

【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24年10月11日(2012.10.11)

【公表番号】特表2012-500778(P2012-500778A)

【公表日】平成24年1月12日(2012.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2012-002

【出願番号】特願2011-523280(P2011-523280)

【国際特許分類】

C 07 D 207/38 (2006.01)

A 61 K 31/4015 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 P 5/28 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 17/10 (2006.01)

A 61 P 17/14 (2006.01)

C 12 P 17/12 (2006.01)

【F I】

C 07 D 207/38

A 61 K 31/4015

A 61 K 37/02

A 61 P 5/28

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 P 27/02

A 61 P 15/00

A 61 P 17/10

A 61 P 17/14

C 12 P 17/12

【手続補正書】

【提出日】平成24年8月24日(2012.8.24)

【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

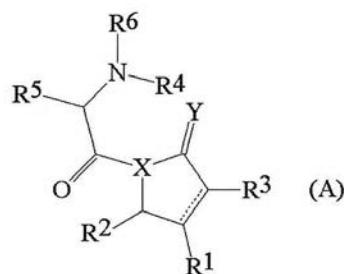
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(A) :

【化1】



[式中、

Xは、CまたはNであり；

Yは、OまたはSであり；

R¹は、H、OH、J、OJ、SJ、またはNJJ'であり、式中JまたはJ'は、炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、非芳香族環式、または芳香族もしくは部分的に芳香族の環式の、飽和または不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、COOR、CONH₂、CONHR、CONR₂、R、OH、OR、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR、NR₂、CN、SH、SR、S₀H、SO₃R、SO₂R、OSO₃R、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは、直鎖状または分枝状の、飽和および非置換のC₁～C₁₀アルキルであり；

R²は、H、もしくはプロリンおよびフェニルアラニン以外のアミノ酸の側鎖であるか、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、COOR、CO NH₂、CONHR、CONR₂、R、OH、OR、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR、NR₂、CN、SH、SR、S₀H、SO₃R、OSO₃R、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは、直鎖状または分枝状の、飽和および非置換のC₁～C₁₀アルキルであり；

R³は、H、OH、OG、NGG'、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、もしくは芳香族もしくは部分的に芳香族の環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、式中GおよびG'は、炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、非芳香族環式、または芳香族もしくは部分的に芳香族の環式の、飽和または不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、COOR、CONH₂、CONHR、CONR₂、R、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、S₀H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは、非置換C₁～C₁₀アルキルであり；

R⁴およびR⁶は独立して、H、もしくはプロリン以外のアミノ酸の側鎖、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、芳香族もしくは部分的に芳香族の環式、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基からなる群から選択され、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、OR、R、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR、NR₂、CN、SH、SR、S₀H、SO₃R、SO₂R、OSO₃R、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは、非置換C₁～C₁₀アルキルであり（ただし、R⁴およびR⁶が共にHであることはなく、かつR⁴およびR⁶はいずれも

【化2】



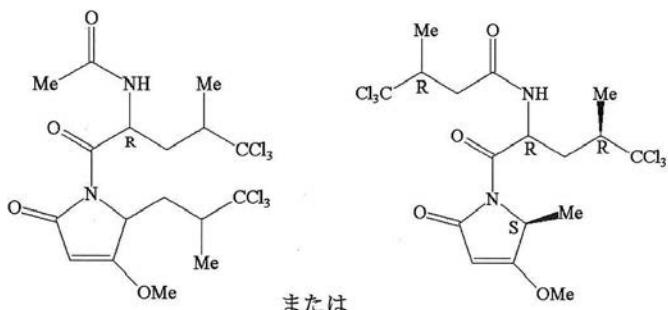
ではない）；

R⁵は、H、もしくはプロリンおよびフェニルアラニン以外のアミノ酸の側鎖、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、CONH₂、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、S₀H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され；

【化3】

は単結合または二重結合である]の化合物(ただし、該化合物は、

【化4】

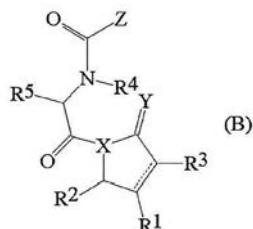


ではない)またはその塩。

【請求項2】

式(B) :

【化5】



[式中、

Xは、CまたはNであり;

Yは、OまたはSであり;

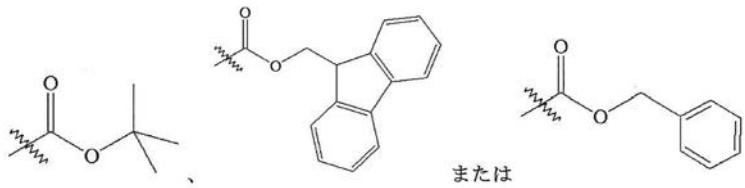
R¹は、H、OH、J、OJ、SJ、またはNJJ'であり、式中JまたはJ'は、炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、非芳香族環式、または芳香族環式の、飽和または不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、C N、SH、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され;

R²は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、R、OH、OR、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR、NR₂、CN、SH、SR、SO₃H、SO₃R、SO₂R、OSO₃R、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは、直鎖状または分枝状の、飽和および非置換のC1~C10アルキルであり;

R³は、H、OH、OG、NGG'、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、式中GおよびG'は、炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、または非芳香族環式の、飽和または不飽和のアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され;

R⁴は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、芳香族環式、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、OR、R、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR、NR₂、CN、SH、SR、SO₃H、SO₃R、SO₂R、OSO₃R、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中Rは非置換C₁~C₁₀アルキルであり(ただし、R⁴は、

【化6】



ではない) ;

R^5 は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され；

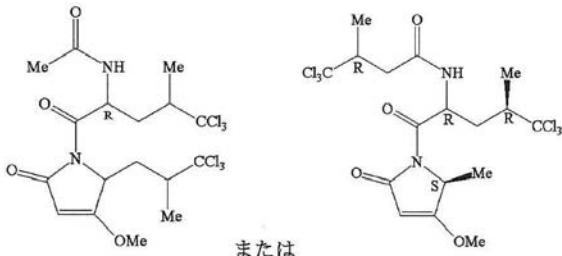
Z は、任意に置換されたBu、Pr、Et、またはMeであり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択され；

【化7】

は単結合または二重結合である]

の化合物(ただし、該化合物は、

【化8】



ではない)、またはその塩。

【請求項3】

R^3 が、H、OH、OG、または炭素数1~10の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、式中Gが、炭素数1~10の、直鎖状または分枝状の、飽和または不飽和のアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択される、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R^3 が、H、OH、OBu、OPr、OEt、またはOMeである、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R^1 が、H、OH、J、またはOJであり、式中Jが、炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、非芳香族環式、または芳香族環式の、飽和または不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、およびNO₂のうちの1個以上から選択される、請求項1~4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R^1 が、H、OH、J、またはOJであり、式中Jが、炭素数1~4の、直鎖状または分枝状の、飽和または不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、およびNH₂のうちの1個以上から選択される、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 が、H、OH、OBu、OPr、OEt、OMe、Bu、Pr、Et、またはMeである、請求項1~6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R^1 がOMeである、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

【化9】

が二重結合である、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

R^2 が、H、または炭素数1～10の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、およびNO₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

R^2 が、H、または炭素数1～4の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和の任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、OH、F、Cl、Br、I、およびNH₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

R^4 が、H、または炭素数1～10の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SH、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

R^4 が、H、または炭素数1～4の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和の任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、OH、F、Cl、Br、I、およびNH₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項14】

R^5 が、H、または炭素数1～10の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項15】

R^5 が、H、または炭素数1～4の、直鎖状もしくは分枝状の、飽和の任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基が、オキソ、OH、F、Cl、Br、I、およびNH₂のうちの1個以上から選択される、請求項1～14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項16】

XがNである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項17】

YがOである、請求項1～16のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項18】

Zが、任意に置換されたBu、Pr、Et、またはMeであり、その任意の置換基が、オキソ、OH、F、Cl、Br、およびIのうちの1個以上から選択される、請求項2～17のいずれか1項に記載の化合物。

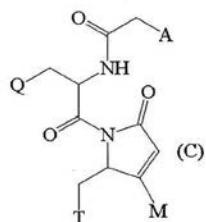
【請求項19】

Zが、任意に置換されたBu、Pr、Et、またはMeであり、その任意の置換基が、F、Cl、Br、およびIのうちの1個以上から選択される、請求項2～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

式(C)：

【化10】



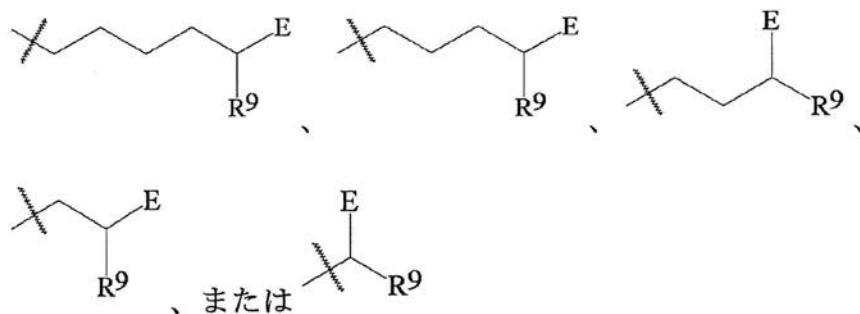
[式中、

Aは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Mは、H、OH、OBu、OPr、OEt、OMe、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Tは、

【化11】

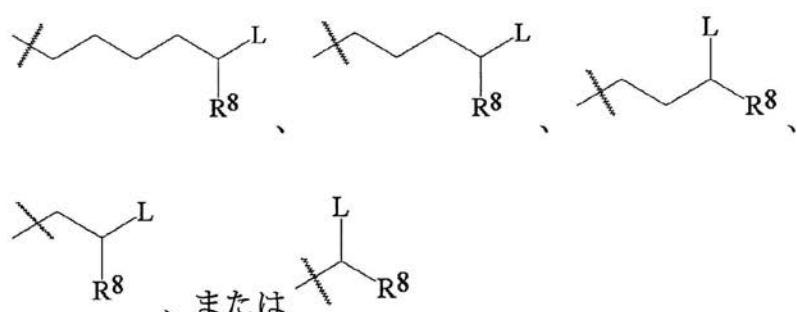


であり；

Eは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Qは、

【化12】



であり；

Lは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

R8は、Cl3C、Cl2HC、ClH2C、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

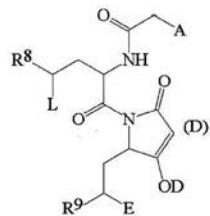
R9は、Cl3C、Cl2HC、ClH2C、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

ここで、A、T、E、Q、およびLは、任意に置換されており、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択される]の化合物、またはその塩。

【請求項21】

式(D)：

【化13】



[式中、

Aは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Dは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Eは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

Lは、Bu、Pr、Et、またはMeであり；

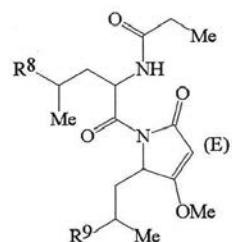
R⁸は、Cl₃C、Cl₂HC、ClH₂C、Bu、Pr、Et、またはMeであり；R⁹は、Cl₃C、Cl₂HC、ClH₂C、Bu、Pr、Et、またはMeである]

の化合物、またはその塩。

【請求項22】

式(E)：

【化14】



[式中、

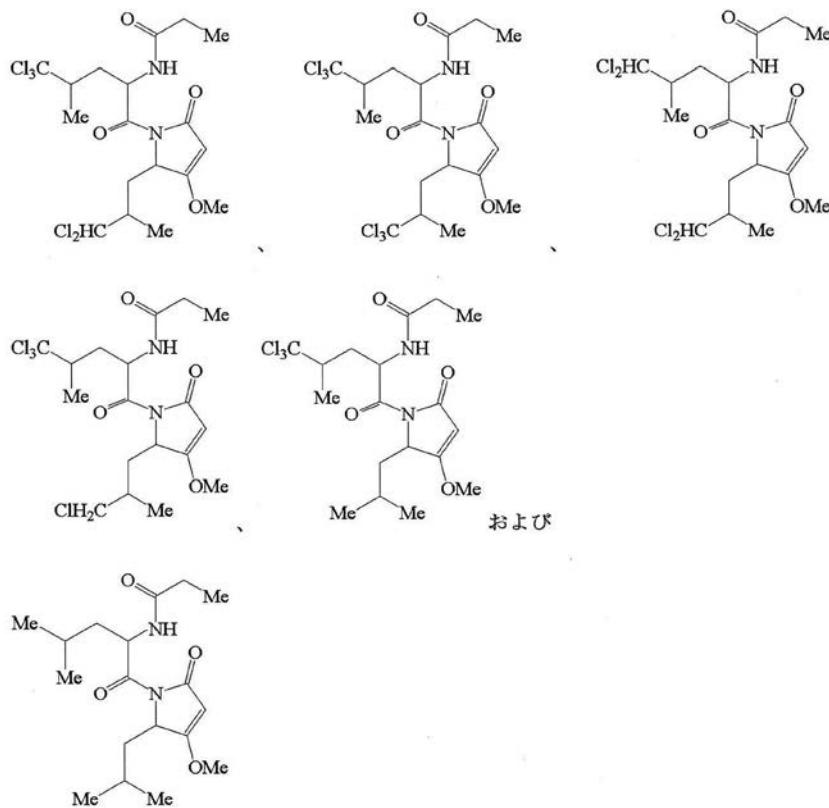
R⁸は、Cl₃C、Cl₂HC、ClH₂C、Et、またはMeであり；R⁹は、Cl₃C、Cl₂HC、ClH₂C、Et、またはMeである]

の化合物またはその塩。

【請求項23】

下記：

【化15】

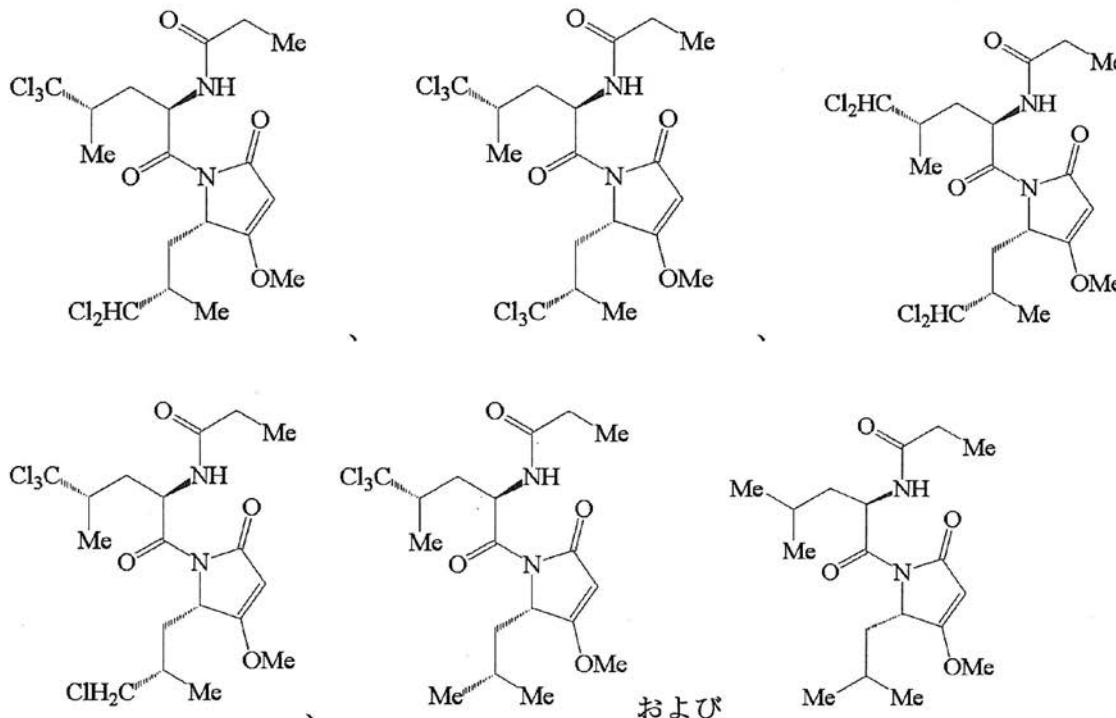


の1つ以上から選択される、化合物またはその塩。

【請求項24】

下記：

【化16】



の1つ以上から選択される、化合物またはその塩。

【請求項25】

アンドロゲン受容体(AR)の活性を調節するために使用する医薬の製造における、請求

項1～24に記載された化合物またはその塩。

【請求項26】

アンドロゲン受容体(AR)の活性を調節するための、請求項1～24に記載された化合物またはその塩。

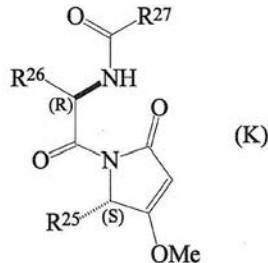
【請求項27】

請求項1～24に記載されたいずれか1種の化合物またはその塩、および薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項28】

式(K)：

【化17】



[式中、

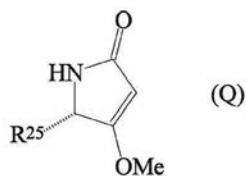
R^{25} は、H、もしくはプロリンおよびフェニルアラニン以外のアミノ酸の側鎖、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、COOR'、CONH₂、C₁～C₁₀の、直鎖状または分枝状の、飽和および非置換のアルキルであり；

R^{26} は、H、もしくはプロリンおよびフェニルアラニン以外のアミノ酸の側鎖、または炭素数1～10の、直鎖状、分枝状、もしくは非芳香族環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、CONH₂、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR'、NR'、CN、SH、SR'、SO₃H、SO₃R'、SO₂R'、OSO₃R'、およびNO₂のうちの1個以上から選択され；

R^{27} は、任意に置換されたBu、Pr、Et、またはMeであり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、SO₃H、およびNO₂のうちの1個以上から選択される]の化合物の製造方法であって、

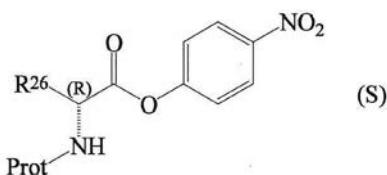
式(Q)：

【化18】



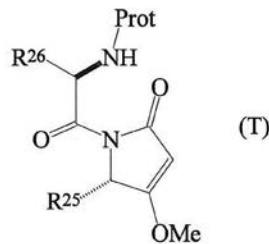
(式中 R^{25} は上で定義した通りである)の化合物をn-BuLiと混合して、混合物を形成すること、および該混合物を式(S)：

【化19】



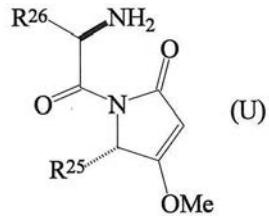
(式中 R^{26} は上で定義した通りであり、Protは保護基である)の化合物と反応させて、式(T)：

【化 2 0】



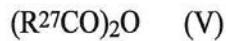
(式中R²⁵、R²⁶、およびProtは、上で定義した通りである)の化合物を形成すること;
式(T)の化合物を脱保護して、式(U):

【化 2 1】



(式中R²⁵およびR²⁶は上で定義した通りである)の化合物を形成すること;ならびに
式(U)の化合物をピリジン中で式(V):

【化 2 2】



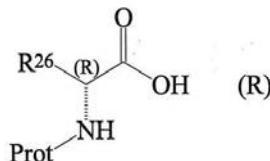
(式中R²⁷は上で定義した通りである)の化合物と反応させて、式(K)の化合物を形成す
ること

を含む、方法。

【請求項 2 9】

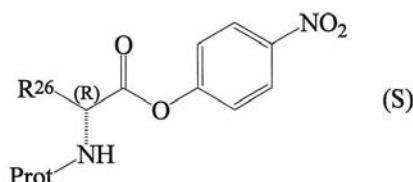
式(R):

【化 2 3】



(式中R²⁶およびProtは請求項2 8で定義した通りである)の化合物を任意の順序で、p-
ニトロフェノール、およびカルボジイミド含有化合物と混合して、式(S):

【化 2 4】

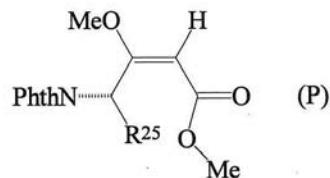


(式中R²⁶およびProtは請求項2 8で定義した通りである)の化合物を形成することをさ
らに含む、請求項2 8に記載の方法。

【請求項 3 0】

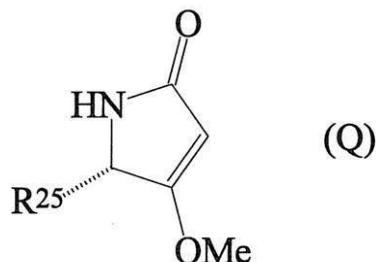
式(P):

【化25】



(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を、MeOH中でヒドラジン一水和物と反応させて、式(Q):

【化26】

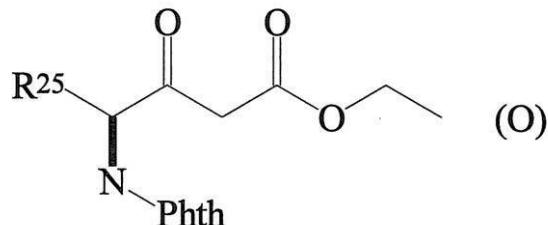


(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を形成することをさらに含む、請求項2_8または2_9に記載の方法。

【請求項31】

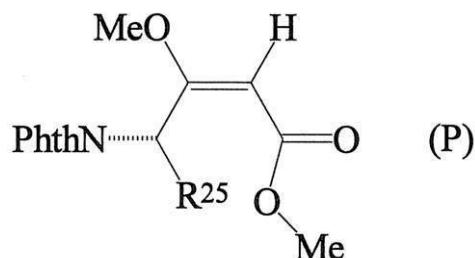
式(O):

【化27】



(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を、触媒としての濃H₂SO₄の存在下で、MeOH中、オルトギ酸トリメチルと反応させて、式(P):

【化28】

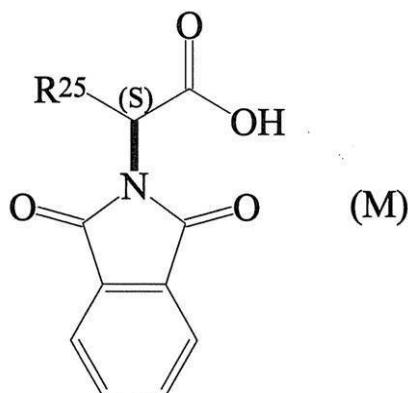


(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を形成することをさらに含む、請求項3_0に記載の方法。

【請求項32】

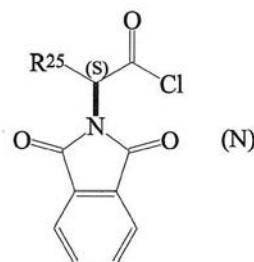
式(M):

【化 2 9】



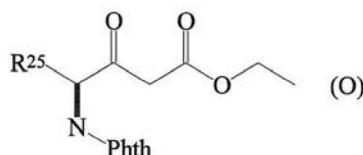
(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を、塩素化剤と反応させて、式(N)：

【化 3 0】



(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を形成すること；および式(N)の化合物を、マロン酸モノエチルとアルキルリチウム化合物とを混合することによって形成された懸濁液と反応させて、式(O)：

【化 3 1】

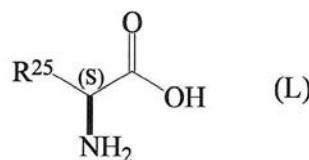


(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を形成することをさらに含む、請求項3_1に記載の方法。

【請求項3_3】

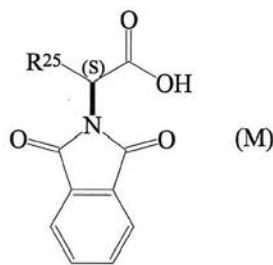
式(L)：

【化 3 2】



(式中R²⁵は請求項2_8で定義した通りである)の化合物を、Na₂CO₃およびH₂Oの存在下、室温で、N-カルボエトキシフタルイミドと反応させて、式(M)：

【化33】

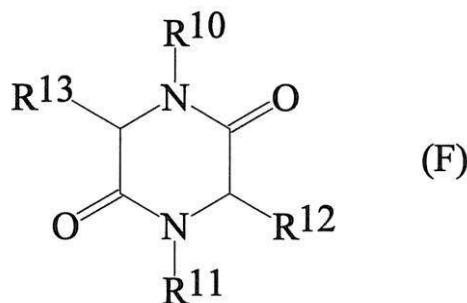


(式中R²⁵は請求項28で定義した通りである)の化合物を形成することをさらに含む、請求項32に記載の方法。

【請求項34】

アンドロゲン受容体(AR)の活性を調節するための式(F)：

【化34】



[式中、

R¹⁰は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、R¹⁴、OH、OR¹⁴、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR¹⁴₂、CN、SH、SR¹⁴、SO₃H、SO₃R¹⁴、SO₂R¹⁴、OSO₃R¹⁴、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中R¹⁴は、非置換C₁~C₁₀の、直鎖状、分枝状、または環式の、飽和または不飽和のアルキル基であり；

R¹¹は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、R¹⁵、OH、OR¹⁵、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR¹⁵₂、CN、SH、SR¹⁵、SO₃H、SO₃R¹⁵、SO₂R¹⁵、OSO₃R¹⁵、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中R¹⁵は、非置換C₁~C₁₀の、直鎖状、分枝状、または環式の、飽和または不飽和のアルキル基であり；

R¹²は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、R¹⁶、OH、OR¹⁶、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR¹⁶₂、CN、SH、SR¹⁶、SO₃H、SO₃R¹⁶、SO₂R¹⁶、OSO₃R¹⁶、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中R¹⁶は、非置換C₁~C₁₀の、直鎖状、分枝状、または環式の、飽和または不飽和のアルキル基であり；

R¹³は、H、または炭素数1~10の、直鎖状、分枝状、もしくは環式の、飽和もしくは不飽和の、任意に置換されたアルキル基であり、その任意の置換基は、オキソ、COOH、R¹⁷、OH、OR¹⁷、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR¹⁷₂、NR¹⁷₂、CN、SH、SR¹⁷、SO₃H、SO₃R¹⁷、SO₂R¹⁷、OSO₃R¹⁷、およびNO₂のうちの1個以上から選択され、式中R¹⁷は、非置換C₁~C₁₀の、直鎖状、分枝状、または環式の、飽和または不飽和のアルキル基である]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項35】

R¹⁰およびR¹¹がそれぞれ独立してHまたは非置換C₁~C₁₀アルキルである、請求項34に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項36】

R¹²が、-CH₂-CH(CH₃)CH₃；-CH₂-CH(CR¹⁸₃)CH₃；-CH₂-CH(CH₂R¹⁸₂)CH₃；-CH₂-CH(CH₂R¹⁸)

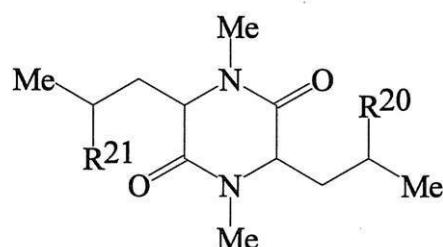
CH_3 ; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CH}_2\text{R}^{18}$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CHR}^{18}_2)\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CHR}^{18}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{18}_3)\text{CR}^{18}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{18}_2)\text{CR}^{18}_3$; または $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{18})\text{CR}^{18}_3$ であり (式中 R^{18} は、F、Cl、Br、またはIである) ;

R^{13} が、 $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CH}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CR}^{19}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CH}_2\text{R}^{19}$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CHR}^{19}_2)\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CHR}^{19}_2$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{19}_3)\text{CR}^{19}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CR}^{19}_2)\text{CR}^{19}_3$; または $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{R}^{19})\text{CR}^{19}_3$ である (式中 R^{19} は、F、Cl、Br、またはIである)、請求項34または35に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項37】

アンドロゲン受容体(AR)の活性を調節するための、式：

【化35】

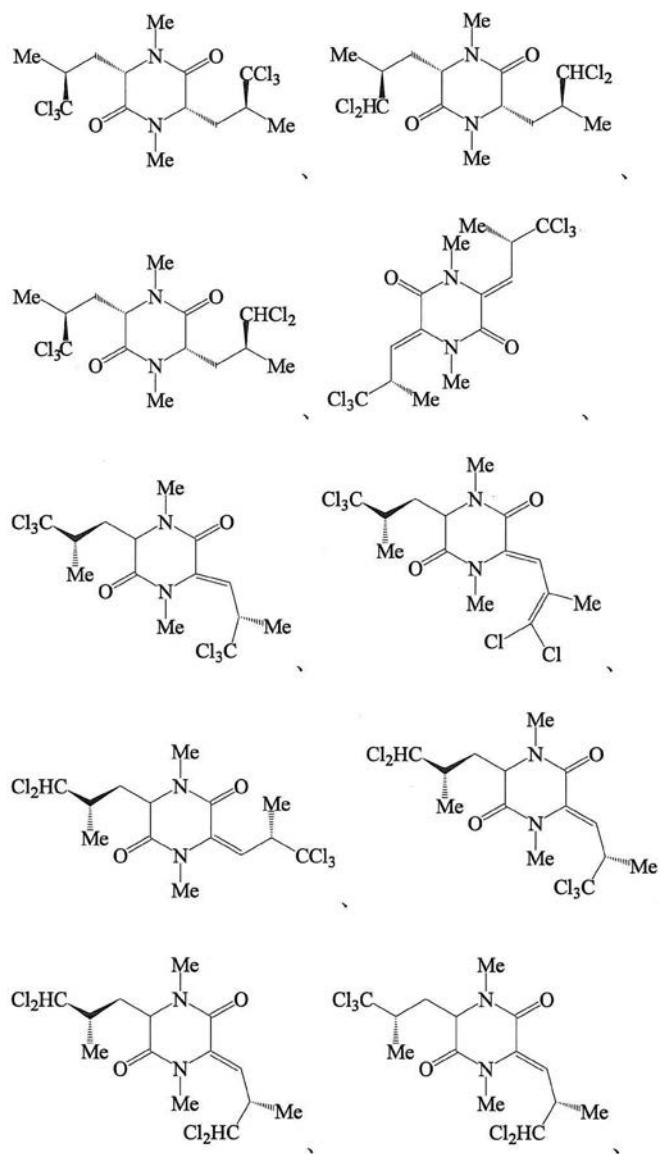


(式中 R^{20} および R^{21} はそれぞれ独立して CCl_3 または CHCl_2 である) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

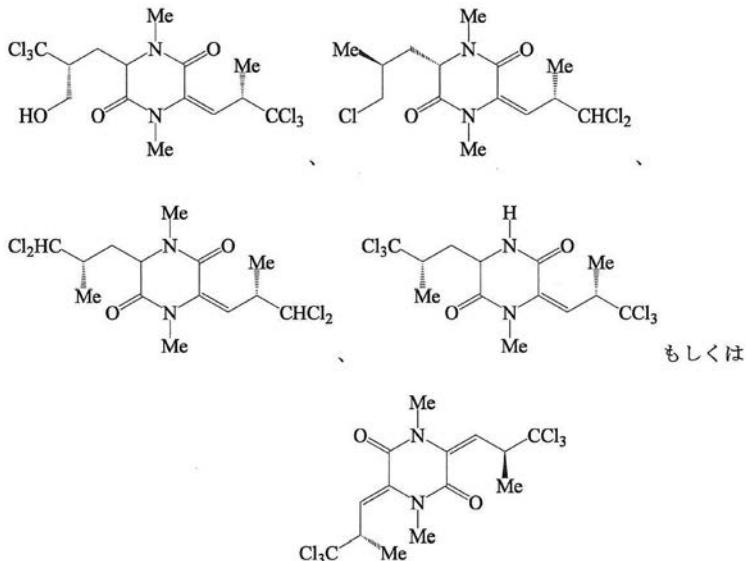
【請求項38】

アンドロゲン受容体(AR)の活性を調節するための、式：

【化36-1】



【化36-2】

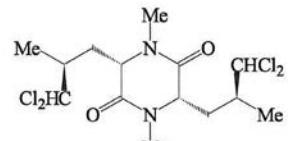
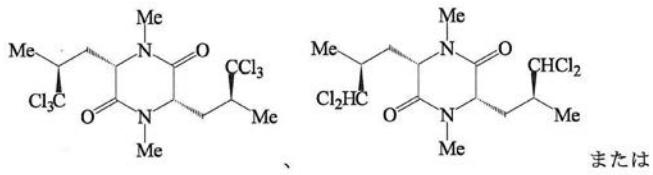


の化合物またはその薬学的に許容される塩。

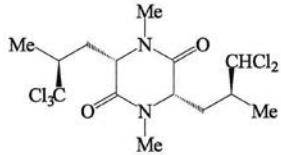
【請求項 3 9】

アンドロゲン受容体 (AR) の活性を調節するための、式：

【化 3 7】



または



の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 0】

ARの活性の調節がヒト細胞におけるものである、請求項3 4 ~ 3 9のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 1】

ARの活性の調節が、ARのN末端領域 (NTD) の活性を阻害するためのものである、請求項3 4 ~ 4 0のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 2】

ARの活性の調節が、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣囊胞、多囊胞性卵巣疾患、思春期早発症、または加齢性黄斑変性症の予防または治療のためのものである、請求項3 4 ~ 4 1のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 3】

ARの活性の調節が、前立腺癌の予防または治療のためのものである、請求項4 2に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 4】

前立腺癌がアンドロゲン非依存性前立腺癌である、請求項4 3に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 5】

前立腺癌がアンドロゲン依存性前立腺癌である、請求項4 3に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。