

【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20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-513998(P2007-513998A)

【公表日】平成19年5月31日(2007.5.31)

【年通号数】公開・登録公報2007-020

【出願番号】特願2006-545371(P2006-545371)

【国際特許分類】

C 07 C	235/24	(2006.01)
A 61 K	31/661	(2006.01)
A 61 P	15/16	(2006.01)
A 61 P	5/28	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	19/10	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	17/14	(2006.01)
A 61 P	25/24	(2006.01)
C 07 F	9/09	(2006.01)
A 61 K	31/167	(2006.01)

【F I】

C 07 C	235/24	Z
A 61 K	31/661	
A 61 P	15/16	
A 61 P	5/28	
A 61 P	35/00	
A 61 P	13/08	
A 61 P	27/02	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	19/10	
A 61 P	3/04	
A 61 P	17/14	
A 61 P	25/24	
C 07 F	9/09	U
A 61 K	31/167	

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月11日(2007.12.11)

【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

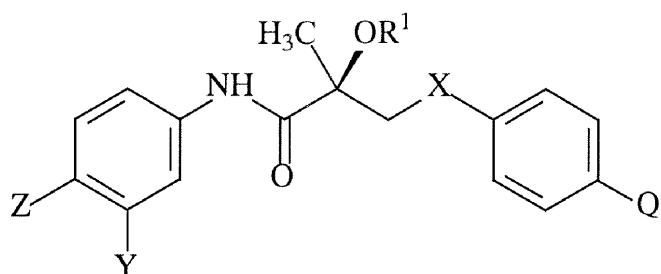
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

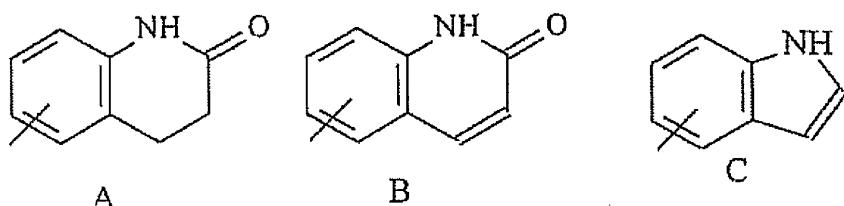
【請求項1】

化学構造式I I [-B]で表されることを特徴とする選択的アンドロゲン受容体調節剤(SARM)化合物のプロドラッグ。



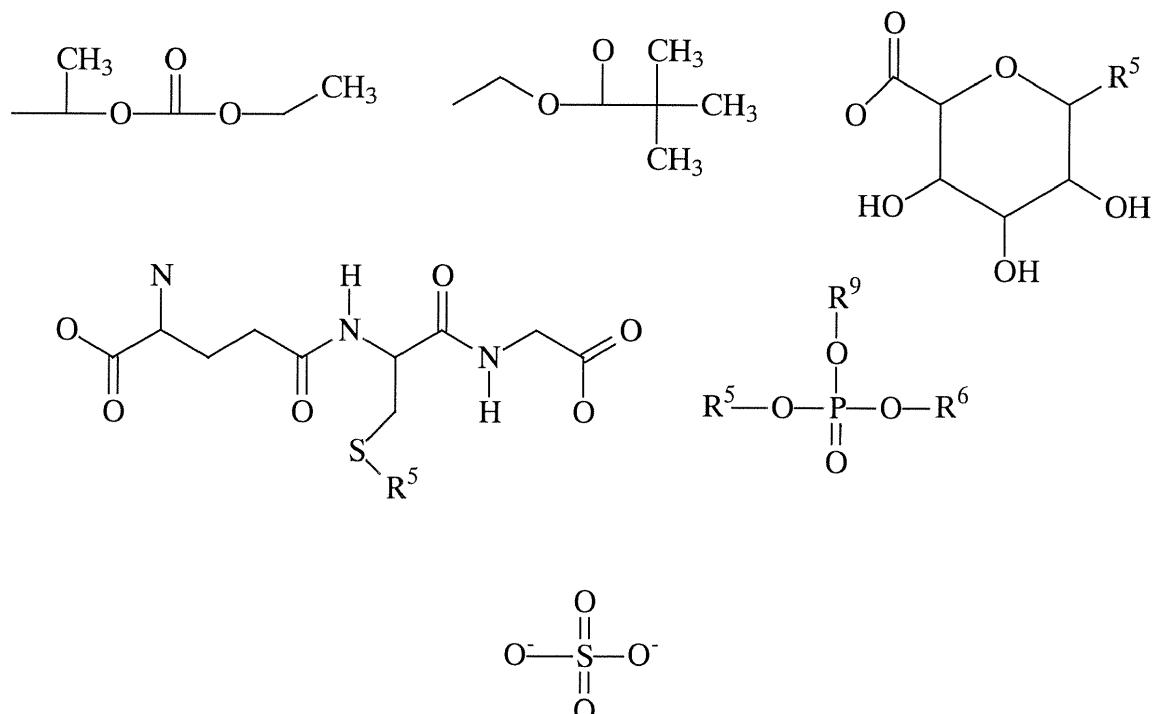
III[[-B]]

ただし、Xは、結合部、 CH_2 、 NH 、 Se 、 PR 、 NO 又は NR であり、
 Zは、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 COR 、 NHCOR 又は CONHR であり、
 Yは、 CF_3 、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CN 、 CR_3 又は SnR_3 であり、
 Qは、アルキル、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCO NR 、 CONHR 、 NHCSCH_3 、 NHCSCH_3 、 NHCSRF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 又は NCO 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る。



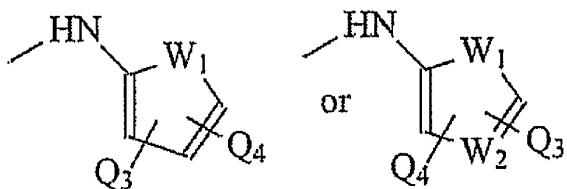
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、アルケニル又は OH であり、

R_1 は、次の構造式の1つであり、



前記SARM化合物は R_1 の適切ないずれかの原子に結合し、

R_5 、 R_6 及び R_9 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS(CF₃)₂、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、結合部、表された位置にある前記SARM化合物のO結合鎖若しくはN結合鎖、又は、



であり、

ただし、 Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS(CF₃)₂、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOである。

【請求項2】

精子形成を抑圧するための薬剤を製造するための、精子増殖を抑圧するのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

【請求項3】

男性用の避妊のための薬剤を製造するための、精子増殖を抑圧するのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

【請求項4】

ホルモンに関連する健康状態を治療するための薬剤を製造するための、ホルモンに関連する健康状態に変化を与えるのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

【請求項5】

前立腺癌を治療するための薬剤を製造するための、前立腺癌を治療するのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

【請求項6】

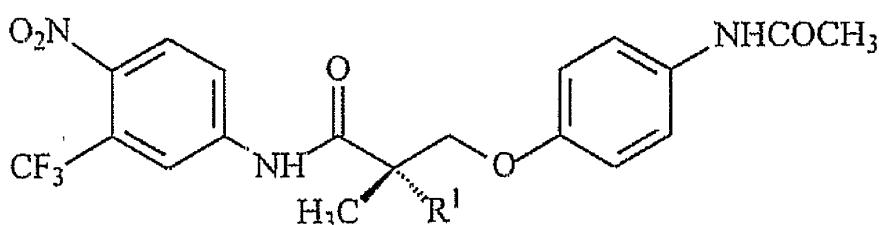
前立腺癌の再発率を低減するための薬剤を製造するための、前立腺癌の再発率を低減するのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

【請求項7】

ドライアイを治療するための薬剤を製造するための、ドライアイを治療するのに効果的な量の請求項1に記載のプロドラッグの使用。

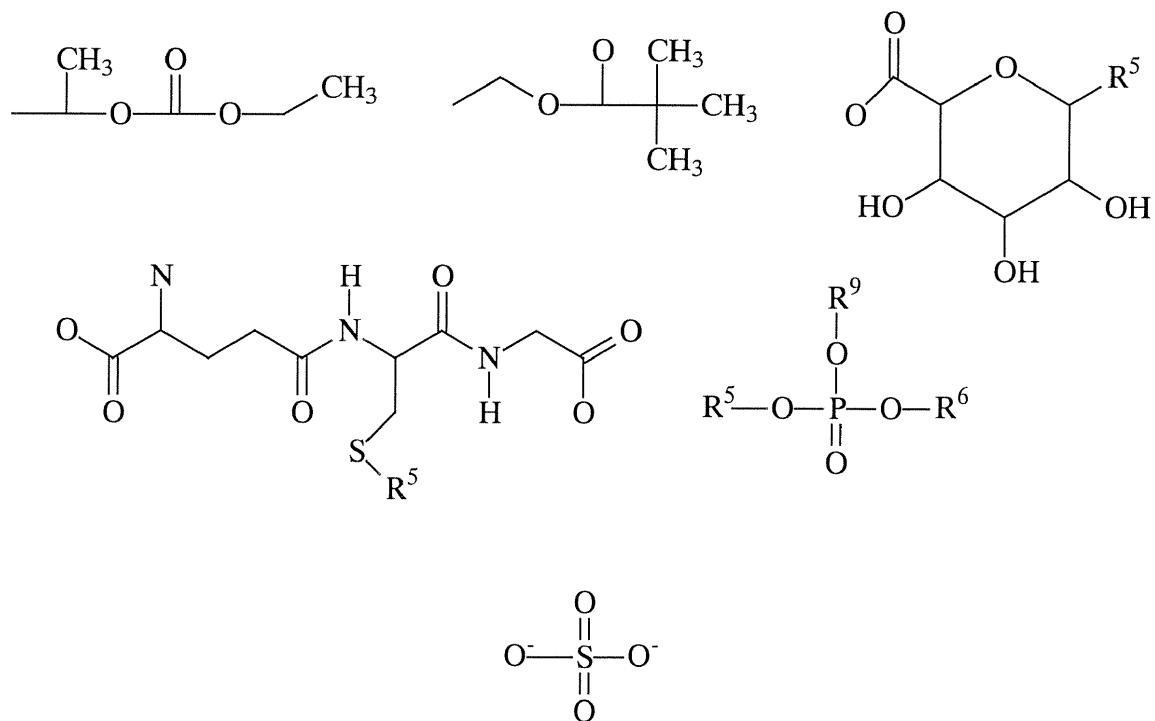
【請求項8】

化学構造式VIII-Bで表されることを特徴とする請求項1に記載のプロドラッグ。

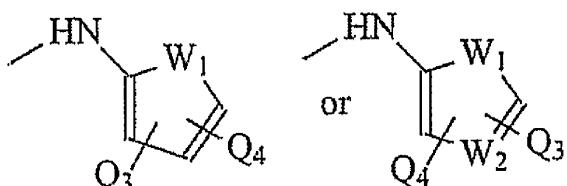


VIII-B

ただし、 R_1 は、次の構造式の1つであり、



ただし、R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、



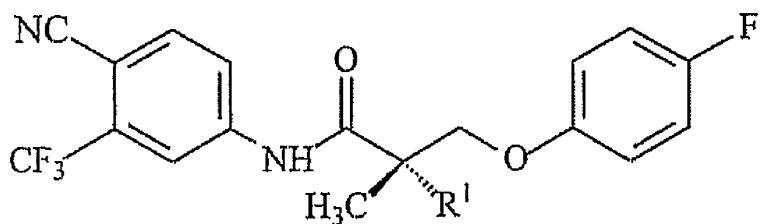
であり、

ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCHF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

前記SARM化合物はR₁の適切ないずれかの原子に結合する。

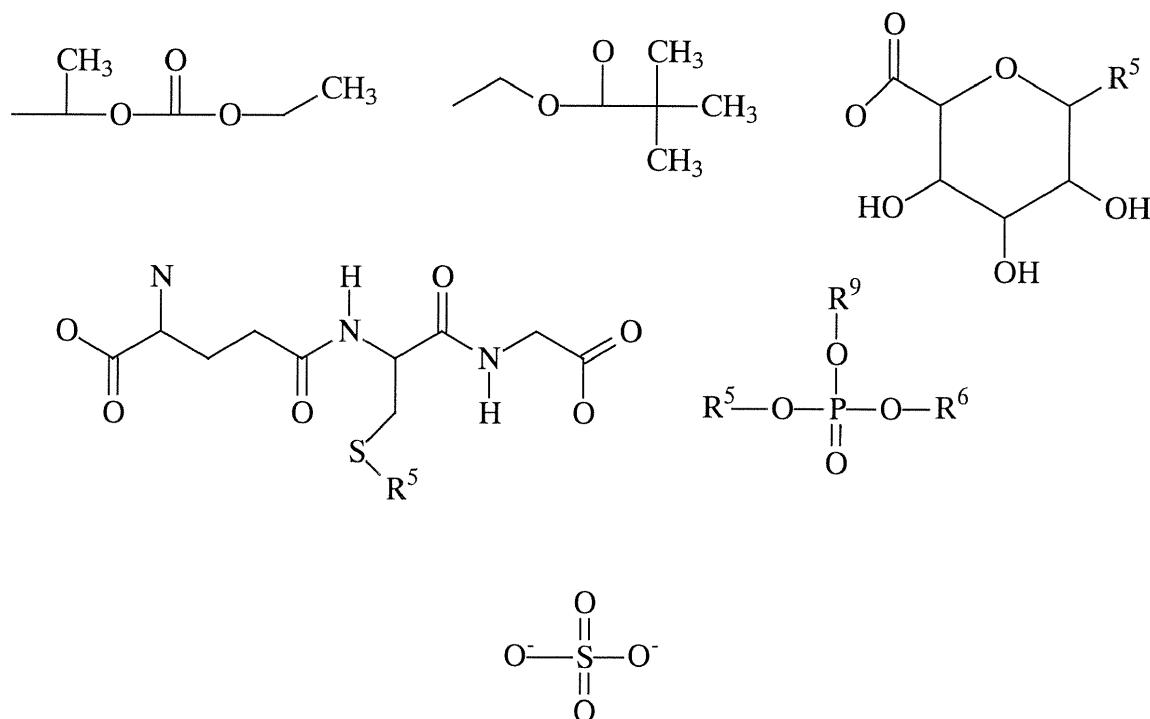
【請求項 9】

化学構造式XI-Bで表されることを特徴とする請求項1に記載のプロドラッグ。

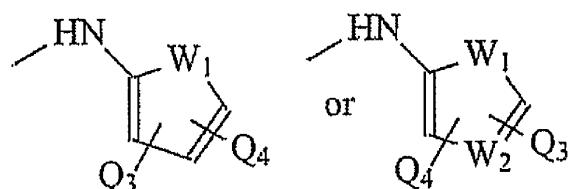


XI-B

ただし、R₁は、次の構造式の1つであり、



ただし、R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、



であり、

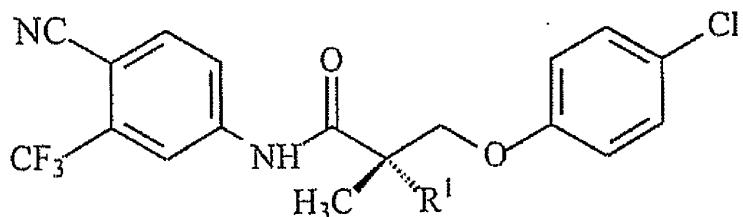
ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

SCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 又は NCO であり、

前記SARM化合物は R_1 の適切ないずれかの原子に結合する。

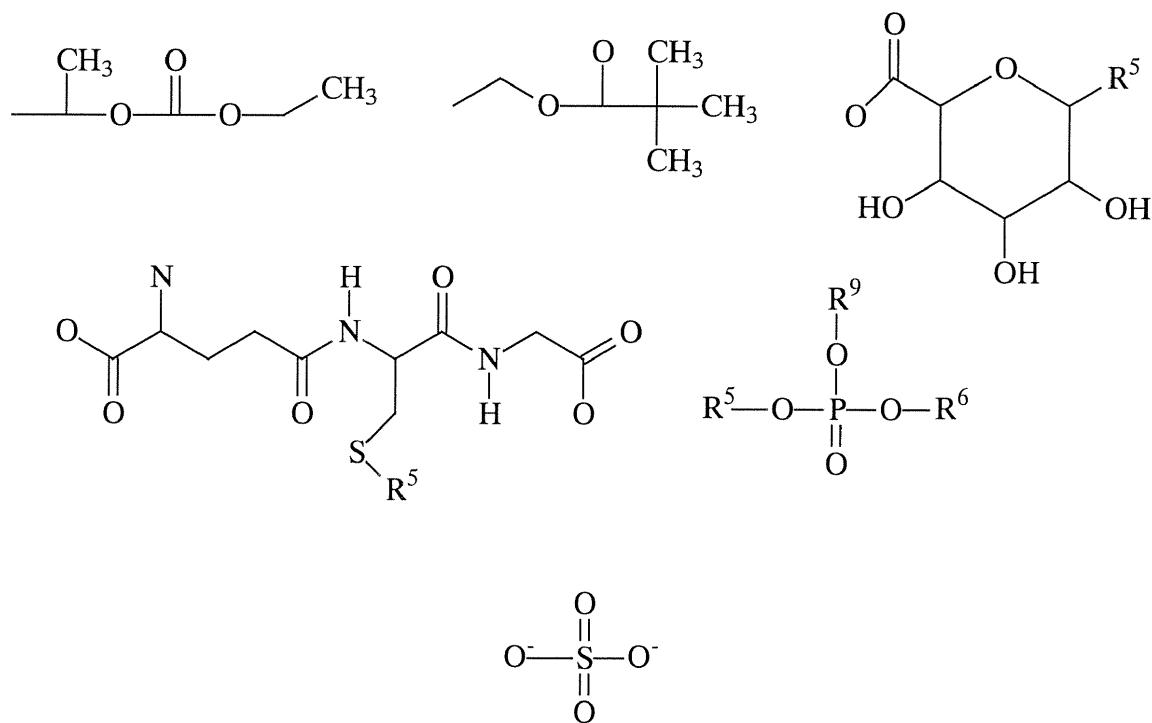
【請求項10】

化学構造式XIII-I-Bで表されることを特徴とする請求項1に記載のプロドラッグ。

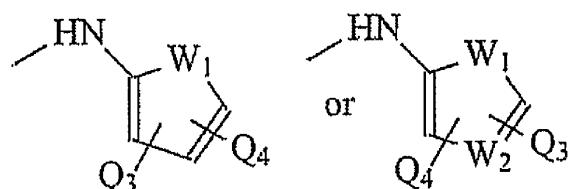


XIII-B

ただし、 R_1 は、次の構造式の1つであり、



ただし、 R_5 、 R_6 及び R_9 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 、 NCO 、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、 O 結合鎖若しくは N 結合鎖、又は、



であり、

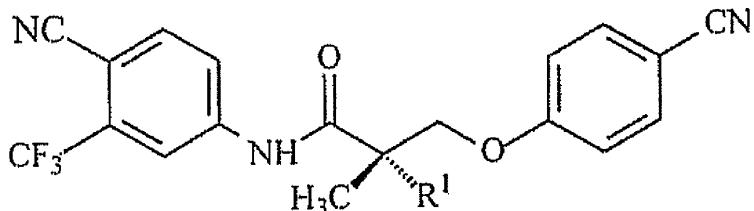
ただし、 Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 C

F_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCH_3 、 $\text{NHCSCH}_3\text{F}_3$ 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 又は NCO であり、

前記SARM化合物は R_1 の適切ないずれかの原子に結合する。

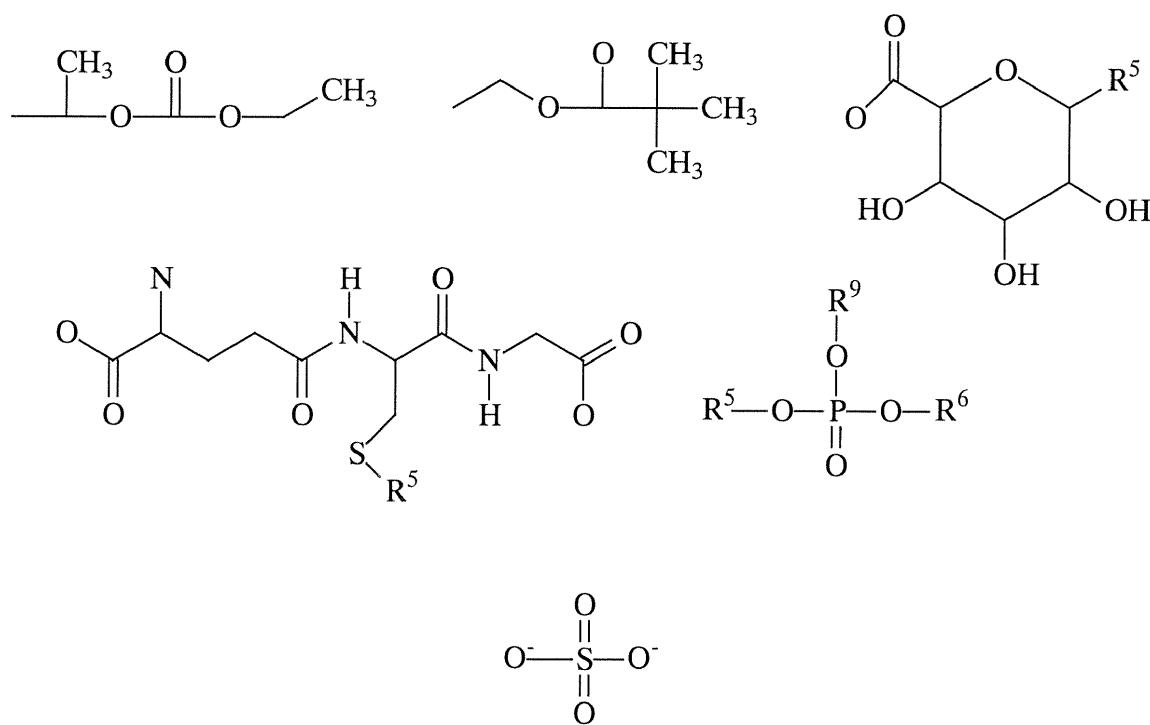
【請求項11】

化学構造式IV-Bで表されることを特徴とする請求項1に記載のプロドラッグ。

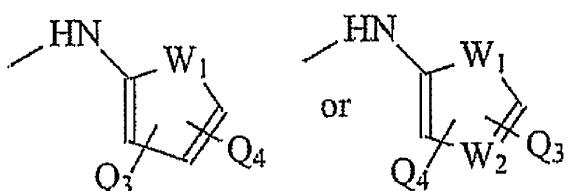


IV-B

ただし、 R_1 は、次の構造式の1つであり、



ただし、 R_5 、 R_6 及び R_9 は、互いに独立して、水素、アルキル、 F 、 I 、 Br 、 Cl 、 CF_3 、 CN 、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、 CONHR 、 NHCSCH_3 、 $\text{NHCSCH}_3\text{F}_3$ 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 、 NCO 、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、



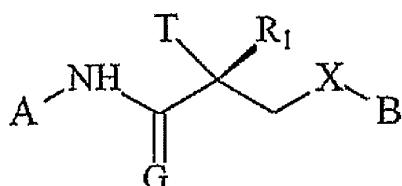
であり、

ただし、Q₃ 及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

前記SARM化合物はR₁の適切ないずれかの原子に結合する。

【請求項12】

化学構造式V-Bで表されることを特徴とする選択的アンドロゲン受容体調節剤(SARM)化合物のプロドラッグ。

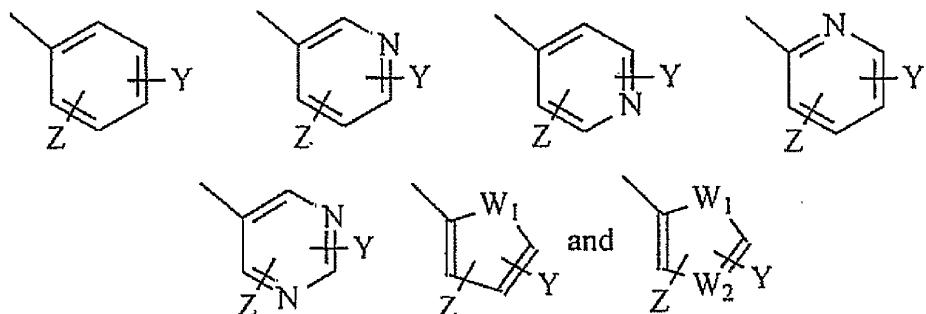


V-B

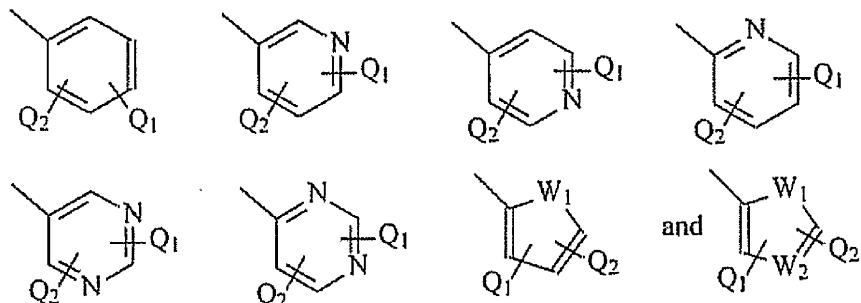
ただし、Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Gは、O又はSであり、

Tは、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃又はCF₂CF₃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、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又はOHであり、

Aは、次から選択される1つの環であり、



Bは、次から選択される1つの環であり、

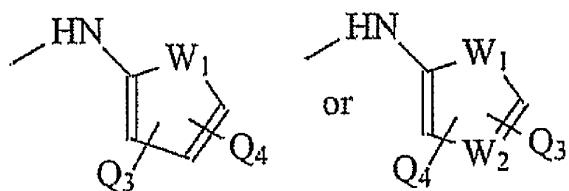


Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、

Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃又はSnR₃であり、

Q₁及びQ₂は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃

、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 、 SR 、 SCN 、 NCS 、 OCN 、 NCO 、又は、



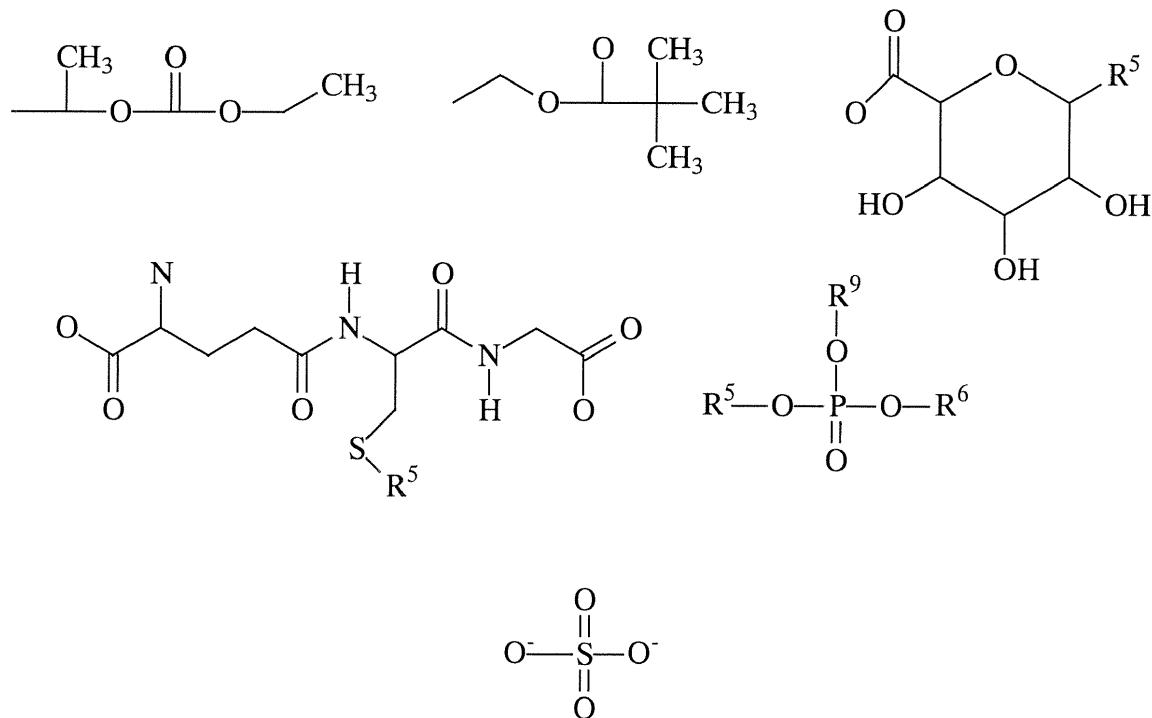
であり、

Q_3 及び Q_4 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

W_1 は、O、NH、NR、NO又はSであり、

W_2 は、N又はNOであり、

R_1 は、次の構造式の1つであり、

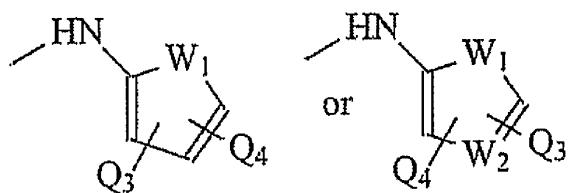


前記SARM化合物は R_1 の適切ないずれかの原子に結合し、

R_7 は、O又はCH₂であり、

R_8 は、N又はCHであり、

R_5 、 R_6 及び R_9 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

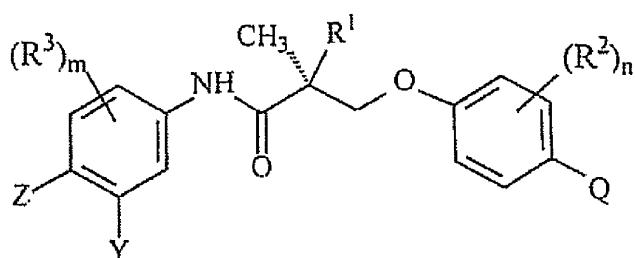


であり、

ただし、Q₃ 及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSFC₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOである。

【請求項 1 3】

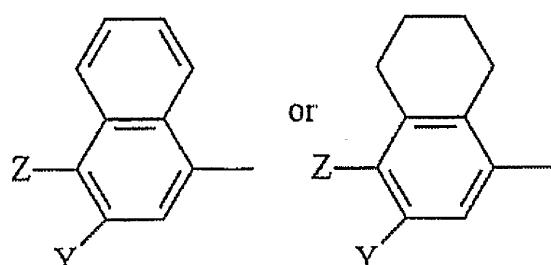
化学構造式VII - Bで表されることを特徴とする選択的アンドロゲン受容体調節剤(SARM)化合物のプロドラッグ。



VII-B

ただし、R₂は、F、Cl、Br、I、CH₃、CF₃、OH、CN、NO₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、アルキル、アリルアルキル、OR、NH₂、NHR、NR₂、SRであり、

R₃は、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、COR、COOH、CONHR、CF₃又はSnR₃であり、或いはR₃は、次の構造のいずれかにより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、



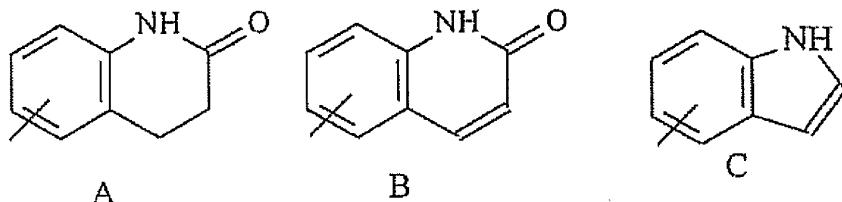
Rは、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又はOHであり、

Zは、NO₂、CN、COR、COOH又はCONHRであり、

Yは、CF₃、F、Br、Cl、I、CN又はSnR₃であり、

Qは、H、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCOONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSR、NHSFC₃、NHCNSR、NHSO₂CH₃

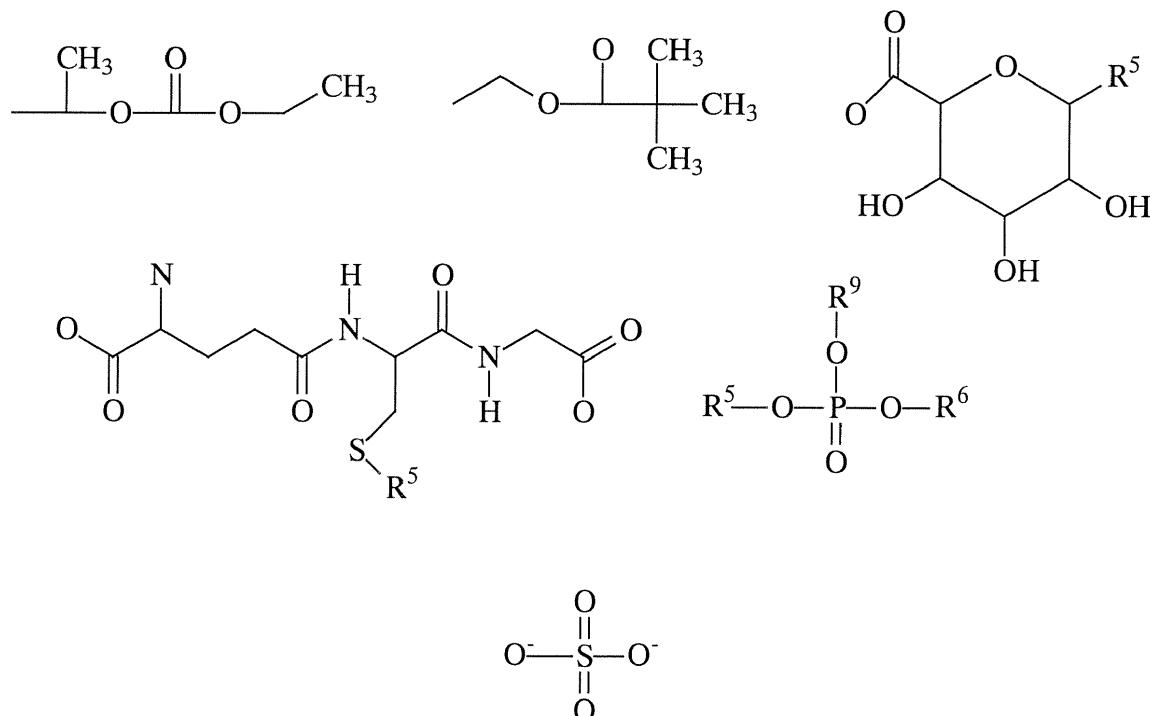
NHSO_2R 、 OH 、 OR 、 COR 、 OCOR 、 OSO_2R 、 SO_2R 又は SR である。或いは、Qは、次の構造式A、B又はCで表される縮合環システムのベンゼン環と結合するようなものからなり。



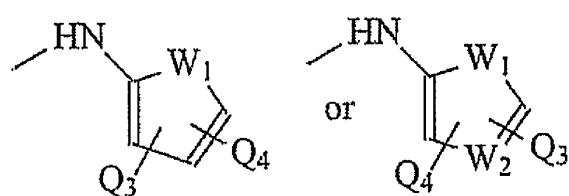
nは、1～4の整数であり、

mは、1～3の整数であり、

R_1 は、次の構造式の1つであり、



ただし、 R_5 、 R_6 及び R_9 は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、 CF_3 、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOOR 、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

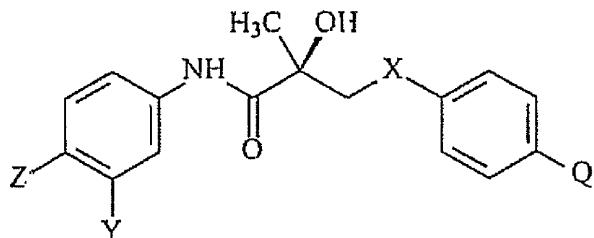


であり、

ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、 CF_3 、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、 NHCOCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、OCONHR、CONHR、 NHCSCH_3 、 NHSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOである。

【請求項14】

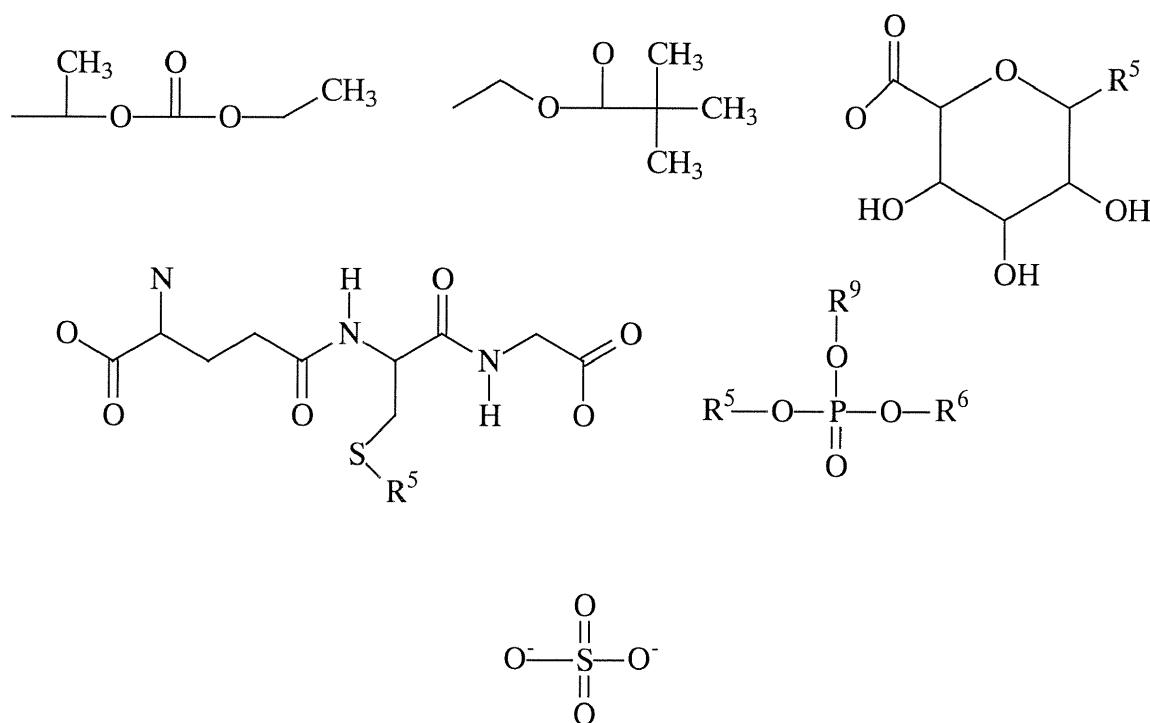
化学構造式 II で表されることを特徴とする選択的アンドロゲン受容体調節剤 (SARM) 化合物のプロドラッグ。



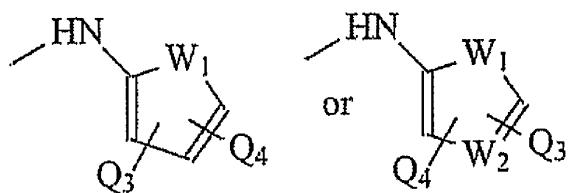
II

ただし、Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃又はSnR₃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、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又はOHであり、

Qは、次の(a)若しくは(b)のいずれかである。すなわち、(a)Qは、次の構造式の1つである。



ただし、R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₂H₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSRF、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

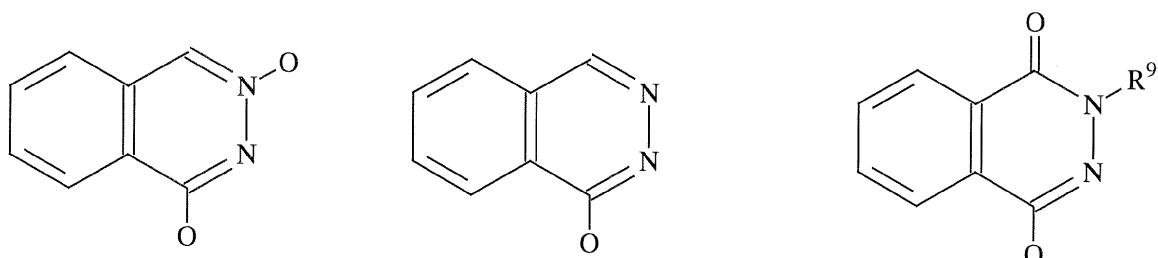
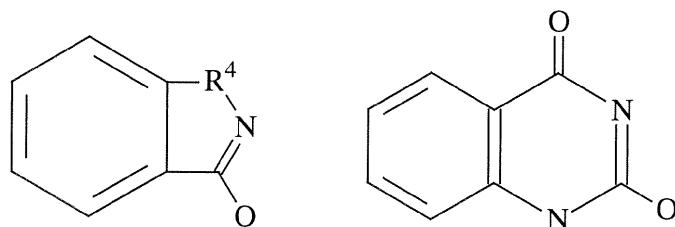


であり、

ただし、Q₃ 及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

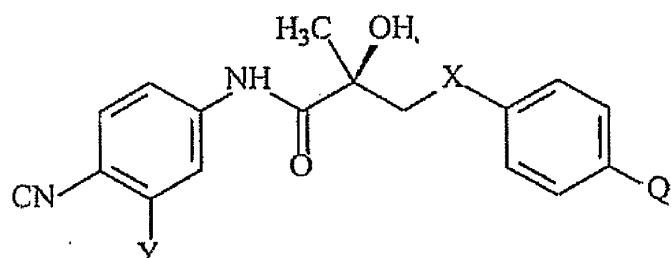
前記SARM化合物はQの適切ないずれかの原子に結合する。或いは、

(b) Qは、次の構造式の1つで表される縮合環システムの環Bと結合するようなものからなる。



【請求項15】

化学構造式LIで表されることを特徴とする請求項14に記載のプロドラッグ。

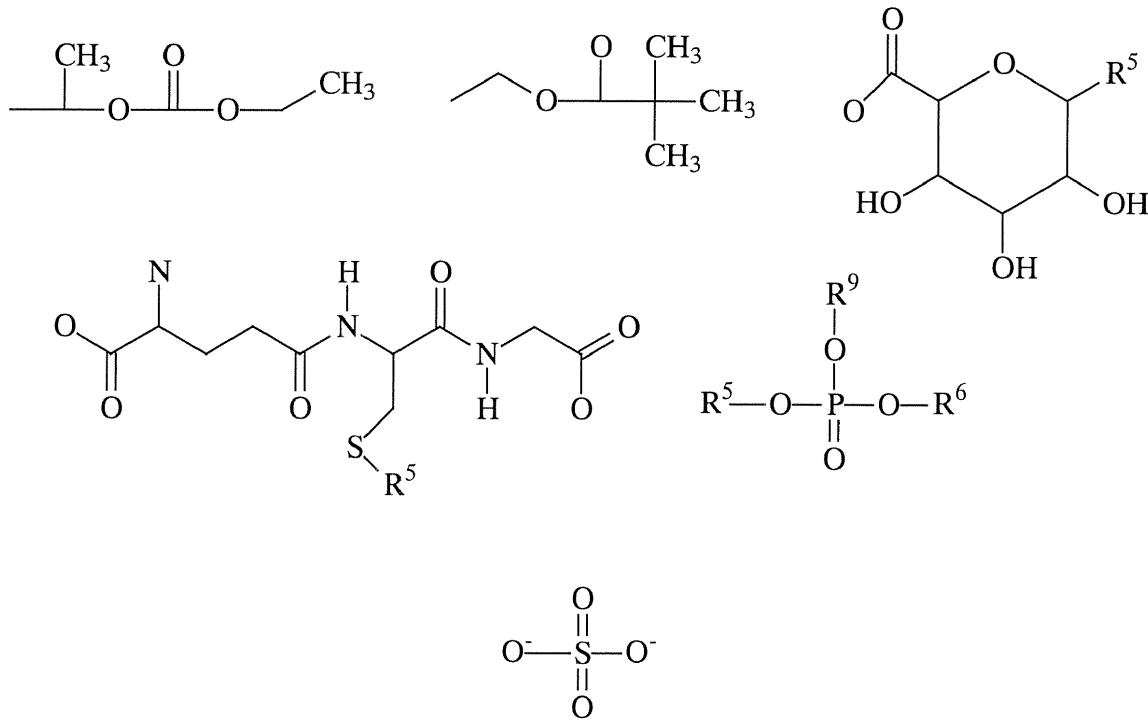


LI

ただし、Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO又はNRであり、Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR又はCONHRであり、Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃又はSnR₃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、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又はOHであり、

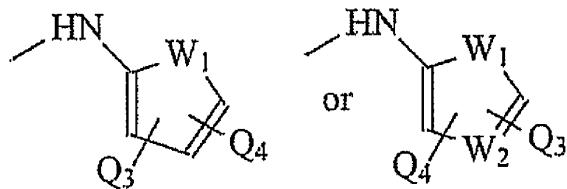
Qは、次の(a)若しくは(b)のいずれかである。すなわち、
(a) Qは、次の構造式の1つである。



ただし、R₇は、O又はCH₂であり、

R₈は、N又はCHであり、

R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS CF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、結合部、表された位置にある前記SARM化合物のO結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

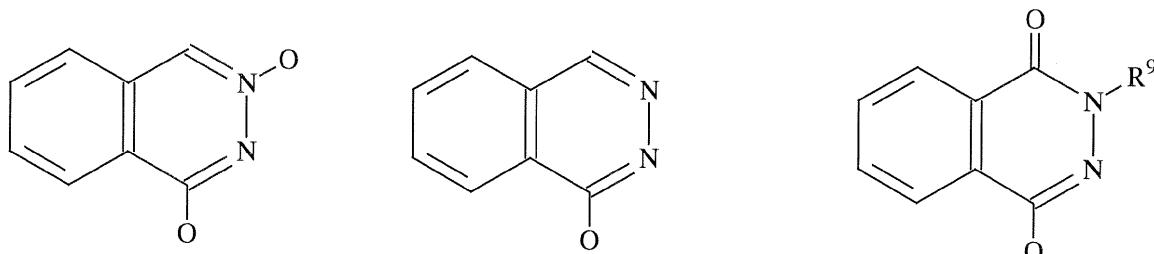
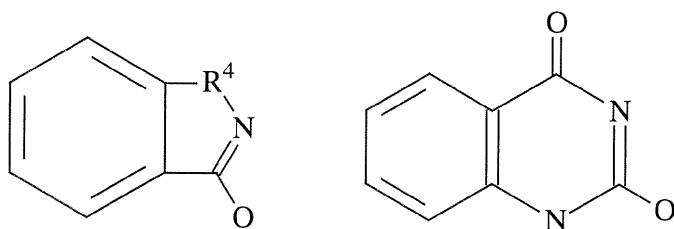


であり、

ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCS CF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

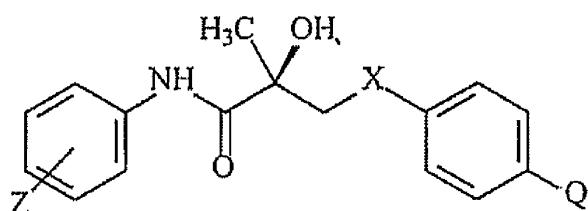
前記SARM化合物はQの適切ないずれかの原子に結合する。或いは、

(b) Qは、次の構造式の1つで表される縮合環システムの環Bと結合するようなものからなる。



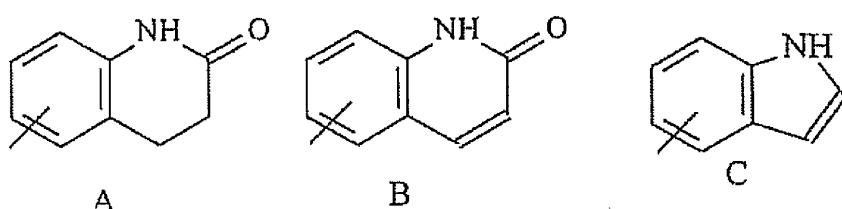
【請求項 16】

化学構造式 L で表されることを特徴とする選択的アンドロゲン受容体調節剤 (SARM) 化合物のプロドラッグ。



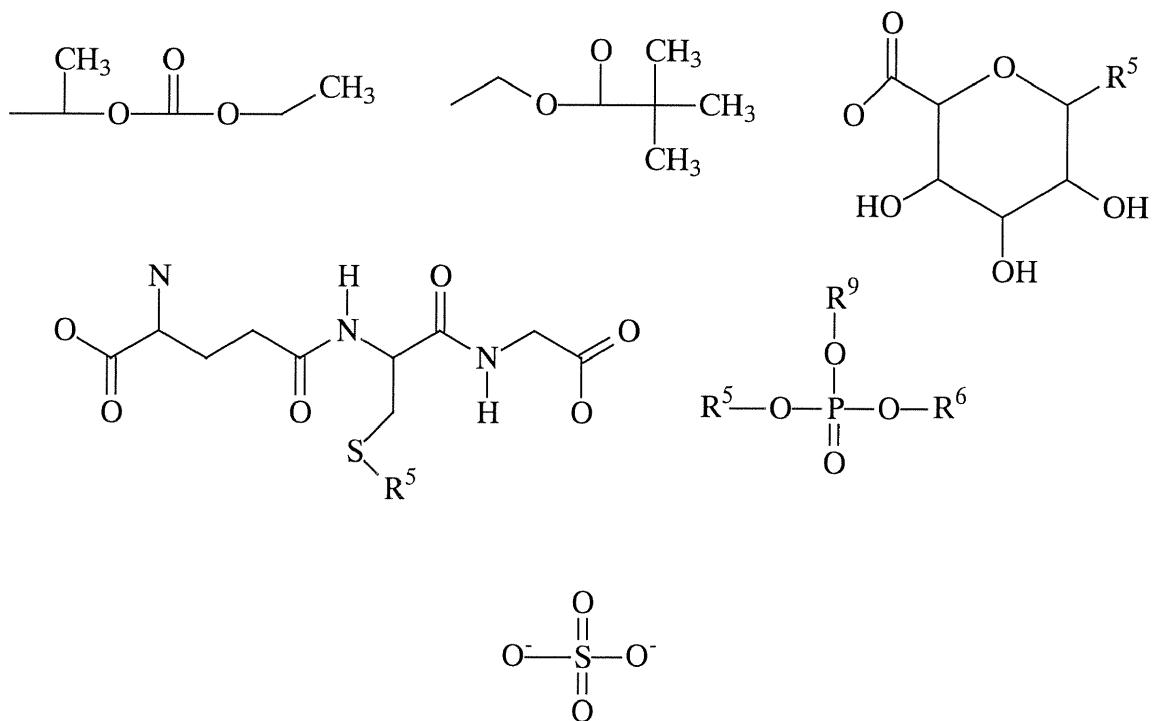
L

ただし、X は、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO 又は NR であり、Q は、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCO NR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSRF₃、NHCSR、NH₂SO₂CH₃、NH₂SO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN 又は NCO 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る。



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、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又は OH であり、

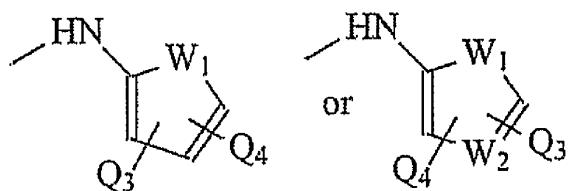
Z は、次の (a) 若しくは (b) のいずれかである。すなわち、
(a) Z は、次の構造式の 1 つである。



ただし、R₇は、O又はCH₂であり、

R₈は、N又はCHであり、

R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂CH₃、NH₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、表された位置にある前記SARM化合物の結合部、O結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

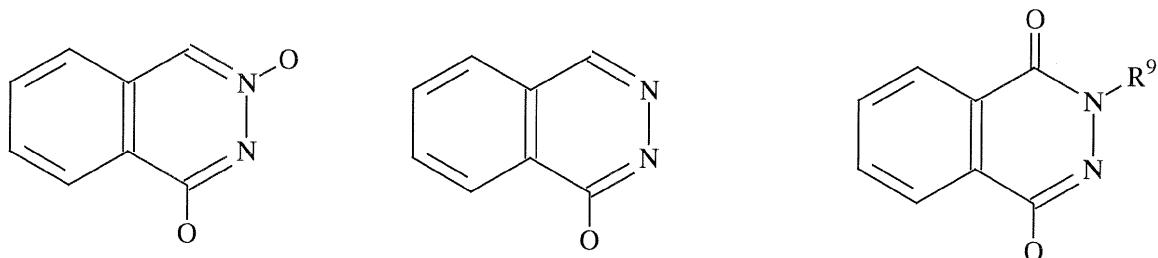
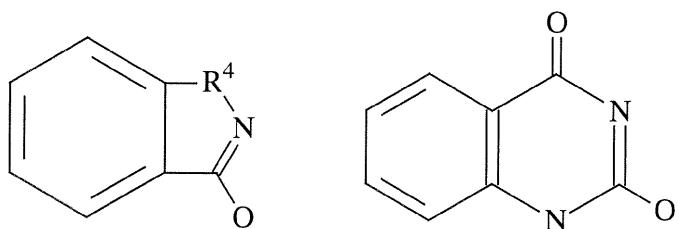


であり、

ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂CH₃、NH₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

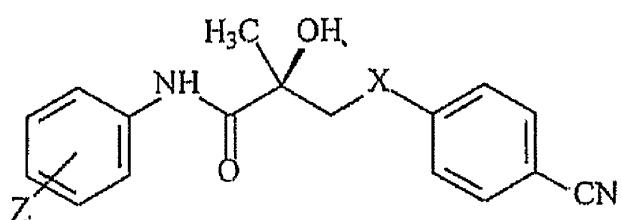
前記SARM化合物はZの適切ないずれかの原子に結合する。或いは、

(b) Zは、次の構造式の1つで表される縮合環システムの環Bと結合するようなものからなる。



【請求項 17】

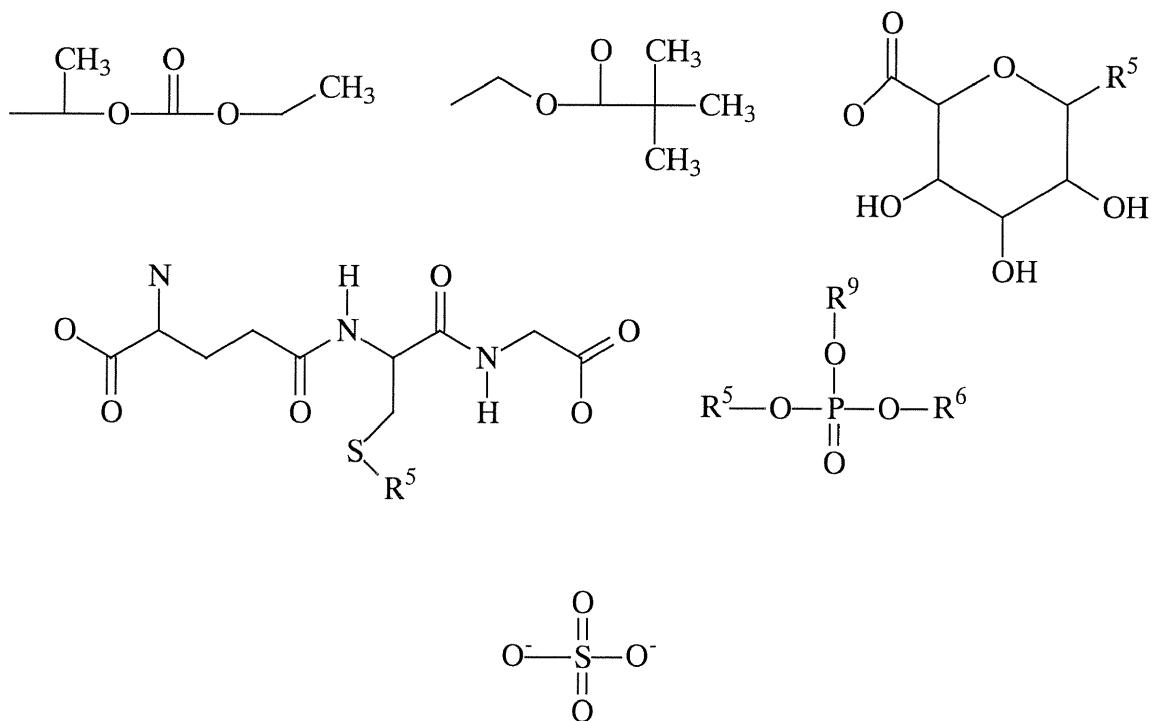
化学構造式 LII で表されることを特徴とする請求項 16 に記載のプロドラッグ。



LII

ただし、Xは、結合部、O、CH₂、NH、Se、PR、NO又はNR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、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、F、I、Br、Cl、アルケニル又はOHであり、

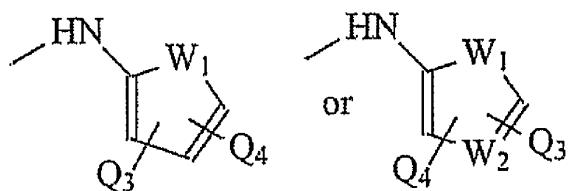
Zは、次の(a)若しくは(b)のいずれかである。すなわち、(a)Zは、次の構造式の1つである。



ただし、R₇は、O又はCH₂であり、

R₈は、N又はCHであり、

R₅、R₆及びR₉は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂CH₃、NH₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SR、SCN、NCS、OCN、NCO、結合部、表された位置にある前記SARM化合物のO結合鎖若しくはN結合鎖、又は、

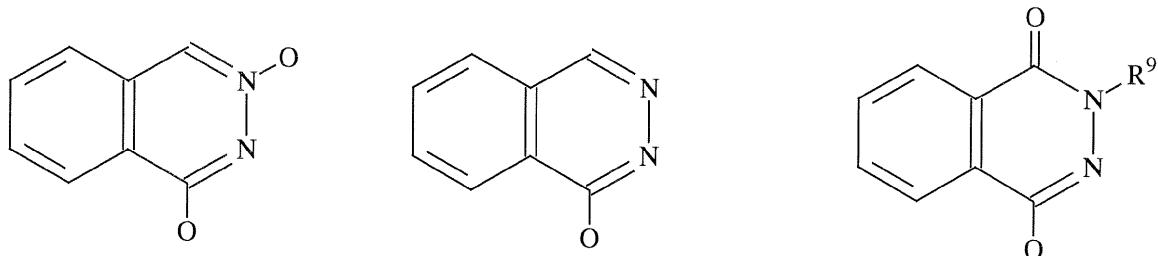
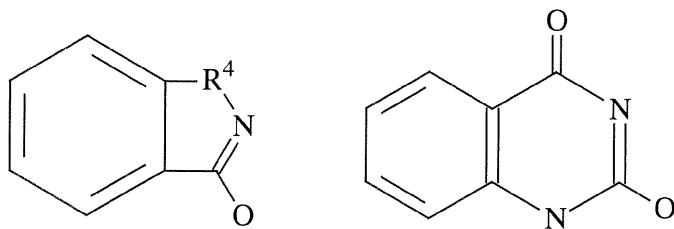


であり、

ただし、Q₃及びQ₄は、互いに独立して、水素、アルキル、F、I、Br、Cl、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NH₂CH₃、NH₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、SCN、NCS、OCN又はNCOであり、

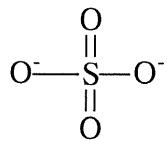
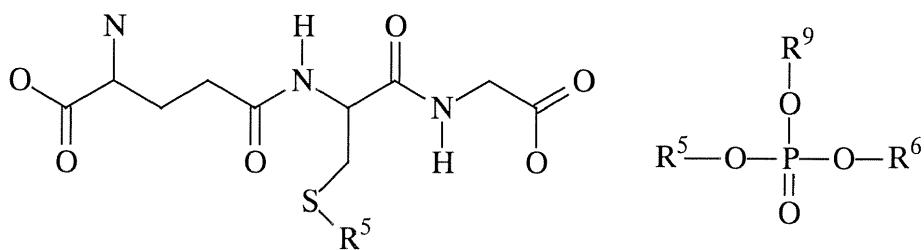
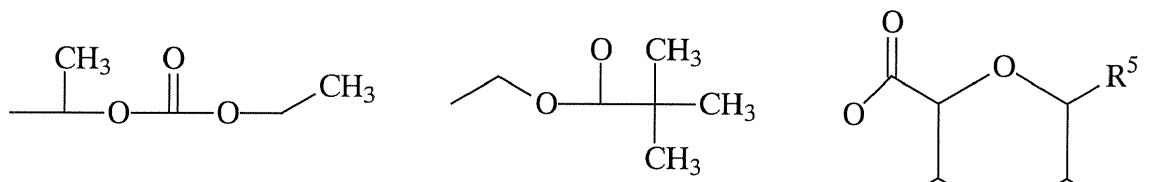
前記SARM化合物はZの適切ないずれかの原子に結合する。或いは、

(b) Zは、次の構造式の1つで表される縮合環システムの環Bと結合するようなものからなる。



【請求項 1 8】

選択的アンドロゲン受容体調節剤（SARM）化合物の生体利用性を向上させる方法であって、次の構造式の1つを前記SARM化合物のキラル炭素に結合させることを特徴とする方法。



【請求項 1 9】

選択的アンドロゲン受容体調節剤（SARM）化合物の生体利用性を向上させる方法であって、次の構造式の1つを前記SARM化合物のA環又はB環に結合させることを特徴とする方法。

