

【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。

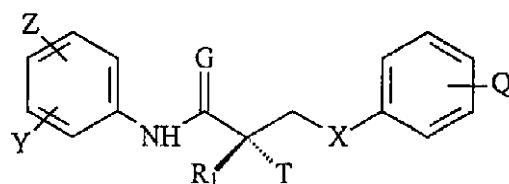
【請求項 2】

前記医薬は、前記 SARM の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剂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、

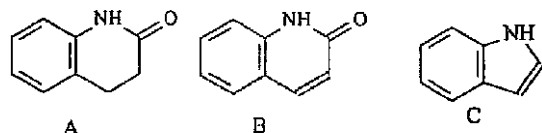
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

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、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、

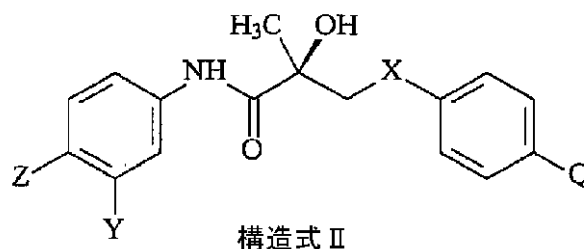
CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

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、

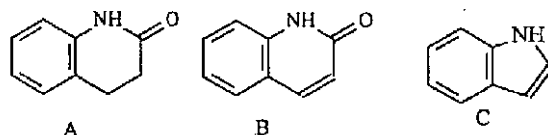
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

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、NHCSCF₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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 S A R M 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。

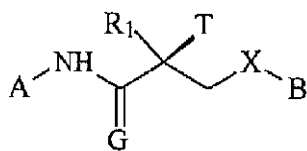
【請求項 1 4】

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NHCOCH₃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、

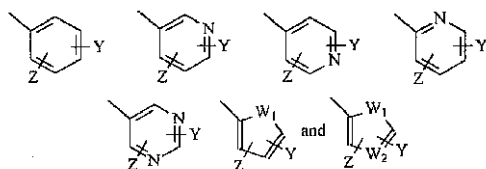
G は、O 若しくは Sであり、

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、

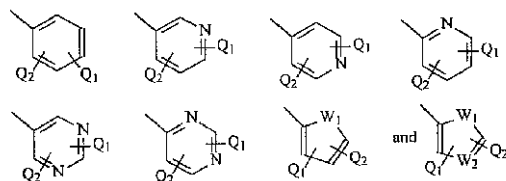
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

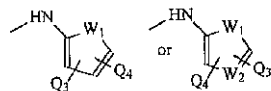


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

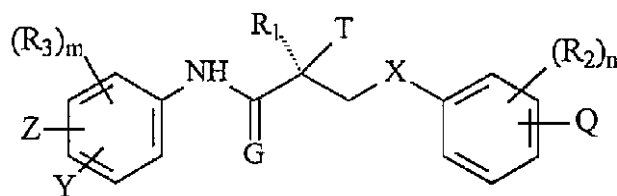
W はO、NH、NR、NO、若しくはSであり、

W₂ は、N 若しくはNOである。

【請求項 16】

前記SARM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SARM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、

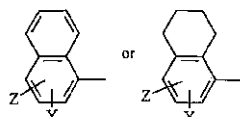
G は、O 若しくは Sであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、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、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、

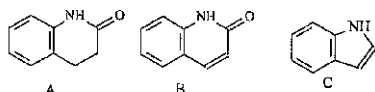


で示されるような縮合環システムであり、

Z は、NO₂、CN、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、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

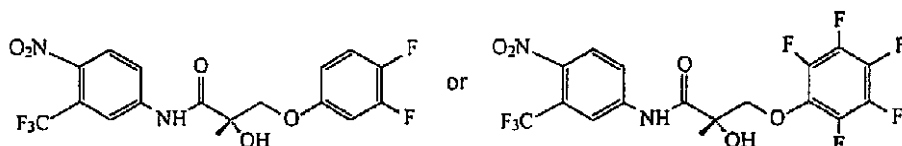
ここで、n は1乃至4の整数であり、

m は1乃至3の整数である。

【請求項 17】

前記SARM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SARM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 SAR M 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 SAR M 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 (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 18 に記載の SAR M 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 (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 1 に記載の SAR M 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 SAR M 化合物の使用。

【請求項 23】

前記医薬は、前記 SAR 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医薬品化合物と、薬剤的に認可さ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 SAR M 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 SAR M 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 SAR M 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 (S A R M) 化合物の使用。

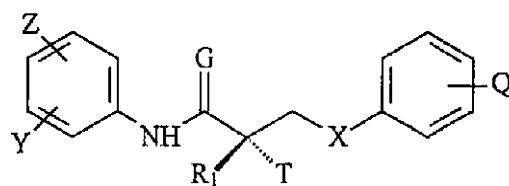
【請求項 27】

前記医薬は、前記 SAR M 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 26 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 28】

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 26 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、

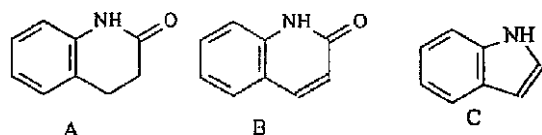
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

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、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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、

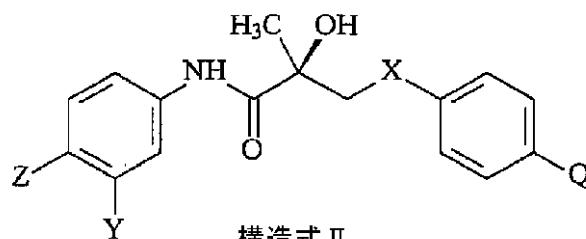
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

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

【請求項 29】

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 26 に記載の SARM 化合物の使用。

【化 2】



構造式 II

ここで、

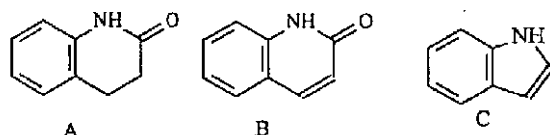
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

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、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 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 2 9 に記載の S A R M 化合物の使用。

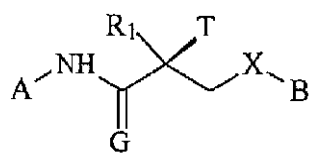
【請求項 3 9】

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 2 9 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 4 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 2 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、

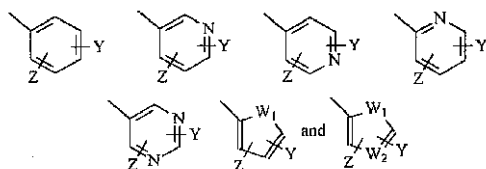
G は、O 若しくは Sであり、

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、

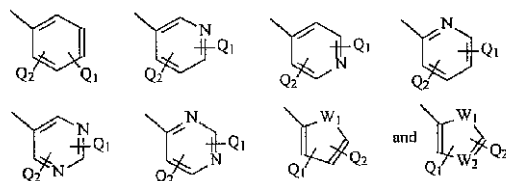
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

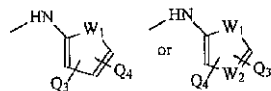


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

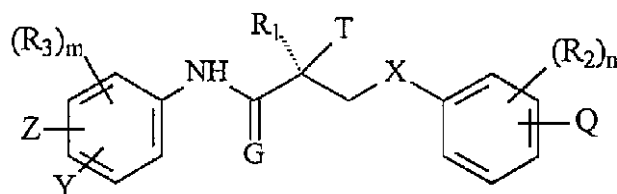
W はO、NH、NR、NO、若しくはSであり、

W₂ は、N 若しくはNOである。

【請求項 4 1】

前記SARM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26に記載のSARM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、

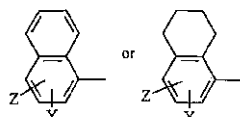
G は、O 若しくは Sであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、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、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、

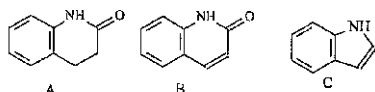


で示されるような縮合環システムであり、

Z は、NO₂、CN、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、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

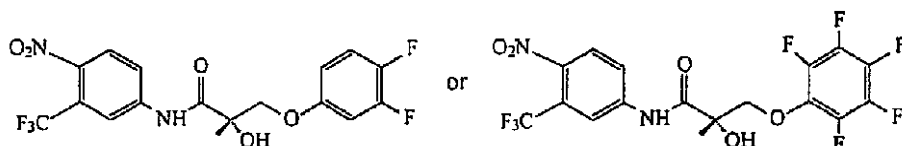
ここで、n は1乃至4の整数であり、

m は1乃至3の整数である。

【請求項 4 2】

前記SARM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26に記載のSARM化合物の使用。

【化 5】



【請求項 4 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 2 6 の SAR M 化合物の使用。

【請求項 4 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 4 3 の SAR M 化合物の使用。

【請求項 4 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 4 3 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 4 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 2 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 4 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 2 6 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 4 8】

前記医薬は、前記 SAR 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医薬品化合物と、薬剤的に認可されている担体とを含む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。

【請求項 4 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 4 8 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 5 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 4 8 に記載の SAR M 化合物の使用。

【請求項 5 1】

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 (SAR M) 化合物を投与する過程を含む SAR M 化合物の使用。

【請求項 5 2】

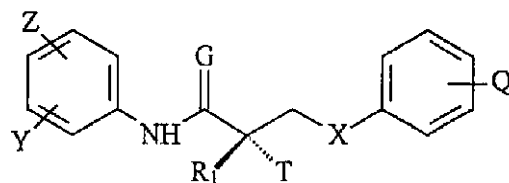
前記医薬は、前記 SAR M の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、水和物、N - 酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 5 1 に記載の SARM 化合物の使用。

【請求項 5 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 5 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、

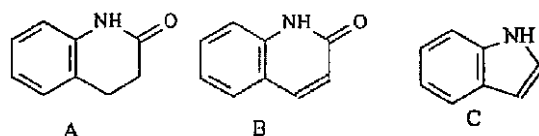
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

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、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、

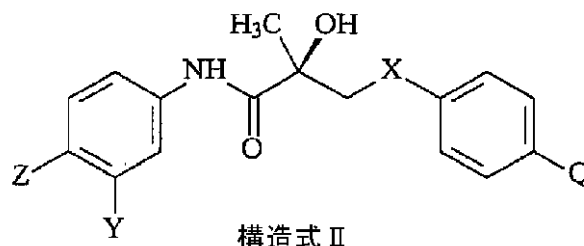
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

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

【請求項 5 4】

前記 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 5 1 に記載の SARM 化合物の使用。

【化 2】



構造式 II

ここで、

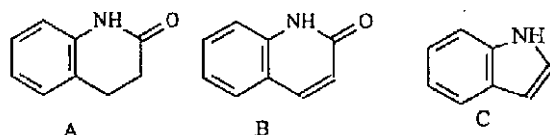
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

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、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

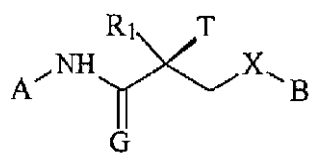
【請求項 6 4】

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、

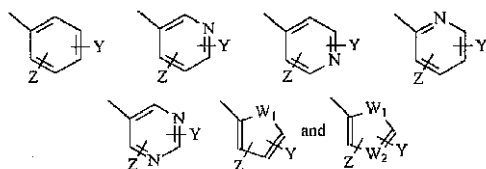
G は、O 若しくは Sであり、

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、

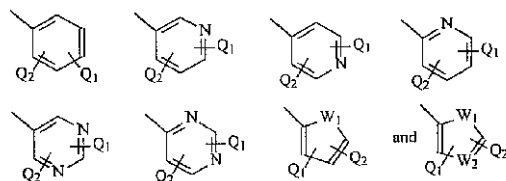
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

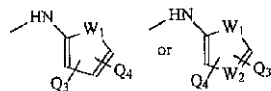


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

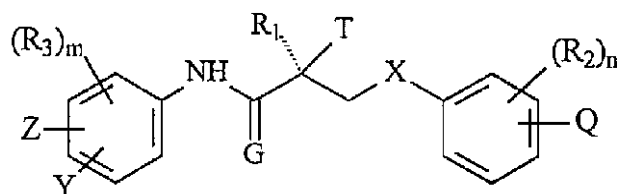
W はO、NH、NR、NO、若しくはSであり、

W₂ は、N 若しくはNOである。

【請求項 6 6】

前記SARM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51に記載のSARM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、

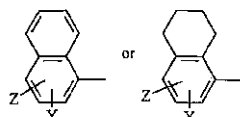
G は、O 若しくは Sであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、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、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、

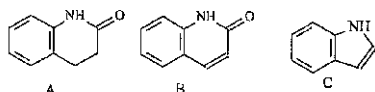


で示されるような縮合環システムであり、

Z は、NO₂、CN、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、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

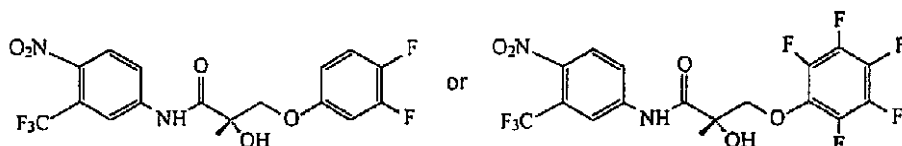
ここで、n は1乃至4の整数であり、

m は1乃至3の整数である。

【請求項 6 7】

前記SARM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51に記載のSARM化合物の使用。

【化 5】



【請求項 6 8】

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 5 1 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 6 9】

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 6 8 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 0】

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 6 8 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 1】

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 5 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 2】

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 5 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 3】

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医薬品化合物と、薬剤的に認可されている担体と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 7 4】

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 7 3 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 5】

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 7 3 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 7 6】

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 (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 7 7】

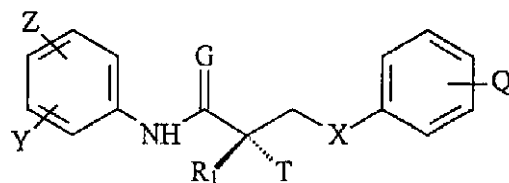
前記医薬は、前記 S A R M の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、水和物、N - 酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 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、

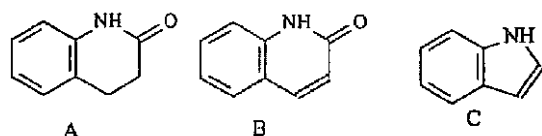
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

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、

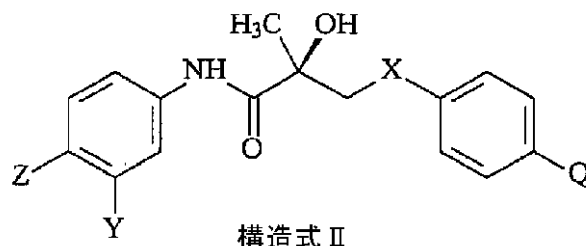
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

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】



構造式 II

ここで、

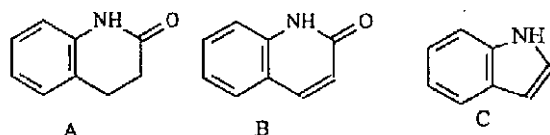
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

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、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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。

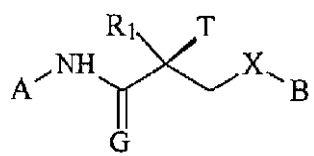
【請求項 8 9】

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、

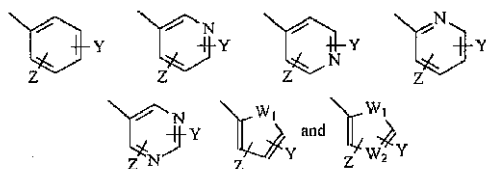
G は、O 若しくは Sであり、

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、

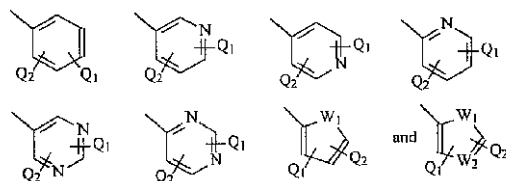
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

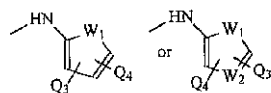


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

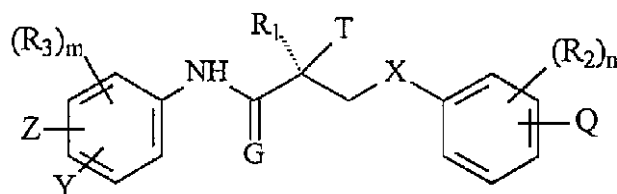
W はO、NH、NR、NO、若しくはSであり、

W₂ は、N 若しくはNOである。

【請求項 9 1】

前記SARM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76に記載のSARM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、

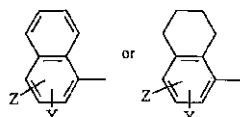
G は、O 若しくは Sであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、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、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、

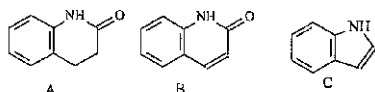


で示されるような縮合環システムであり、

Z は、NO₂、CN、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、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

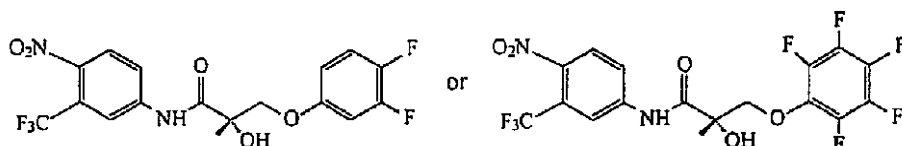
ここで、n は1乃至4の整数であり、

m は1乃至3の整数である。

【請求項 9 2】

前記SARM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76に記載のSARM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 SAR 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 SAR 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 SAR 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 SAR 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 SAR M 化合物の使用。

【請求項 9 8】

前記医薬は、前記 SAR 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医薬品化合物と、薬剤的に認可さ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 SAR 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 SAR 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 SAR 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 (SAR M) 化合物を投与する過程を含む SAR M 化合物の使用。

【請求項 1 0 2】

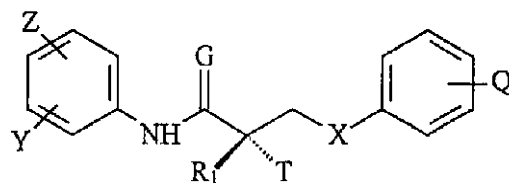
前記医薬は、前記 SAR M の類似体、誘導体、異性体、代謝産物、薬剤的に認可されている塩、医薬品、水和物、N - 酸化物、若しくはそれらのいずれかの組み合わせを含むこと

を特徴とする請求項 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、

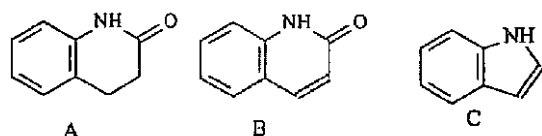
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくは NR であり、

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、

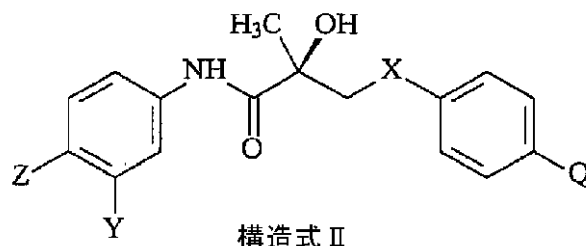
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくは OH であり、

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】



構造式 II

ここで、

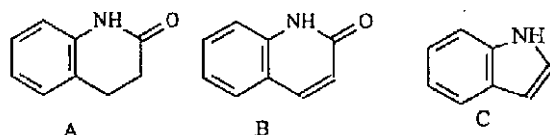
X は、結合、O、CH₂、NH、Se、PR、NO、若しくはNRであり、

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、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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 1 0 5】

ここで、XがOであることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 6】

ここで、YがCF₃であることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 7】

ここで、ZがNO₂であることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 8】

ここで、ZがCNであることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 0 9】

ここで、Qがハロゲンであることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 1 0】

ここで、QがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 1 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 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 1 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 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 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 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 1 4】

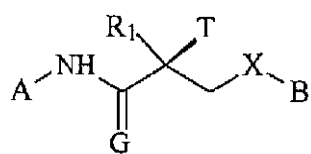
ここで、XがOであり、ZがCNであり、YがCF₃であり、またQがNHCOCH₃であることを特徴とする請求項 1 0 4 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 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 0 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、

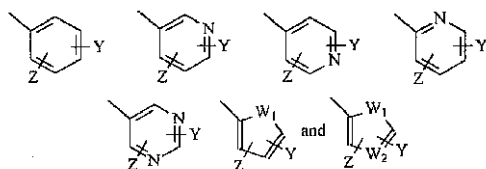
G は、O 若しくは Sであり、

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、

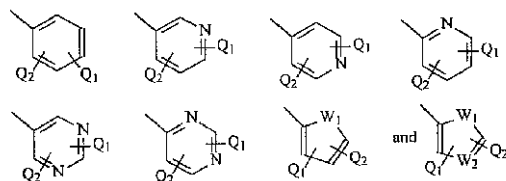
R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₂CF₃、アリル、フェニル、ハロゲン、アルケニル、若しくはOHであり、

A は次の環群、



から選択され、

B は次の環群、

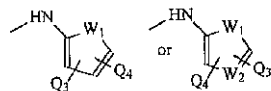


から選択され、ここではA及びBが同時にベンゼン環であってはならない。

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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、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、NHCSCH₃、NHCSR、NHCO₂CH₃、NHCO₂R、OR、COR、OCOR、OSO₂R、SO₂R、若しくはSRより選択され、

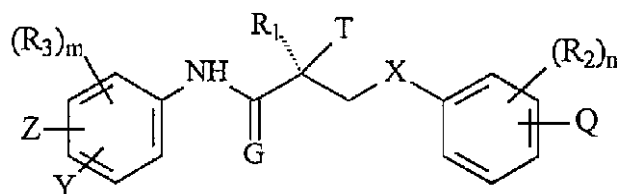
W はO、NH、NR、NO、若しくはSであり、

W₂ は、N 若しくはNOである。

【請求項 116】

前記SARM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SARM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、

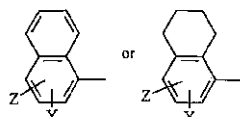
G は、O 若しくは Sであり、

T は、OH、OR、NHCOCH₃、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、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、

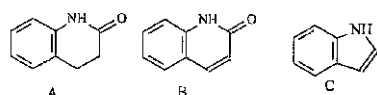


で示されるような縮合環システムであり、

Z は、NO₂、CN、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、NHCOCH₃、NHCOCF₃、NHCOR、NHCONHR、NHCOOR、OCONHR、CONHR、NHCSCH₃、NHCSCF₃、NHCSR、NHOSO₂CH₃、NHOSO₂R、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。

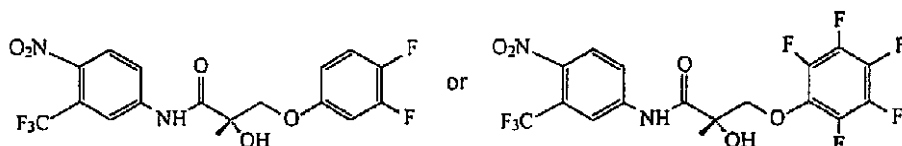
ここで、n は1乃至4の整数であり、

m は1乃至3の整数である。

【請求項 117】

前記SARM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101に記載のSARM化合物の使用。

【化 5】



【請求項 1 1 8】

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 1 0 1 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 1 9】

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 1 1 8 の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 0】

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 1 8 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 1】

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 1 0 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 2】

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 0 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 3】

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医薬品化合物と、薬剤的に認可さ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 1 0 1 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 4】

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 1 2 3 に記載の S A R M 化合物の使用。

【請求項 1 2 5】

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 1 2 3 に記載の S A R M 化合物の使用。