

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】平成18年10月5日(2006.10.5)

【公表番号】特表2006-513169(P2006-513169A)  
 【公表日】平成18年4月20日(2006.4.20)  
 【年通号数】公開・登録公報2006-016  
 【出願番号】特願2004-553612(P2004-553612)  
 【国際特許分類】

**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**  
**A 6 1 P 5/26 (2006.01)**  
**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/14 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/18 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/517 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/506 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/56 (2006.01)**

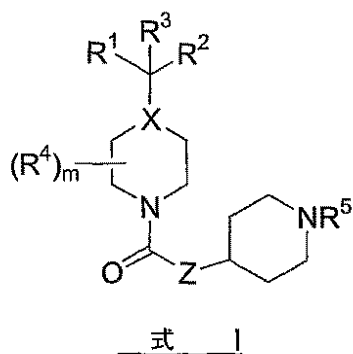
【F I】

C 0 7 D 401/12 C S P  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 P 5/26  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 13/08  
 A 6 1 P 17/12  
 A 6 1 P 17/14  
 A 6 1 K 31/18  
 A 6 1 K 31/517  
 A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/56  
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】  
 【提出日】平成18年8月16日(2006.8.16)  
 【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】

構造式：

## 【化 1】



で表される化合物であって、

ここで：

X は、C H または N であり；

Z は、O または N ( R <sup>6</sup> ) であり；

R <sup>1</sup> および R <sup>2</sup> は、同一であるかまたは異なっていて、各々が独立して、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルからなる群から選択され；ここで該アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルの各々が、非置換であり得るか、または必要に応じて、独立して、同一であってもまたは異なっていてよい一つ以上の部分で置換され得、各々の部分が独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、C F <sub>3</sub>、C N、- O C F <sub>3</sub>、- O R <sup>6</sup>、- C ( O ) R <sup>7</sup>、- N R <sup>6</sup> R <sup>7</sup>、- C ( O ) O R <sup>6</sup>、- C ( O ) N R <sup>6</sup> R <sup>7</sup>、- S R <sup>6</sup>、- S ( O <sub>2</sub> ) R <sup>7</sup>、- S ( O <sub>2</sub> ) N R <sup>6</sup> R <sup>7</sup>、- N ( R <sup>6</sup> ) S ( O <sub>2</sub> ) R <sup>7</sup>、- N ( R <sup>6</sup> ) C ( O ) R <sup>7</sup> および - N ( R <sup>6</sup> ) C ( O ) N R <sup>6</sup> R <sup>7</sup> からなる群から選択され；

R <sup>3</sup> は、H または - O R <sup>6</sup> であるが、ただし、X が N の場合は、R <sup>3</sup> は - O R <sup>6</sup> ではなく；

R <sup>4</sup> は、H、アルキル、アリール、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され；

m は、0 ~ 4 の数であり、そして m が 1 より大きい場合は、該 R <sup>4</sup> 基は、同一であり得るかまたは異なり得、そして独立して選択され；

R <sup>5</sup> は、- C ( O ) R <sup>7</sup> または - S ( O <sub>2</sub> ) R <sup>7</sup> であり；

R <sup>6</sup> は、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群から選択され、ここで該アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルの各々が、非置換であり得るか、または必要に応じて、独立して、同一であってもまたは異なっていてよい一つ以上の部分で置換され得、各々の部分が独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、C F <sub>3</sub>、O C F <sub>3</sub>、C N、- O R <sup>7</sup>、- N H R <sup>7</sup>、- N ( R <sup>7</sup> ) <sub>2</sub>、- C H <sub>2</sub> O R <sup>7</sup>、- C ( O ) R <sup>7</sup>、- C ( O ) O R <sup>7</sup>、- C ( O ) N H R <sup>7</sup>、- C ( O ) N ( R <sup>7</sup> ) <sub>2</sub>、- S R <sup>7</sup>、- S ( O <sub>2</sub> ) R <sup>7</sup>、- S ( O <sub>2</sub> ) N H R <sup>7</sup>、- S ( O <sub>2</sub> ) N ( R <sup>7</sup> ) <sub>2</sub>、- N ( R <sup>7</sup> ) S ( O <sub>2</sub> ) R <sup>7</sup>、- N ( R <sup>7</sup> ) C ( O ) R <sup>7</sup>、- N ( R <sup>7</sup> ) C ( O ) N H R <sup>7</sup> および - N ( R <sup>7</sup> ) C ( O ) N ( R <sup>7</sup> ) <sub>2</sub> からなる群から選択され；そして

R <sup>7</sup> は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、- O R <sup>6</sup>、- N H R <sup>6</sup>、および - N ( R <sup>6</sup> ) <sub>2</sub> からなる群から選択され、ここで該アルキル、ヘテロアラルキル、アリール、ヘテロアリールおよびアラルキルの各々は、非置換であり得るか、または必要に応じて、同一であってもまたは異なっていてよい一つ以上の部分で置換され得、各々の部分は独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、C F <sub>3</sub>、O C F <sub>3</sub>、C N、- O R <sup>6</sup>、- N H R <sup>6</sup>、- N ( R <sup>6</sup> ) <sub>2</sub>、- C H <sub>2</sub> O R <sup>6</sup>、- C ( O ) O R <sup>6</sup>、- C ( O ) N H R <sup>6</sup>、- C ( O ) N ( R <sup>6</sup> ) <sub>2</sub>、- S R <sup>6</sup>、- S ( O

$R^2$  )  $R^6$ 、 $-S(O_2)NHR^6$ 、 $-S(O_2)N(R^6)_2$ 、 $-N(R^6)S(O_2)R^6$ 、 $-N(R^6)C(O)R^6$ 、 $-N(R^7)C(O)NHR^6$  および  $-N(R^7)C(O)N(R^7)_2$  からなる群から選択され、さらにここで、該部分  $-N(R^6)_2$  中および  $-N(R^7)_2$  中の該 2 つの  $R^6$  基または該 2 つの  $R^7$  基は、それぞれ同一であってもよくまたは異なってもよく、そして独立に選択され、その上さらにここでアリール上またはヘテロアリール上の任意の 2 つの隣接するアルキル置換基は、一緒になってメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成し得る、化合物。

【請求項 2】

X が N である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Z が O である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Z が  $N(R^6)$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^1$  および  $R^2$  が、同一であり、そしてアリールまたはヘテロアリールであって、該アリールおよびヘテロアリールの各々が、非置換であるかまたは必要に応じて、独立して、同一であってもまたは異なってもよい一つ以上の部分で置換されるかのいずれかであり、各々の部分は独立して、ハロゲン、アルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^6$ 、 $-C(O)R^7$ 、および  $-C(O)OR^6$  からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^3$  が H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^4$  が H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R^5$  が  $-C(O)R^7$  または  $-S(O_2)R^7$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

$R^5$  が  $-C(O)R^7$  である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

$R^6$  が、H、アルキル、アリール、 $-CF_3$ 、 $-C(O)R^7$  および  $-S(O_2)R^7$  からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

$R^6$  が H、メチルまたは  $CF_3$  である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

$R^7$  が、アルキル、アラルキルおよびアリールからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

$R^6$  が H である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R^1$  および  $R^2$  が、同一であり、そしてフェニルであり、ここで該両方のフェニル基が非置換である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 15】

$R^1$  が非置換のフェニルであり、 $R^2$  が、ハロゲン、アルキル、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、および  $-C(O)R^7$  からなる群から選択される一つ以上の部分で置換されたフェニルである、請求項 5 に記載の化合物。

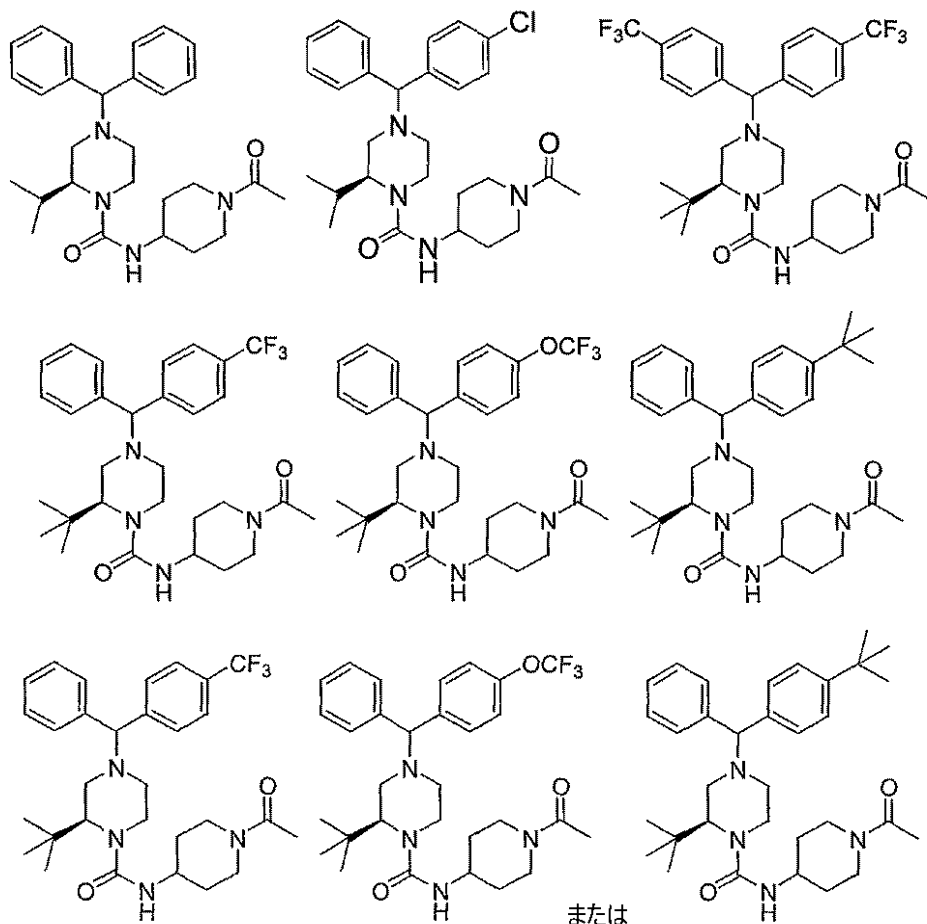
【請求項 16】

$R^7$  がアルキルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 17】

式：

## 【化 2】



の化合物もしくは該化合物の異性体、または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは該化合物の溶媒和物、または該異性体の薬学的に受容可能な塩もしくは該異性体の溶媒和物。

## 【請求項 18】

タイプ 3 17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼを阻害するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、  
治療的に有効な量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含み、そのような阻害を必要とする患者への投与のために処方されている、薬学的組成物。

## 【請求項 19】

アンドロゲン依存性疾患を処置または予防するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、  
治療的に有効な量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩または該化合物の溶媒和物を含み、該処置または予防を必要とする患者への投与のために処方されている、薬学的組成物。

## 【請求項 20】

前記アンドロゲン依存性疾患が、前立腺癌、良性前立腺肥大、前立腺上皮内新生物形成、多毛症、アクネ、男性ホルモン性脱毛症、または多嚢胞性卵巢症候群である、請求項 19 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 21】

アンドロゲン依存性疾患を処置または予防するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、  
少なくとも一つの抗アンドロゲン性薬剤と組み合わせて、有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含み、該処置または予防を必要とする哺乳動物への投与のために処方されている、薬学的組成物。

## 【請求項 2 2】

前記抗アンドロゲン性薬剤が、5 - レダクターゼ タイプ 1 および / または タイプ 2 のインヒビター、フルタミド、ニカルタミド、ピカルタミド、LHRH アゴニスト、LHRH アンタゴニスト、17 - ヒドロキシラーゼ / C 17 ~ 20 リアーゼのインヒビター、ならびに 17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ タイプ 5 および 17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ / 17 - オキシドレダクターゼ イソエンザイムのインヒビターからなる群から選択される、請求項 2 1 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 2 3】

良性前立腺肥大を処置または予防するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、良性前立腺肥大の処置もしくは予防において有用な少なくとも一つの薬剤と組み合わせてまたは良性前立腺肥大の処置もしくは予防において有用な少なくとも一つの薬剤に関連して有効量の、少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含み、該処置または予防を必要とする患者への投与のために処方されている、薬学的組成物。

## 【請求項 2 4】

前記良性前立腺肥大の処置または予防において有用な薬剤が、タムスロシンまたはテラゾシンから選択される - 1 アドレナリン作用性アンタゴニストである、請求項 2 3 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 2 5】

毛喪失を処置または予防するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、少なくとも一つの抗脱毛剤と組み合わせてまたは少なくとも一つの抗脱毛剤に関連して有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含み、該処置または予防を必要とする患者への投与のために処方されている、薬学的組成物。

## 【請求項 2 6】

前記抗脱毛剤が、カリウムチャンネルアゴニストまたは 5 - レダクターゼインヒビターである、請求項 2 5 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 2 7】

前記カリウムチャンネルアゴニストが、ミノキシジルまたは KC - 5 1 6 である、請求項 2 6 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 2 8】

前記 5 - レダクターゼインヒビターが、フィナステリドまたはデュタステリドである、請求項 2 6 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 2 9】

増殖性の疾患を処置または予防するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、治療的に有効な量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含み、有効量の、化学療法剤、生物学的薬剤、外科治療および放射線治療からなる群から選択される少なくとも一つの治療方法の組合せまたは結合とともに投与するように処方された、薬学的組成物。

## 【請求項 3 0】

前記増殖性の疾患が、肺癌、膵臓癌、結腸癌、腎臓癌、骨髄性白血病、甲状腺小胞癌、脊髄形成異常症 (MDS)、膀胱癌、皮膚癌、黒色腫、乳癌、卵巣癌および前立腺癌から選択される、請求項 2 9 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 3 1】

薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、少なくとも一つの薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて、治療的に有効な量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 3 2】

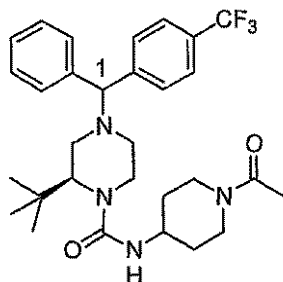
必要に応じて外科治療および放射線治療から選択される少なくとも一つの方法に関連して、5 - レダクターゼ タイプ 1 のインヒビター、5 - レダクターゼ タイプ 2 のインヒビター、フルタミド、ニカルタミド、ピカルタミド、LHRH アゴニスト、LHRH アンタゴニスト、17 - ヒドロキシラーゼ / C 17 ~ 20 リアーゼのインヒビター、17 - ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ タイプ 5 のインヒビター、17 - ヒドロ

キシステロイドデヒドロゲナーゼ / 17 - オキシドレダクターゼ イソエンザイムのインヒビター、タムスロシン、テラゾシン、カリウムチャネルアゴニスト、5 - レダクターゼインヒビター、化学療法剤および生物学的薬剤からなる群から選択される一つ以上の薬剤をさらに含む、請求項 3 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 3】

構造：

【化 3】

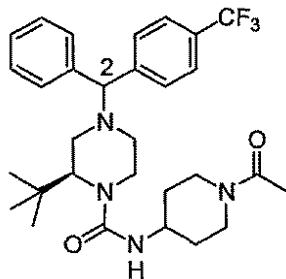


を有する、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩または該化合物の溶媒和物。

【請求項 3 4】

構造：

【化 4】

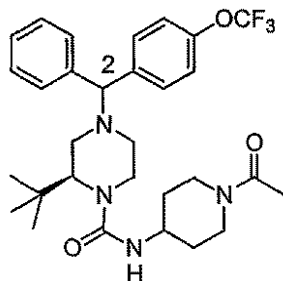


を有する、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩または該化合物の溶媒和物。

【請求項 3 5】

構造：

【化 5】

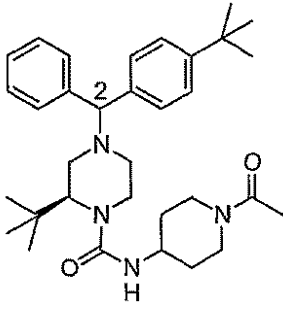


を有する、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩または該化合物の溶媒和物。

【請求項 3 6】

構造：

## 【化 6】



を有する、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩または該化合物の溶媒和物。

## 【請求項 37】

精製された形態における、請求項 1 に記載の化合物。