

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-516002(P2005-516002A)

【公表日】平成17年6月2日(2005.6.2)

【年通号数】公開・登録公報2005-021

【出願番号】特願2003-550726(P2003-550726)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	31/275	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	39/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/167	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	31/275	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/00	1 0 1
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	39/02	

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月29日(2005.8.29)

【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】

筋萎縮障害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、選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)化合物の使用。

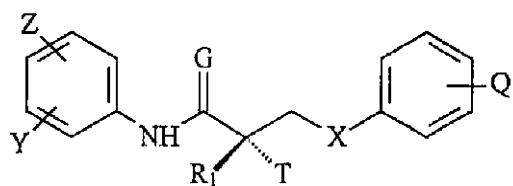
【請求項2】

前記医薬は、前記SARM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、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むことを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【請求項3】

前記SARM化合物が次の化学式1の構造で示されることを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【化1】



構造式I

ここで、

Gは、O若しくはSであり、

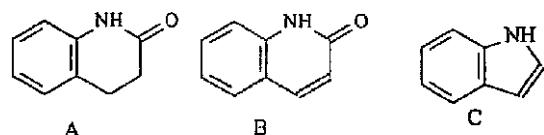
Xは、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

Tは、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

Zは、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Yは、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Qは、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C、



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、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である。

【請求項4】

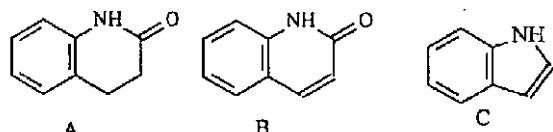
前記SARM化合物が次の化学式2の構造で示されることを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【化2】



ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、
T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、
Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、
NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C。



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、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である。

【請求項5】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項6】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項7】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項8】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項9】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項10】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項11】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項12】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項4に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 1 3】

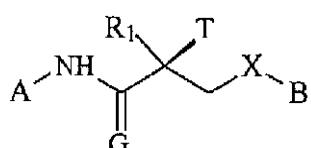
ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項4に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 1 4】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOC₃であることを特徴とする請求項4に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 1 5】

前記S A R M化合物が次の化学式3の構造で示されることを特徴とする請求項1に記載のS A R M化合物の使用。

【化 3】

構造式III

ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

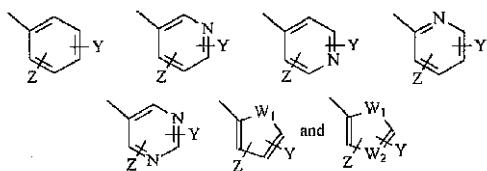
G は、O 若しくは S であり、

R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

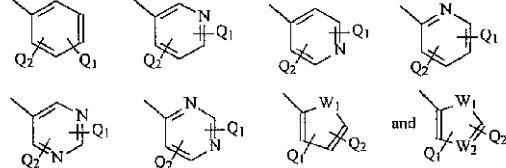
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

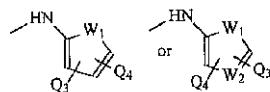


から選択され、ここでは A 及び B が同時にベンゼン環であってはならない。

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q₁ and Q₂ は、各々、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、



より選択される。

Q₃ and Q₄ は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

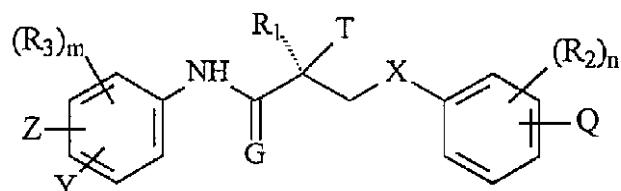
W は O、NH、NR、NO、若しくはS であり、

W₂は、N 若しくはNO である。

【請求項 1 6】

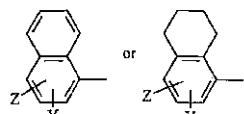
前記 S A R M 化合物が次の化学式 4 の構造で示されることを特徴とする請求項 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化4】



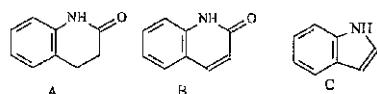
構造式IV

X は、結合、O、CH₂、NH、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、NHCOC₃、若しくはNHCOR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、NHCOC₃、NHCOCF、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、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
 Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
 Q は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、NHCOCF₃、
 NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
 NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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、



より選択される。

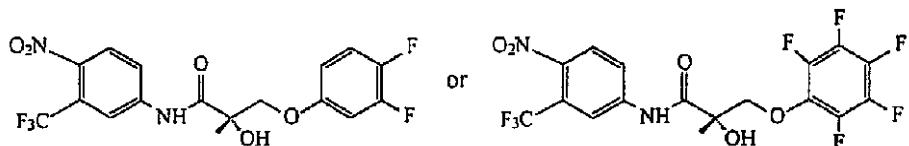
ここで、n は 1 乃至 4 の整数であり、

m は 1 乃至 3 の整数である。

【請求項 17】

前記 SAR M 化合物が次の化学式構造で示されることを特徴とする請求項 1 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化5】



【請求項18】

前記筋萎縮障害が、病理、疾病、疾患、若しくは容態に依存していることを特徴とする請求項1のSARM化合物の使用。

【請求項19】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、神経性、感染性、慢性的、若しくは遺伝的であることを特徴とする請求項18のSARM化合物の使用。

【請求項20】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、筋ジストロフィー、筋萎縮、X染色体に連鎖した脊髄延髄性(spinal-bulbar)筋萎縮症(SBMA)、悪液質、栄養失調、ライ病、糖尿病、腎臓病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、癌、末期腎不全、Sarcopenia、肺気腫、骨軟化症、HIV感染、AIDS、若しくは心筋症であることを特徴とする請求項18に記載のSARM化合物の使用。

【請求項21】

前記筋萎縮障害が、高齢に関連する筋萎縮障害、および不活動性体調不良(disuse deconditioning)に関連する筋萎縮障害であり、また、前記筋萎縮障害が、慢性的な弱い背痛、やけど、中枢神経系(CNS)傷害、末梢神経傷害、脊椎傷害、化学的損傷、及びアルコール依存症に依存していることを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【請求項22】

前記筋萎縮障害が慢性的な筋萎縮障害であることを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【請求項23】

前記医薬は、前記SARM、及び/又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含む医薬品化合物と、薬剤的に認められている担体とを含むことを特徴とする請求項1に記載のSARM化合物の使用。

【請求項24】

前記医薬は、

前記被験者に対して静脈注射、動脈注射、若しくは筋肉注射するか、

前記医薬品化合物を含むペレットを前記被験者に皮下埋め込みするか、

前記被験者に対して経口投与するか、

前記被験者の前記皮膚表面に局所的に塗布することによって投与されることを特徴とする請求項23に記載のSARM化合物の使用。

【請求項25】

前記医薬が、ペレット、タブレット、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、坐薬、若しくは非経口剤であることを特徴とする請求項23に記載のSARM化合物の使用。

【請求項26】

被験者に於ける筋萎縮障害の前記発生を予防し、防止し、抑制し、また減少させるための医薬を製造するための、選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)化合物の使用。

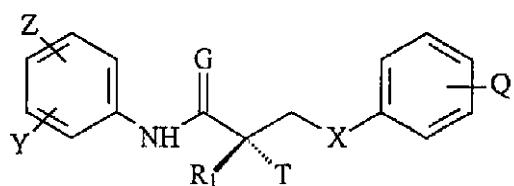
【請求項27】

前記医薬は、前記SARMの類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むことを特徴とする特徴とする請求項26に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 2 8】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 1 の構造で示されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

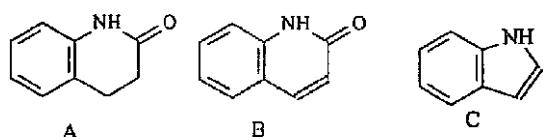
【化 1】



構造式 I

ここで、

G は、O 若しくは S であり、
 X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、
 T は、OH、OR、NHCOC₃、若しくは NHCOR であり、
 Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくは CONHR であり、
 Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくは SnR₃ であり、
 Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR 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 A、B、C、



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、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 である。

【請求項 2 9】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 2 の構造で示されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化 2】



ここで、

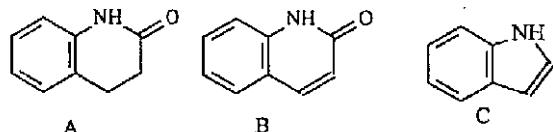
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C、



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、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である。

【請求項 3 0】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 1】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 2】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 3】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 4】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

。

【請求項 3 5】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 6】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 7】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 3 8】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

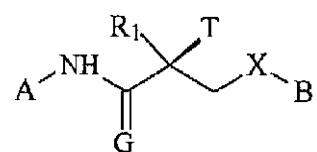
【請求項 3 9】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項29に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 4 0】

前記SARM化合物が次の化学式3の構造で示されることを特徴とする請求項26に記載のSARM化合物の使用。

【化3】



構造式III

ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

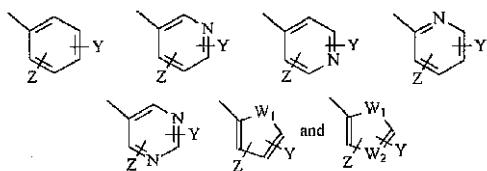
G は、O 若しくは S であり、

R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

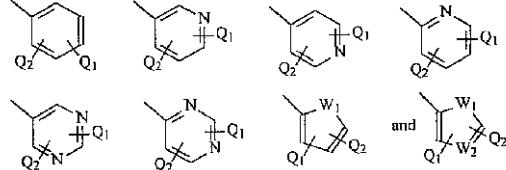
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

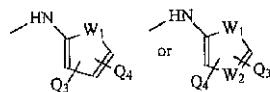


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q₁ and Q₂ は、各々、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、



より選択される。

Q₃ and Q₄ は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

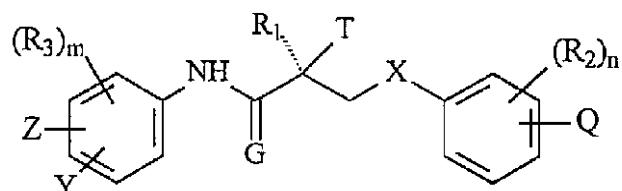
W は O、NH、NR、NO、若しくはS であり、

W₂ は、N 若しくは NO である。

【請求項 4 1】

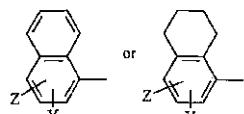
前記 SAR M 化合物が次の化学式 4 の構造で示されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化4】



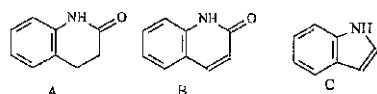
構造式IV

X は、結合、O、CH₂、NH、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、NHCOC₃、若しくはNHCOR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、NHCOC₃、NHCOCF、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、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
 Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
 Q は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、NHCOCF₃、
 NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
 NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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、



より選択される。

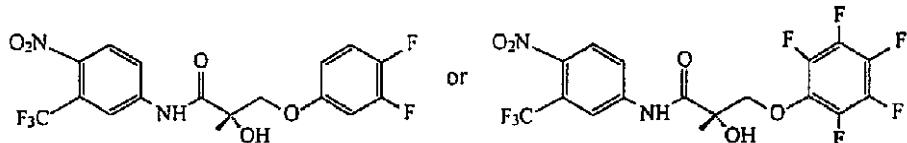
ここで、n は 1 乃至 4 の整数であり、

m は 1 乃至 3 の整数である。

【請求項 4 2】

前記 SAR M 化合物が次の化学式構造で示されることを特徴とする請求項 2 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化5】



【請求項43】

前記筋萎縮障害が、病理、疾病、疾患、若しくは容態に依存することを特徴とする請求項26のSARM化合物の使用。

【請求項44】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、神経性、感染性、慢性的、若しくは遺伝的であることを特徴とする請求項43のSARM化合物の使用。

【請求項45】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、筋ジストロフィー、筋萎縮、X染色体に連鎖した脊髄延髄性(spinal-bulbar)筋萎縮症(SBMA)、悪液質、栄養失調、ライ病、糖尿病、腎臓病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、癌、末期腎不全、Sarcopenia、肺気腫、骨軟化症、HIV感染、AIDS、若しくは心筋症であることを特徴とする、請求項43に記載のSARM化合物の使用。

【請求項46】

前記筋萎縮障害が、高齢に関連する筋萎縮障害、および不活動性体調不良(disuse deconditioning)に関連する筋萎縮障害であり、また、前記筋萎縮障害が、慢性的な弱い背痛、やけど、中枢神経系(CNS)傷害、末梢神経傷害、脊椎傷害、化学的損傷、及びアルコール依存症に依存していることを特徴とする請求項26に記載のSARM化合物の使用。

【請求項47】

前記筋萎縮障害が慢性的な筋萎縮障害であることを特徴とする請求項26に記載のSARM化合物の使用。

【請求項48】

前記医薬は、前記SARM、及び/又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含む医薬品化合物と、薬剤的に認められている担体とを含むことを特徴とする請求項26に記載のSARM化合物の使用。

【請求項49】

前記医薬は、

前記被験者に対して静脈注射、動脈注射、若しくは筋肉注射するか、

前記医薬品化合物を含むペレットを前記被験者に皮下埋め込みするか、

前記被験者に対して経口投与するか、

前記被験者の前記皮膚表面に局所的に塗布することによって投与されることを特徴とする請求項48に記載のSARM化合物の使用。

【請求項50】

前記医薬が、ペレット、タブレット、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、坐薬、若しくは非経口剤であることを特徴とする請求項48に記載のSARM化合物の使用。

【請求項51】

筋萎縮障害に苦しむ被験者に於ける筋肉損失を予防し、防止し、抑制し、また減少させる方法であって、前記被験者に選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)化合物を投与する過程を含むSARM化合物の使用。

【請求項52】

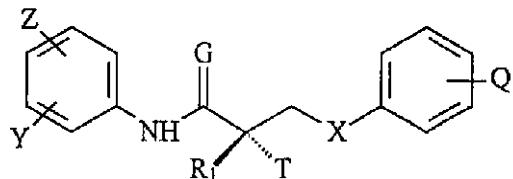
前記医薬は、前記SARMの類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 5 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 5 3】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 1 の構造で示されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化 1】



構造式 I

ここで、

G は、O 若しくは S であり、

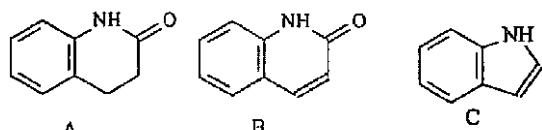
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくは NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくは CONHR であり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくは SnR₃ であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR 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 A、B、C、



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、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 である。

【請求項 5 4】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 2 の構造で示されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化 2】



ここで、

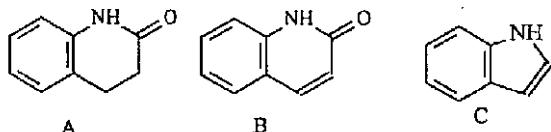
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C、



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、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である。

【請求項 5 5】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 5 6】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 5 7】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 5 8】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 5 9】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

。

【請求項 6 0】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 6 1】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 6 2】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 6 3】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

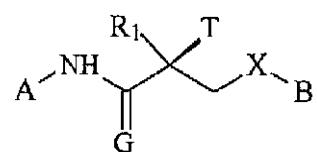
【請求項 6 4】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項 5 4 に記載のS A R M 化合物の使用。

【請求項 6 5】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 3 の構造で示されることを特徴とする請求項 5 1 に記載のS A R M 化合物の使用。

【化3】



構造式III

ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

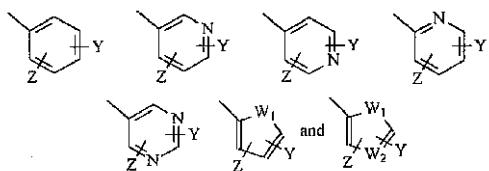
G は、O 若しくは S であり、

R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

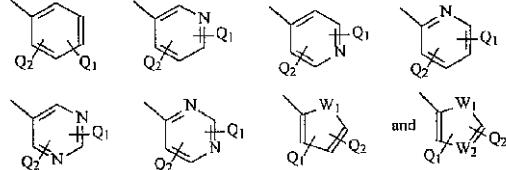
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

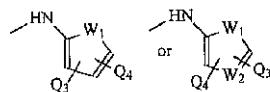


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q₁ and Q₂ は、各々、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、若しくはSRより選択され、



より選択される。

Q₃ and Q₄ は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R若しくはSRより選択され、

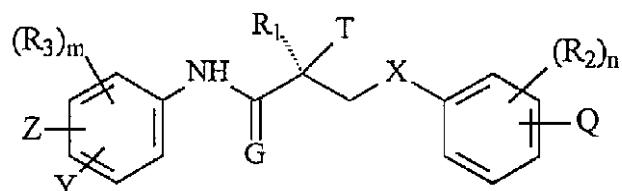
W は O、NH、NR、NO、若しくはS であり、

W₂ は、N 若しくは NO である。

【請求項 6 6】

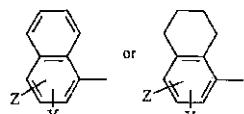
前記 SAR M 化合物が次の化学式 4 の構造で示されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化4】



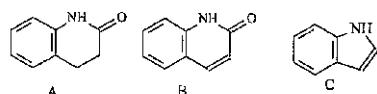
構造式IV

X は、結合、O、CH₂、NH、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、NHCOC₃、若しくはNHCOR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、NHCOC₃、NHCOCF、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、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
 Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
 Q は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、
 NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
 NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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、



より選択される。

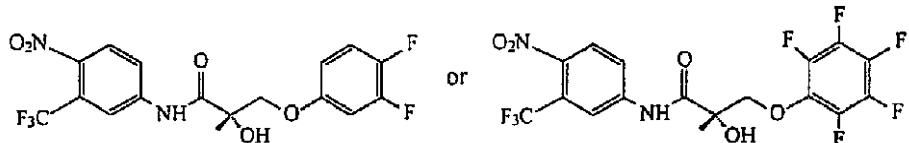
ここで、n は 1 乃至 4 の整数であり、

m は 1 乃至 3 の整数である。

【請求項 6 7】

前記 SAR M 化合物が次の化学式構造で示されることを特徴とする請求項 5 1 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化5】



【請求項68】

前記筋萎縮障害が、病理、疾病、疾患、若しくは容態に依存することを特徴とする請求項51のSARM化合物の使用。

【請求項69】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、神経性、感染性、慢性的、若しくは遺伝的であることを特徴とする請求項68のSARM化合物の使用。

【請求項70】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、筋ジストロフィー、筋萎縮、X染色体に連鎖した脊髄延髄性(spinal-bulbar)筋萎縮症(SBMA)、悪液質、栄養失調、ライ病、糖尿病、腎臓病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、癌、末期腎不全、Sarcopenia、肺気腫、骨軟化症、HIV感染、AIDS、若しくは心筋症であることを特徴とする、請求項68に記載のSARM化合物の使用。

【請求項71】

前記筋萎縮障害が、高齢に関連する筋萎縮障害、および不活動性体調不良(disuse deconditioning)に関連する筋萎縮障害であり、また、前記筋萎縮障害が、慢性的な弱い背痛、やけど、中枢神経系(CNS)傷害、末梢神経傷害、脊椎傷害、化学的損傷、及びアルコール依存症に依存していることを特徴とする請求項51に記載のSARM化合物の使用。

【請求項72】

前記筋萎縮障害が慢性的な筋萎縮障害であることを特徴とする請求項51に記載のSARM化合物の使用。

【請求項73】

前記医薬は、前記SARM、及び/又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含む医薬品化合物と、薬剤的に認められている担体とを含むことを特徴とする請求項51に記載のSARM化合物の使用。

【請求項74】

前記医薬は、

前記被験者に対して静脈注射、動脈注射、若しくは筋肉注射するか、

前記医薬品化合物を含むペレットを前記被験者に皮下埋め込みするか、

前記被験者に対して経口投与するか、

前記医薬品化合物を前記被験者の前記皮膚表面に局所的に塗布することによって投与されることを特徴とする請求項73に記載のSARM化合物の使用。

【請求項75】

前記医薬が、ペレット、タブレット、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、坐薬、若しくは非経口剤であることを特徴とする請求項73に記載のSARM化合物の使用。

【請求項76】

筋萎縮障害に苦しむ被験者に於ける筋萎縮を予防し、防止し、抑制し、また減少させる方法であって、前記被験者に選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子(SARM)化合物を投与する過程を含むSARM化合物の使用。

【請求項77】

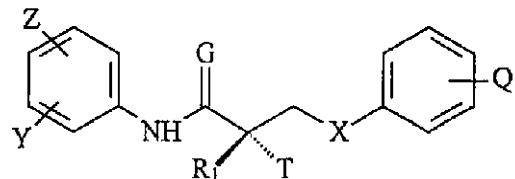
前記医薬は、前記SARMの類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 8】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 1 の構造で示されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化 1】



構造式 I

ここで、

G は、O 若しくは S であり、

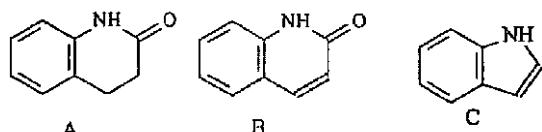
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくは NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくは CONHR であり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくは SnR₃ であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR 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 A、B、C、



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、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 である。

【請求項 7 9】

前記 S A R M 化合物が次の化学式 2 の構造で示されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化 2】



ここで、

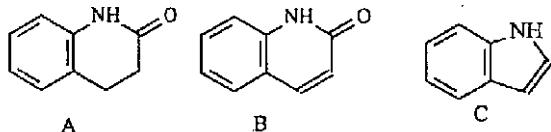
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C、



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、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である。

【請求項 8 0】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 1】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 2】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 3】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 4】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

。

【請求項 8 5】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 6】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 7】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 8 8】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

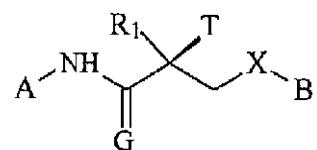
【請求項 8 9】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項7 9に記載のS A R M化合物の使用。

【請求項 9 0】

前記S A R M化合物が次の化学式3の構造で示されることを特徴とする請求項7 6に記載のS A R M化合物の使用。

【化3】



構造式III

ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

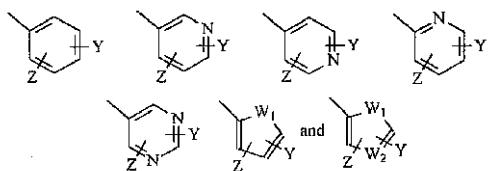
G は、O 若しくは S であり、

R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

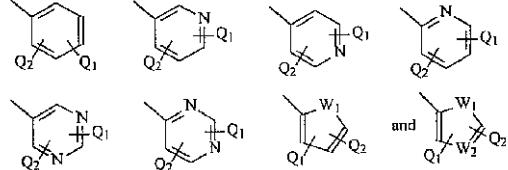
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

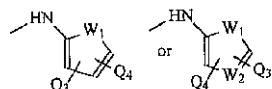


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q₁ and Q₂ は、各々、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、



より選択される。

Q₃ and Q₄ は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R若しくはSRより選択され、

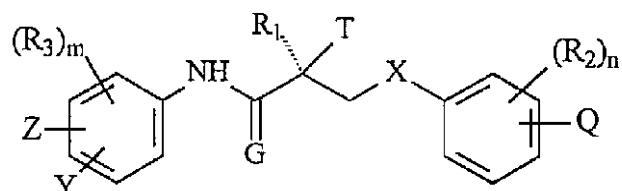
W は O、NH、NR、NO、若しくはS であり、

W₂は、N若しくはNOである。

【請求項 9 1】

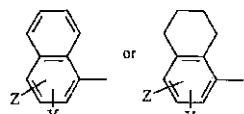
前記 SAR M 化合物が次の化学式 4 の構造で示されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化4】



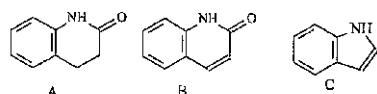
構造式IV

X は、結合、O、CH₂、NH、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、NHCOC₃、若しくはNHCOR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、NHCOC₃、NHCOCF、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、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
 Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
 Q は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、NHCOCF₃、
 NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
 NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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、



より選択される。

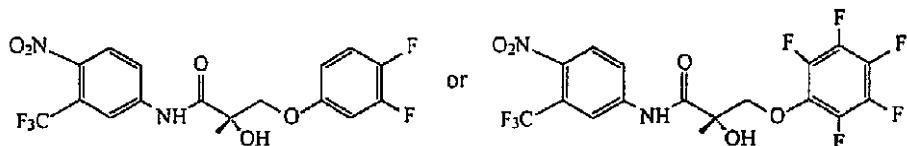
ここで、n は 1 乃至 4 の整数であり、

m は 1 乃至 3 の整数である。

【請求項 9 2】

前記 SAR M 化合物が次の化学式構造で示されることを特徴とする請求項 7 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【化5】



【請求項 9 3】

前記筋萎縮障害が、病理、疾病、疾患、若しくは容態に依存することを特徴とする請求項 7 6 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 4】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、神経性、感染性、慢性的、若しくは遺伝的であることを特徴とする請求項 9 3 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 5】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、筋ジストロフィー、筋萎縮、X 染色体に連鎖した脊髄延髄性 (spinal-bulbar) 筋萎縮症 (S B M A) 、悪液質、栄養失調、ライ病、糖尿病、腎臓病、慢性閉塞性肺疾患 (C O P D) 、癌、末期腎不全、Sarcopenia、肺気腫、骨軟化症、H I V 感染、A I D S 、若しくは心筋症であることを特徴とする、請求項 9 3 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 6】

前記筋萎縮障害が、高齢に関連する筋萎縮障害、および不活動性体調不良 (disuse deconditioning) に関連する筋萎縮障害であり、また、前記筋萎縮障害が、慢性的な弱い背痛、やけど、中枢神経系 (C N S) 傷害、末梢神経傷害、脊椎傷害、化学的損傷、及びアルコール依存症に依存していることを特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 7】

前記筋萎縮障害が慢性的な筋萎縮障害であることを特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 8】

前記医薬は、前記 S A R M 、及び / 又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N - 酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含む医薬品化合物と、薬剤的に認められている担体とを含むことを特徴とする請求項 7 6 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 9 9】

前記医薬は、

前記被験者に対して静脈注射、動脈注射、若しくは筋肉注射するか、

前記医薬品化合物を含むペレットを前記被験者に皮下埋め込みするか、

前記被験者に対して経口投与するか、

前記被験者の前記皮膚表面に局所的に塗布することによって投与されることを特徴とする請求項 9 8 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 0】

前記医薬が、ペレット、タブレット、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、坐薬、若しくは非経口剤であることを特徴とする請求項 9 8 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 1】

筋萎縮障害に苦しむ被験者に於ける筋肉タンパク質異化反応を予防し、防止し、抑制し、また減少させる方法であって、前記被験者に選択的アンドロゲンレセプタ修飾因子 (S A R M) 化合物を投与する過程を含む S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 2】

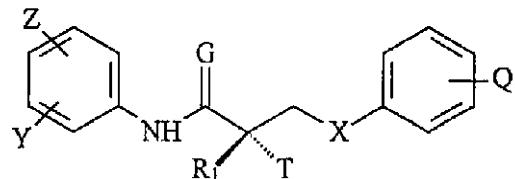
前記医薬は、前記 S A R M の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N - 酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 101 に記載の SARM 化合物の使用。

【請求項 103】

前記 SARM 化合物が次の化学式 1 の構造で示されることを特徴とする請求項 101 に記載の SARM 化合物の使用。

【化 1】



構造式 I

ここで、

G は、O 若しくは S であり、

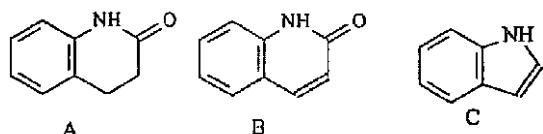
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくは NHCOR であり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくは CONHR であり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくは SnR₃ であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR 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 A、B、C、



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、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 である。

【請求項 104】

前記 SARM 化合物が次の化学式 2 の構造で示されることを特徴とする請求項 101 に記載の SARM 化合物の使用。

【化 2】



ここで、

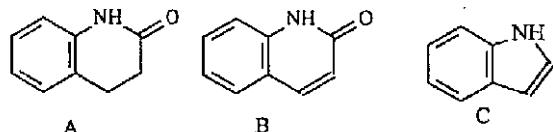
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q は、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCH₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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A、B、C、



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、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である。

【請求項 105】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 106】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 107】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 108】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 109】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 110】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 111】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 112】

ここで、XがOであり、ZがNO₂であり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 113】

ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがハロゲンであることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 114】

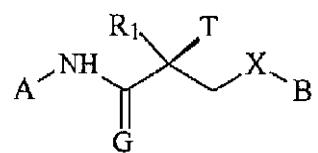
ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項104に記載のSARM化合物の使用。

【請求項 115】

前記SARM化合物が次の化学式3の構造で示されることを特徴とする請求項101に記

載のSARM化合物の使用。

【化3】



構造式III

ここで、

X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

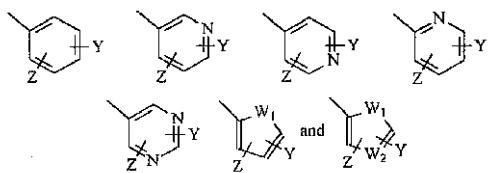
G は、O 若しくは S であり、

R₁は、CH₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CH₂CH₃、若しくはCF₂CF₃であり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、若しくはNHCORであり、

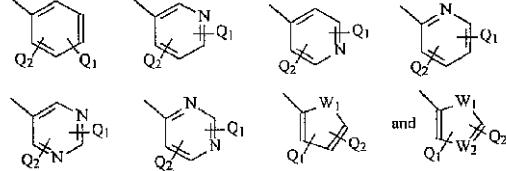
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

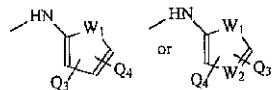


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

Z は、NO₂、CN、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、

Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、

Q₁ and Q₂ は、各々、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR、



より選択される。

Q₃ and Q₄ は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R若しくはSRより選択され、

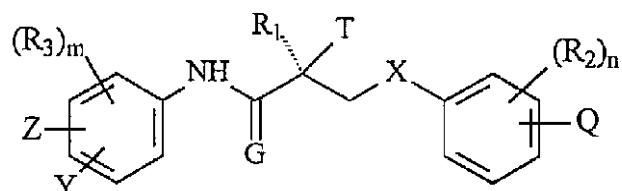
W は O、NH、NR、NO、若しくはS であり、

W₂ は、N 若しくは NO である。

【請求項 116】

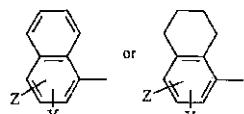
前記 S A R M 化合物が次の化学式 4 の構造で示されることを特徴とする請求項 101 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化4】



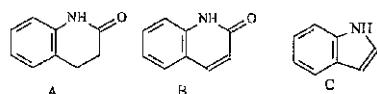
構造式IV

X は、結合、O、CH₂、NH、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、NHCOC₃、若しくはNHCOR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、NHCOC₃、NHCOCF、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、COOH、COR、NHCOR、若しくはCONHRであり、
Y は、CF₃、F、I、Br、Cl、CN、CR₃、若しくはSnR₃であり、
Q は、水素、アルキル、ハロゲン、CF₃、CN、CR₃、SnR₃、NR₂、NHCOC₃、NHCOCF₃、
NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、
NHCSR、NHSO₂CH₃、NHSO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、SR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、



より選択される。

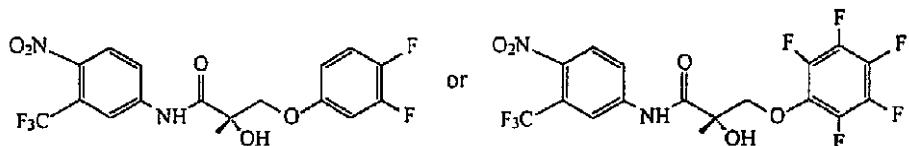
ここで、n は 1 乃至 4 の整数であり、

m は 1 乃至 3 の整数である。

【請求項 1 1 7】

前記 S A R M 化合物が次の化学式構造で示されることを特徴とする請求項 1 0 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【化5】



【請求項118】

前記筋萎縮障害が、病理、疾病、疾患、若しくは容態に依存することを特徴とする請求項101のSARM化合物の使用。

【請求項119】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、神経性、感染性、慢性的、若しくは遺伝的であることを特徴とする請求項118のSARM化合物の使用。

【請求項120】

前記病理、疾病、疾患、若しくは容態が、筋ジストロフィー、筋萎縮、X染色体に連鎖した脊髄延髄性(spinal-bulbar)筋萎縮症(SBMA)、悪液質、栄養失調、ライ病、糖尿病、腎臓病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、癌、末期腎不全、Sarcopenia、肺気腫、骨軟化症、HIV感染、AIDS、若しくは心筋症であることを特徴とする、請求項18に記載のSARM化合物の使用。

【請求項121】

前記筋萎縮障害が、高齢に関連する筋萎縮障害、および不活動性体調不良(disuse deconditioning)に関連する筋萎縮障害であり、また、前記筋萎縮障害が、慢性的な弱い背痛、やけど、中枢神経系(CNS)傷害、末梢神経傷害、脊椎傷害、化学的損傷、及びアルコール依存症に依存していることを特徴とする請求項101に記載のSARM化合物の使用。

【請求項122】

前記筋萎縮障害が慢性的な筋萎縮障害であることを特徴とする請求項101に記載のSARM化合物の使用。

【請求項123】

前記医薬は、前記SARM、及び/又はその類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認められている塩、医薬品、水和物、N-酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含む医薬品化合物と、薬剤的に認められている担体とを投与する過程を含むことを特徴とする請求項101に記載のSARM化合物の使用。

【請求項124】

前記医薬は、

前記被験者に対して静脈注射、動脈注射、若しくは筋肉注射するか、

前記医薬品化合物を含むペレットを前記被験者に皮下埋め込みするか、

前記被験者に対して経口投与するか、

前記被験者の前記皮膚表面に局所的に塗布することによって投与されることを特徴とする請求項123に記載のSARM化合物の使用。

【請求項125】

前記医薬が、ペレット、タブレット、カプセル、溶液、懸濁液、乳濁液、エリキシル、ゲル、クリーム、坐薬、若しくは非経口剤であることを特徴とする請求項123に記載のSARM化合物の使用。