一方のＲ^{3}が、－ＮＨＳＯ$_2$ＣＨ$_3$、－ＮＨＳＯ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、または－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$から選択され、他方のＲ^{3}が、存在する場合、－ＣＮ、Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルコキシ、－ＳＯ$_2$（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－ＮＨ$_2$、－（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）ＮＨ$_2$、－ＮＨＳＯ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$、－ＮＨＳＯ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＳＯ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－ＳＯ$_2$ＮＨ$_2$、－ＣＯＮＨ$_2$、－ＣＯＮ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）$_2$、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＣＯＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）、または－Ｎ（ＣＨ$_3$）ＣＯＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_3$アルキル）から選択される、請求項８に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

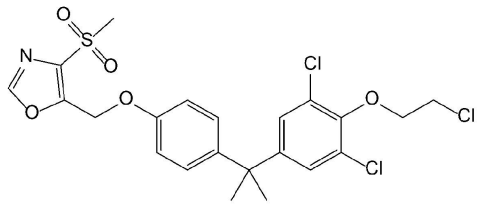
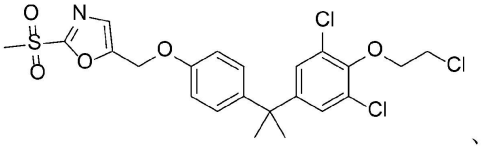
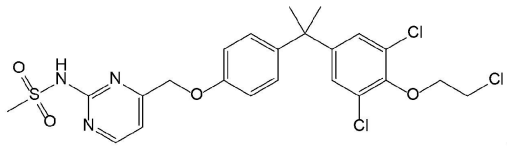
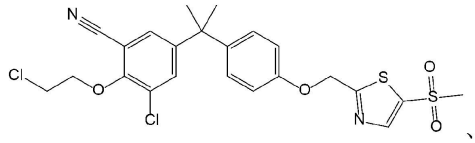
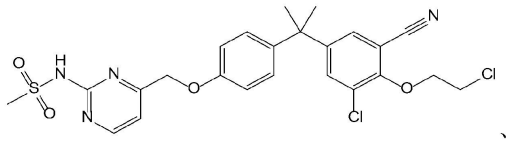
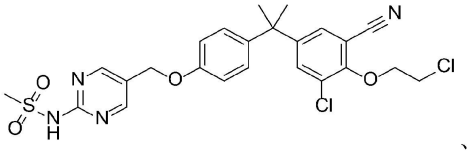
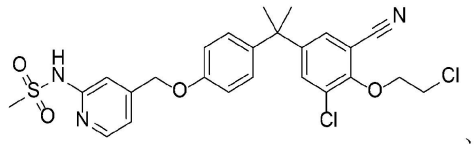
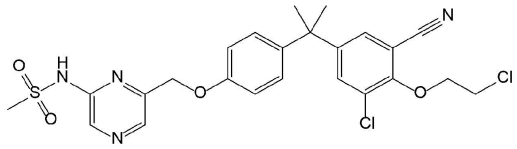
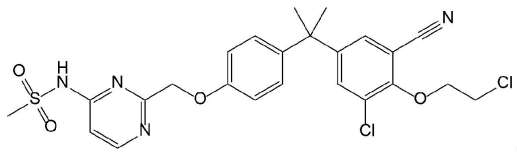
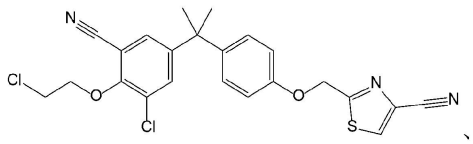
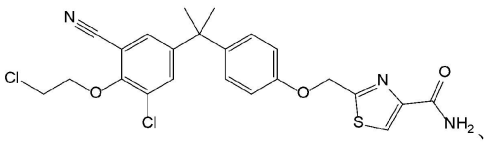
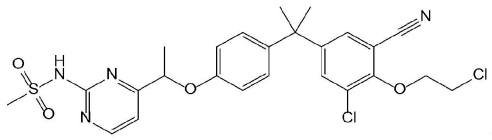
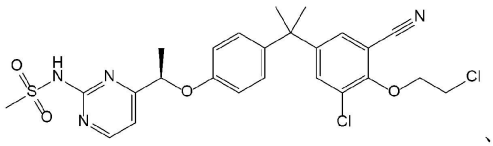
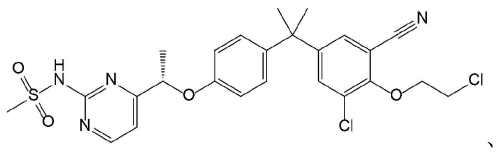
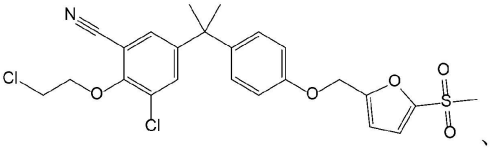
【請求項１０】

表Ａもしくは表Ｂ中の化合物またはそれらの薬学的に許容される塩から選択されるアンドロゲン受容体モジュレーターと、第２の治療活性剤と、を含む、薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１１】

前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、

【化７－１】


、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

、

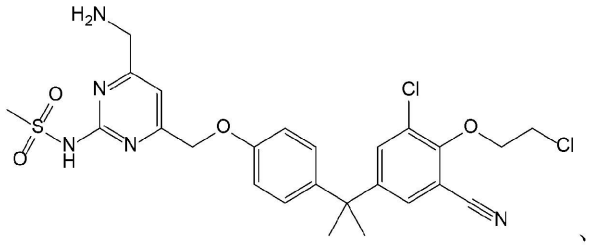
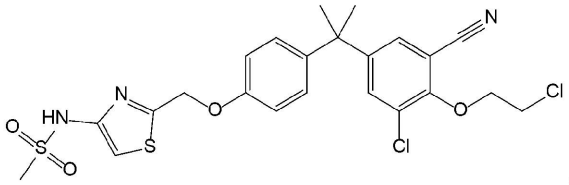
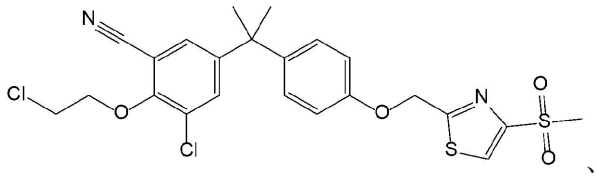
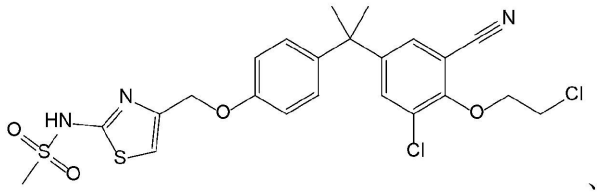
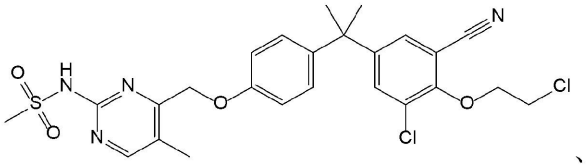
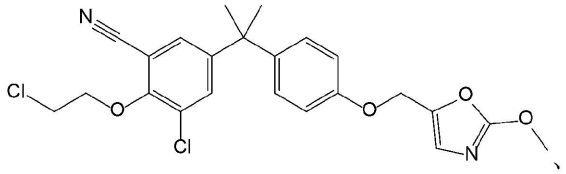
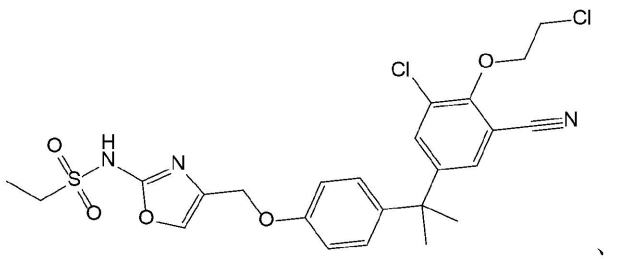
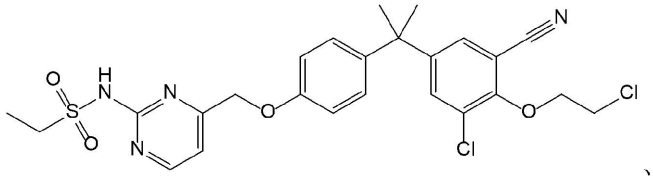
、

、

、

、

【化７－２】

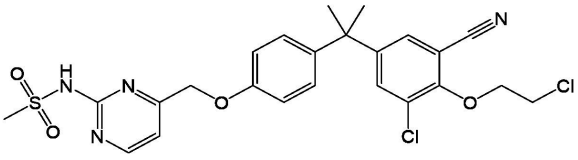

、

、

、

、

、

、

、

、

またはそれらの薬学的に許容される塩、互変異性体、立体異性体、もしくはプロドラッグから選択される、請求項１０に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１２】

前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、

【化８】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項１１に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１３】

前記第２の治療活性剤が、ポリ（ＡＤＰ－リボース）ポリメラーゼ（ＰＡＲＰ）阻害剤、アンドロゲン受容体リガンド結合ドメイン阻害剤、ＣＹＰ１７阻害剤、微小管阻害剤、ＰＤ－１またはＰＤ－Ｌ１のモジュレーター、ゴナドトロピン放出ホルモンアゴニスト、５－アルファ還元酵素阻害剤、血管内皮成長因子阻害剤、ヒストンデアセチラーゼ阻害剤、インテグリンアルファ－ｖ－ベーター－３阻害剤、受容体チロシンキナーゼ、ホスホイノシチド３－キナーゼ阻害剤、未分化リンパ腫キナーゼ（ＡＬＫ）阻害剤、エンドセリン受容体Ａアンタゴニスト、抗ＣＴＬＡ４阻害剤、熱ショックタンパク質２７（ＨＳＰ２７）阻害剤、アンドロゲン受容体分解剤、アンドロゲン受容体ＤＮＡ結合ドメイン阻害剤、ブロモドメイン及びエクストラ末端モチーフ（ＢＥＴ）阻害剤、アンドロゲン受容体Ｎ末端ドメイン阻害剤、アルファ粒子放出放射治療剤、ニクロサミド、選択的エストロゲン受容体モジュレーター（ＳＥＲＭ）、選択的エストロゲン受容体分解剤（ＳＥＲＤ）、アロマターゼ阻害剤、選択的プロゲステロン受容体モジュレーター（ＳＰＲＭ）、グルココルチコイド受容体阻害剤、ＨＥＲ２受容体アンタゴニスト、ラパマイシンの哺乳類標的（ｍＴＯＲ）阻害剤、ＡＫＴ阻害剤、Ｂ細胞リンパ腫－２（Ｂｃｌ－２）阻害剤、オーロラキナーゼ阻害剤、Ｗｎｔ標的アンタゴニスト、ＣＹＰ１１ａ阻害剤、選択的アンドロゲン受容体モジュレーター、またはｚｅｓｔｅホモログ２（ＥＺＨ２）阻害剤のエンハンサーから選択される、請求項１～１２のいずれか一項に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１４】

アンドロゲン受容体リガンド結合ドメイン阻害剤が、エンザルタミド、アパルタミド、ダロルタミド、ビカルタミド、ニルタミド、フルタミド、ＯＤＭ－２０４、またはＴＡＳ３６８１である、請求項１３に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１５】

Ｂｃｌ－２阻害剤が、ベネトクラクスである、請求項１３に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１６】

薬学的に許容される担体をさらに含む、請求項１～１５のいずれか一項に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項１７】

アンドロゲン受容体活性を調節するための方法であって、アンドロゲン受容体活性の調節を必要とする対象に、請求項１～１６のいずれか一項に記載の薬学的組成物を投与することを含む、前記方法。

【請求項１８】

前記アンドロゲン受容体活性を調節することが、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、膀胱癌、膵臓癌、肝細胞癌、子宮内膜癌、唾液腺癌、抜け毛、座瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症、脊椎及び延髄性筋萎縮、または加齢黄斑変性から選択される状態または疾患を治療するためのものである、請求項１７に記載の方法。

【請求項１９】

がん治療用の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項２０】

前記がんが、前立腺癌である、請求項１９に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項２１】

前記前立腺癌が、原発性または限局性前立腺癌、限局性進行性前立腺癌、再発性前立腺癌、進行性前立腺癌、転移性前立腺癌、転移性去勢抵抗性前立腺癌、及びホルモン感受性前立腺癌である、請求項２０に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

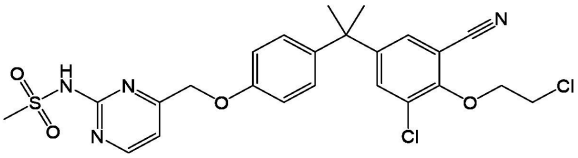
【請求項２２】

前記前立腺癌が、転移性去勢抵抗性前立腺癌である、請求項２１に記載の薬学的組成物または組み合わせ。

【請求項２３】

前記前立腺癌が、全長アンドロゲン受容体または切断型アンドロゲン受容体スプライス

バリアントを発現する、請求項２２に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項２４】
前記前立腺癌が、エンザルタミド単剤療法に耐性がある、請求項２２に記載の薬学的組成物または組み合わせ。
【請求項２５】
前記アンドロゲン受容体モジュレーターが、
【化９】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項１７に記載の方法。
【請求項２６】
前記第２の治療活性剤が、エンザルタミド、アパルタミド、ダロルタミド、アビラテロン、またはアビラテロン酢酸エステルである、請求項２５に記載の方法。