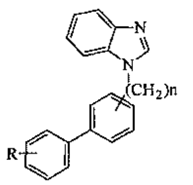
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成29年3月30日(2017.3.30)

【公表番号】特表2016-515630(P2016-515630A)
【公表日】平成28年5月30日(2016.5.30)
【年通号数】公開・登録公報2016-033
【出願番号】特願2016-506667(P2016-506667)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 235/06 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4184 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/10 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4725 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/08 (2006.01)
Ｃ０７Ｊ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/58 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 235/06 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/4184
Ｃ０７Ｄ 403/10
Ｃ０７Ｄ 403/12
Ｃ０７Ｄ 401/10
Ａ６１Ｋ 31/4725
Ｃ０７Ｄ 401/14
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 13/08
Ｃ０７Ｊ 43/00
Ａ６１Ｋ 31/58

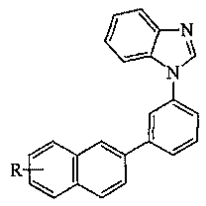
【手続補正書】
【提出日】平成29年2月22日(2017.2.22)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
ガン治療用薬剤の製造のための化合物の使用方法であって、当該化合物が以下の化合物群から選択される方法：
３β－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５，１６－ジエン（ＶＮＰＰ４３３－３β（Ａ１））
３β－（ピリジン－４－イルメトキシ）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５，１６－ジエン（ＶＮＰＰ４１４（Ａ１６））
６－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）ナフタレン－２－オール（ＶＮＰＰ３７２／２（Ｎａ１））および

　Ｎ－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）［（４－メトキシフェニル）スルホニル］アミン（ＶＮＰＰ４３１（ＳｕｌＡｍｄ２））。
【請求項２】
　前記ガンが、前立腺ガン、去勢抵抗性前立腺ガン、膀胱ガン、膵臓ガン、肝細胞ガン、良性前立腺過形成（ＢＰＨ）、ケネディー病、アンドロゲン性脱毛症、乳ガン、アンドロゲン不応症、および球脊髄性筋萎縮症である、請求項１に記載の方法。
【請求項３】
　前記ガンが前立腺ガンである、請求項１に記載の方法。
【請求項４】
　前記ガンが去勢抵抗性ヒト前立腺ガンである、請求項１に記載の方法。
【請求項５】
　全長アンドロゲン受容体またはスプライス変異体アンドロゲン受容体分解用薬剤の製造のための化合物の使用方法であって、当該化合物が以下の化合物群から選択される方法：
　３β－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５，１６－ジエン（ＶＮＰＰ４３３－３β（Ａ１））
　３β－（ピリジン－４－イルメトキシ）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５，１６－ジエン（ＶＮＰＰ４１４（Ａ１６））
　６－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）ナフタレン－２－オール（ＶＮＰＰ３７２／２（Ｎａ１））および
　Ｎ－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）［（４－メトキシフェニル）スルホニル］アミン（ＶＮＰＰ４３１（ＳｕｌＡｍｄ２））。
【請求項６】
　アンドロゲン感受性細胞株の増殖阻害用薬剤の製造のための化合物の使用方法であって、当該化合物が以下の化合物群から選択される方法：
　３β－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５,１６－ジエン（ＶＮＰＰ４３３－３β（Ａ１））
　３β－（ピリジン－４－イルメトキシ）－１７－（１Ｈ－ベンズイミダゾール－１－イル）アンドロスタ－５，１６－ジエン（ＶＮＰＰ４１４（Ａ１６）
　６－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）ナフタレン－２－オール（ＶＮＰＰ３７２／２（Ｎａ１））および
　Ｎ－（３－ベンズイミダゾリルフェニル）［（４－メトキシフェニル）スルホニル］アミン（ＶＮＰＰ４３１（ＳｕｌＡｍｄ２））。
【請求項７】
　以下から成る群より選択される少なくとも１種の化合物と、薬学的に受容されるキャリアまたは賦形剤とを含む、薬学的組成物：
　構造式Ｂ
【化１】


B
n = 0 又は 1 又は 2

　ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ(Ｒ’)２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；
　構造式Ｎａ

【化２】

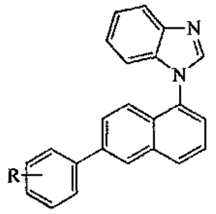


Na

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ(Ｒ’)２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ｎｂ

【化３】

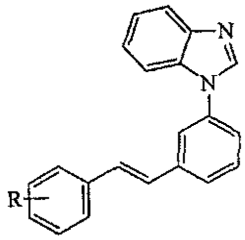


Nb

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ｓ

【化４】

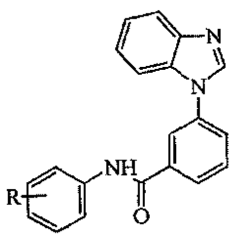


S

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ａｍｄ－ａ

【化５】

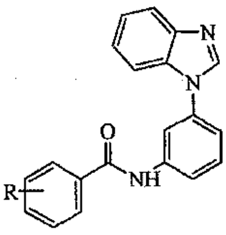


Amd-a

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ａｍｄ－ｂ

【化６】

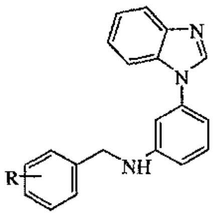


Amd-b

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ａｍ－ａ

【化７】

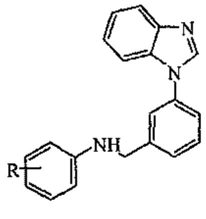


Am-a

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式Ａｍ－ｂ

【化２８】

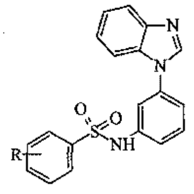


Am-b

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

構造式ＳｕｌＡｍｄ

【化９】

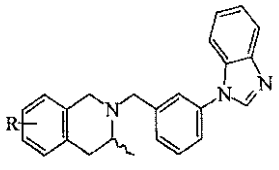


SulAmd

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；ならびに

構造式Ｑ

【化１０】



Q

ここでＲは、－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＲ’、－Ｎ（Ｒ’）２－、－ＳＨ、－ＯＭｅ、－ＣＮ、－ＣＯＯＨ、－ＣＯＯＭｅ、－ＣＯＯＥｔ、イミダゾール、１Ｈ－テトラゾール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される１または２置換基を表し、ここで各Ｒ’は、アルキルまたはアリールから独立して選択される；

【請求項８】

ガン治療用薬剤の製造のための請求項５０に記載の薬学的組成物の使用方法。

【請求項９】

前記ガンが、前立腺ガン、去勢抵抗性前立腺ガン、膀胱ガン、膵臓ガン、肝細胞ガン、良性前立腺過形成（ＢＰＨ）、ケネディー病、アンドロゲン性脱毛症、乳ガン、アンドロゲン不応症、および球脊髄性筋萎縮症である、請求項８に記載の方法。

【請求項１０】

前記ガンが前立腺ガンである、請求項８に記載の方法。

【請求項１１】

前記ガンが去勢抵抗性ヒト前立腺ガンである、請求項８に記載の方法。

【請求項１２】

全長アンドロゲン受容体またはスプライス変異体アンドロゲン受容体分解用薬剤の製造のための請求項７に記載の薬学的組成物の使用方法。

【請求項１３】

アンドロゲン感受性細胞株の増殖阻害用薬剤の製造のための請求項７に記載の薬学的組成物の使用方法。