

【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4月13日(2006.4.13)

【公表番号】特表2005-526741(P2005-526741A)

【公表日】平成17年9月8日(2005.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2005-035

【出願番号】特願2003-572923(P2003-572923)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 P 5/28 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/16 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 237/20 C S P

A 6 1 K 31/167

A 6 1 P 5/28

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/16

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月22日(2006.2.22)

【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

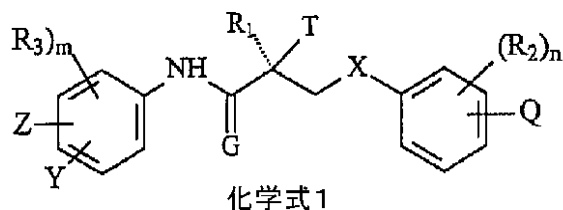
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

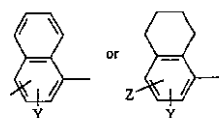
【請求項1】

化学式1で示される選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)。

【化1】



Xは、結合、O、CH₂、NH、S、Se、PR、NO、若しくはNRであり、
 Gは、O、若しくはSであり、
 TはOH、OR、 \cdot NHCOCH₃、若しくはNHCOR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、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、
 R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、
 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、SnR₃、若しくはR₃であり、また、結合されたベンゼン環を有している次の構造、

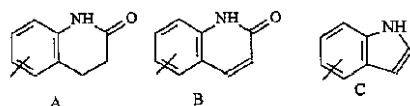


で示されるような縮合環システムであり、

Zは、NO₂、CN、COR、COOH、若しくはCONHRであり、

Yは、CF₃、F、Br、Cl、I、CN、若しくはSnR₃であり、

Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OH、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR；若しくは、ベンゼン環を有しベンゼン環に取着されているQは、次の構造A、B、若しくはCで示される縮合環システムであり、



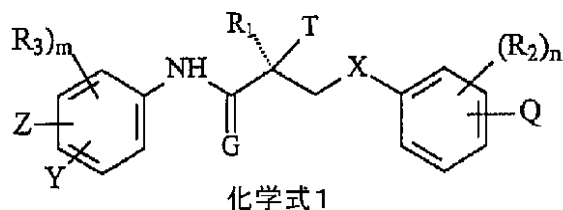
n は、1-4 の整数であり、また、

m は、1-3 の整数である。

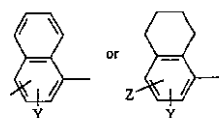
【請求項 2】

化学式 1 で示される選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子 (SARM)、若しくはその類似体、異性体、代謝産物、誘導体、薬剂的に認可されている塩、医薬品、N-酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせ。

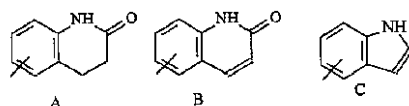
【化 1】



Xは、結合、O、CH₂、NH、S、Se、PR、NO、若しくはNRであり、
 Gは、O、若しくはSであり、
 TはOH、OR、 \cdot NHCOCH₃、若しくはNHCOR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、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、
 R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、
 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、SnR₃、若しくはR₃であり、また、結合されたベンゼン環を有している次の構造、



で示されるような縮合環システムであり、
 Zは、NO₂、CN、COR、COOH、若しくはCONHRであり、
 Yは、CF₃、F、Br、Cl、I、CN、若しくはSnR₃であり、
 Qは、H、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OH、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR；
 若しくは、ベンゼン環を有しベンゼン環に取着されているQは、次の構造A、B、若しくはCで示される縮合環システムであり、



n は、1-4 の整数であり、また、
 m は、1-3 の整数である。

【請求項 3】

ここでGがOであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 4】

ここでTがOHであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 5】

ここでR₁がCH₃であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 6】

ここでXがOであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 7】

ここでZがNO₂であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 8】

ここでZがCNであることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 9】

ここでYがCF₃であることを特徴とする請求項1に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 10】

ここで Q が NHCOCH_3 であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 11】

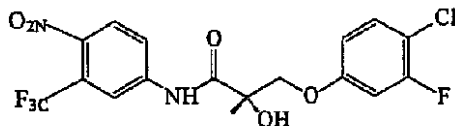
ここで Q が F であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 12】

ここで Q が F であり、 R_2 が Cl であることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 13】

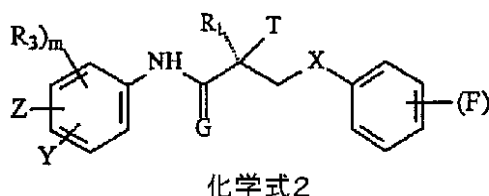
次の構造で示された請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。



【請求項 14】

化学式 2 の構造で示された請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【化 2】



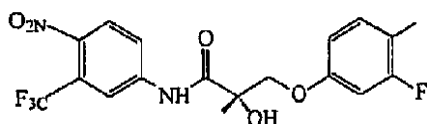
ここで、 p は 2 乃至 5 の整数である。

【請求項 15】

p が 5 であることを特徴とする請求項 14 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 16】

次の構造で示された請求項 14 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。



【請求項 17】

前記化合物がアンドロゲンレセプタアンタゴニストであることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 18】

前記化合物がアンドロゲンレセプタアゴニストであることを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 19】

前記化合物がアンドロゲンレセプタに不可逆的に結合することを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

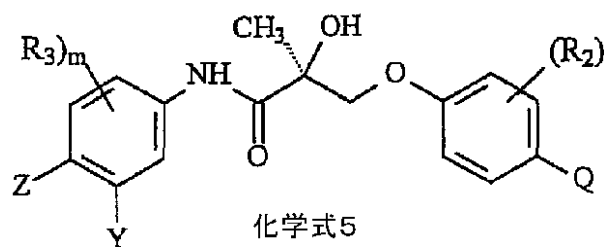
【請求項 20】

前記化合物がアンドロゲンレセプタに可逆的に結合することを特徴とする請求項 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 2 1】

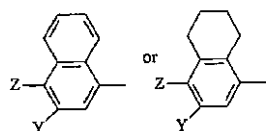
化学式 5 で示される選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子 (SARM)。

【化 5】



R_2 は、F、Cl、Br、I、 CH_3 、 CF_3 、OH、CN、 NO_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHICOR$ 、アルキル、アリルアルキル、OR、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、SR であり、

R_3 は、F、Cl、Br、I、CN、 NO_2 、COR、COOH、CONHR、 CF_3 、 SnR_3 、若しくは、結合されたベンゼン環を有している次の構造、



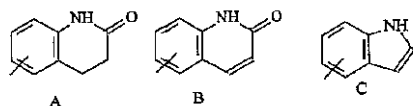
で示されるような縮合環システムであり、

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、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

Z は、 NO_2 、CN、COR、COOH、若しくは CONHR であり、

Y は、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、若しくは SnR_3 であり、

Q は、H、アルキル、ハロゲン、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 $NHCONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $OCONHR$ 、CONHR、 $NHCSCCH_3$ 、 $NHCSCF_3$ 、 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR；若しくは、ベンゼン環を有しベンゼン環に取着されているQは、次の構造A、B、若しくはCで示される縮合環システムであり、

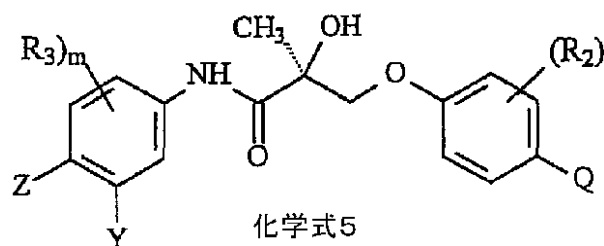


ここで、n は、1-4 の整数であり、また、m は、1-3 の整数である。

【請求項 2 2】

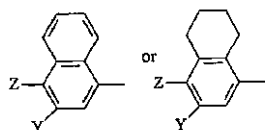
化学式 5 で示される選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子 (SARM)、若しくはその類似体、異性体、代謝産物、誘導体、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N-酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせ。

【化 5】



R_2 は、F、Cl、Br、I、 CH_3 、 CF_3 、OH、CN、 NO_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHICOR$ 、アルキル、アリールアルキル、OR、 NH_2 、 NHR 、 NR_2 、SR であり、

R_3 は、F、Cl、Br、I、CN、 NO_2 、COR、COOH、CONHR、 CF_3 、 SnR_3 、若しくは、結合されたベンゼン環を有している次の構造、



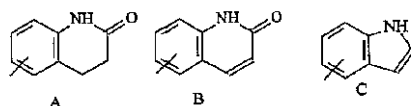
で示されるような縮合環システムであり、

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、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

Z は、 NO_2 、CN、COR、COOH、若しくは CONHR であり、

Y は、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、若しくは SnR_3 であり、

Q は、H、アルキル、ハロゲン、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 $NHCOCH_3$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOR$ 、 $NHCONHR$ 、 $NHCOOR$ 、 $OCONHR$ 、CONHR、 $NHCSCF_3$ 、 $NHCSR$ 、 $NHSO_2CH_3$ 、 $NHSO_2R$ 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR；若しくは、ベンゼン環を有しベンゼン環に取着されているQは、次の構造A、B、若しくはCで示される縮合環システムであり、



ここで、n は、1-4 の整数であり、また、
m は、1-3 の整数である。

【請求項 2 3】

ここで Z が NO_2 であることを特徴とする請求項 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 2 4】

ここで Z が CN であることを特徴とする請求項 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 2 5】

ここで Y が CF_3 であることを特徴とする請求項 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 2 6】

ここで Q が $NHCOCH_3$ であることを特徴とする請求項 2 1 に記載の選択的アンドロゲン

ンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 27】

ここで Q が F であることを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

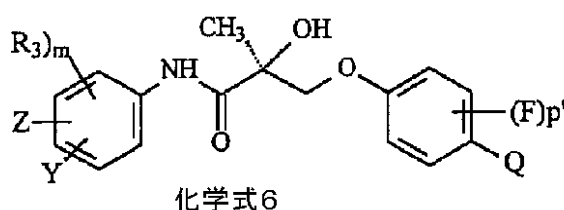
【請求項 28】

ここで Q が F であり、 R_2 が C1 であることを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 29】

化学式 6 の構造で示された請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【化 6】



ここで、 p' は 1 乃至 4 の整数である。

【請求項 30】

Q が F であり、 p' が 4 であることを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 31】

前記化合物がアンドロゲンレセプタアンタゴニストであることを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 32】

前記化合物がアンドロゲンレセプタアゴニストであることを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 33】

前記化合物がアンドロゲンレセプタに不可逆的に結合することを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 34】

前記化合物がアンドロゲンレセプタに可逆的に結合することを特徴とする請求項 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物。

【請求項 35】

請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせ、及び適切な担体及び希釈液を含む成分。

【請求項 36】

効果的な量の、請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせ、及び適切な担体及び希釈液を含む医薬品成分。

【請求項 37】

選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物を選択的アンドロゲンレセプタに結合させる方法であって、

結合に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせと、前記アンドロゲンレ

セプタとを接触させる過程を含む方法。

【請求項 38】

被験者における精子形成を抑制するための医薬を製造するための、精子形成抑制に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 39】

男性被験者における避妊のための医薬を製造するための、精子形成を抑制し、前記被験者の避妊に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 40】

ホルモン治療のための医薬を製造するための、アンドロゲン依存コンディションの変化に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 41】

ホルモン補充療法のための医薬を製造するための、アンドロゲン依存コンディションの変化に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 42】

ホルモン関連コンディションの被験者を治療するための医薬を製造するための、アンドロゲン依存コンディションの変化に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 43】

前立腺ガンに苦しむ被験者を治療するための医薬を製造するための、前記前立腺ガンの治療に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 44】

被験者における前立腺ガンを防止するための医薬を製造するための、前立腺ガン防止に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 45】

前立腺ガンに苦しむ被験者の前立腺ガン進行を遅延させるための医薬を製造するための、前記前立腺ガンの進行遅延に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 46】

前立腺ガンに苦しむ被験者の前立腺ガン再発を防止するための医薬を製造するための、前記前立腺ガンの再発防止に効果的な量の請求項 1 若しくは 21 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 47】

前立腺ガンに苦しむ被験者の前立腺ガン再発を治療するための医薬を製造するための、前記前立腺ガンの再発の治療に効果的な量の請求項 1 若しくは 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導體、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

【請求項 48】

ドライアイに苦しむ被験者のドライアイコンディションの治療のための医薬を製造するための、ドライアイの治療に効果的な量の請求項 1 若しくは 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導體、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

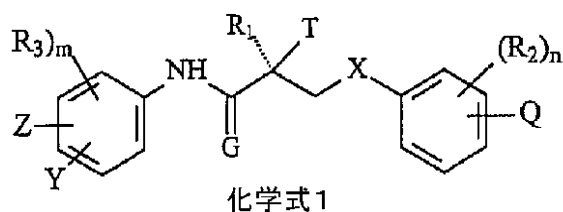
【請求項 49】

被験者のドライアイコンディションの防止のための医薬を製造するための、ドライアイの防止に効果的な量の請求項 1 若しくは 2 1 に記載の選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物、及び / 又はその類似体、誘導體、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N - 酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせの使用。

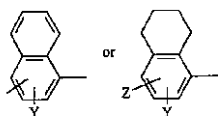
【請求項 50】

化学式 1 の構造によって示された選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子 (SARM) 化合物を調製するプロセス。

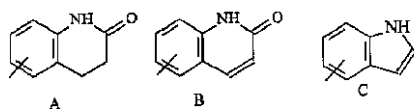
【化 1】



X は、O、NH、S、Se、PR、若しくは NR であり、
 G は、O、若しくは S であり、
 T は OH、OR、 -NHCOCIL_3 、若しくは NHCOR 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、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、
 R_1 は、 CH_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2CH_3 、若しくは CF_2CF_3 であり、
 R_2 は、F、Cl、Br、I、 CH_3 、 CF_3 、OH、CN、 NO_2 、 NHCOCCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、アルキル、アリルアルキル、OR、 NH_2 、NHR、 NR_2 、SR であり、
 R_3 は、F、Cl、Br、I、CN、 NO_2 、COR、COOH、CONHR、 CF_3 、 SnR_3 、若しくは R_3 であり、また、結合されたベンゼン環を有している次の構造、

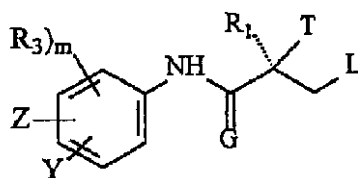


で示されるような縮合環システムであり、
 Z は、 NO_2 、CN、COR、COOH、若しくは CONHR であり、
 Y は、 CF_3 、F、Br、Cl、I、CN、若しくは SnR_3 であり、
 Q は、H、アルキル、ハロゲン、 CF_3 、CN、 CR_3 、 SnR_3 、 NR_2 、 NHCOCCH_3 、 NHCOCF_3 、 NHCOR 、 NHCONHR 、 NHCOOR 、 OCONHR 、CONHR、 NHCSCCH_3 、 NHCSCF_3 、 NHCSR 、 NHSO_2CH_3 、 NHSO_2R 、OH、OR、COR、OCOR、 OSO_2R 、 SO_2R 、SR；
 若しくは、ベンゼン環を有しベンゼン環に取替されている Q は、次の構造 A、B、若しくは C で示される縮合環システムであり、



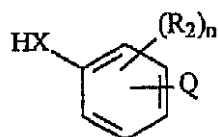
n は、1-4 の整数であり、また、
 m は、1-3 の整数である。

前記プロセスは、Z、Y、G、 R_1 、T、 R_3 、及び m が上で定義され、また L が脱離基である化学式 7 の化合物、



化学式 7

と、Q、 XR_2 及び n が上で定義されている化学式 8 の化合物、



化学式 8

とをカップリングさせる過程を含んでいる。

【請求項 5 1】

ここで G が O であることを特徴とする請求項 5 0 に記載のプロセス。

【請求項 5 2】

ここでTがOHであることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項53】

ここでR₁がCH₃であることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項54】

ここでXがOであることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項55】

ここでZがNO₂であることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項56】

ここでZがCNであることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項57】

ここでYがCF₃であることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項58】

ここでQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項59】

ここでQがFであることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

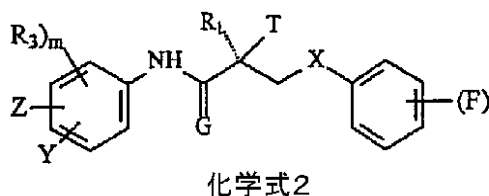
【請求項60】

ここでQがFであり、R₂がCl₃であることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項61】

前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物が、化学式2の構造によって示されることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【化2】

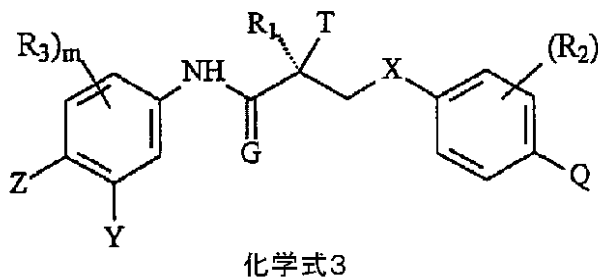


ここで、pは2乃至5の整数である。

【請求項62】

前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物が、化学式3の構造によって示されることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

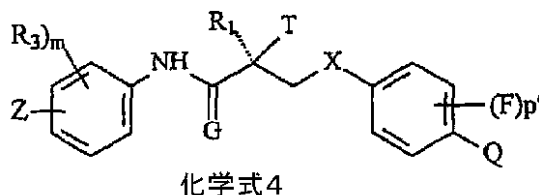
【化3】



【請求項63】

前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物が、化学式4の構造によって示されることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【化 4】

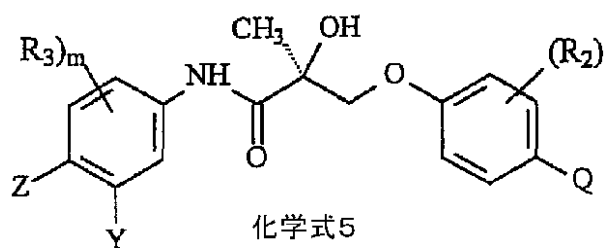


ここで、 p' は 1 乃至 4 の整数である。

【請求項 6 4】

前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物が、化学式 5 の構造によって示されることを特徴とする請求項 5 0 に記載のプロセス。

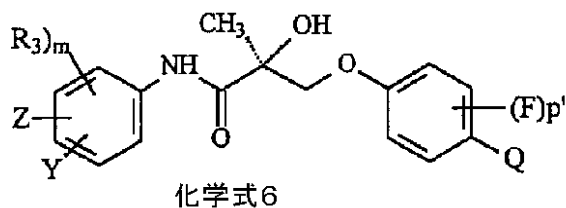
【化 5】



【請求項 6 5】

前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子化合物が、化学式 6 の構造によって示されることを特徴とする請求項 5 0 に記載のプロセス。

【化 6】



ここで、 p' は 1 乃至 4 の整数である。

【請求項 6 6】

前記カップリング過程が、塩基存在下で実行されることを特徴とする請求項 5 0 に記載のプロセス。

【請求項 6 7】

前記脱離基 L が、Br であることを特徴とする請求項 5 0 に記載のプロセス。

【請求項 6 8】

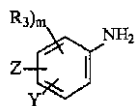
化学式 7 の前記化合物が、次の過程、

i) 化学式10の環状化合物を開環することによる、化学式9の化合物の調製が、次のように実行され



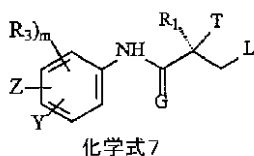
ここで、L、R₁、G、及びTが上で定義されており、T₁はO若しくはNHであり、また、

ii) カップリング薬剤存在下で、Z、Y、R₃、及びmが上で定義されている化学式11のアミン、



化学式11

と、化学式9の化合物とを反応させて、化学式7の化合物、



を生成する。

で、調製されることを特徴とする請求項50に記載のプロセス。

【請求項69】

さらに、前記選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)化合物を、その類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、N-酸化物、水和物、若しくはいずれかの組み合わせへと変換する過程を含むことを特徴とする請求項50に記載のプロセス。