

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5940982号
(P5940982)

(45) 発行日 平成28年6月29日 (2016. 6. 29)

(24) 登録日 平成28年5月27日 (2016. 5. 27)

(51) Int. Cl.		F I	
A 6 1 K	31/09 (2006. 01)	A 6 1 K	31/09
A 6 1 K	31/275 (2006. 01)	A 6 1 K	31/275
A 6 1 P	43/00 (2006. 01)	A 6 1 P	43/00 1 1 1
A 6 1 P	5/28 (2006. 01)	A 6 1 P	5/28
A 6 1 P	13/08 (2006. 01)	A 6 1 P	13/08

請求項の数 47 (全 327 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2012-547415 (P2012-547415)
 (86) (22) 出願日 平成23年1月6日 (2011. 1. 6)
 (65) 公表番号 特表2013-516435 (P2013-516435A)
 (43) 公表日 平成25年5月13日 (2013. 5. 13)
 (86) 国際出願番号 PCT/CA2011/000019
 (87) 国際公開番号 W02011/082487
 (87) 国際公開日 平成23年7月14日 (2011. 7. 14)
 審査請求日 平成26年1月6日 (2014. 1. 6)
 (31) 優先権主張番号 61/282, 238
 (32) 優先日 平成22年1月6日 (2010. 1. 6)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 500489613
 ブリティッシュ コロンビア キャンサー
 エージェンシー ブランチ
 カナダ国 ブイ5ゼット 4イー6 ブリ
 ティッシュ コロンビア, バンクーバー
 , ウェスト 10ティーエイチ アベニ
 ュー 600
 (73) 特許権者 502087932
 ザ ユニヴァーシティ オブ ブリティッ
 シュ コロンビア
 カナダ国 ブイ6ティー 1ゼット3 ブ
 リティッシュ コロンビア, バンクーバー
 , アグロノミー ロード 103-619
 0

最終頁に続く

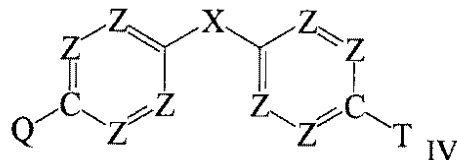
(54) 【発明の名称】 アンドロゲンレセプター活性調節因子としての、ビスフェノール誘導体およびその使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

アンドロゲンレセプター活性を阻害するための組成物であって、式IVの構造

【化836】



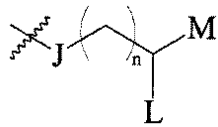
を有する化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含有し、ここで：

Xは、C(CH₃)₂であり；

各Zは、独立して、CHであり；

Qは、

【化 8 3 7】



であり；

Jは、Oであり；

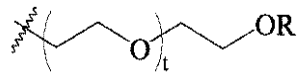
Mは、H、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、CHBr₂、
CBr₃またはC—CHであり； 10

Lは、HまたはA—Dであり；

Aは、Oであり；

Dは、H、R、または

【化 8 3 8 A】



20

であり；

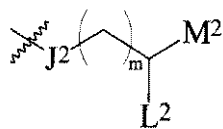
tは、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

MまたはLのいずれかがHであり；

Tは、

【化 8 3 9】



30

であり；

J²は、Oであり；

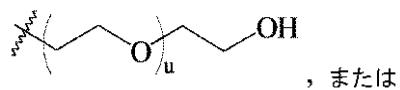
M²は、H、CH₃、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、C
HBr₂、CBr₃、CH₂OH、またはC—CHであり；

L²は、HまたはA²—D²であり；

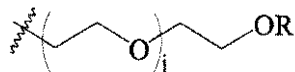
A²は、Oであり；

D²は、H、R、

【化 8 4 0 A】



，または



であり；

50

u および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；
 m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；
 R は、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；
 n および m がともに 0 である場合、M および M² は、両方が C—CH であることはなく；
 Q および T は、両方が $-O(CH_2)_3Cl$ であることはなく；
 n が 1、2 または 3 であり、L が A—D である場合、D は、H であり、T は、 $-O(CH_2)_2OH$ 、 $-O(CH_2)_3OH$ 、 $-O(CH_2)_4OH$ ではない、
 組成物。

【請求項 2】

M が、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CB 10
 r_3 または C—CH である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

M が、 CH_2Cl 、 CH_2Br または C—CH である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

M が、 CH_2Cl である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

M が、C—CH である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

M が、H である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

L が、H である、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

20

【請求項 8】

L が、A—D である、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

D が、H である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

D が、R である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

n が、0 である、請求項 1 から 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

n が、1 である、請求項 1 から 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

30

【請求項 13】

M² が、H、 CH_2Cl 、 CH_2OH 、または C—CH である、請求項 1 から 12 のい
 ずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

M² が、 CH_2Cl である、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 15】

M² が、 CH_2OH である、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】

M² が、C—CH である、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

40

【請求項 17】

L² が、H である、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 18】

L² が、A²—D² である、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 19】

D² が、H である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

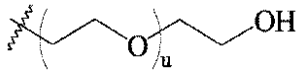
D² が、R である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 21】

D² が、

50

【化 8 5 0】



であり、u が、0、1、または2である、請求項18に記載の組成物。

【請求項22】

m が、0である、請求項1から21のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項23】

m が、1、2、3、4または5である、請求項1から21のいずれか1項に記載の組成物 10

【請求項24】

m が、1である、請求項1から21のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項25】

M が、C₂H₅であり；M² が、CH₂Clであり；L が、Hである、請求項1に記載の組成物。

【請求項26】

L² が、Hである、請求項25に記載の組成物。

【請求項27】

L² が、A² - D²であり；D² が、Hである、請求項25に記載の組成物。 20

【請求項28】

n が、0である、請求項25から27のいずれか1項に記載の組成物。

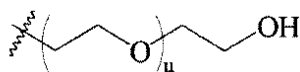
【請求項29】

M が、CH₂Clであり；L が、Hであり；M² が、H、CH₂OH、またはCH₂Clである、請求項1に記載の組成物。

【請求項30】

L² が、A² - D²であり；D² が、Hまたは

【化 8 5 2】



30

であり、u が、0、1、2、3、4、5、6または7である、請求項29に記載の組成物。

【請求項31】

n が、1、2、3、4または5である、請求項29および30のいずれか1項に記載の組成物。

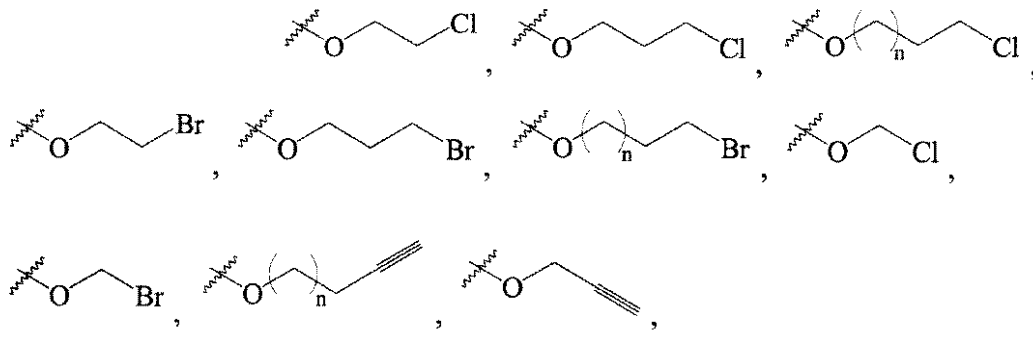
【請求項32】

m が、1、2、3、4または5である、請求項25から31のいずれか1項に記載の組成物。 40

【請求項33】

Q が、

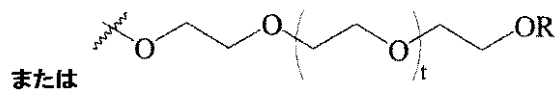
【化 8 5 6 A】



10

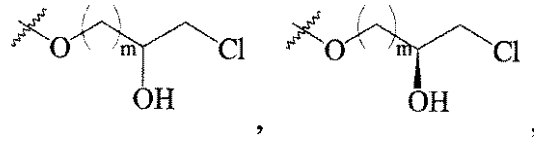
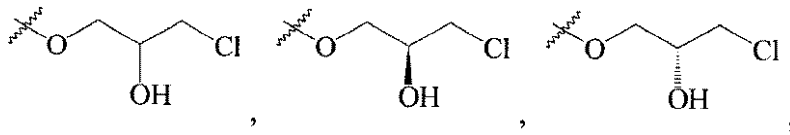
20

30

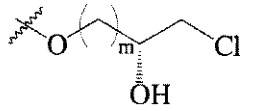


であり；
Tが、

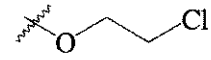
【化 8 5 7 A】



【化 8 5 8 A】



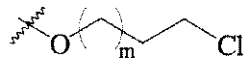
,



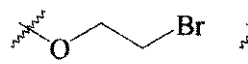
,



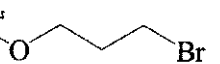
,



,



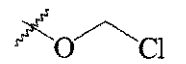
,



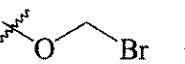
,



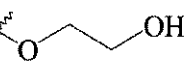
,



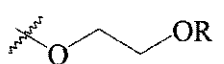
,



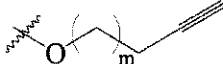
,



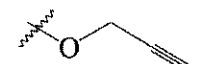
,



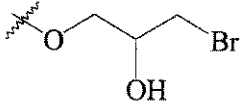
,



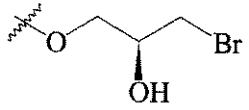
,



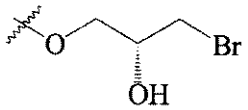
,



,



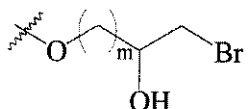
,



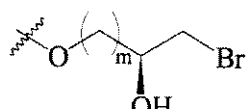
,

10

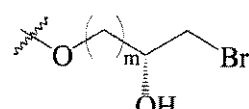
20



,

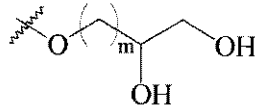


,

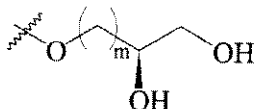


,

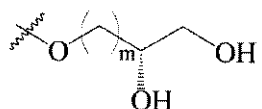
30



,



,



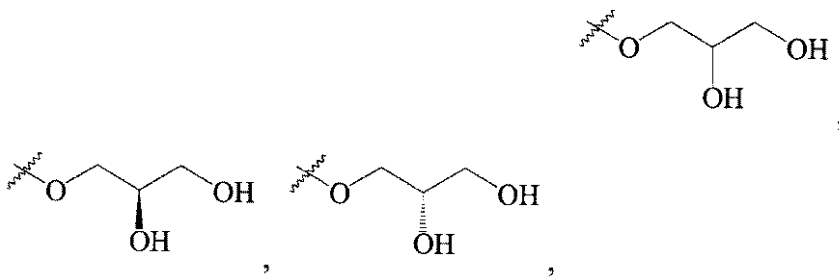
,

40

【化 8 5 9 A】

10

20

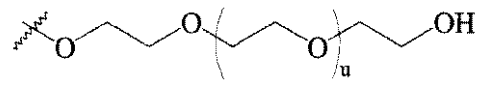


30

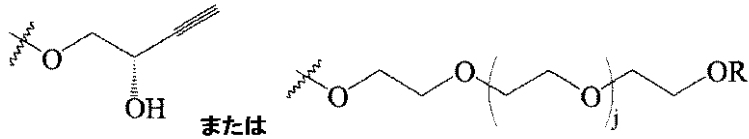
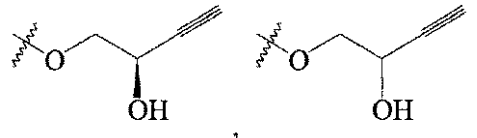
40

【化 8 6 0 A】

10



20



30

であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

t が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

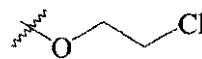
m が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

u および j の各々が、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、請求項 1 に記載の組成物。

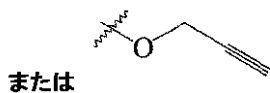
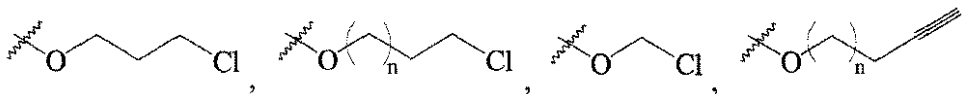
【請求項 34】

Q が、

【化 8 6 6 A】

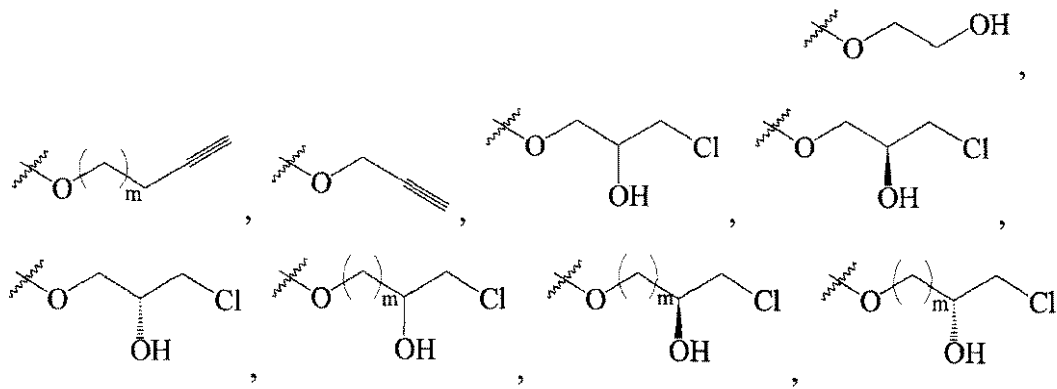


40



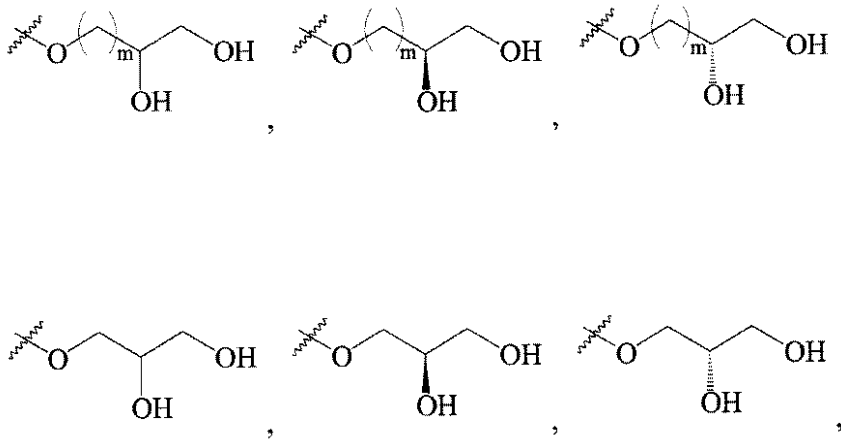
50

であり；Tが、
【化867】



10

【化868A】



20

30

または



であり；

nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

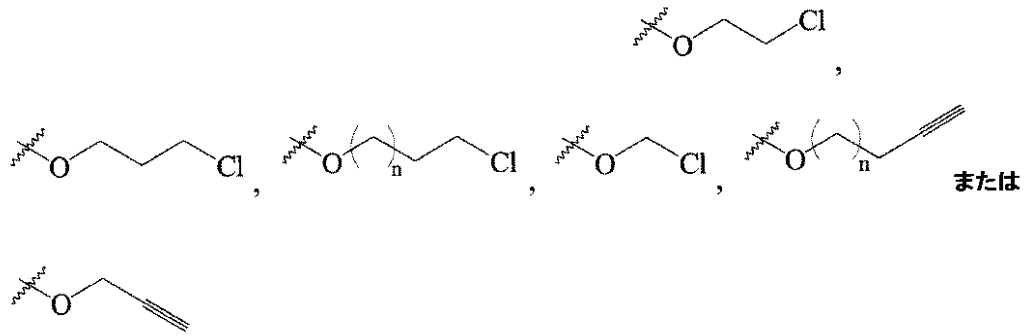
uが、0、1、2、3、4、5、6または7である、請求項1に記載の組成物。

40

【請求項35】

Qが、

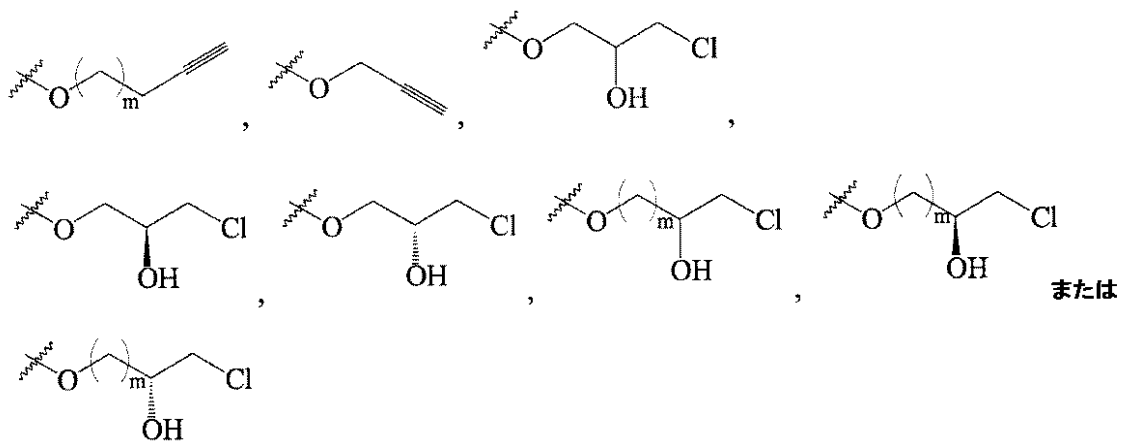
【化 8 6 9】



10

であり；Tが、

【化 8 7 0】



20

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、請求項1に記載の組成物。

30

【請求項36】

Qが、

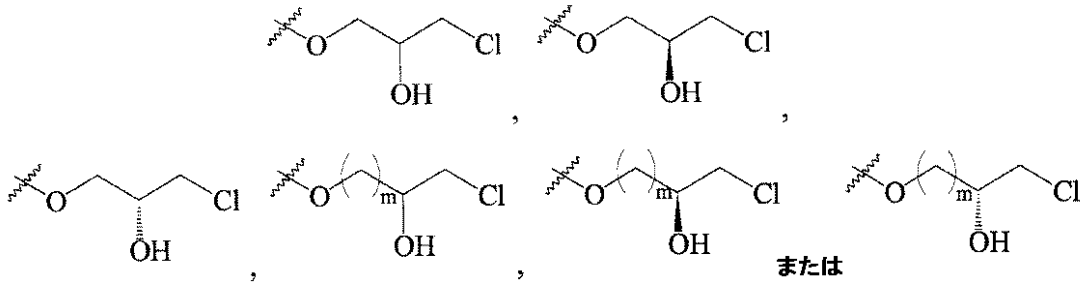
【化 8 7 1】



40

であり；Tが、

【化 8 7 2】



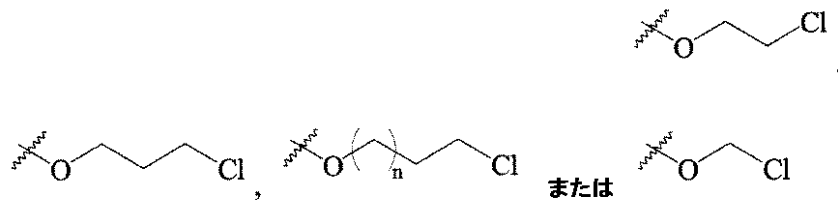
10

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、請求項1に記載の組成物。

【請求項37】

Qが、

【化 8 7 3】



20

であり；Tが、

【化 8 7 4】



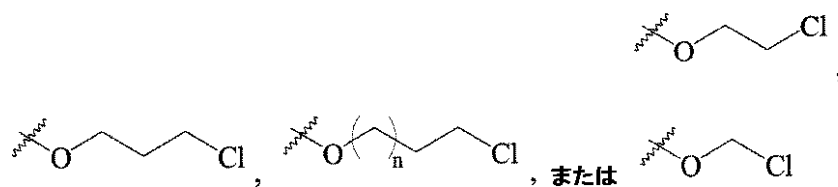
30

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、請求項1に記載の組成物。

【請求項38】

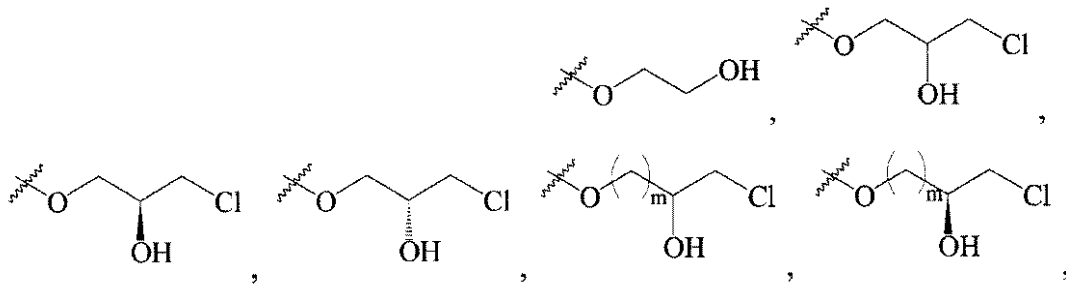
Qが、

【化 8 7 5 A】



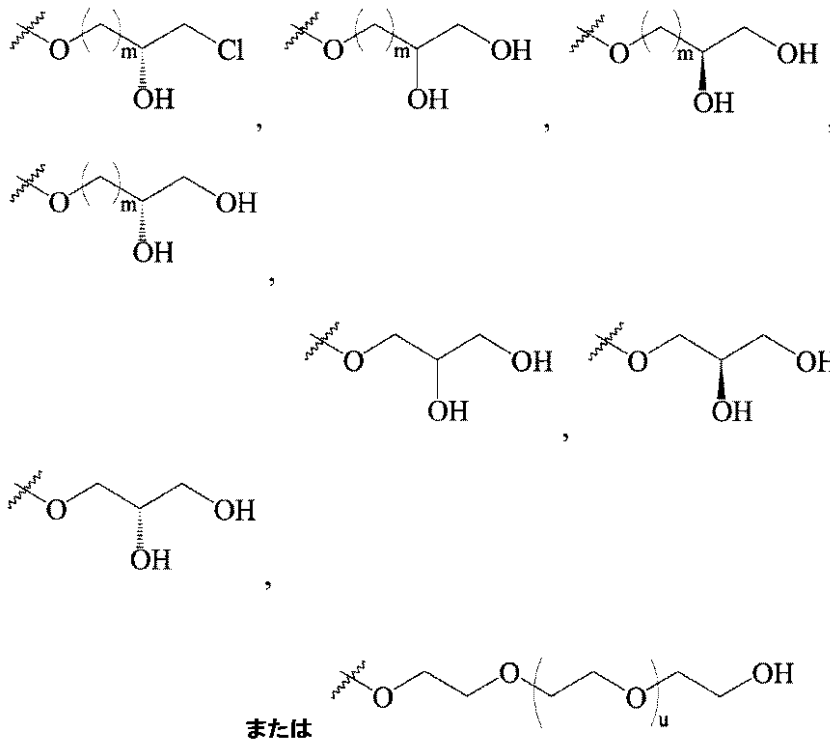
40

であり；Tが、
【化876】



10

【化877A】



20

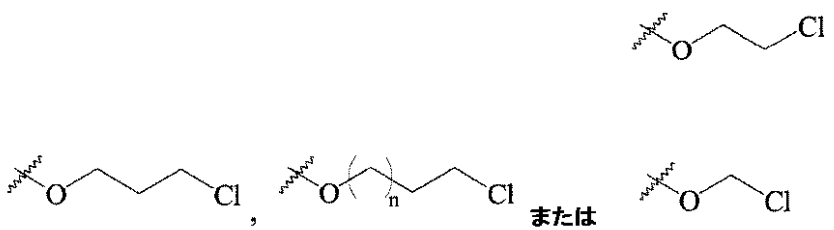
30

であり；
nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；
mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；
uが、0、1、2、3、4、5、6または7である、請求項1に記載の組成物。

【請求項39】

Qが、

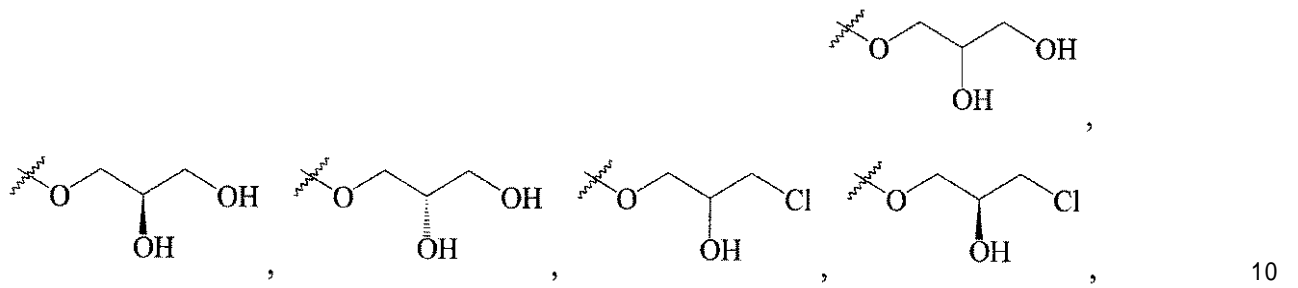
【化878】



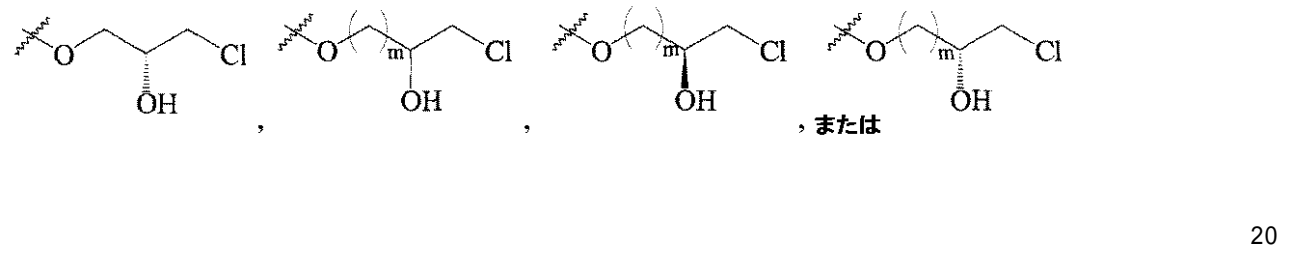
40

50

であり；Tが、
【化879】



【化880A】

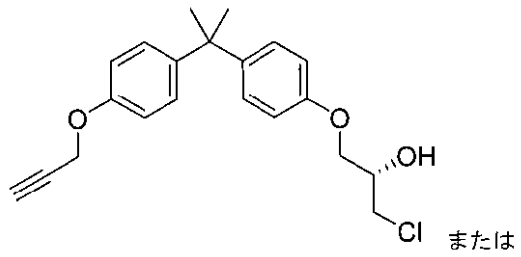
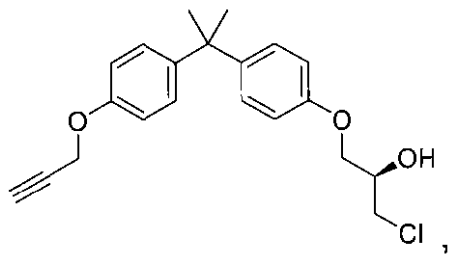
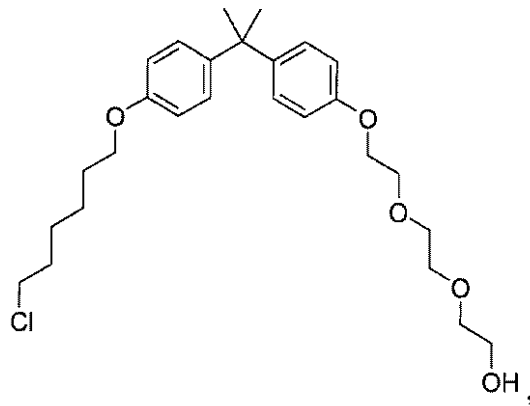
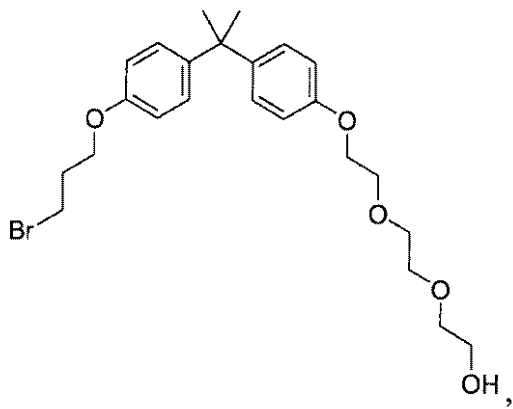
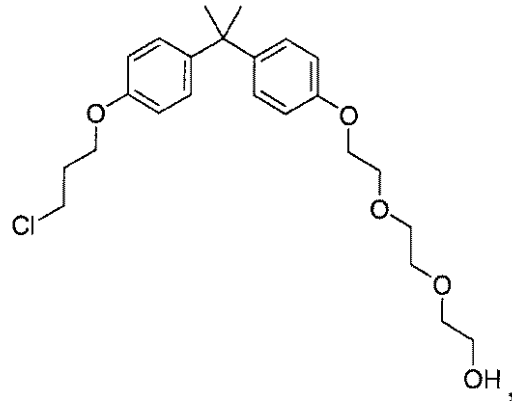
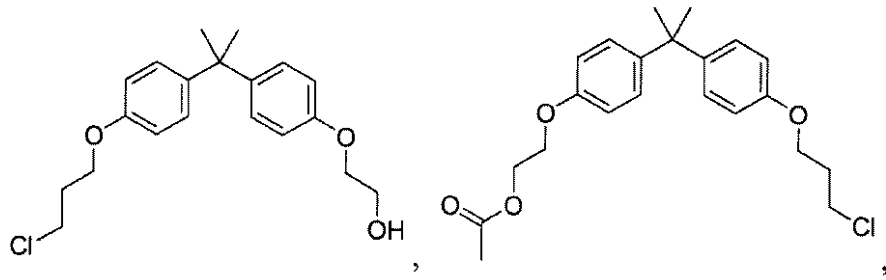


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、請求項1に記載の組成物。

【請求項40】

前記化合物が、以下：

【化900A】

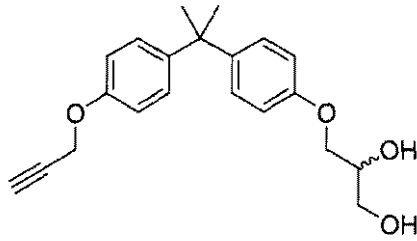


10

20

30

【化 9 0 1 A】



10

20

のうちの1つ以上から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項41】

前記アンドロゲンレセプター（AR）活性の阻害が、哺乳動物細胞におけるものである、請求項1から40のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項42】

前記AR活性の阻害が、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するためのものである、請求項1から41のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項43】

前記適応症が、前立腺癌である、請求項1から42のいずれか1項に記載の組成物。

30

【請求項44】

前記前立腺癌が、アンドロゲン非依存性前立腺癌である、請求項43に記載の組成物。

【請求項45】

前記前立腺癌が、アンドロゲン依存性前立腺癌である、請求項43に記載の組成物。

【請求項46】

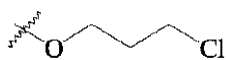
請求項1から45のいずれか1項に記載の組成物であって、薬学的に許容され得るキャリアをさらに含む、組成物。

【請求項47】

Qが

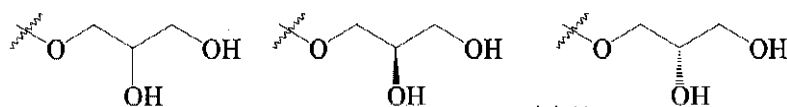
40

【化 9 5 1】



であり；Tが、

【化 9 5 2】



、または

50

である、請求項 1 に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願への相互参照

本出願は、2010年1月6日に出願された米国仮特許出願第61/282,238号(発明の名称「ACHIRAL GROUP CONTAINING BISPHENOL DERIVATIVE THERAPEUTICS AND METHODS FOR THEIR USE」)の利益を主張する。

10

【0002】

技術分野

本発明は、様々な癌を含む様々な適応症を処置するための、治療薬、それらの使用および方法に関する。特に、本発明は、すべてのステージ、ならびにアンドロゲン依存性、アンドロゲン感受性およびアンドロゲン非依存性(ホルモン不応性、去勢抵抗性、アンドロゲン遮断抵抗性、アンドロゲン除去抵抗性、アンドロゲン枯渇非依存性、去勢再発性(castration-recurrent)、抗アンドロゲン-再発性(anti-androgen-recurrent)とも呼ばれる)を含む前立腺癌などの癌に対する治療法および処置方法に関する。

20

【背景技術】

【0003】

背景

アンドロゲンは、その作用をアンドロゲンレセプター(AR)を介して媒介する。アンドロゲンは、幅広い発育反応および生理反応に関与し、男性性分化、精子形成の維持および男性ゴナドトロピンの制御に関わる(R. K. Ross, G. A. Coetzee, C. L. Pearce, J. K. Reichardt, P. Bretsky, L. N. Kolonel, B. E. Henderson, E. Lander, D. Altshuler & G. Daley, Eur Urol 35, 355-361 (1999); A. A. Thomson, Reproduction 121, 187-195 (2001); N. Tanji, K. Aoki & M. Yokoyama, Arch Androl 47, 1-7 (2001))。いくつかの一連の証拠が、アンドロゲンが前立腺癌発生に関連すると示している。第1に、アンドロゲンは、げっ歯類モデルにおいて前立腺癌発生を誘導し(R. L. Noble, Cancer Res 37, 1929-1933 (1977); R. L. Noble, Oncology 34, 138-141 (1977))、アナボリックステロイドの形態のアンドロゲンを投与された男性は、より高い前立腺癌発生率を有する(J. T. Roberts & D. M. Essenhugh, Lancet 2, 742 (1986); J. A. Jackson, J. Waxman & A. M. Spiekerman, Arch Intern Med 149, 2365-2366 (1989); P. D. Guinan, W. Sadoughi, H. Alsheik, R. J. Ablin, D. Alrenga & I. M. Bush, Am J Surg 131, 599-600 (1976))。第2に、ヒトまたはイヌを春機発動期前に去勢すると、前立腺癌は発生しない(J. D. Wilson & C. Roehrborn, J Clin Endocrinol Metab 84, 4324-4331 (1999); G. Wilding, Cancer Surv 14, 113-130 (1992))。成人男性の去勢は、他の男性外性器に対する影響を誘発せずに、前立腺の退縮および前立腺上皮のアポトーシスを引き起こす(E. M. Bruckheimer & N. Kyprianou, Cell Tissue Res 301, 153-162 (2000); J. T. Isaacs, Prostate 5, 545-557 (1984))。このアンドロゲンへの依存は、化学的または外科的な去勢(アンドロゲン除去)によって前立腺癌を処置することに対する基礎となる理論的根拠を提供する。

30

40

50

【0004】

アンドロゲンは、女性特有の癌にも関与する。一例は、卵巣癌であり、高レベルのアンドロゲンが、卵巣癌発生の高リスクと関連する (K. J. Helzlsouer, A. J. Alberg, G. B. Gordon, C. Longcope, T. L. Bush, S. C. Hoffman & G. W. Comstock, JAMA 274, 1926-1930 (1995); R. J. Edmondson, J. M. Monaghan & B. R. Davies, Br J Cancer 86, 879-885 (2002))。卵巣癌の大部分においてARが検出されている (H. A. Risch, J Natl Cancer Inst 90, 1774-1786 (1998); B. R. Rao & B. J. Slotman, Endocr Rev 12, 14-26 (1991); G. M. Clinton & W. Hua, Crit Rev Oncol Hematol 25, 1-9 (1997)) のに対して、エストロゲンレセプター-アルファ (ERa) およびプロゲステロンレセプターは、50%未満の卵巣腫瘍でしか検出されていない。

10

【0005】

進行前立腺癌に使用可能な唯一の効果的処置は、前立腺上皮細胞の生存にとって必須のアンドロゲンを除去することである。アンドロゲン除去療法は、血清前立腺特異的抗原 (PSA) の減少と同時に腫瘍量の一時的な減少をもたらす。残念ながら、前立腺癌は、最終的には、アンドロゲンの非存在下において再度成長することができる (アンドロゲン非依存性疾患) (Huberら、1987 Scand J Urol Nephrol 104, 33-39)。アンドロゲン非依存性疾患は、症状が発生する前に血清PSA値の上昇によって生化学的に特徴付けられる (Millerら、1992 J. Urol 147, 956-961)。この疾患は、いったんアンドロゲン非依存性になると、ほとんどの患者が、2年以内にこの疾患で死亡する。

20

【0006】

ARは、カルボキシ末端のリガンド結合ドメイン (LBD)、2つのジンクフィンガーマチーフを含むDNA結合ドメイン (DBD)、および1つ以上の転写活性化ドメインを含むN末端ドメイン (NTD) を含む、異なる機能ドメインを有する。アンドロゲン (リガンド) がARのLBDに結合すると、そのレセプターは、「通常は」アンドロゲンによって制御される遺伝子 (例えば、PSA) のプロモーターおよびエンハンサー領域上の、ARに特異的なDNAコンセンサス部位 (アンドロゲン応答エレメント (ARE) と呼ばれる) に効率的に結合することができるようにARが活性化し、転写が開始する。ARは、cAMP依存性タンパク質キナーゼ (PKA) 経路の刺激、インターロイキン-6 (IL-6) および様々な成長因子によって、アンドロゲンの非存在下でも活性化され得る (Culigら、1994 Cancer Res 54, 5474-5478; Nazarethら、1996 J. Biol. Chem. 271, 19900-19907; Sadar 1999 J. Biol. Chem. 274, 7777-7783; Uedaら、2002 A J. Biol. Chem. 277, 7076-7085; および Uedaら、2002 B J. Biol. Chem. 277, 38087-38094)。ARがリガンド非依存性に変換する機序は：1) 核移行を示唆する核ARタンパク質の増加；2) AR/ARE複合体形成の増加；および3) AR-NTDが関わりと示されている (Sadar 1999 J. Biol. Chem. 274, 7777-7783; Uedaら、2002 A J. Biol. Chem. 277, 7076-7085; および Uedaら、2002 B J. Biol. Chem. 277, 38087-38094)。ARは、アンドロゲン非依存性疾患では代替のシグナル伝達経路によって、精巣アンドロゲンの非存在下でも活性化されることがあり、このことは、核ARタンパク質が二次前立腺癌腫瘍に存在するという知見と一致する (Kimら、2002 Am. J. Pathol 160, 219-226; および van der Kwastら、1991 Inter. J. Cancer 48, 189-193)。

30

40

【0007】

50

利用可能なARインヒビターとしては、非ステロイド系抗アンドロゲン（例えば、ピカルタミド（CasodexTM）、ニルタミドおよびフルタミド）およびステロイド系抗アンドロゲンである酢酸シプロテロンが挙げられる。これらの抗アンドロゲンは、ARのLBDを標的とし、その大部分は、不十分な親和性およびこれらの同じ抗アンドロゲンによるARの活性化をもたらす変異におそらく起因して失敗に終わる（Taplin, M. E., Bublely, G. J., Kom Y. J., Small E. J., Upton M., Rajeshkumarm B., Balkm S. P., Cancer Res., 59, 2511 - 2515 (1999)）。これらの抗アンドロゲンは、リガンド結合ドメイン（LBD）を欠く最近発見されたARスプライスパリアントに対しても効果を有しないことから、アンドロゲン非依存性前立腺癌への進行を促す恒常的に活性化レセプターがもたらされる（Dehm SM, Schmidt LJ, Heemers HV, Vessella RL, Tindall DJ., Cancer Res 68, 5469 - 77, 2008; Guo Z, Yang X, Sun F, Jiang R, Linn DE, Chen H, Chen H, Kong X, Melamed J, Tepper CG, Kung HJ, Brodie AM, Edwards J, Qiu Y., Cancer Res. 69, 2305 - 13, 2009）。

10

【0008】

従来の治療法は、ARのC末端ドメインを介したARのアンドロゲン依存的活性化に的をしばっている。ARに対するアンタゴニスト開発の最近の研究は、C末端、および詳細には：1) アロステリックポケットおよびAF-2活性（Estebanez - Perpinaら、2007, PNAS 104, 16074 - 16079）；2) 非ステロイド系アンタゴニストの同定のためのインシリコ「薬物リパーピング（drug repurposing）」法（Bissonら、2007, PNAS 104, 11927 - 11932）；およびコアクチベーターまたはコリプレッサーの相互作用（Changら、2005, Mol Endocrinology 19, 2478 - 2490；Hurら、2004, PLoS Biol 2, E274；Estebanez - Perpinaら、2005, JBC 280, 8060 - 8068；Heら、2004, Mol Cell 16, 425 - 438）に的をしばっている。

20

【0009】

NTDは、アンドロゲンの非存在下でのARの活性化に関与するので（Sadar, M. D. 1999 J. Biol. Chem. 274, 7777 - 7783；Sadar MDら、1999 Endocr Relat Cancer. 6, 487 - 502；Uedaら、2002 J. Biol. Chem. 277, 7076 - 7085；Ueda 2002 J. Biol. Chem. 277, 38087 - 38094；Blaszczykら、2004 Clin Cancer Res. 10, 1860 - 9；Dehmら、2006 J Biol Chem. 28, 27882 - 93；Gregoryら、2004 J Biol Chem. 279, 7119 - 30）、AR-NTDは、薬物開発のための標的でもある（例えば、WO2000/001813）。AR-NTDは、デコイ分子の適用によって示されているように（Quayleら、2007, Proc Natl Acad Sci USA. 104, 1331 - 1336）、前立腺癌のホルモンによる進行において重要である。

30

40

【0010】

ARのC末端のLBDについては結晶構造が解明されたが、NTDについては、その高度の可撓性およびその溶液中での固有の無秩序が原因で解明されておらず（非特許文献1）、このことにより、パーチャルドッキングによる創薬アプローチが妨げられている。

【先行技術文献】

【非特許文献】

【0011】

【非特許文献1】Reidら、2002 J. Biol. Chem. 277, 20079 - 20086

50

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0012】

要旨

本発明は、本明細書中に記載される化合物がアンドロゲンレセプター（AR）活性を調節するという偶然の発見に一部基づく。詳細には、本明細書中で特定される化合物は、AR活性の阻害を示し、これは、アンドロゲンの存在下および非存在下におけるインビボでの腫瘍成長の阻止に有用であり得る。海洋無脊椎動物抽出物の最初のスクリーニングが、AR活性の阻害についての試験であり、その最初のスクリーニングにおいて同定された化合物のいくつかは、BADGE（ビスフェノールAジグリシジルエーテル（Bisphenol A Diglycidic Ether））と構造的に似ていると判明したので、この発見は、特に幸運なものだった。BADGEとの類似から、これらの化合物が、産業上の起源となる可能性が最も高く、汚染された海水から海綿によって生物濃縮されたことが示唆される。したがって、Badge化合物に対する公知の活性に起因して、本BADGE誘導体は、他の任意の状況下でのアッセイではスクリーニングされなかった可能性が高い。

10

【0013】

本明細書中に記載される化合物は、オーファンおよび核レセプター（アンドロゲンレセプターなどのステロイドレセプターを含む）の機序を検討するインビボまたはインビトロにおける研究用途（すなわち、非臨床的）に使用され得る。さらに、これらの化合物は、組換えタンパク質、培養下で維持される細胞および/または動物モデルを使用する、シグナル伝達経路ならびに/またはオーファンおよび核レセプターの活性化を検討するインビボまたはインビトロでの研究のために、個別にまたはキットの一部として使用され得る。

20

【0014】

本発明はまた、本明細書中に記載される化合物が、研究用途と治療用途の両方のために、インビボまたはインビトロにおいてアンドロゲンレセプター活性を調節するためにも使用され得るという驚くべき発見に一部基づく。これらの化合物は、アンドロゲンレセプター活性が調節され得るような有効量で使用され得る。そのアンドロゲンレセプターは、哺乳動物のものであり得る。あるいは、そのアンドロゲンレセプターは、ヒトのものであり得る。特に、その化合物は、ARを阻害するために使用され得る。その化合物の調節活性は、以下の適応症：前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症のうちの少なくとも1つの研究のために、インビボまたはインビトロモデルにおいて使用され得る。さらに、その化合物の調節活性は、以下の適応症：前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症（精巣中毒症（testotoxicosis））および加齢黄斑変性症のうちの少なくとも1つの処置のために使用され得る。処置するための適応症は、前立腺癌であり得る。その前立腺癌は、アンドロゲン非依存性前立腺癌であり得る。その前立腺癌は、アンドロゲン依存性前立腺癌であり得る。

30

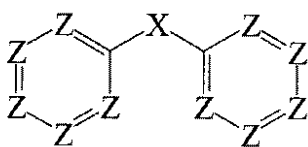
【0015】

1つの実施形態によると、アンドロゲンレセプター（AR）活性を調節するための、式Iの構造を有する化合物

40

【0016】

【化1】



I

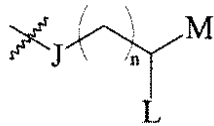
またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、

50

ここで：Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得、ここで、各 R^3 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得、各 R^6 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり得；一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、 $\text{C} - \text{Q}$ であり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり得、残りの各Zは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり得；Qは、

【0017】

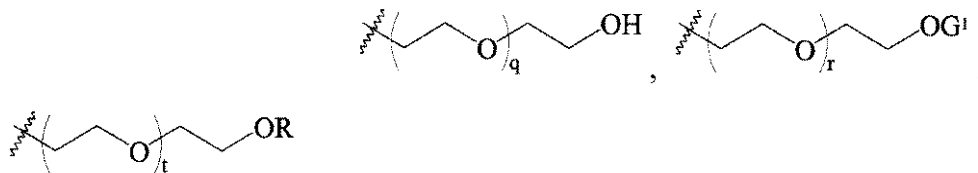
【化2】



であり得；Jは、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり得；Mは、 H 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 CHCl_2 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 CHBr_2 、 CBr_3 または $\text{C} - \text{CH}$ であり得；Lは、 H または $\text{A} - \text{D}$ であり得；Aは、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得；Dは、 H 、 G^1 、 R 、

【0018】

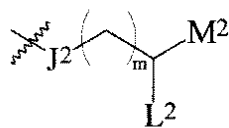
【化3】



または表1から選択される部分であり得；q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；Tは、

【0019】

【化4】



であり得； J^2 は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり得； M^2 は、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 CHCl_2 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 CHBr_2 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 $\text{CH}_2\text{OJ}''$ 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $\text{CH}_2\text{OG}^1\text{OG}^1'$ 、 $\text{G}^1\text{OG}^1'$ 、 $\text{G}^1\text{OG}^1'\text{OG}^1''$

10

20

30

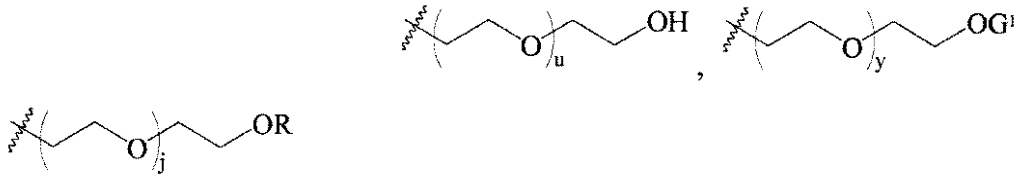
40

50

、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 CH_2NG^1 または $\text{C}-\text{CH}$ であり得； L^2 は、 H または A^2-D^2 であり得； A^2 は、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得； D^2 は、 H 、 G^1 、 R 、

【0020】

【化5】



10

または表1から選択される部分であり得； u 、 y および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得； J'' および J''' の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得； G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_1-C_{10} アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 COOH 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 CONH_2 、 CONHR^4 、 CONHR^5 、 CONR^4_2 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 CONR^4R^5 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得、ここで、各 R^4 は、独立して、非置換 C_1-C_{10} アルキルであり得、各 R^5 は、独立して、 C_1-C_{10} アシルであり得； R は、 C_1-C_{10} アシルであり得る。

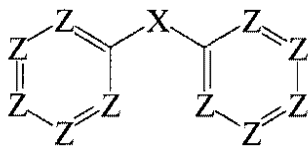
20

【0021】

別の実施形態によると、アンドロゲンレセプター (AR) 活性を調節するための、式Iの構造を有する化合物

【0022】

【化6】



I

30

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、

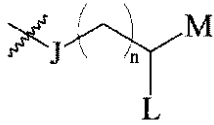
ここで： X は、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の C_1-C_{10} アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 C_3-C_{10} アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得、ここで、各 R^3 は、独立して、非置換 C_1-C_{10} アルキルであり得、各 R^6 は、独立して、 C_1-C_{10} アシルであり得；一方の芳香族環の少なくとも1つの Z は、独立して、 $\text{C}-\text{Q}$ であり得、他方の芳香族環の少なくとも1つの Z は、独立して、 $\text{C}-\text{T}$ 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり得、残りの各 Z は、独立して、 $\text{C}-\text{T}$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COS

40

50

O_3H 、 $COPO_3H_2$ 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であり得；Qは、
【0023】

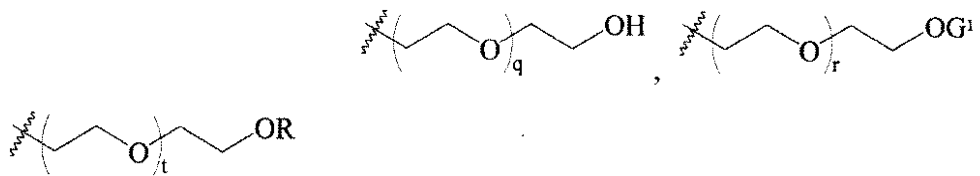
【化7】



であり得；Jは、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり得；Mは、H、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 またはC-CHであり得；Lは、HまたはA-Dであり得；Aは、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得；Dは、H、 G^1 、R、

【0024】

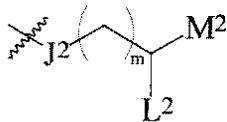
【化8】



または表1から選択される部分であり得；q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；Tは、

【0025】

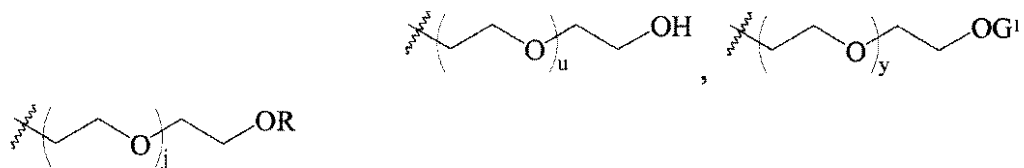
【化9】



であり得； J^2 は、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり得； M^2 は、H、 CH_3 、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ'' 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1'$ 、 G^1OG^1' 、 $G^1OG^1'OG^1''$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ またはC-CHであり得； L^2 は、Hまたは A^2 - D^2 であり得； A^2 は、O、S、SO、 SO_2 、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得； D^2 は、H、 G^1 、R、

【0026】

【化10】



または表1から選択される部分であり得；u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； J'' および J^1 の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得； G^1 - G^1' および G^1'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_1 - C_{10} アルキルであ

10

20

30

40

50

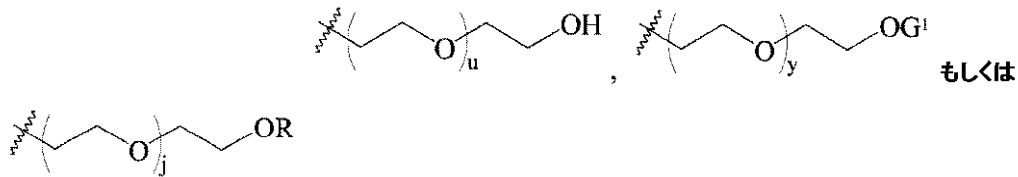
り得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得、ここで、各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得； R は、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得、ただし：

i) 芳香族環上の X に対してパラ位の 1 つの Z が、 $C - Q$ であり； n が、1 であり； J が、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH または NG^1 であり； L が、 $A - D$ であり； A が、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり； D が、 H または表 1 から選択される部分であるとき、他方の芳香族環上の X に対してパラ位の Z は、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CNH_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、 $C - T$ であり、ここで、 m が、1 であり、 J^2 が、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH または NG^1 であるとき、 L^2 は、 H または $A^2 - D^2$ であり、ここで、 A^2 は、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり、 D^2 は、 G^1 、 R 、

10

【0027】

【化11】

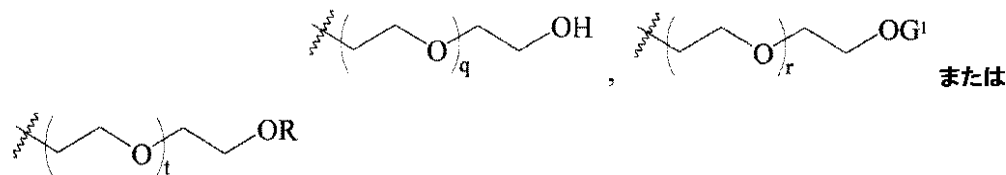


20

または $C - Q$ であり、ここで、 n が、1 であり、 J が、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH または NG^1 であるとき、 L は、 H または $A - D$ であり、ここで、 A は、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり、 D は、 G^1 、 R 、

【0028】

【化12】



30

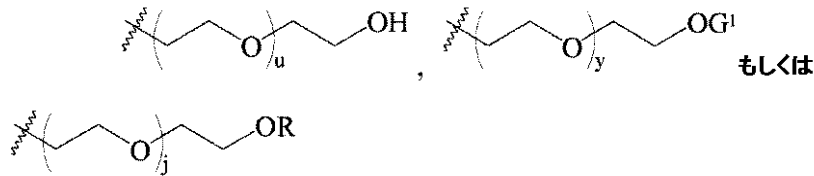
であり；

ii) 芳香族環上の X に対してパラ位の 1 つの Z が、 CG^1 、 COG^1 、 $CNHG^1$ 、 CNG^1_2 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であるとき、他方の芳香族環上の X に対してパラ位の Z は、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CNH_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、 $C - T$ であり、ここで、 m が、1 であり、 J^2 が、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH または NG^1 であるとき、 L^2 は、 H または $A^2 - D^2$ であり、ここで、 A^2 は、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり； D^2 は、 G^1 、 R 、

40

【0029】

【化13】

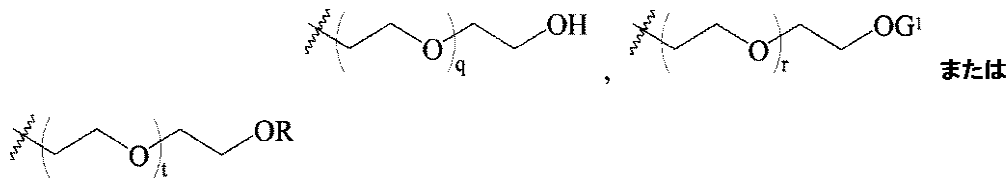


またはC - Qであり、ここで、nが、1であり、Jが、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NHまたはNG¹であるとき、Lは、HまたはA - Dであり、ここで、Aは、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり、Dは、G¹、R、

10

【0030】

【化14】



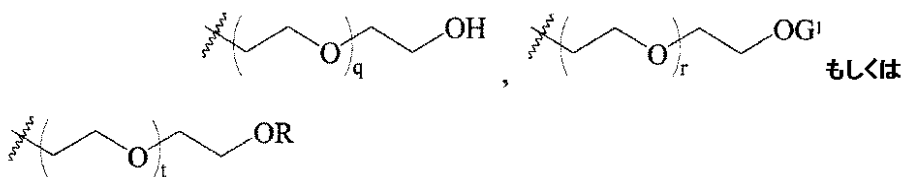
であり；

iii) 芳香族環上のXに対してパラ位の1つのZが、C - Tであり；mが、1であり；J²が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NHまたはNG¹であり；L²が、A² - D²であり；A²が、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり；D²が、Hまたは表1から選択される部分であるとき、他方の芳香族環上のXに対してパラ位のZは、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CNH₂、COSO₃H、COPO₃H₂、C - Qであり、ここで、nが、1であり、Jが、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NHまたはNG¹であるとき、Lは、HまたはA - Dであり、ここで、Aは、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり；Dは、G¹、R、

20

【0031】

【化15】

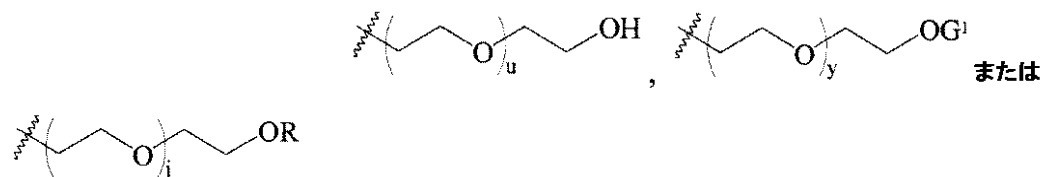


またはC - Tであり、ここで、mが、1であり、J²が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NHまたはNG¹であるとき、L²は、HまたはA² - D²であり、ここで、A²は、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり、D²は、G¹、R、

40

【0032】

【化16】



である。

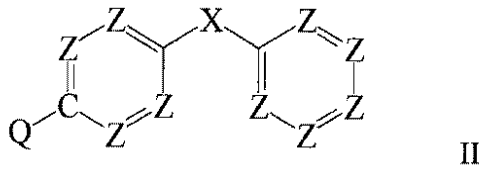
【0033】

50

別の実施形態によると、式 I I の構造を有する化合物

【 0 0 3 4 】

【 化 1 7 】

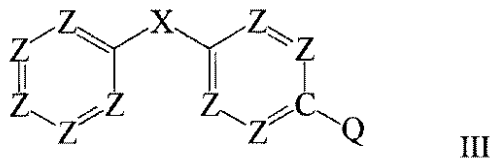


またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式 I I I の構造を有する化合物

10

【 0 0 3 5 】

【 化 1 8 】

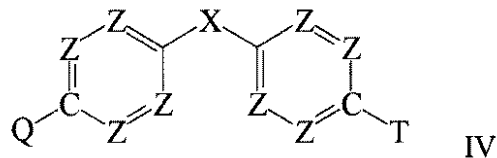


またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式 I V の構造を有する化合物

20

【 0 0 3 6 】

【 化 1 9 】

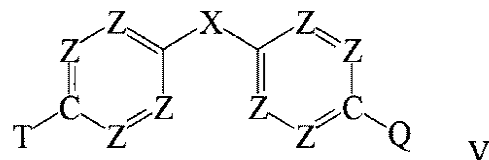


またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、QおよびTの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式 V の構造を有する化合物

30

【 0 0 3 7 】

【 化 2 0 】

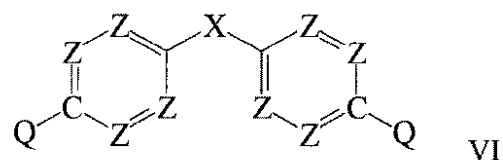


またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、QおよびTの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式 V I の構造を有する化合物

40

【 0 0 3 8 】

【 化 2 1 】



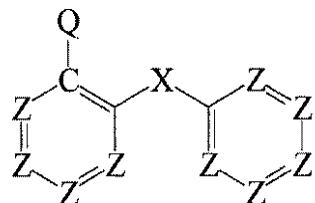
またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は

50

、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおりに定義され得る。別の実施形態によると、式VIIの構造を有する化合物

【0039】

【化22】



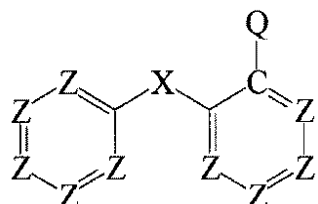
VII

10

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおりに定義され得る。別の実施形態によると、式VIIIの構造を有する化合物

【0040】

【化23】



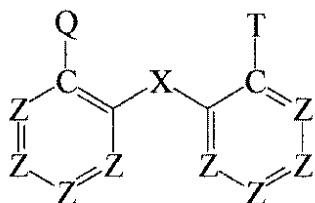
VIII

20

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおりに定義され得る。別の実施形態によると、式IXの構造を有する化合物

【0041】

【化24】



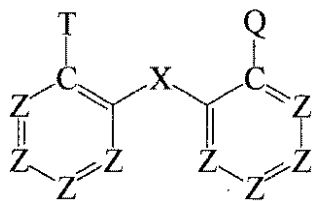
IX

30

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、QおよびTの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおりに定義され得る。別の実施形態によると、式Xの構造を有する化合物

【0042】

【化25】



X

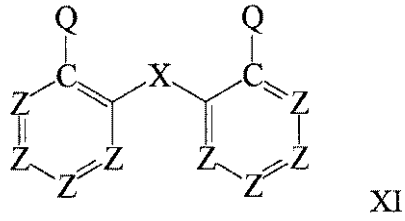
40

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、QおよびTの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおりに定義され得る。別の実施形態によると、式XIの構造を有する化合物

50

【 0 0 4 3 】

【 化 2 6 】

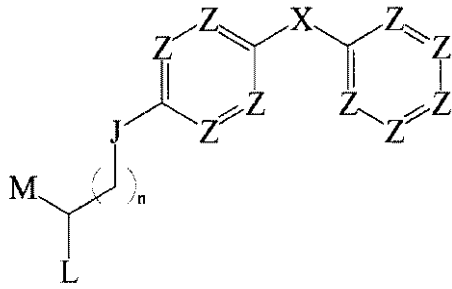


またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、ZおよびQの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式X I Iの構造を有する化合物

10

【 0 0 4 4 】

【 化 2 7 】

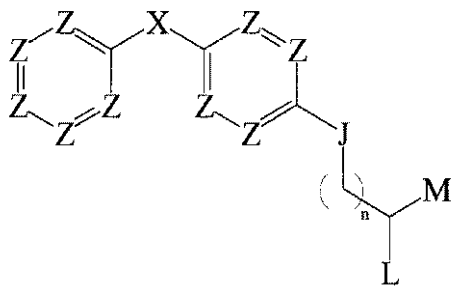


20

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式X I I Iの構造を有する化合物

【 0 0 4 5 】

【 化 2 8 】



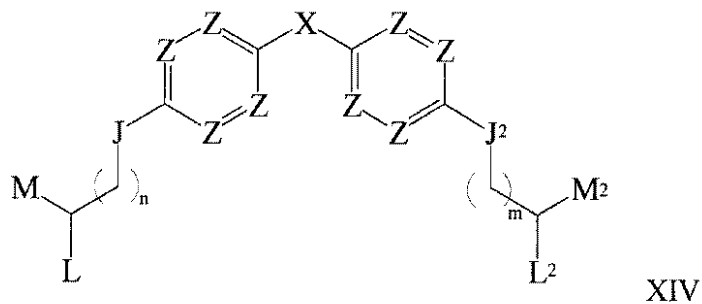
30

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式X I Vの構造を有する化合物

40

【 0 0 4 6 】

【化29】

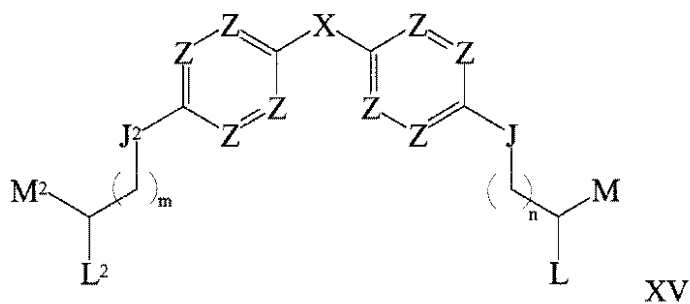


10

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、J²、M、M²、L、L²、nおよびmの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XVの構造を有する化合物

【0047】

【化30】

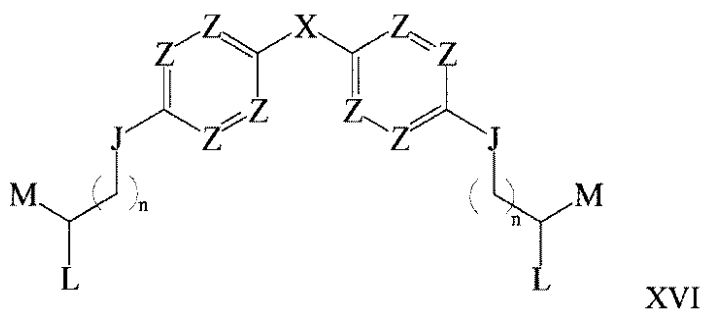


20

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、J²、M、M²、L、L²、nおよびmの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XVIの構造を有する化合物

【0048】

【化31】



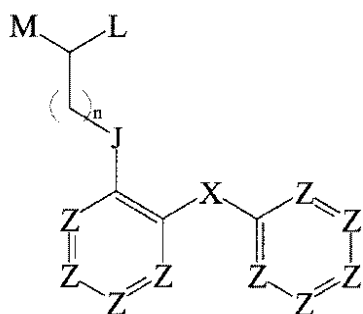
30

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XVIIの構造を有する化合物

40

【0049】

【化32】



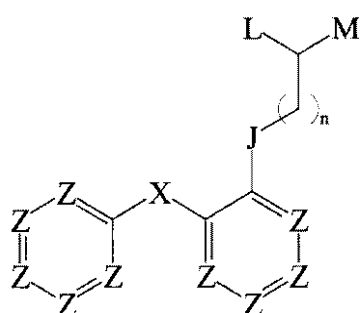
XVII

10

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XVIIの構造を有する化合物

【0050】

【化33】



XVIII

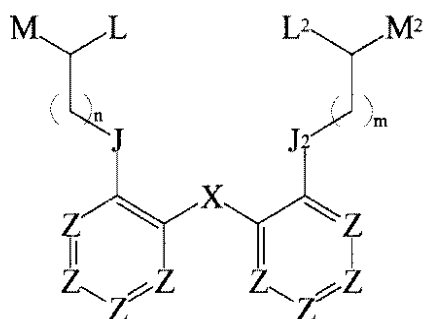
20

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XVIIIの構造を有する化合物

【0051】

30

【化34】



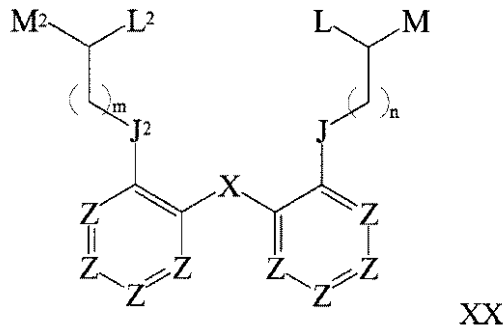
XIX

40

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、J²、M、M²、L、L²、nおよびmの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XIXの構造を有する化合物

【0052】

【化35】

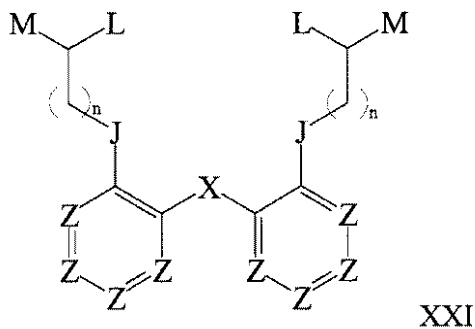


10

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、J²、M、M²、L、L²、nおよびmの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。別の実施形態によると、式XXIの構造を有する化合物

【0053】

【化36】



20

またはその薬学的に許容され得る塩の使用が提供され、ここで、X、Z、J、M、Lおよびnの各々は、独立して、本明細書中のいずれかの箇所のとおり定義され得る。

【0054】

各Jは、独立して、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH、NG¹、SO、SO₂またはNRであり得る。各Jは、独立して、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NHまたはNG¹であり得る。各Jは、独立して、O、S、NH、NG¹、SO、SO₂またはNRであり得る。各Jは、独立して、O、S、SOまたはSO₂であり得る。各Jは、独立して、O、NH、NG¹またはNRであり得る。各Jは、独立して、S、NH、NG¹、SO、SO₂またはNRであり得る。各Jは、独立して、S、SOまたはSO₂であり得る。各Jは、独立して、NH、NG¹またはNRであり得る。各Jは、独立して、G¹、CH₂、CHG¹またはCG¹₂であり得る。各Jは、独立して、O、CH₂、SまたはNHであり得る。各Jは、独立して、O、CH₂またはNHであり得る。各Jは、独立して、OまたはCH₂であり得る。各Jは、独立して、G¹、O、CHG¹またはNHであり得る。各Jは、独立して、G¹、OまたはCHG¹であり得る。各Jは、独立して、G¹またはOであり得る。各Jは、独立して、OまたはSであり得る。各Jは、独立して、G¹であり得る。各Jは、独立して、CH₂であり得る。各Jは、CHG¹であり得る。各Jは、CG¹₂であり得る。各Jは、NRであり得る。各Jは、SO₂であり得る。各Jは、SOであり得る。各Jは、NG¹であり得る。各Jは、NHであり得る。各Jは、Sであり得る。各Jは、Oであり得る。

30

40

【0055】

各Mは、独立して、H、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、CHBr₂、CBr₃またはC—CHであり得る。各Mは、独立して、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、CHBr₂またはCBr₃であり得る。各Mは、独立して、Cl、CH₂Cl、CHCl₂またはCCl₃であり得る。各Mは、

50

独立して、Br、CH₂Br、CHBr₂またはCBr₃であり得る。各Mは、独立して、ClまたはBrであり得る。各Mは、独立して、CH₂ClまたはCH₂Brであり得る。各Mは、独立して、CHCl₂またはCHBr₂であり得る。各Mは、独立して、CCl₃またはCBr₃であり得る。各Mは、独立して、CH₂Cl、CHCl₂またはCCl₃であり得る。各Mは、独立して、CH₂Br、CHBr₂またはCBr₃であり得る。各Mは、独立して、Cl、CH₂ClまたはCHCl₂であり得る。各Mは、独立して、Br、CH₂BrまたはCHBr₂であり得る。各Mは、独立して、CH₂ClまたはCHCl₂であり得る。各Mは、独立して、CH₂BrまたはCHBr₂であり得る。各Mは、独立して、ClまたはCCl₃であり得る。各Mは、独立して、BrまたはCBr₃であり得る。各Mは、Hであり得る。各Mは、Clであり得る。各Mは、Brであり得る。各Mは、CHCl₂であり得る。各Mは、CCl₃であり得る。各Mは、CH₂Brであり得る。各Mは、CHBr₂であり得る。各Mは、CBr₃であり得る。各Mは、C—CHであり得る。各Mは、CH₂Clであり得る。

10

【0056】

各Lは、独立して、HまたはA—Dであり得る。各Lは、Hであり得る。各Lは、A—Dであり得る。

【0057】

各Aは、独立して、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり得る。各Aは、独立して、O、NHまたはN⁺H₂であり得る。各Aは、独立して、O、S、NHまたはN⁺H₂であり得る。各Aは、独立して、O、SまたはNHであり得る。各Aは、独立して、OまたはNHであり得る。各Aは、独立して、OまたはSであり得る。各Aは、Sであり得る。各Aは、NHであり得る。各Aは、NG¹であり得る。各Aは、N⁺H₂であり得る。各Aは、N⁺HG¹であり得る。各Aは、Oであり得る。

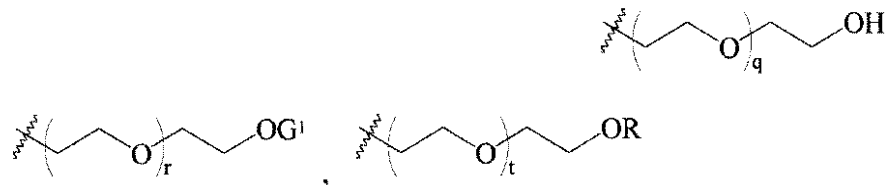
20

【0058】

各Dは、独立して、H、G¹、R、

【0059】

【化37】

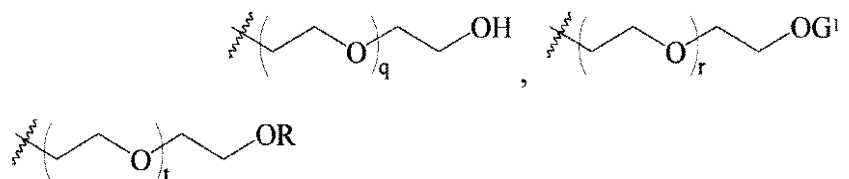


30

または表1から選択される部分であり得る。各Dは、独立して、H、G¹またはRであり得る。各Dは、独立して、HまたはRであり得る。各Dは、独立して、G¹またはRであり得る。各Dは、独立して、HまたはG¹であり得る。各Dは、独立して、

【0060】

【化38】

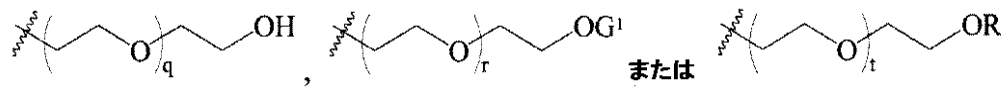


40

または表1から選択される部分であり得る。各Dは、独立して、

【0061】

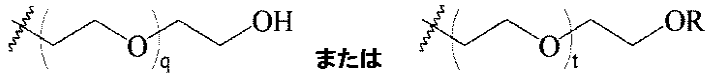
【化39】



であり得る。各Dは、独立して、

【0062】

【化40】



10

であり得る。各Dは、独立して、

【0063】

【化41】

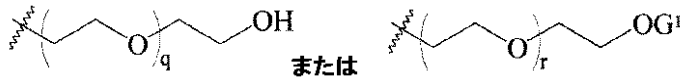


であり得る。各Dは、独立して、

【0064】

【化42】

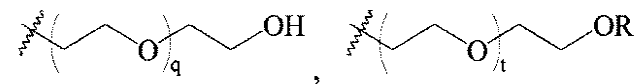
20



であり得る。各Dは、独立して、

【0065】

【化43】

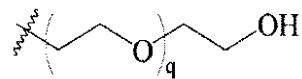


または表1から選択される部分であり得る。各Dは、独立して、

30

【0066】

【化44】

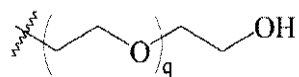


または表1から選択される部分であり得る。各Dは、Hであり得る。各Dは、G¹であり得る。各Dは、Rであり得る。各Dは、

【0067】

【化45】

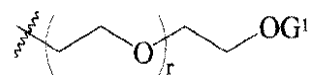
40



であり得る。各Dは、

【0068】

【化46】

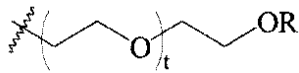


であり得る。各Dは、

【0069】

50

【化47】



であり得る。各Dは、表1から選択される部分であり得る。

【0070】

各 J^2 は、独立して、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NHまたは NG^1 であり得る。各 J^2 は、独立して、O、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり得る。各 J^2 は、独立して、O、S、SOまたは SO_2 であり得る。各 J^2 は、独立して、O、NH、 NG^1 またはNRであり得る。各 J^2 は、独立して、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり得る。各 J^2 は、独立して、S、SOまたは SO_2 であり得る。各 J^2 は、独立して、NH、 NG^1 またはNRであり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 、 CH_2 、 CHG^1 または CG^1_2 であり得る。各 J^2 は、独立して、O、 CH_2 、SまたはNHであり得る。各 J^2 は、独立して、O、 CH_2 またはNHであり得る。各 J^2 は、独立して、Oまたは CH_2 であり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 、O、 CHG^1 またはNHであり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 、Oまたは CHG^1 であり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 またはOであり得る。各 J^2 は、独立して、OまたはSであり得る。各 J^2 は、独立して、 G^1 であり得る。各 J^2 は、独立して、 CH_2 であり得る。各 J^2 は、 CHG^1 であり得る。各 J^2 は、 CG^1_2 であり得る。各 J^2 は、NRであり得る。各 J^2 は、 SO_2 であり得る。各 J^2 は、SOであり得る。各 J^2 は、 NG^1 であり得る。各 J^2 は、NHであり得る。各 J^2 は、Sであり得る。各 J^2 は、Oであり得る。

【0071】

各 M^2 は、独立して、H、 CH_3 、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ'' 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1'$ 、 G^1OG^1' 、 $G^1OG^1'OG^1''$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ またはC-CHであり得る。各 M^2 は、独立して、H、 CH_3 、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CH_2OJ'' 、 CH_2OG 、 CH_2OGOG' 、 GOG' 、 $GOG'OG''$ 、 CH_2SG 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG または CH_2NG_2 であり得る。各 M^2 は、独立して、H、 CH_3 、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CH_2OJ'' 、 CH_2OG または CH_2OGOG' であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CH_2OH 、 CH_2OCH_3 、 CH_2O (イソプロピル)または $CH_2OC_2H_4OC_4H_9$ であり得る。各 M^2 は、独立して、H、 CH_3 、 CH_3OCH_3 、 $CH_3OCH_2CH_3$ 、 CH_2Cl または CH_2Br であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_3 、 $CH_3OCH_2CH_3$ 、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CH_2OH 、 CH_2OCH_3 または CH_2O (イソプロピル)であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_3 、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CH_2OH 、 $CH_3OCH_2CH_3$ または CH_2OCH_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_3 、 CH_2OH 、 CH_2OCH_3 または $CH_2OCH_2CH_3$ であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Cl または CH_2Br であり得る。各 M^2 は、独立して、H、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 またはC-CHであり得る。各 M^2 は、独立して、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ または CBr_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、Cl、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ または CCl_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、Br、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ または CBr_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、ClまたはBrであり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Cl または CH_2Br であり得る。各 M^2 は、独立して、 $CHCl_2$ または $CHBr_2$ であり得る。各 M^2 は、独立して、 CCl_3 または CBr_3 であり得る。各 M^2 は、独立して

、 CH_2Cl 、 CHCl_2 または CCl_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Br 、 CHBr_2 または CBr_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、 Cl 、 CH_2Cl または CHCl_2 であり得る。各 M^2 は、独立して、 Br 、 CH_2Br または CHBr_2 であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Cl または CHCl_2 であり得る。各 M^2 は、独立して、 CH_2Br または CHBr_2 であり得る。各 M^2 は、独立して、 Cl または CCl_3 であり得る。各 M^2 は、独立して、 Br または CBr_3 であり得る。各 M^2 は、 H であり得る。各 M^2 は、 CH_3 であり得る。各 M^2 は、 Cl であり得る。各 M^2 は、 Br であり得る。各 M^2 は、 CH_2Cl であり得る。各 M^2 は、 CHCl_2 であり得る。各 M^2 は、 CCl_3 であり得る。各 M^2 は、 CH_2Br であり得る。各 M^2 は、 CHBr_2 であり得る。各 M^2 は、 CBr_3 であり得る。各 M^2 は、 CH_2OH であり得る。各 M^2 は、 $\text{CH}_2\text{OJ}''$ であり得る。各 M^2 は、 G^1 であり得る。各 M^2 は、 CH_2OG^1 であり得る。各 M^2 は、 CH_2OR であり得る。各 M^2 は、 $\text{CH}_2\text{OG}^1\text{OG}^1'$ であり得る。各 M^2 は、 $\text{G}^1\text{OG}^1'$ であり得る。各 M^2 は、 $\text{G}^1\text{OG}^1'\text{OG}^1''$ であり得る。各 M^2 は、 CH_2SG^1 であり得る。各 M^2 は、 CH_2NH_2 であり得る。各 M^2 は、 CH_2NHG^1 であり得る。各 M^2 は、 CH_2NG^1_2 であり得る。各 M^2 は、 $\text{C}-\text{CH}$ であり得る。

【0072】

各 L^2 は、独立して、 H または $\text{A}^2 - \text{D}^2$ であり得る。各 L^2 は、 H であり得る。各 L^2 は、 $\text{A}^2 - \text{D}^2$ であり得る。

【0073】

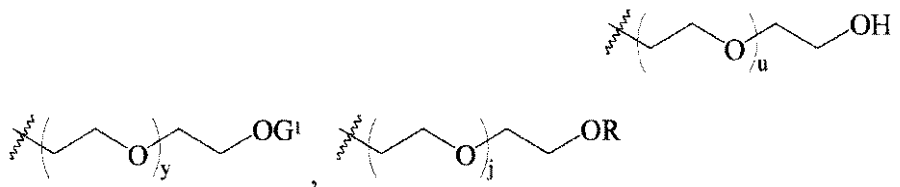
各 A^2 は、独立して、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 S 、 SO または SO_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、独立して、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH または N^+H_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 S 、 SO または SO_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、独立して、 NH または N^+H_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 NH または N^+H_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 S 、 NH または N^+H_2 であり得る。各 A^2 は、独立して、 O 、 S または NH であり得る。各 A^2 は、独立して、 O または NH であり得る。各 A^2 は、独立して、 O または S であり得る。各 A^2 は、 S であり得る。各 A^2 は、 SO であり得る。各 A^2 は、 SO_2 であり得る。各 A^2 は、 NH であり得る。各 A^2 は、 NG^1 であり得る。各 A^2 は、 N^+H_2 であり得る。各 A^2 は、 N^+HG^1 であり得る。各 A^2 は、 O であり得る。

【0074】

各 D^2 は、独立して、 H 、 G^1 、 R 、

【0075】

【化48】



または表1から選択される部分であり得る。各 D^2 は、独立して、 H 、 G^1 または R であり得る。各 D^2 は、独立して、 H または R であり得る。各 D^2 は、独立して、 G^1 または R であり得る。各 D^2 は、独立して、 H または G^1 であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0076】

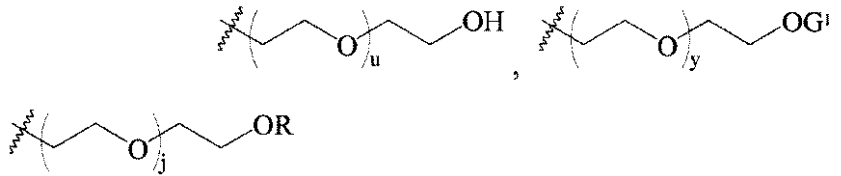
10

20

30

40

【化49】

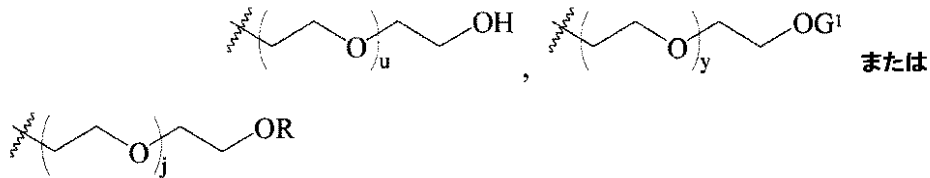


または表1から選択される部分であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0077】

【化50】

10



であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0078】

【化51】

20



であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0079】

【化52】

30



であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0080】

【化53】

40



であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0081】

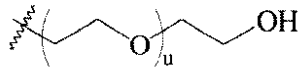
【化54】



または表1から選択される部分であり得る。各 D^2 は、独立して、

【0082】

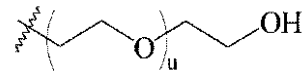
【化55】



または表1から選択される部分であり得る。各 D^2 は、Hであり得る。各 D^2 は、 G^1 であり得る。各 D^2 は、Rであり得る。各 D^2 は、

【0083】

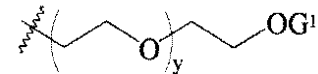
【化56】



であり得る。各 D^2 は、

【0084】

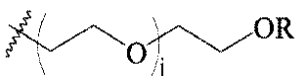
【化57】



であり得る。各 D^2 は、

【0085】

【化58】



であり得る。各 D^2 は、表1から選択される部分であり得る。

【0086】

各 Q は、独立して、

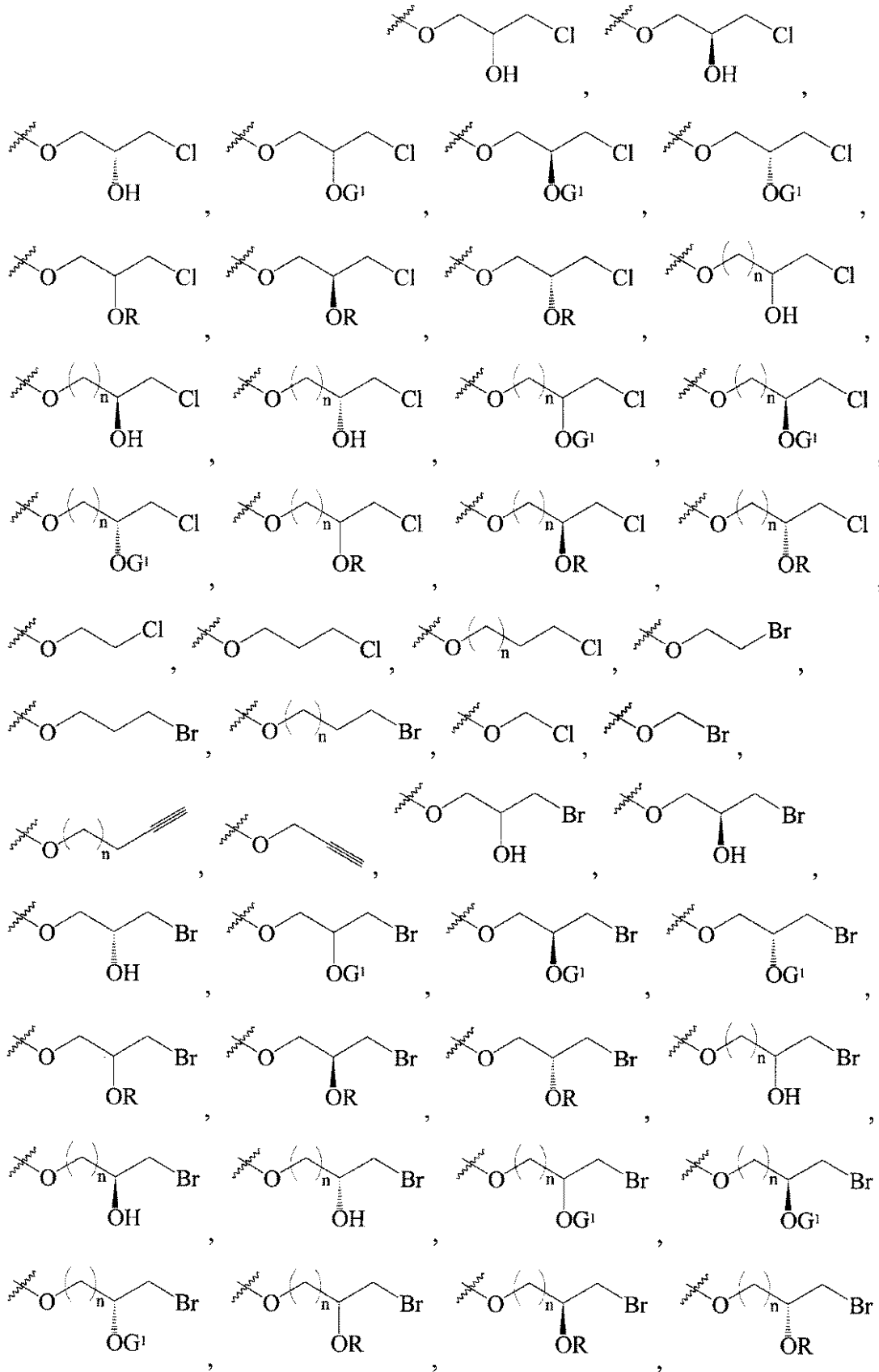
【0087】

10

20

30

【化59】



10

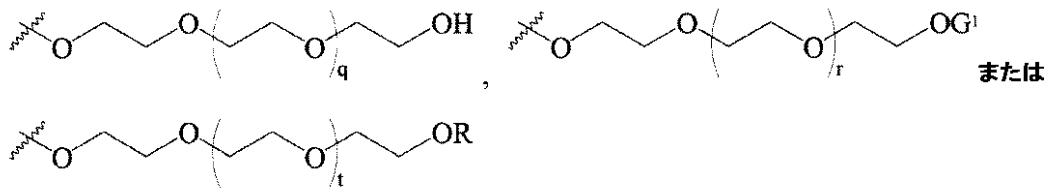
20

30

40

【0088】

【化 6 0】



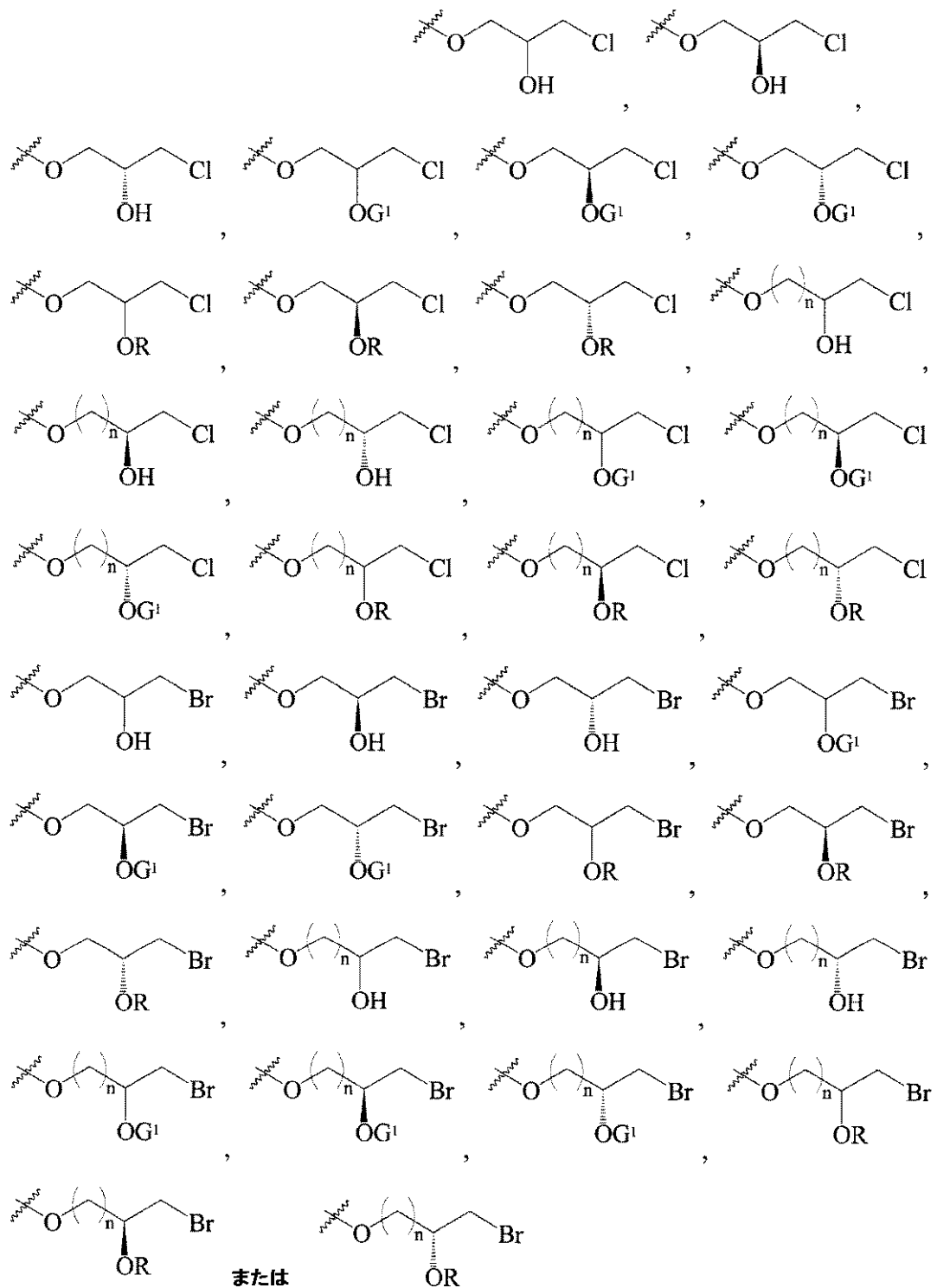
であり得る。

【 0 0 8 9 】

各 Q は、独立して、

【 0 0 9 0 】

【化 6 1】



10

20

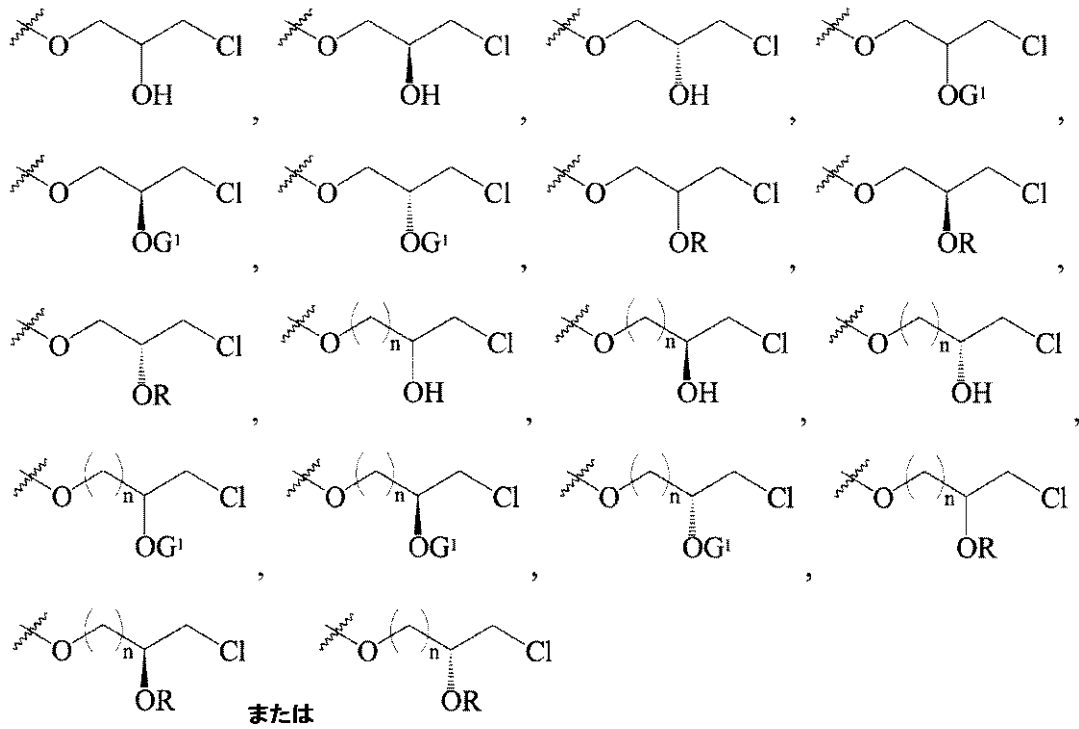
30

40

であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 0 9 1 】

【化62】



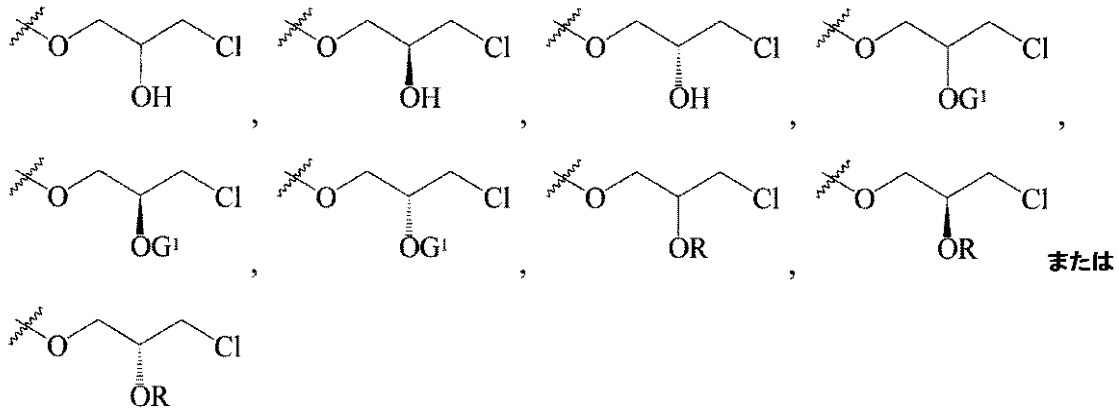
10

20

であり得る。各Qは、独立して、

【0092】

【化63】

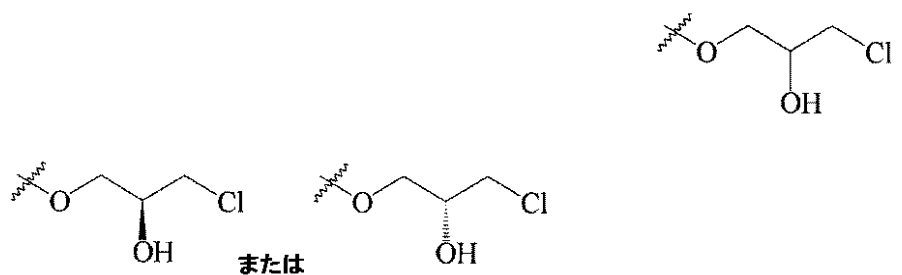


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0093】

【化64】



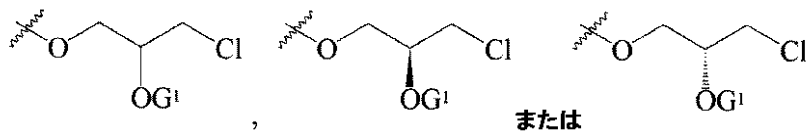
40

であり得る。各Qは、独立して、

50

【 0 0 9 4 】

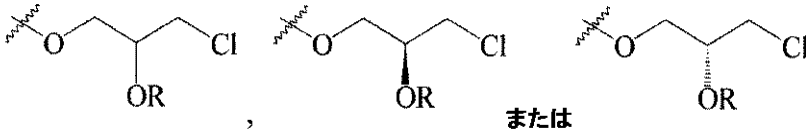
【 化 6 5 】



であり得る。各Qは、独立して、

【 0 0 9 5 】

【 化 6 6 】

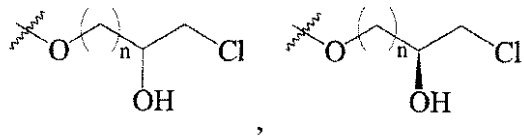


10

であり得る。各Qは、独立して、

【 0 0 9 6 】

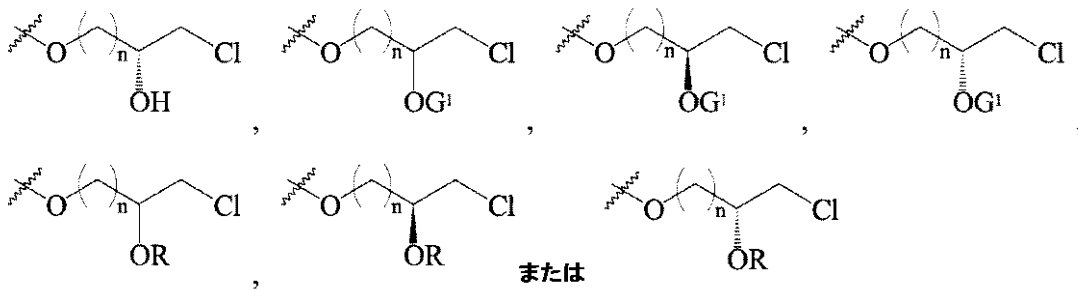
【 化 6 7 】



20

【 0 0 9 7 】

【 化 6 8 】

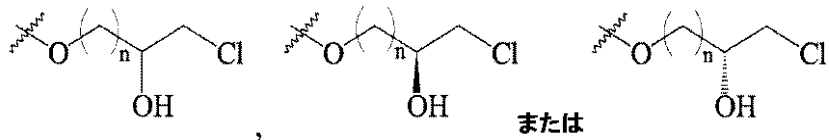


30

であり得る。各Qは、独立して、

【 0 0 9 8 】

【 化 6 9 】

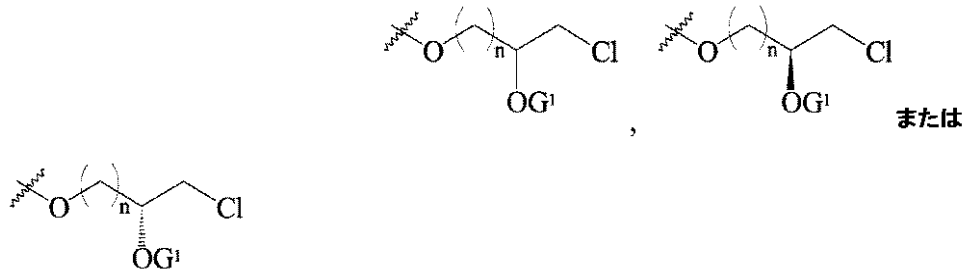


40

であり得る。各Qは、独立して、

【 0 0 9 9 】

【化70】

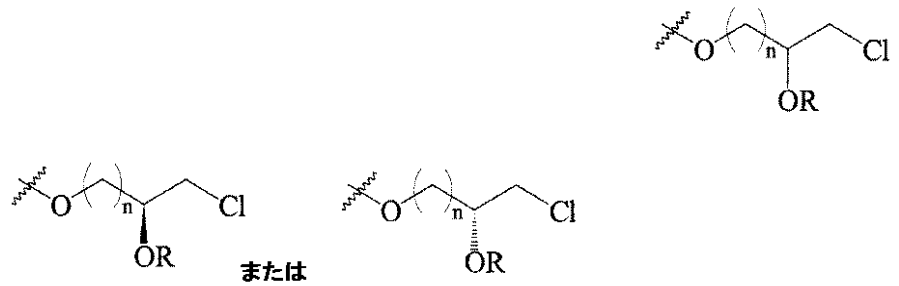


であり得る。各Qは、独立して、

10

【0100】

【化71】

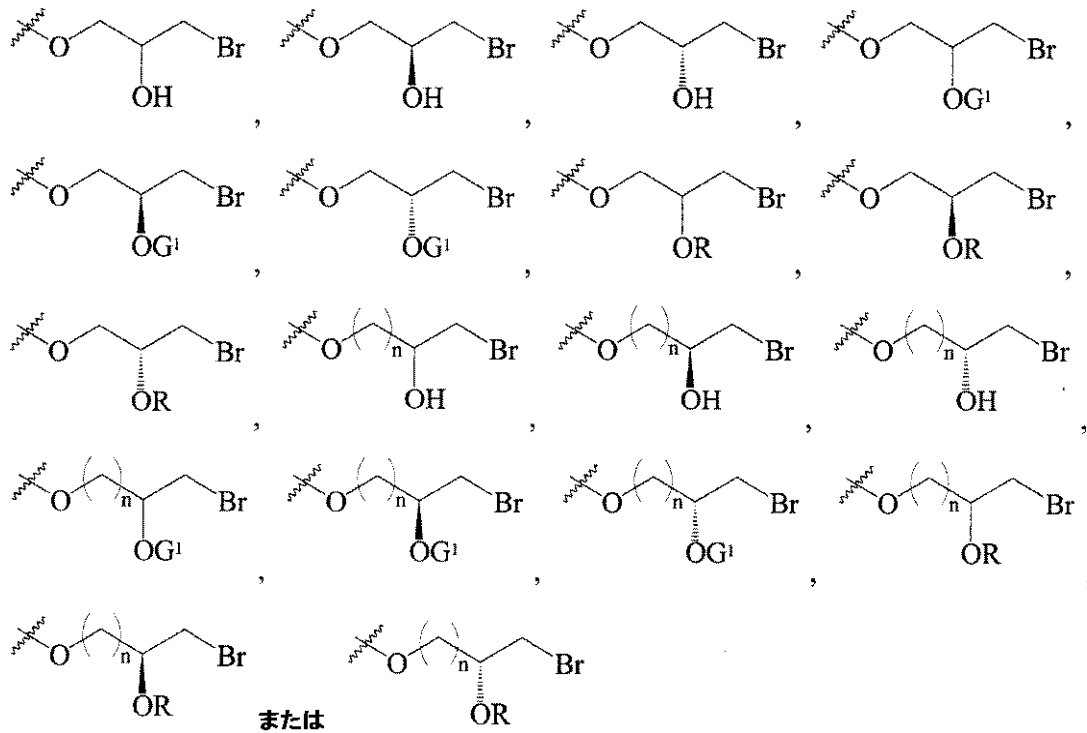


であり得る。各Qは、独立して、

20

【0101】

【化72】



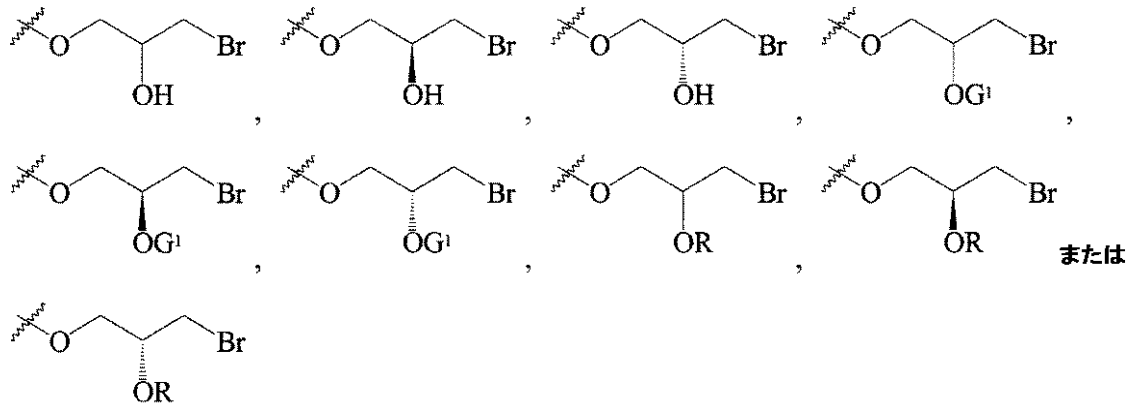
であり得る。各Qは、独立して、

30

40

【0102】

【化73】

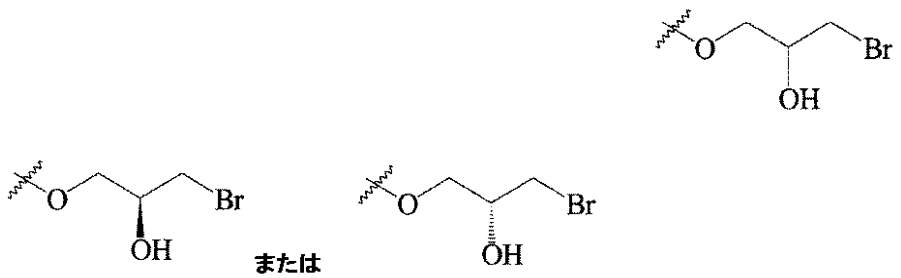


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0103】

【化74】

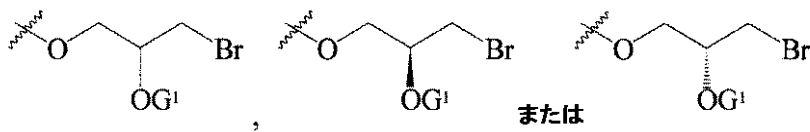


20

であり得る。各Qは、独立して、

【0104】

【化75】

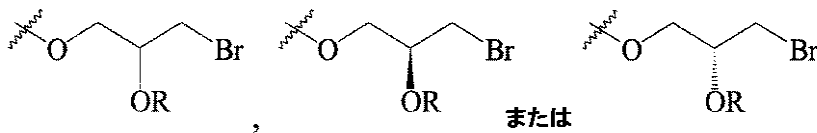


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0105】

【化76】

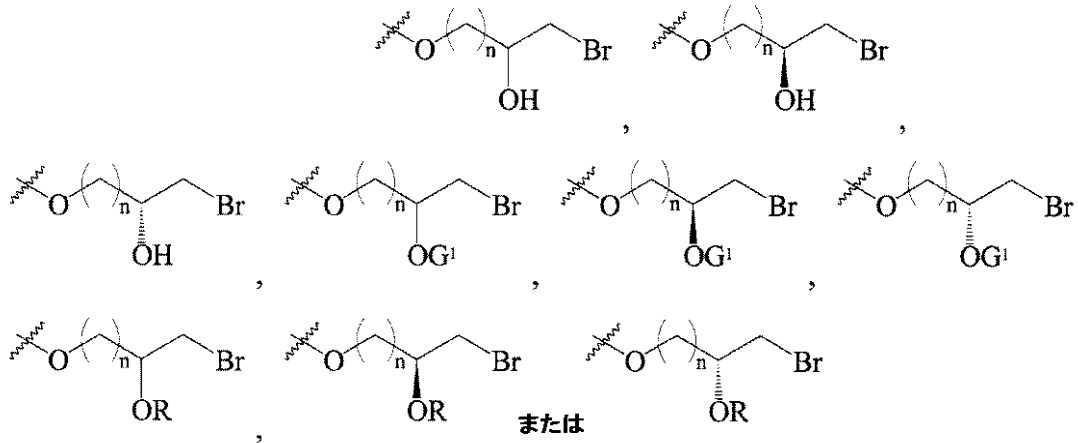


40

であり得る。各Qは、独立して、

【0106】

【化77】

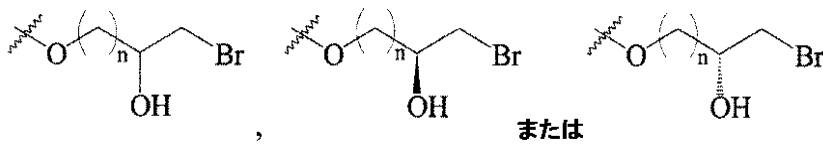


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0107】

【化78】

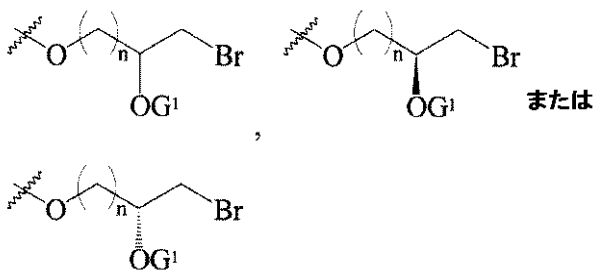


20

であり得る。各Qは、独立して、

【0108】

【化79】

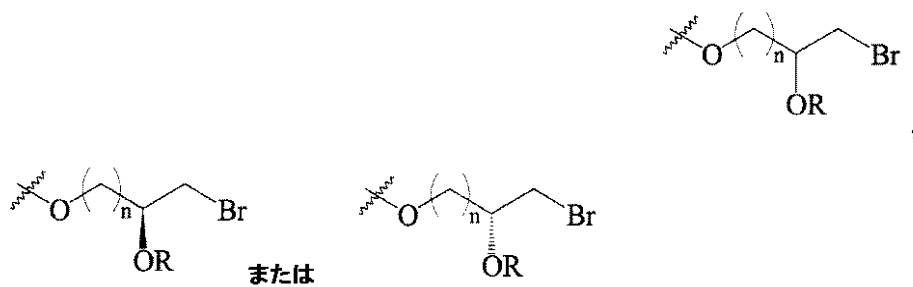


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0109】

【化80】

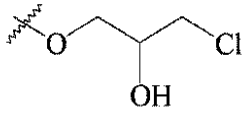


40

であり得る。各Qは、独立して、

【0110】

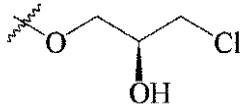
【化 8 1】



であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 1】

【化 8 2】

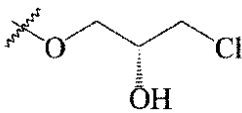


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 2】

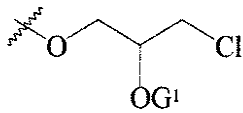
【化 8 3】



であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 3】

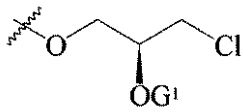
【化 8 4】



であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 4】

【化 8 5】

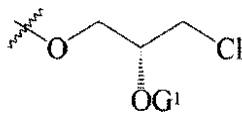


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 5】

【化 8 6】

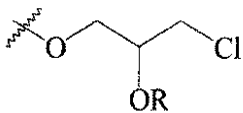


40

であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 6】

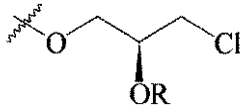
【化 8 7】



であり得る。各Qは、独立して、

【0 1 1 7】

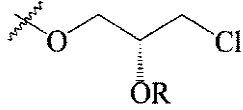
【化 8 8】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 1 8】

【化 8 9】

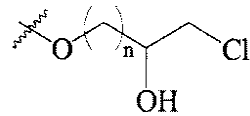


10

であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 1 9】

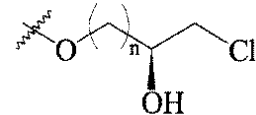
【化 9 0】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 0】

【化 9 1】

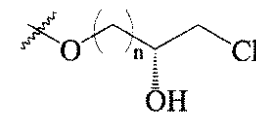


20

であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 1】

【化 9 2】

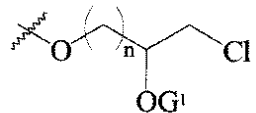


30

であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 2】

【化 9 3】

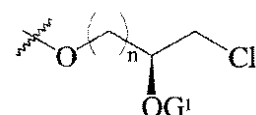


40

であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 3】

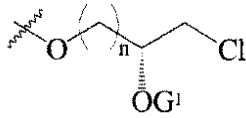
【化 9 4】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 4】

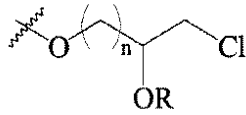
【化 9 5】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 5】

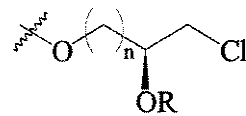
【化 9 6】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 6】

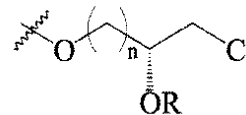
【化 9 7】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 7】

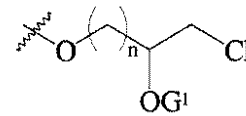
【化 9 8】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 8】

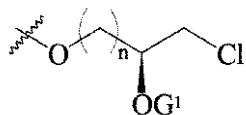
【化 9 9】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 2 9】

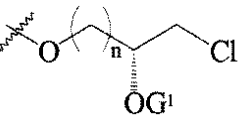
【化 1 0 0】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 3 0】

【化 1 0 1】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 3 1】

10

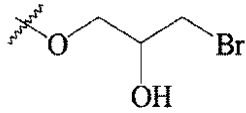
20

30

40

50

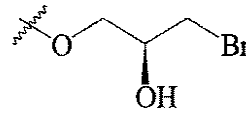
【化102】



であり得る。各Qは、独立して、

【0132】

【化103】

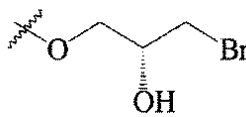


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0133】

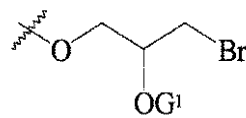
【化104】



であり得る。各Qは、独立して、

【0134】

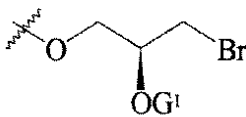
【化105】



であり得る。各Qは、独立して、

【0135】

【化106】

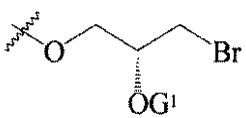


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0136】

【化107】

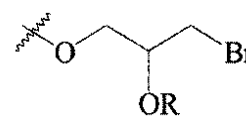


40

であり得る。各Qは、独立して、

【0137】

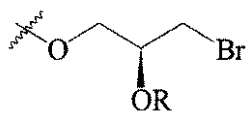
【化108】



であり得る。各Qは、独立して、

【0138】

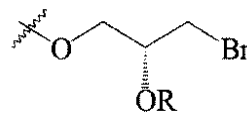
【化109】



であり得る。各Qは、独立して、

【0139】

【化110】

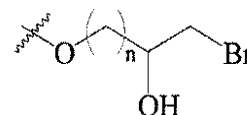


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0140】

【化111】

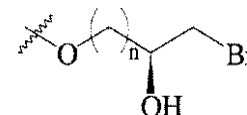


であり得る。各Qは、独立して、

【0141】

20

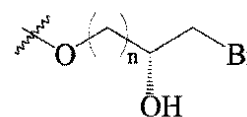
【化112】



であり得る。各Qは、独立して、

【0142】

【化113】

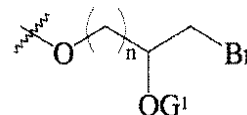


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0143】

【化114】

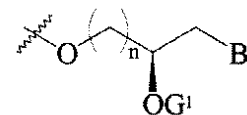


であり得る。各Qは、独立して、

【0144】

40

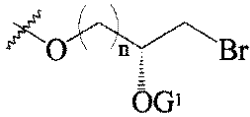
【化115】



であり得る。各Qは、独立して、

【0145】

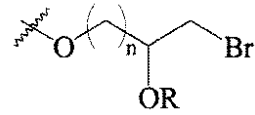
【化116】



であり得る。各Qは、独立して、

【0146】

【化117】

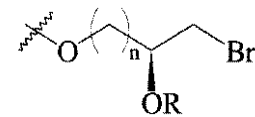


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0147】

【化118】

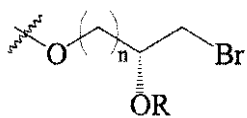


であり得る。各Qは、独立して、

20

【0148】

【化119】



であり得る。

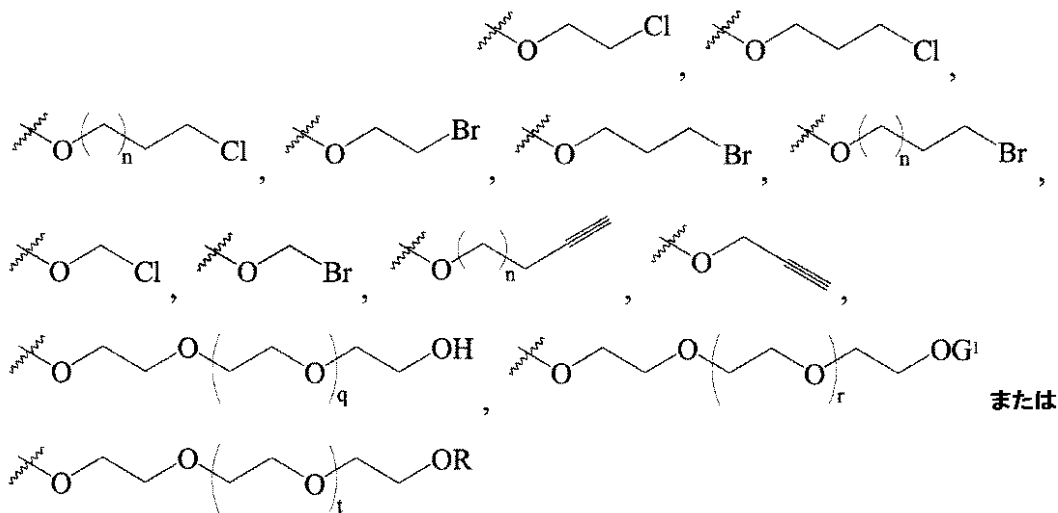
【0149】

各Qは、独立して、

30

【0150】

【化120】

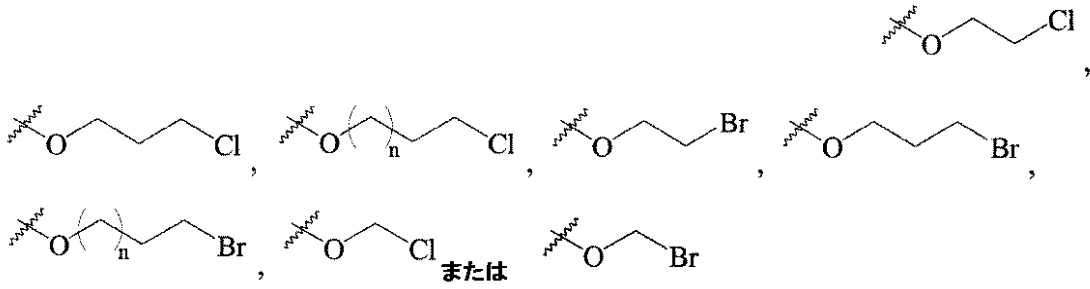


40

であり得る。各Qは、独立して、

【0151】

【化121】

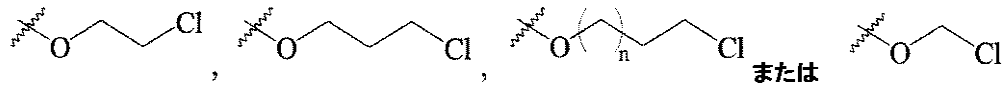


10

であり得る。各Qは、独立して、

【0152】

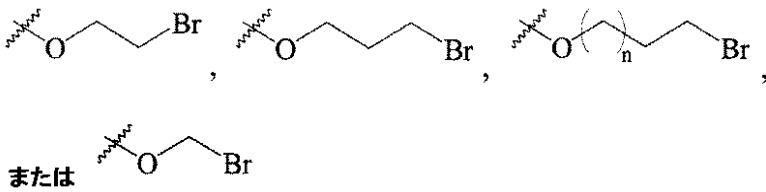
【化122】



であり得る。各Qは、独立して、

【0153】

【化123】



20

であり得る。各Qは、独立して、

【0154】

【化124】

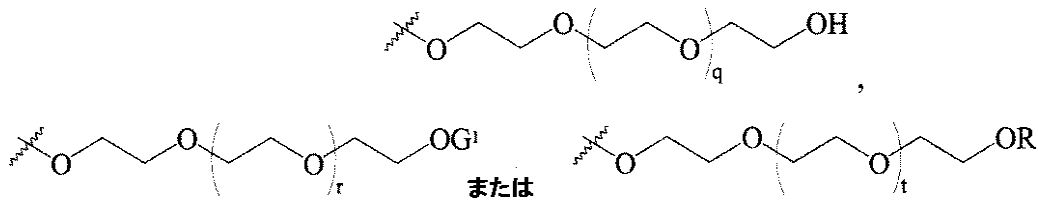


30

であり得る。各Qは、独立して、

【0155】

【化125】

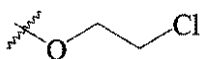


40

であり得る。各Qは、

【0156】

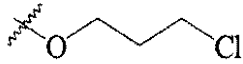
【化126】



であり得る。各Qは、

【0157】

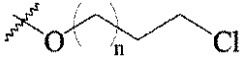
【化 1 2 7】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 5 8】

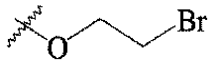
【化 1 2 8】



であり得る。各 Q は、

【 0 1 5 9】

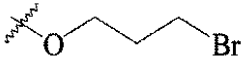
【化 1 2 9】



であり得る。各 Q は、

【 0 1 6 0】

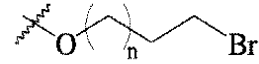
【化 1 3 0】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 6 1】

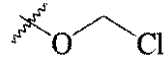
【化 1 3 1】



であり得る。各 Q は、

【 0 1 6 2】

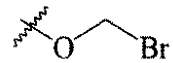
【化 1 3 2】



であり得る。各 Q は、

【 0 1 6 3】

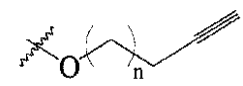
【化 1 3 3】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 6 4】

【化 1 3 4】



であり得る。各 Q は、

【 0 1 6 5】

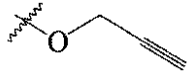
10

20

30

40

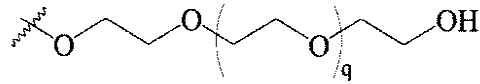
【化 1 3 5】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 6 6】

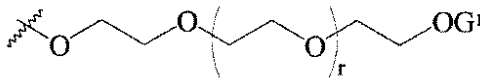
【化 1 3 6】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 6 7】

【化 1 3 7】



であり得る。各 Q は、独立して、

【 0 1 6 8】

【化 1 3 8】



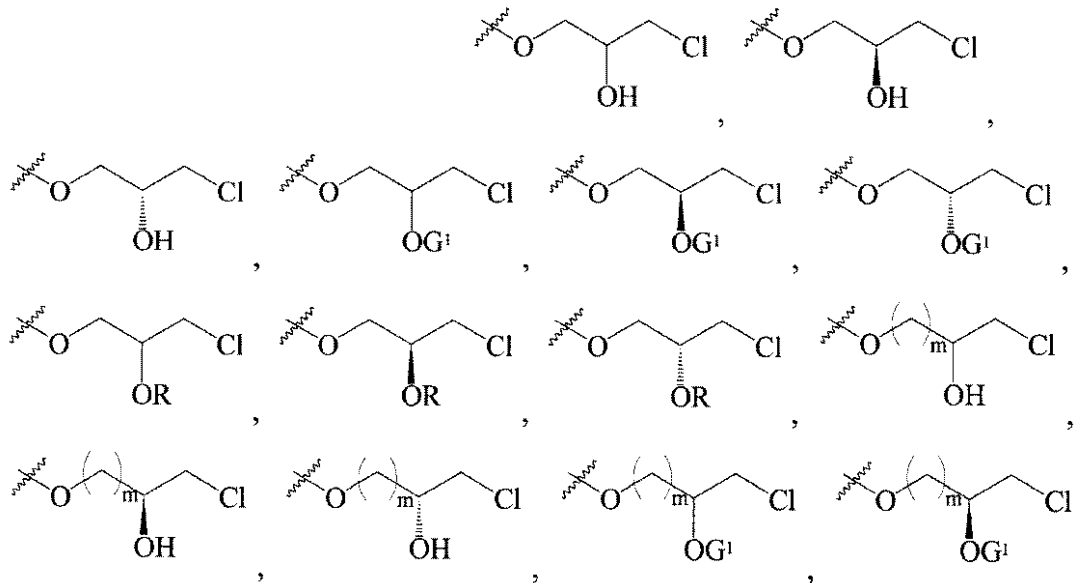
であり得る。

【 0 1 6 9】

各 T は、独立して、

【 0 1 7 0】

【化 1 3 9】



【 0 1 7 1】

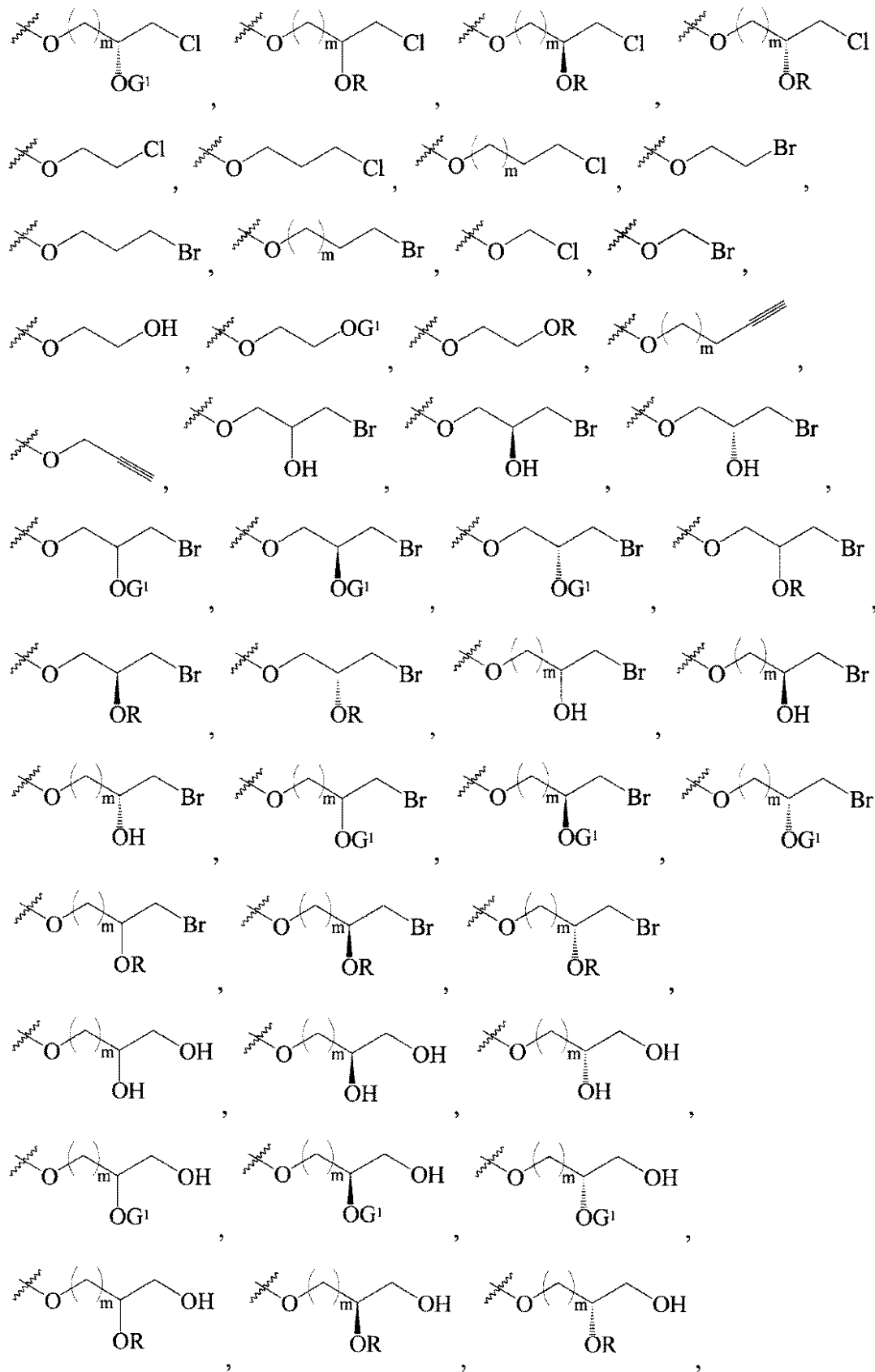
10

20

30

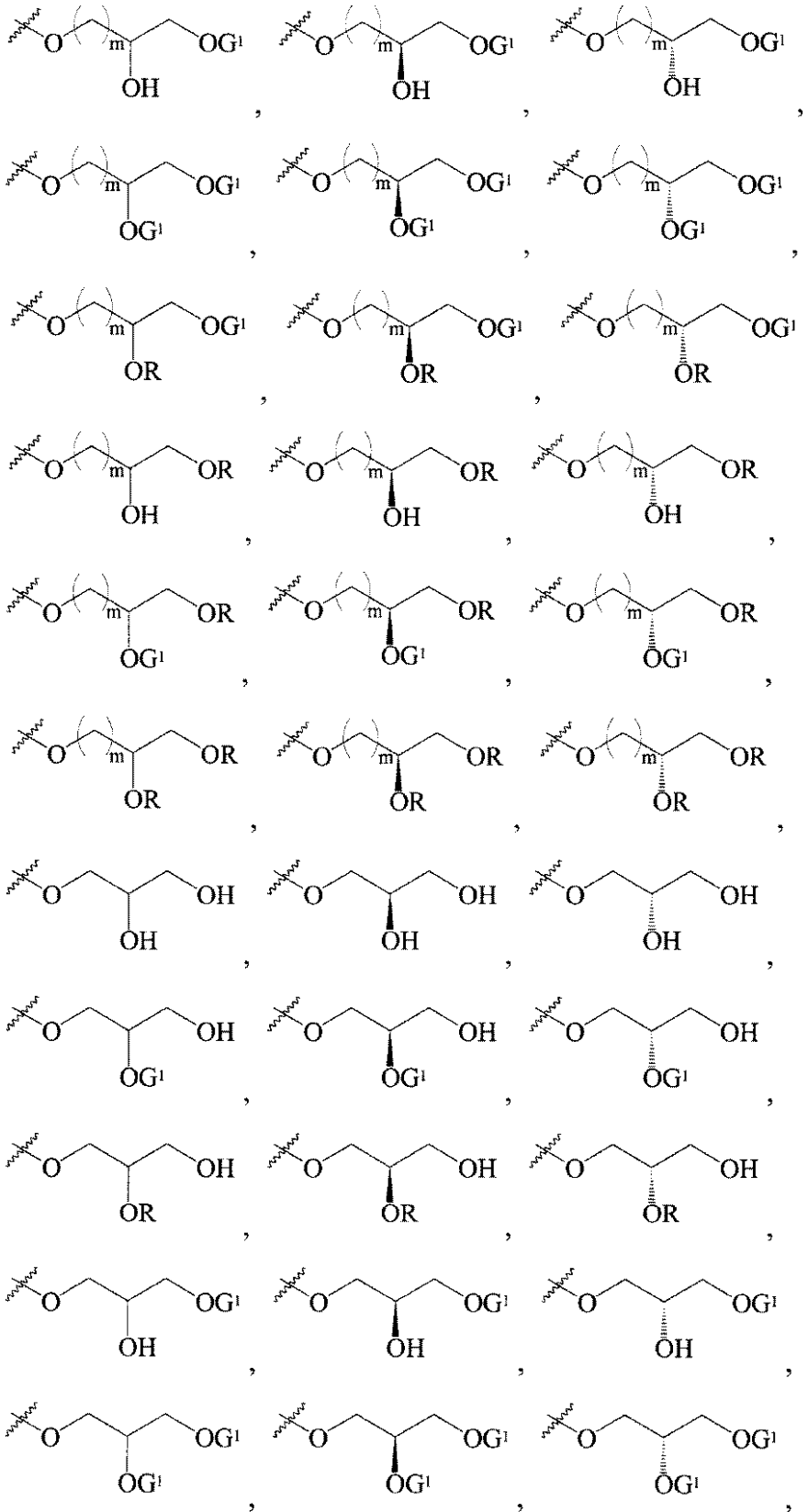
40

【化 1 4 0】



【 0 1 7 2】

【化 1 4 1】



10

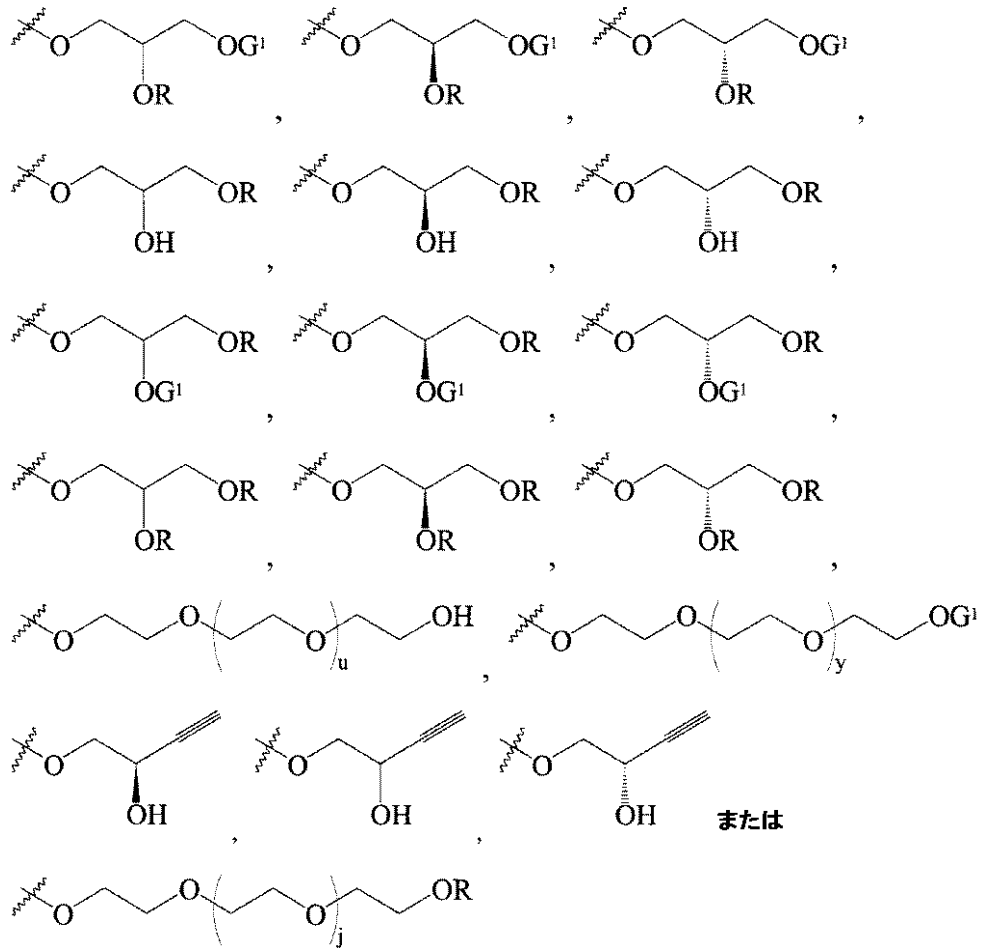
20

30

40

【 0 1 7 3 】

【化 1 4 2】



10

20

であり得る。

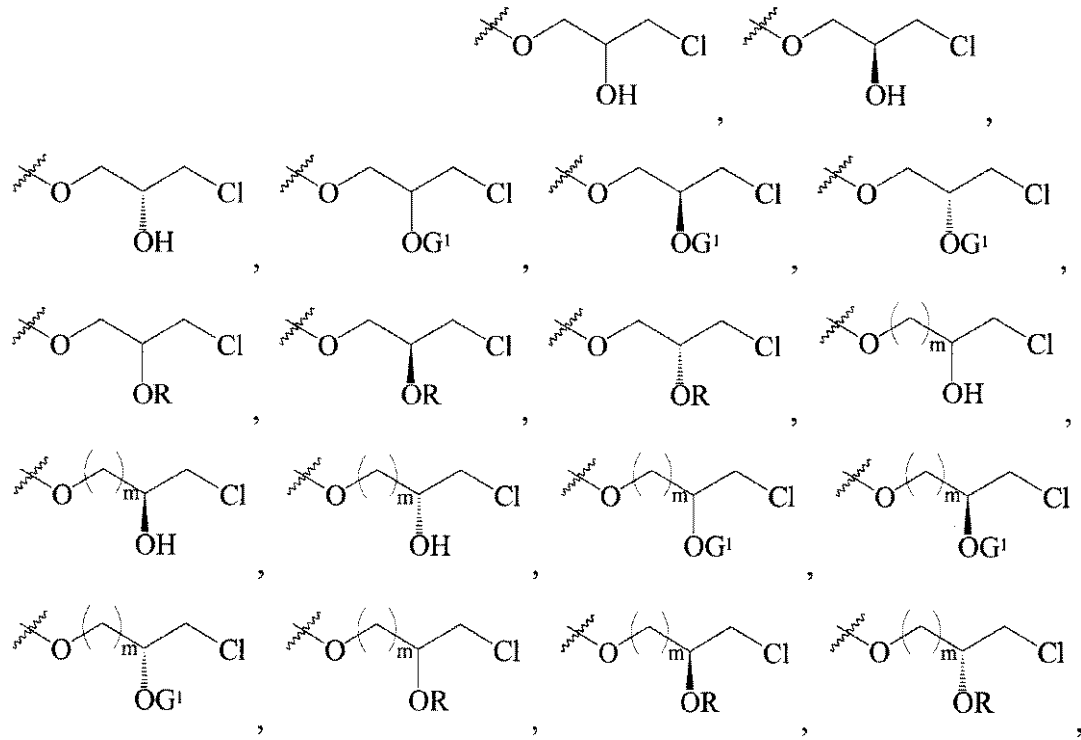
【 0 1 7 4】

各 T は、独立して、

【 0 1 7 5】

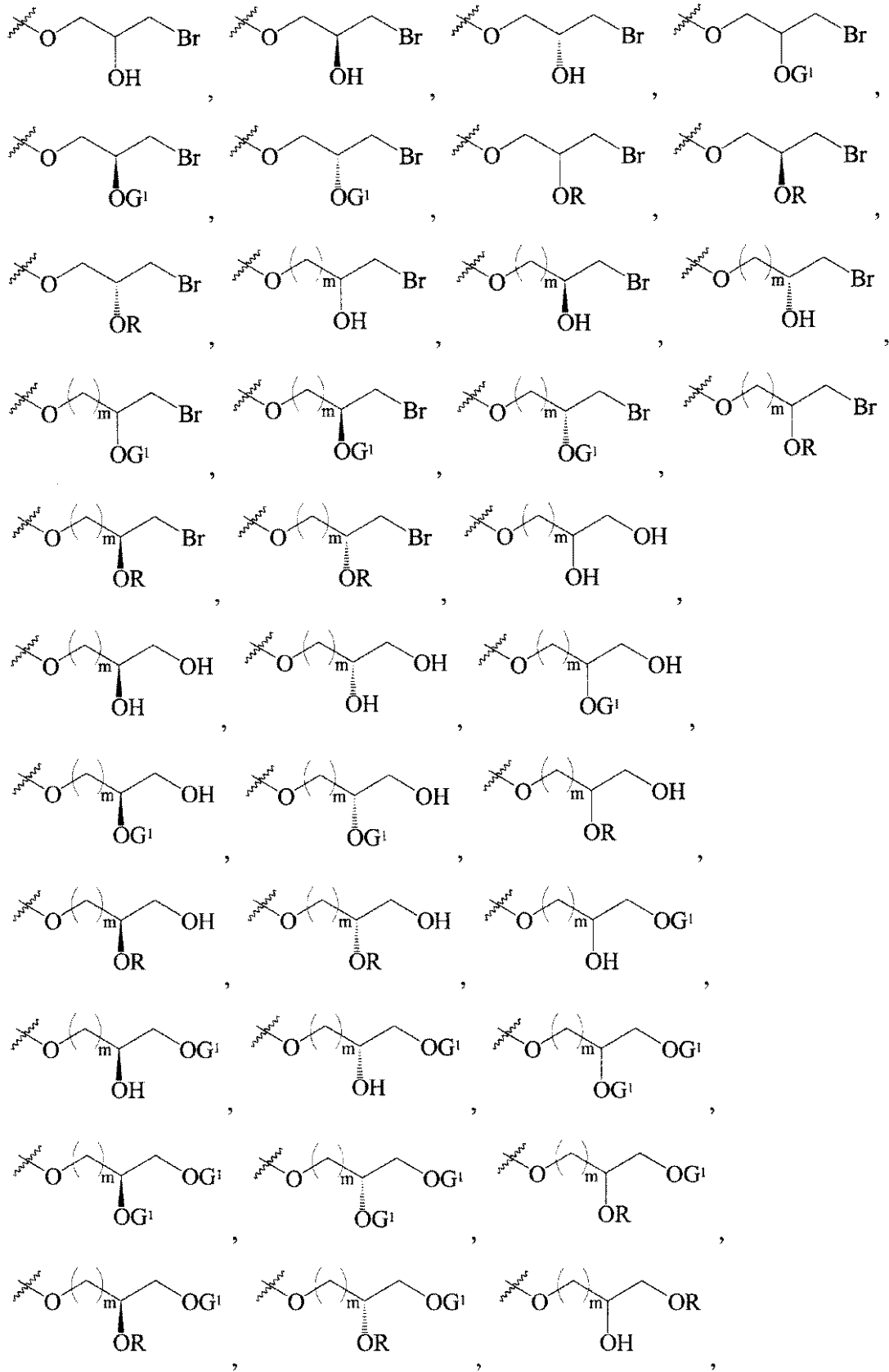
30

【化 1 4 3】



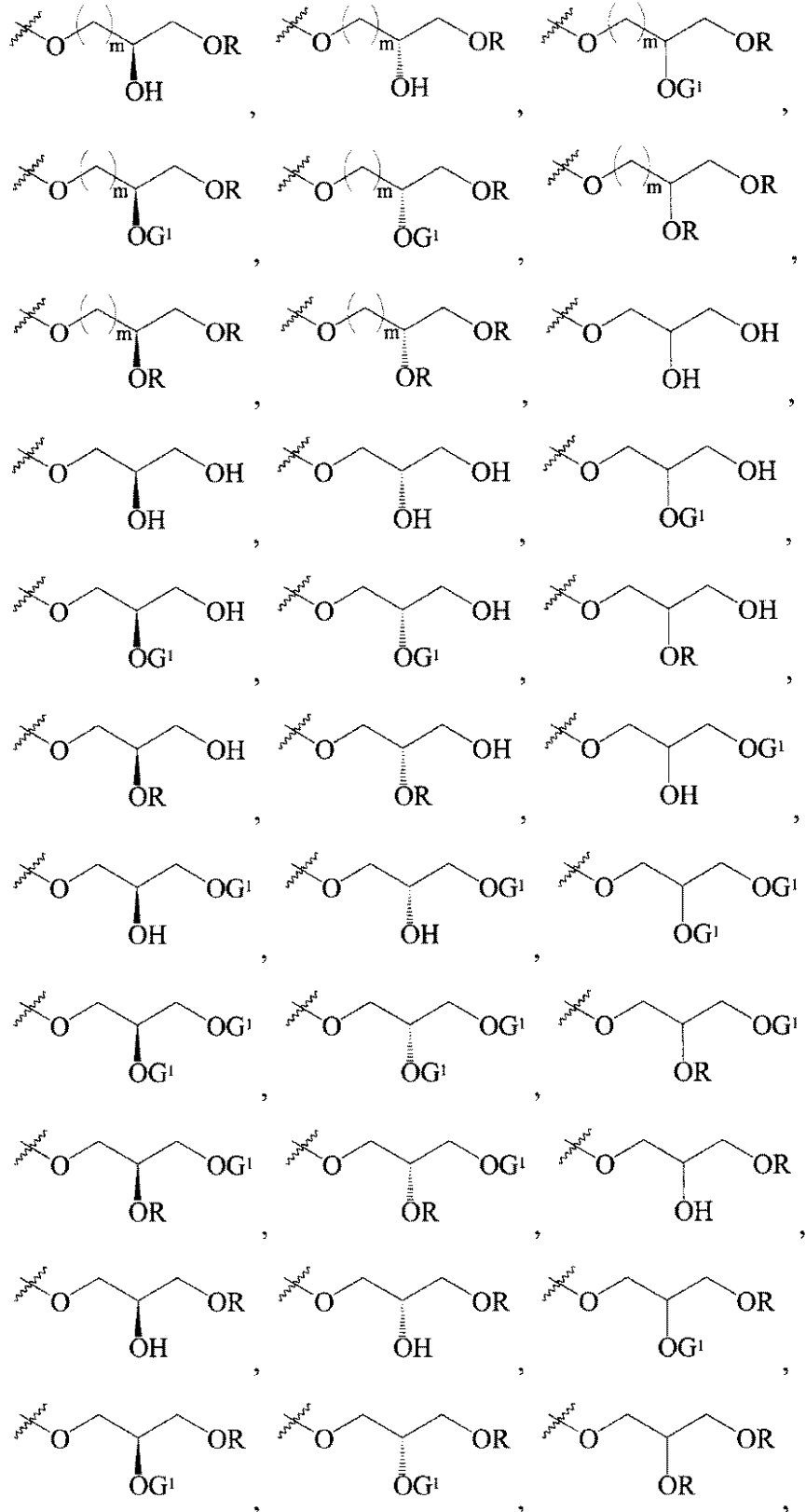
【 0 1 7 6】

【化 1 4 4】



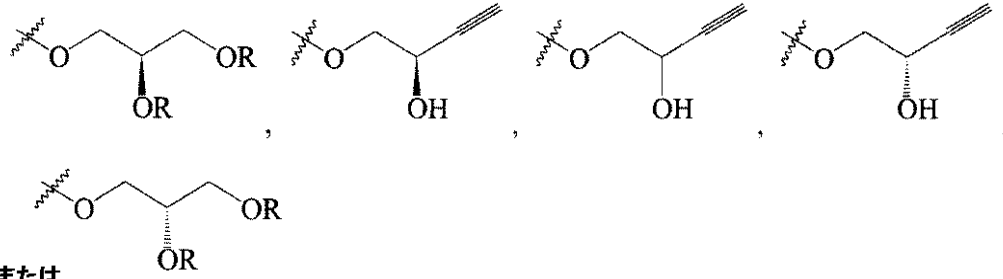
【 0 1 7 7】

【化 1 4 5】



【 0 1 7 8 】

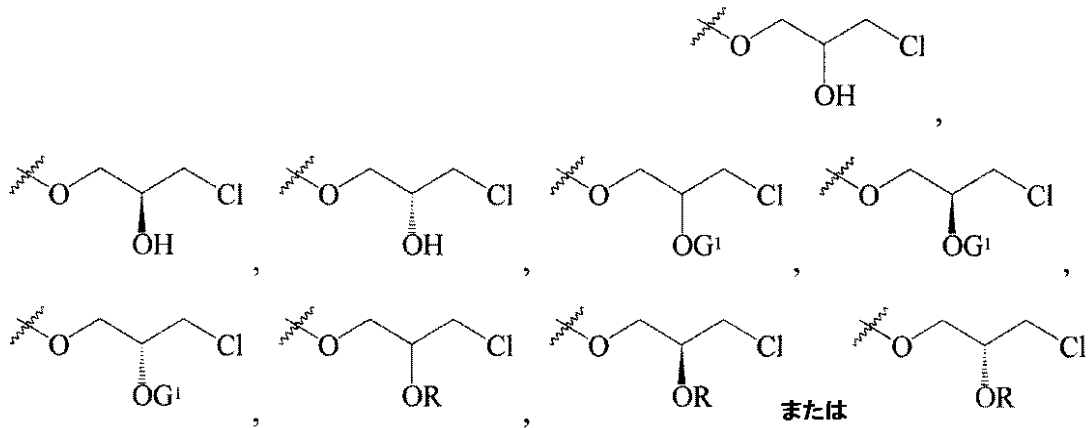
【化146】



であり得る。各Tは、独立して、

【0179】

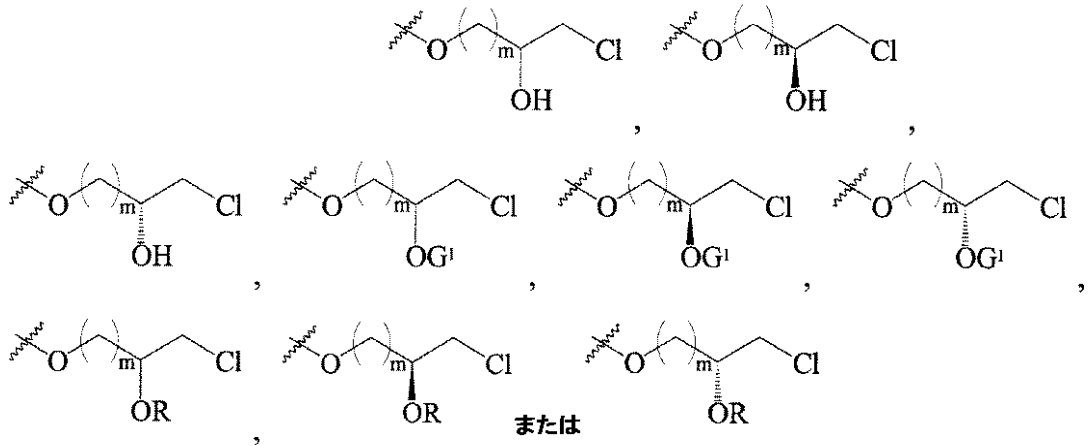
【化147】



であり得る。各Tは、独立して、

【0180】

【化148】



であり得る。各Tは、独立して、

【0181】

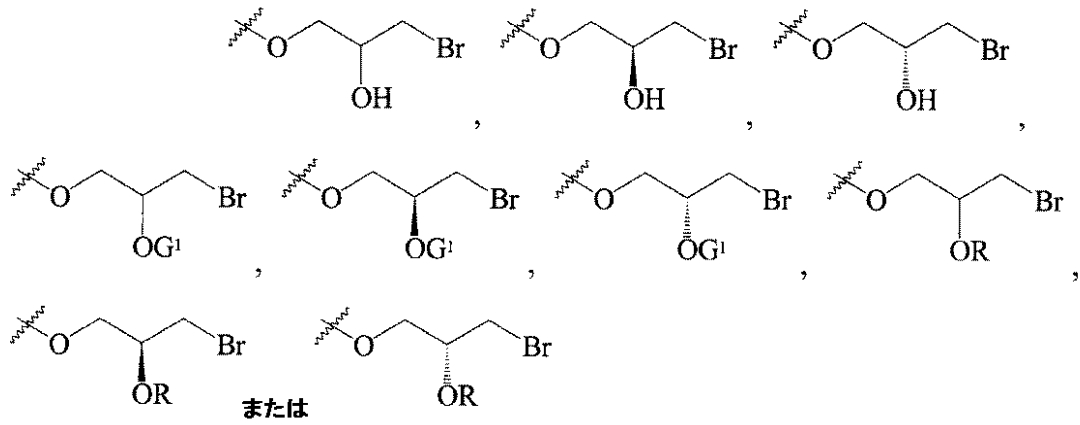
10

20

30

40

【化149】

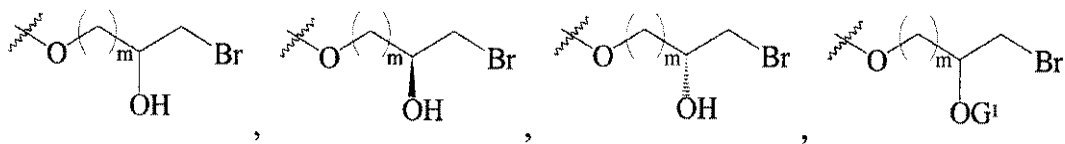


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0182】

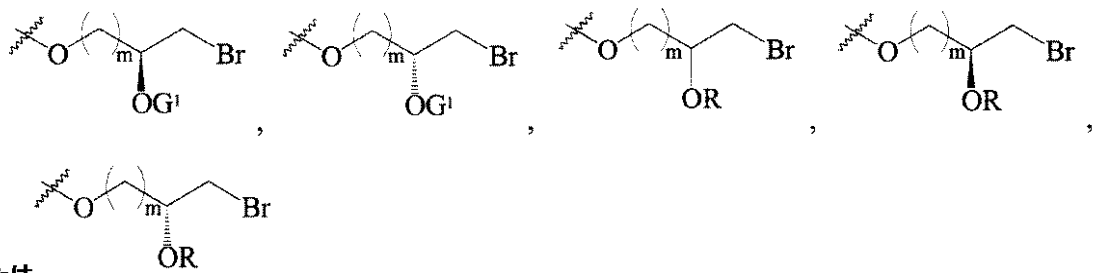
【化150】



20

【0183】

【化151】



30

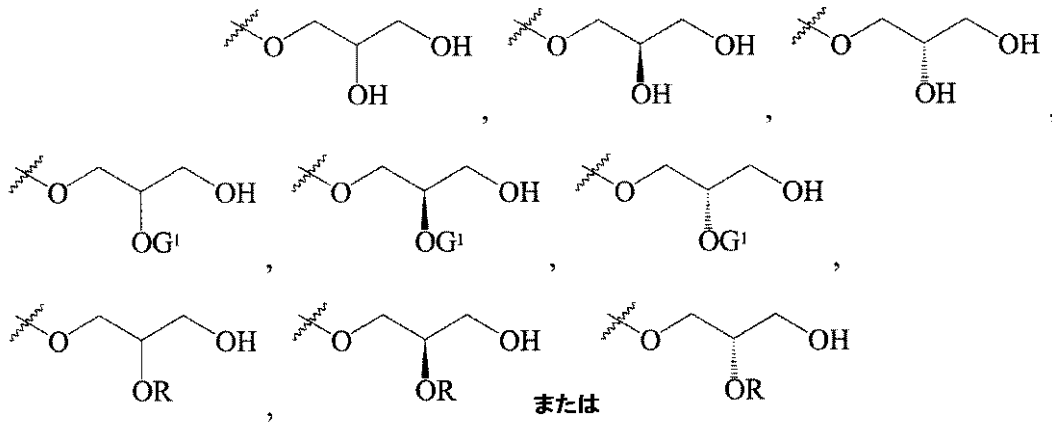
であり得る。各Tは、独立して、

【0184】

であり得る。各Tは、独立して、

【0187】

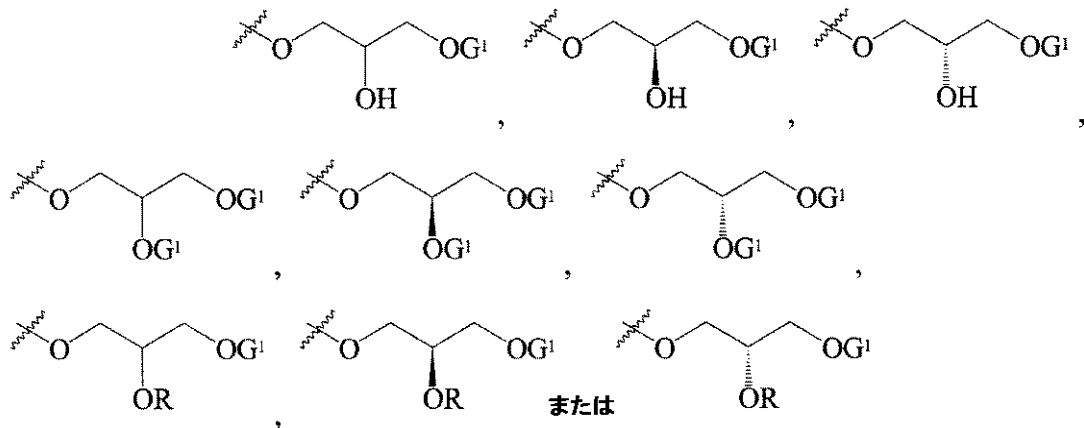
【化155】



であり得る。各Tは、独立して、

【0188】

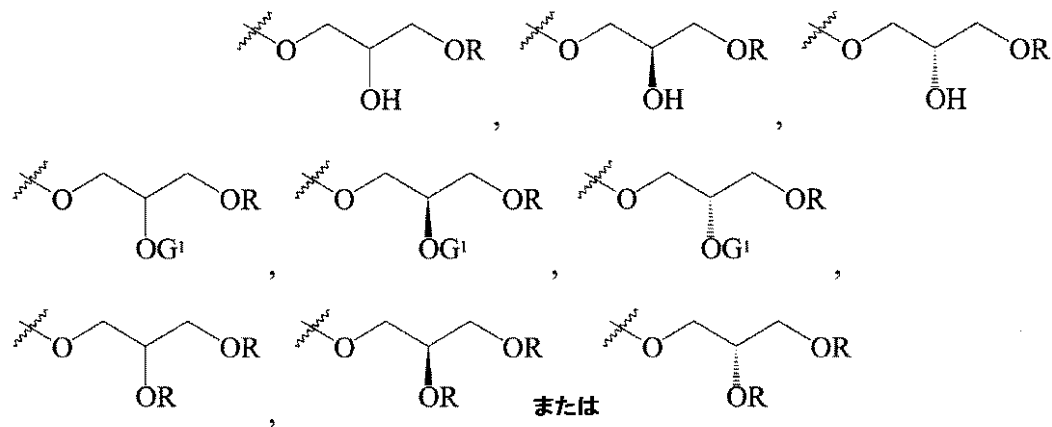
【化156】



であり得る。各Tは、独立して、

【0189】

【化157】



であり得る。各Tは、独立して、

【0190】

【化158】

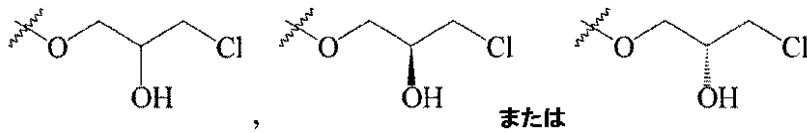
10

20

30

40

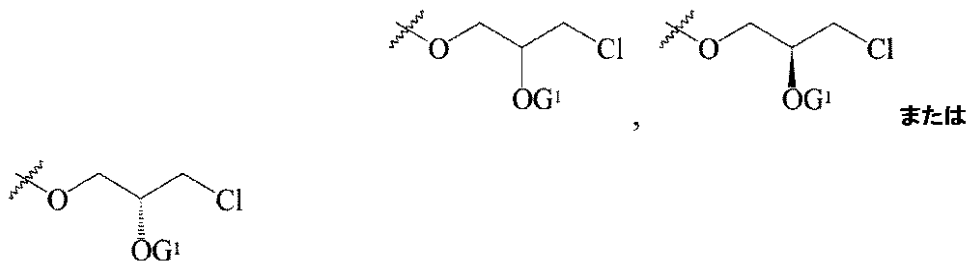
【化158】



であり得る。各Tは、独立して、

【0191】

【化159】

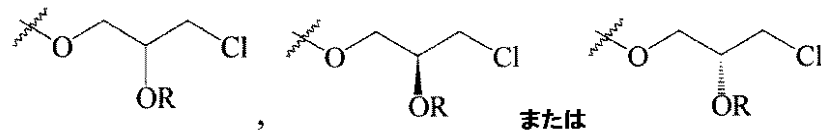


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0192】

【化160】

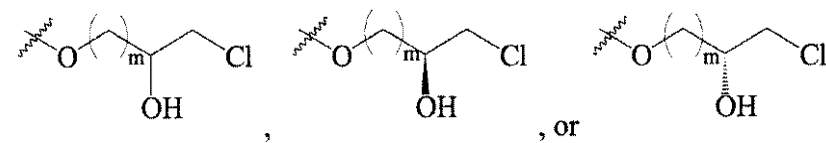


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0193】

【化161】

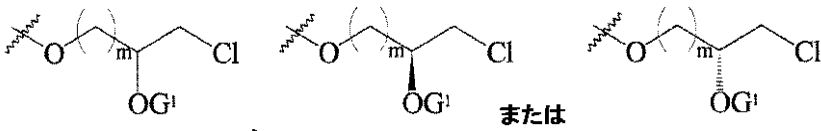


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0194】

【化162】

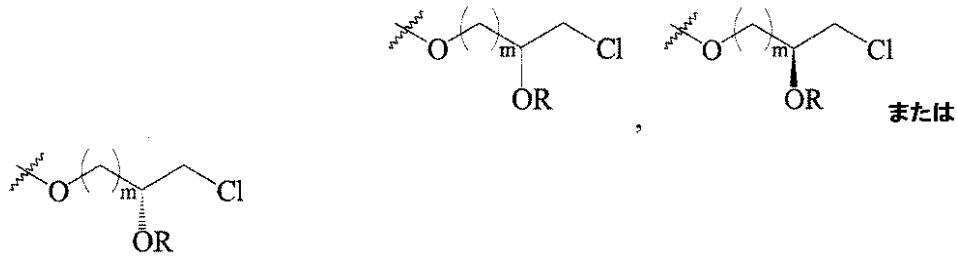


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0195】

【化163】

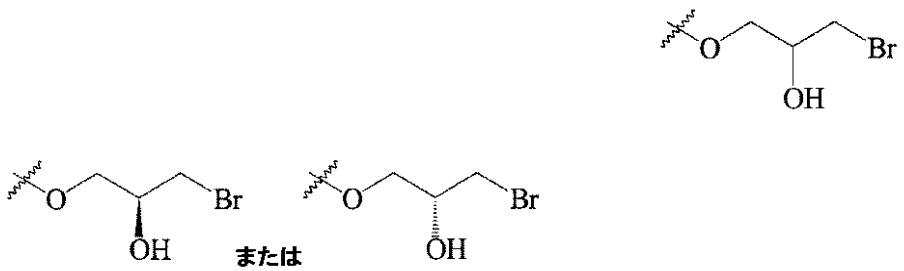


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0196】

【化164】

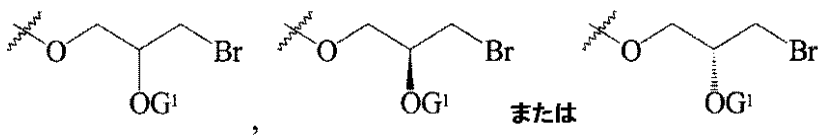


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0197】

【化165】

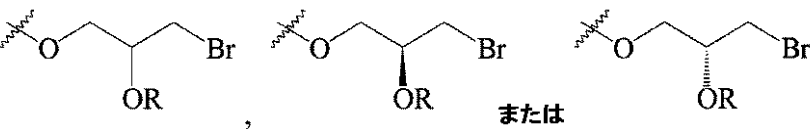


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0198】

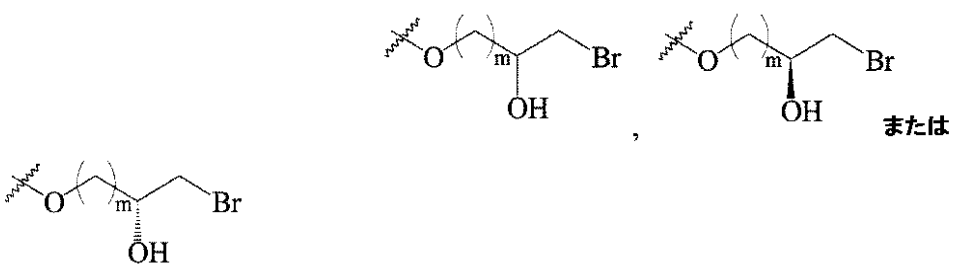
【化166】



であり得る。各Tは、独立して、

【0199】

【化167】

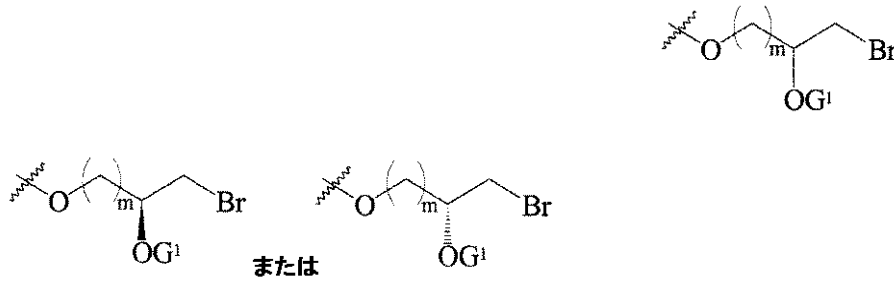


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0200】

【化168】

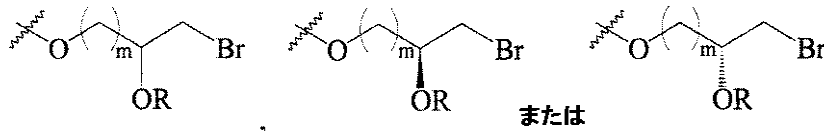


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0201】

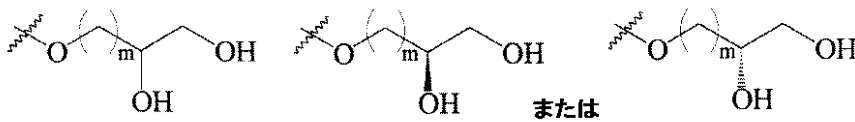
【化169】



であり得る。各Tは、独立して、

【0202】

【化170】

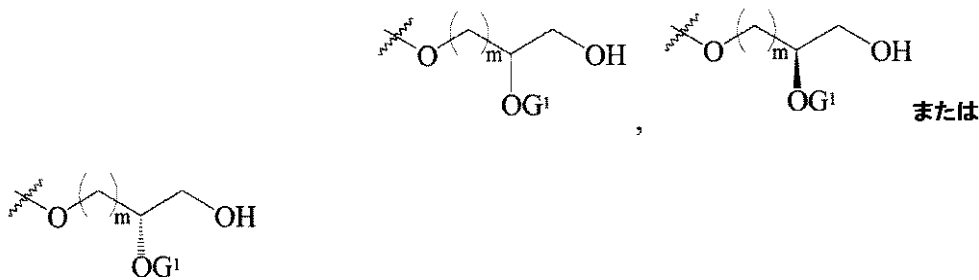


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0203】

【化171】

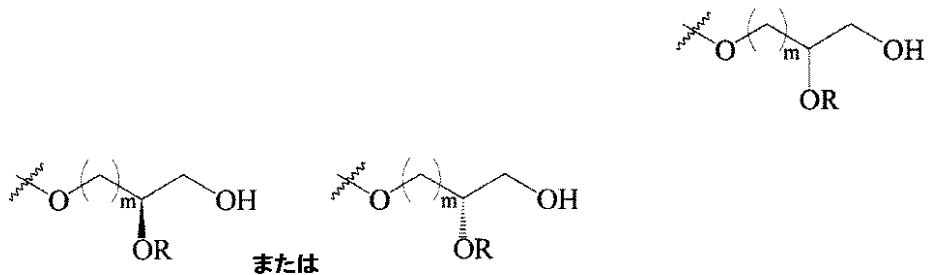


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0204】

【化172】



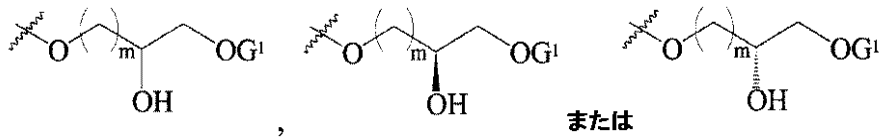
40

であり得る。各Tは、独立して、

【0205】

50

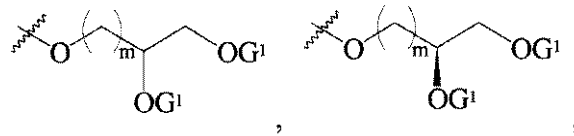
【化173】



であり得る。各Tは、独立して、

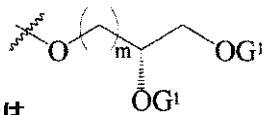
【0206】

【化174】



10

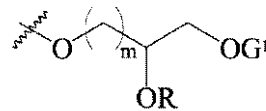
または



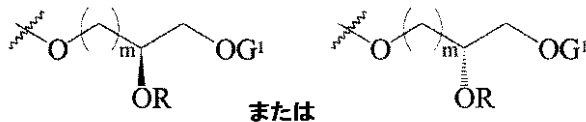
であり得る。各Tは、独立して、

【0207】

【化175】



20

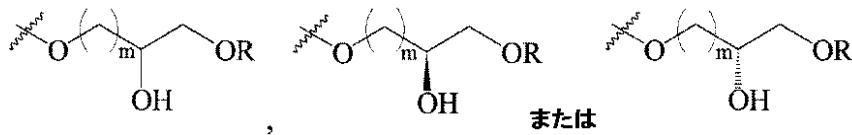


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0208】

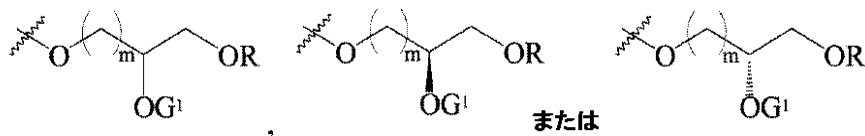
【化176】



であり得る。各Tは、独立して、

【0209】

【化177】

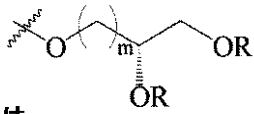
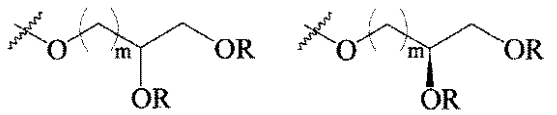


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0210】

【化178】



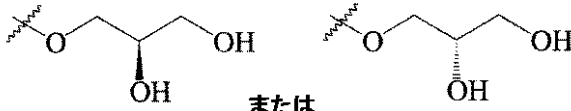
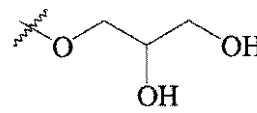
または

10

であり得る。各Tは、独立して、

【0211】

【化179】



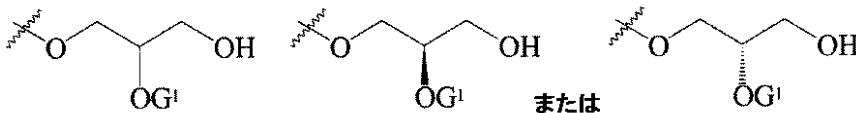
または

20

であり得る。各Tは、独立して、

【0212】

【化180】



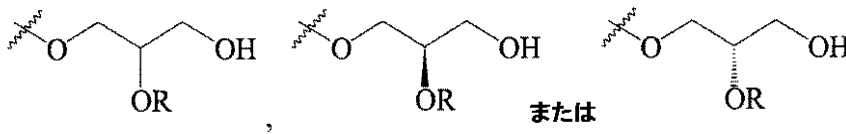
または

30

であり得る。各Tは、独立して、

【0213】

【化181】

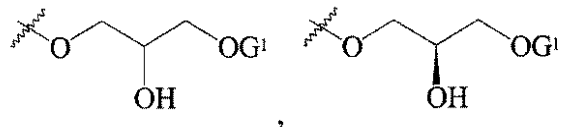


または

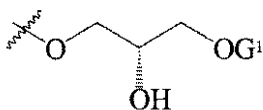
であり得る。各Tは、独立して、

【0214】

【化182】



または

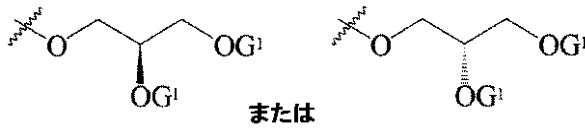
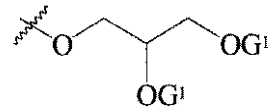


であり得る。各Tは、独立して、

【0215】

50

【化183】

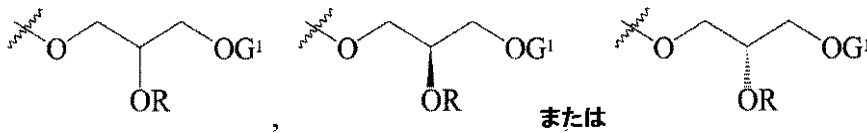


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0216】

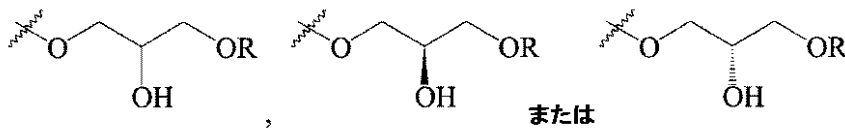
【化184】



であり得る。各Tは、独立して、

【0217】

【化185】

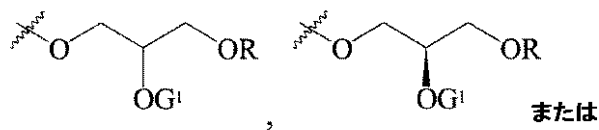


20

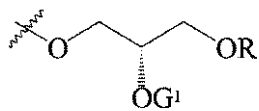
であり得る。各Tは、独立して、

【0218】

【化186】



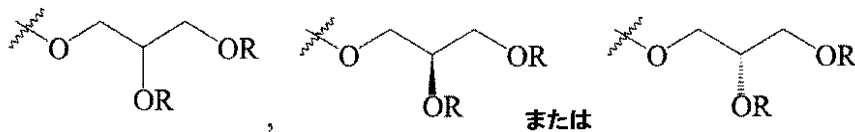
30



であり得る。各Tは、独立して、

【0219】

【化187】

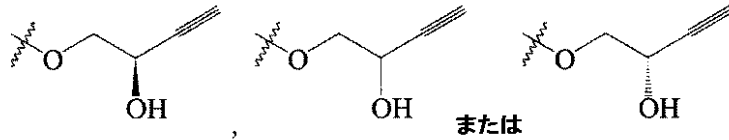


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0220】

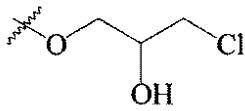
【化188】



であり得る。各Tは、独立して、

【0221】

【化189】

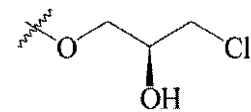


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0222】

【化190】

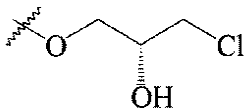


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0223】

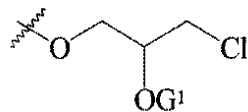
【化191】



であり得る。各Tは、独立して、

【0224】

【化192】

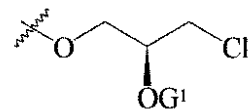


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0225】

【化193】

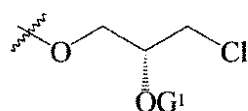


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0226】

【化194】

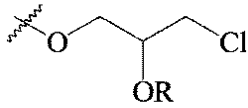


であり得る。各Tは、独立して、

【0227】

50

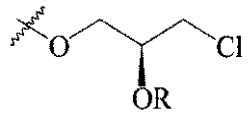
【化195】



であり得る。各Tは、独立して、

【0228】

【化196】

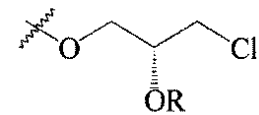


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0229】

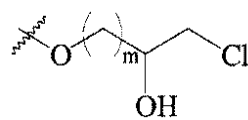
【化197】



であり得る。各Tは、独立して、

【0230】

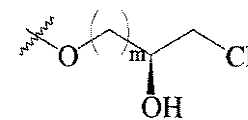
【化198】



であり得る。各Tは、独立して、

【0231】

【化199】

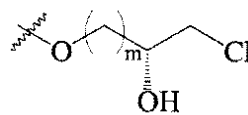


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0232】

【化200】

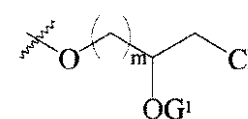


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0233】

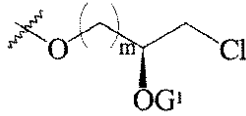
【化201】



であり得る。各Tは、独立して、

【0234】

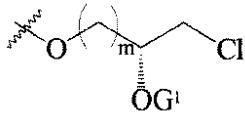
【化202】



であり得る。各Tは、独立して、

【0235】

【化203】

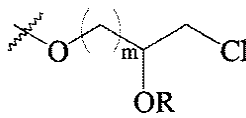


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0236】

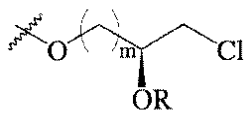
【化204】



であり得る。各Tは、独立して、

【0237】

【化205】

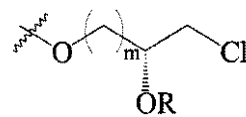


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0238】

【化206】

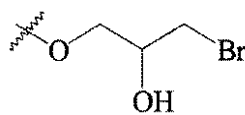


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0239】

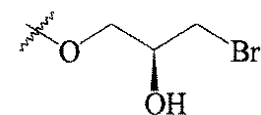
【化207】



であり得る。各Tは、独立して、

【0240】

【化208】

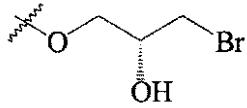


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0241】

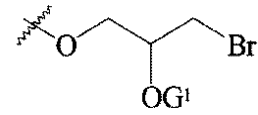
【化209】



であり得る。各Tは、独立して、

【0242】

【化210】

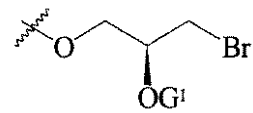


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0243】

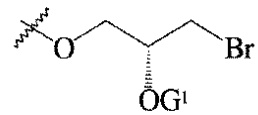
【化211】



であり得る。各Tは、独立して、

【0244】

【化212】

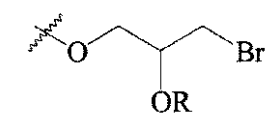


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0245】

【化213】

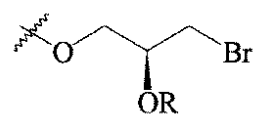


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0246】

【化214】

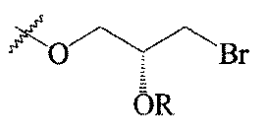


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0247】

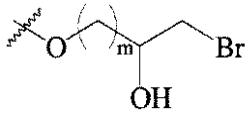
【化215】



であり得る。各Tは、独立して、

【0248】

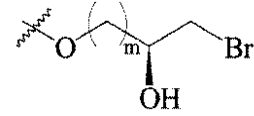
【化 2 1 6】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 4 9 】

【化 2 1 7】

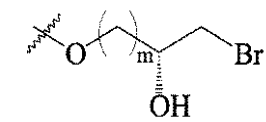


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 0 】

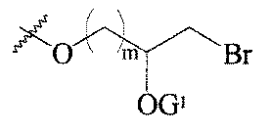
【化 2 1 8】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 1 】

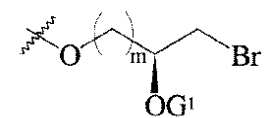
【化 2 1 9】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 2 】

【化 2 2 0】

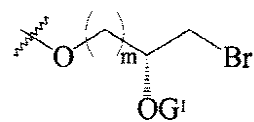


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 3 】

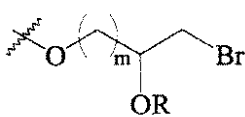
【化 2 2 1】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 4 】

【化 2 2 2】

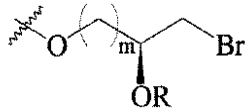


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 5 】

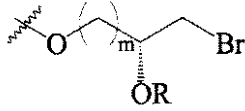
【化 2 2 3】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 6】

【化 2 2 4】

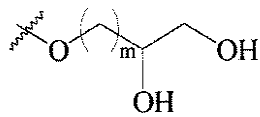


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 7】

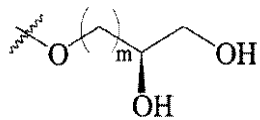
【化 2 2 5】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 8】

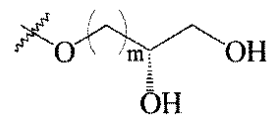
【化 2 2 6】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 5 9】

【化 2 2 7】

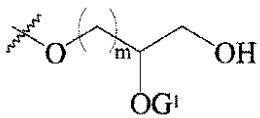


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 6 0】

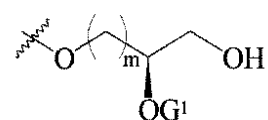
【化 2 2 8】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 6 1】

【化 2 2 9】

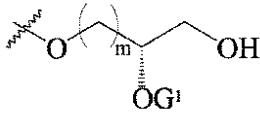


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 6 2】

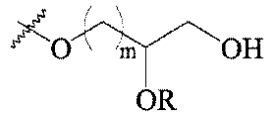
【化230】



であり得る。各Tは、独立して、

【0263】

【化231】

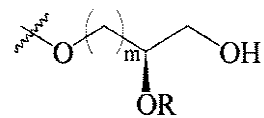


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0264】

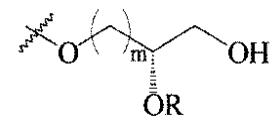
【化232】



であり得る。各Tは、独立して、

【0265】

【化233】

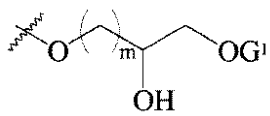


20

であり得る。各Tは、独立して、

【0266】

【化234】

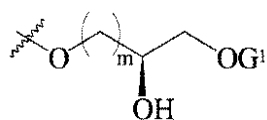


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0267】

【化235】

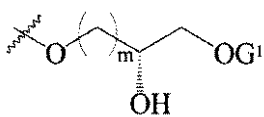


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0268】

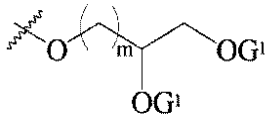
【化236】



であり得る。各Tは、独立して、

【0269】

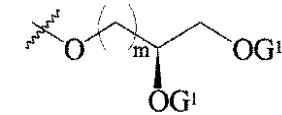
【化 2 3 7】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 0】

【化 2 3 8】

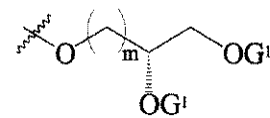


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 1】

【化 2 3 9】

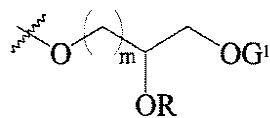


20

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 2】

【化 2 4 0】

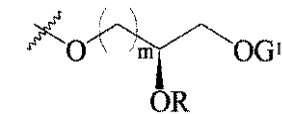


であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 3】

【化 2 4 1】

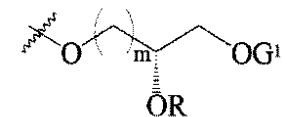
30



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 4】

【化 2 4 2】

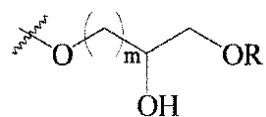


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 5】

【化 2 4 3】

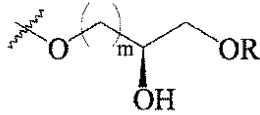


であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 6】

50

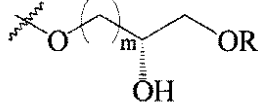
【化 2 4 4】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 7】

【化 2 4 5】

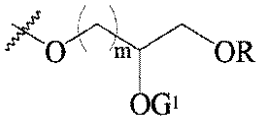


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 8】

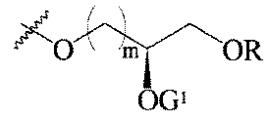
【化 2 4 6】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 7 9】

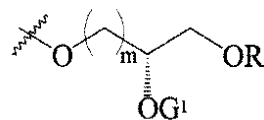
【化 2 4 7】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 0】

【化 2 4 8】

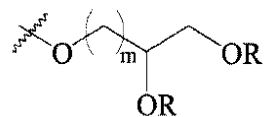


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 1】

【化 2 4 9】

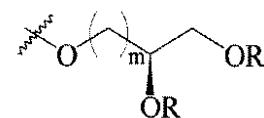


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 2】

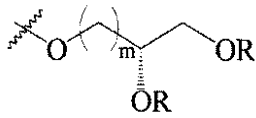
【化 2 5 0】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 3】

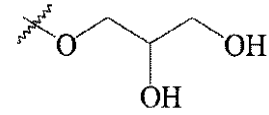
【化 2 5 1】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 4】

【化 2 5 2】

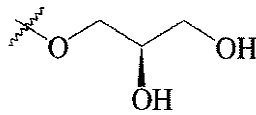


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 5】

【化 2 5 3】

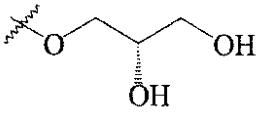


であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 6】

20

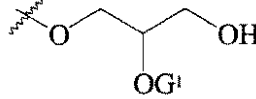
【化 2 5 4】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 7】

【化 2 5 5】

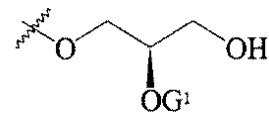


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 8】

【化 2 5 6】

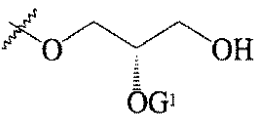


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 8 9】

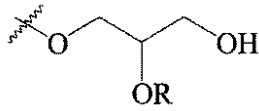
【化 2 5 7】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 0】

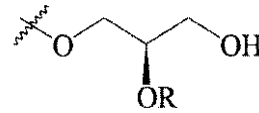
【化 2 5 8】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 1】

【化 2 5 9】

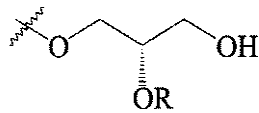


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 2】

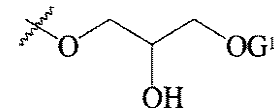
【化 2 6 0】



【 0 2 9 3】

20

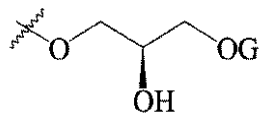
【化 2 6 1】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 4】

【化 2 6 2】

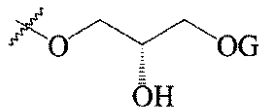


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 5】

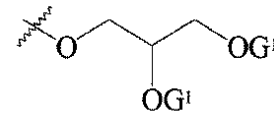
【化 2 6 3】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 6】

【化 2 6 4】

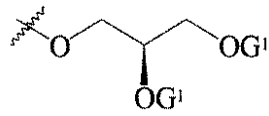


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 2 9 7】

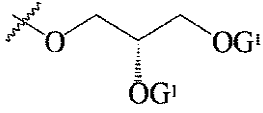
【化265】



であり得る。各Tは、独立して、

【0298】

【化266】

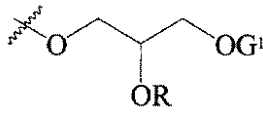


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0299】

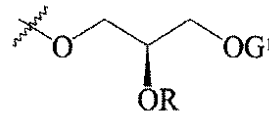
【化267】



であり得る。各Tは、独立して、

【0300】

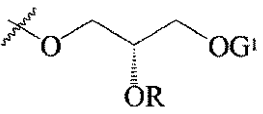
【化268】



であり得る。各Tは、独立して、

【0301】

【化269】

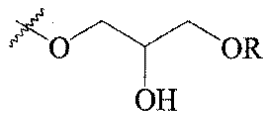


30

であり得る。各Tは、独立して、

【0302】

【化270】

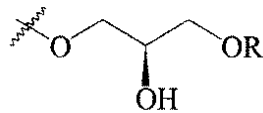


40

であり得る。各Tは、独立して、

【0303】

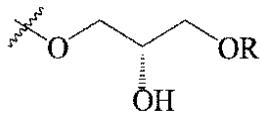
【化271】



であり得る。各Tは、独立して、

【0304】

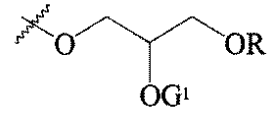
【化 2 7 2】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 0 5】

【化 2 7 3】

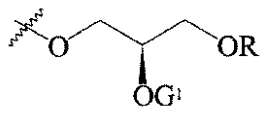


10

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 0 6】

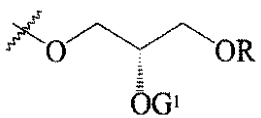
【化 2 7 4】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 0 7】

【化 2 7 5】

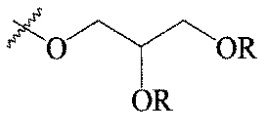


20

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 0 8】

【化 2 7 6】

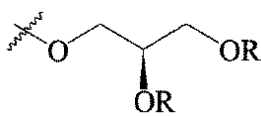


30

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 0 9】

【化 2 7 7】

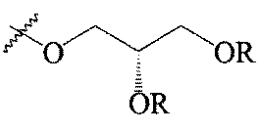


40

であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 1 0】

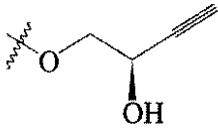
【化 2 7 8】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 1 1】

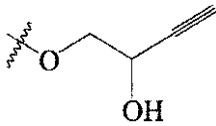
【化279】



であり得る。各Tは、独立して、

【0312】

【化280】

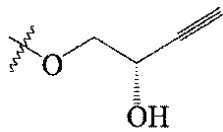


10

であり得る。各Tは、独立して、

【0313】

【化281】



20

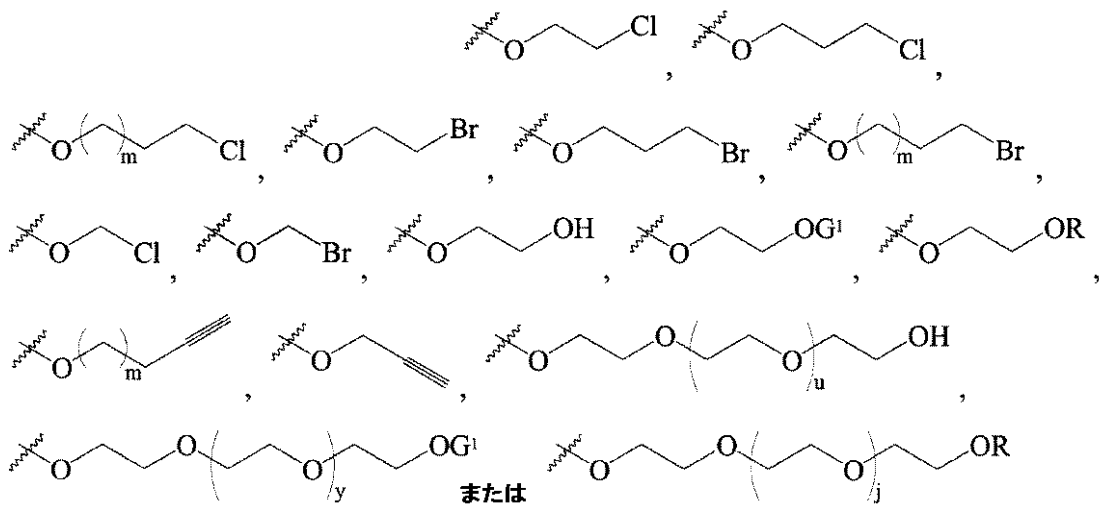
であり得る。

【0314】

各Tは、独立して、

【0315】

【化282】



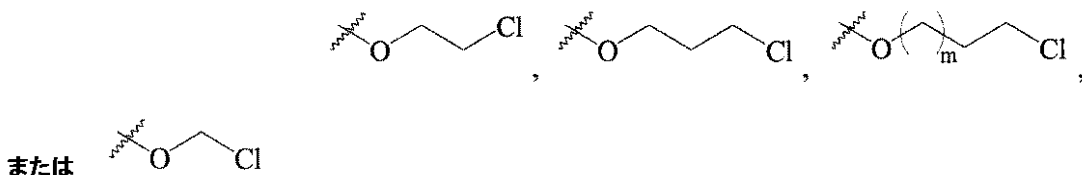
30

40

であり得る。各Tは、独立して、

【0316】

【化283】

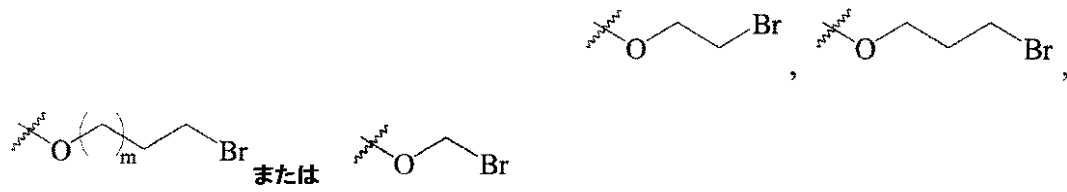


であり得る。各Tは、独立して、

50

【 0 3 1 7 】

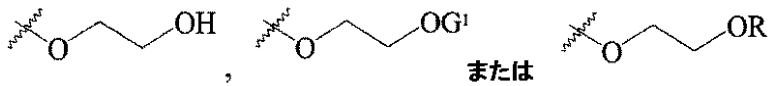
【 化 2 8 4 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 1 8 】

【 化 2 8 5 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 1 9 】

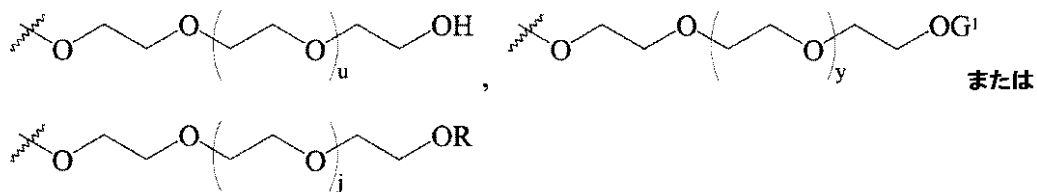
【 化 2 8 6 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 2 0 】

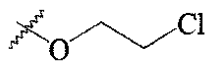
【 化 2 8 7 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 2 1 】

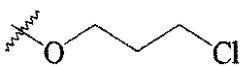
【 化 2 8 8 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 2 2 】

【 化 2 8 9 】



であり得る。各 T は、独立して、

【 0 3 2 3 】

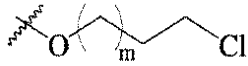
10

20

30

40

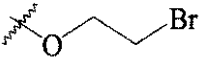
【化290】



であり得る。各Tは、独立して、

【0324】

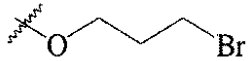
【化291】



であり得る。各Tは、独立して、

【0325】

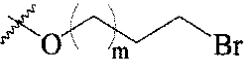
【化292】



であり得る。各Tは、独立して、

【0326】

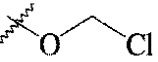
【化293】



であり得る。各Tは、独立して、

【0327】

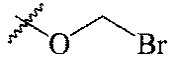
【化294】



であり得る。各Tは、独立して、

【0328】

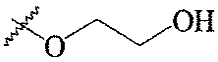
【化295】



であり得る。各Tは、独立して、

【0329】

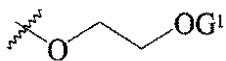
【化296】



であり得る。各Tは、独立して、

【0330】

【化297】



であり得る。各Tは、独立して、

【0331】

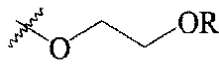
10

20

30

40

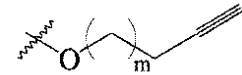
【化298】



であり得る。各 T は、独立して、

【0332】

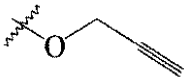
【化299】



であり得る。各 T は、独立して、

【0333】

【化300】



であり得る。各 T は、独立して、

【0334】

【化301】



であり得る。各 T は、独立して、

【0335】

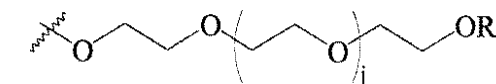
【化302】



であり得る。各 T は、独立して、

【0336】

【化303】



であり得る。

【0337】

各 q は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり得る。各 q は、独立して、0 ~ 1、0 ~ 2、0 ~ 3、0 ~ 4、0 ~ 5、0 ~ 6 または 0 ~ 7 であり得る。各 q は、独立して、1 ~ 2、1 ~ 3、1 ~ 4、1 ~ 5、1 ~ 6 または 1 ~ 7 であり得る。各 q は、独立して、2 ~ 3、2 ~ 4、2 ~ 5、2 ~ 6 または 2 ~ 7 であり得る。各 q は、独立して、3 ~ 4、3 ~ 5、3 ~ 6 または 3 ~ 7 であり得る。各 q は、0 であり得る。各 q は、1 であり得る。各 q は、2 であり得る。各 q は、3 であり得る。各 q は、4 であり得る。各 q は、5 であり得る。各 q は、6 であり得る。各 q は、7 であり得る。

【0338】

各 r は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり得る。各 r は、独立して、0 ~ 1、0 ~ 2、0 ~ 3、0 ~ 4、0 ~ 5、0 ~ 6、0 ~ 7 であり得る。各 r は、独立して、1 ~ 2、1 ~ 3、1 ~ 4、1 ~ 5、1 ~ 6 または 1 ~ 7 であり得る。各 r は、独立して、2 ~ 3、2 ~ 4、2 ~ 5、2 ~ 6 または 2 ~ 7 であり得る。各 r は、独立して、3 ~ 4、3 ~ 5、3 ~ 6 または 3 ~ 7 であり得る。各 r は、0 であり得る。各 r は、1 であり得る。各 r は、2 であり得る。各 r は、3 であり得る。各 r は、4 であり得る。各 r

10

20

30

40

50

は、5であり得る。各 r は、6であり得る。各 r は、7であり得る。

【0339】

各 t は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。各 t は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6または0～7であり得る。各 t は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6または1～7であり得る。各 t は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6または2～7であり得る。各 t は、独立して、3～4、3～5、3～6または3～7であり得る。各 t は、0であり得る。各 t は、1であり得る。各 t は、2であり得る。各 t は、3であり得る。各 t は、4であり得る。各 t は、5であり得る。各 t は、6であり得る。各 t は、7であり得る。

【0340】

各 n は、独立して、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。各 n は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6、0～7または0～8であり得る。各 n は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6、1～7または1～8であり得る。各 n は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6、2～7または2～8であり得る。各 n は、独立して、3～4、3～5、3～6、3～7または3～8であり得る。各 n は、0であり得る。各 n は、1であり得る。各 n は、2であり得る。各 n は、3であり得る。各 n は、4であり得る。各 n は、5であり得る。各 n は、6であり得る。各 n は、7であり得る。各 n は、8であり得る。

【0341】

各 u は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。各 u は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6、0～7であり得る。各 u は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6または1～7であり得る。各 u は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6または2～7であり得る。各 u は、独立して、3～4、3～5、3～6または3～7であり得る。各 u は、0であり得る。各 u は、1であり得る。各 u は、2であり得る。各 u は、3であり得る。各 u は、4であり得る。各 u は、5であり得る。各 u は、6であり得る。各 u は、7であり得る。

【0342】

各 y は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。各 y は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6または0～7であり得る。各 y は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6または1～7であり得る。各 y は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6または2～7であり得る。各 y は、独立して、3～4、3～5、3～6または3～7であり得る。各 y は、0であり得る。各 y は、1であり得る。各 y は、2であり得る。各 y は、3であり得る。各 y は、4であり得る。各 y は、5であり得る。各 y は、6であり得る。各 y は、7であり得る。

【0343】

各 j は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。各 j は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6または0～7であり得る。各 j は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6または1～7であり得る。各 j は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6または2～7であり得る。各 j は、独立して、3～4、3～5、3～6または3～7であり得る。各 j は、0であり得る。各 j は、1であり得る。各 j は、2であり得る。各 j は、3であり得る。各 j は、4であり得る。各 j は、5であり得る。各 j は、6であり得る。各 j は、7であり得る。

【0344】

各 m は、独立して、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。各 m は、独立して、0～1、0～2、0～3、0～4、0～5、0～6、0～7または0～8であり得る。各 m は、独立して、1～2、1～3、1～4、1～5、1～6、1～7または1～8であり得る。各 m は、独立して、2～3、2～4、2～5、2～6、2～7または2～8であり得る。各 m は、独立して、3～4、3～5、3～6、3～7または3～8であり得る。各 m は、0であり得る。各 m は、1であり得る。各 m は、2であり得る。各 m は、3であり得る。各 m は、4であり得る。各 m は、5であり得る。各 m は、6であり得る。

10

20

30

40

50

各 m は、7 であり得る。各 n は、8 であり得る。

【0345】

一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - T、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COPO₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得、残りの各Zは、独立して、C - T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COPO₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得る。一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Tであり得、残りの各Zは、独立して、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、CG¹またはCOHであり得る。一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、COHであり得、残りの各Zは、独立して、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、CG¹またはCOHであり得る。一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Tであり得、残りの各Zは、独立して、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得る。一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、CHであり得る。一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり得、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、COHであり得、残りの各Zは、独立して、CHであり得る。残りの各Zは、独立して、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CCH₃、CNH₂、COSO₃HまたはCOPO₃H₂であり得る。残りの各Zは、独立して、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得る。残りの各Zは、独立して、CH、CF、CCl、CBrまたはCIであり得る。残りの各Zは、独立して、CH、CClまたはCBrであり得る。残りの各Zは、CHであり得る。

10

20

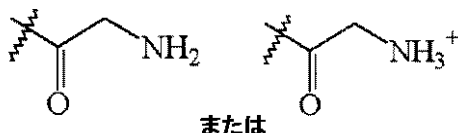
30

【0346】

J"およびJ'"の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得る。J"およびJ'"の各々は、独立して、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分またはポリエチレングリコールベースの部分であり得る。あるいは、J"およびJ'"の各々は、独立して、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。J"およびJ'"の各々は、

【0347】

【化304】



40

であり得る。

【0348】

G¹ G¹'およびG¹"の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁ - C₁₀アルキルであり得る。G¹、G¹'およびG¹"の各々は、独立して、分枝状、直鎖状または非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁ - C₁₀アルキルであり得る。G¹、G¹'およびG¹"の各々は、独立して、分枝状、直鎖状または非芳香族環状の置換または飽和または不飽和のC₁ - C₁₀アルキルであり得る。G¹、G¹'およびG¹"

50

の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_9$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_8$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_7$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1'''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_6$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1''''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_5$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1'''''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_4$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1''''''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_3$ アルキルであり得る。 G^1 、 G^1' および G^1'''''''' の各々は、独立して、分枝状、非分枝状または非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和 $C_1 - C_2$ アルキルであり得る。

10

【0349】

必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 および NO_2 からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 および NO_2 からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 および NO_2 からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br および I からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br および I からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ（すなわち = O）、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F および Cl からなる群から選択され得る。直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の飽和または不飽和の各 $C_1 - C_{10}$ アルキルは、例えば、1、2、3、4、5または6個の置換基で置換され得る。

20

30

【0350】

各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_9$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_8$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_7$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_6$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_5$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_4$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_3$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_2$ アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_1 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_2 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_3 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_4 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_5 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_6 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_7 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_8 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_9 アルキルであり得る。各 R^4 は、独立して、非置換 C_{10} アルキルであり得る。

40

50

【0351】

各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_9$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_8$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_7$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_6$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_5$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_4$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_3$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_2$ アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_1 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_2 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_3 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_4 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_5 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_6 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_7 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_8 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_9 アシルであり得る。各 R^5 は、独立して、 C_{10} アシルであり得る。

10

【0352】

各 R は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_9$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_8$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_7$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_6$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_5$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_4$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_3$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 $C_1 - C_2$ アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_1 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_2 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_3 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_4 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_5 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_6 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_7 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_8 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_9 アシルであり得る。各 R は、独立して、 C_{10} アシルであり得る。

20

【0353】

X は、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得る。 X は、 CH_2 であり得る。 X は、 CHR^1 であり得る。 X は、 CR^1R^2 であり得る。

【0354】

R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒にあって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_9$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_8$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_7$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_6$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_5$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_4$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_3$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、分枝状または非分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_2$ アルキルであり得る。 R^1 および R^2 の各々は、 CH_3 であり得る。 R^1 および R^2 は、一緒にあって、置換または非置換の飽和または不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し得る。 R^1 および R^2 は、一緒にあって、非置換の飽和環状 C_6 アルキルを形成し得る。

30

40

【0355】

必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl

50

、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、CN、SH、SR³、SOR³、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³、OSO₃R³、OR⁶、CO₂R³、CONH₂、CONHR³、CONHR⁶、CONR³₂、NHR⁶、OPO₃H₃、CONR³R⁶、NR³R⁶およびNO₂からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、CN、SH、SR³、SOR³、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³、OSO₃R³およびNO₂からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³およびNO₂からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂およびNO₂からなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、BrおよびIからなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、OH、F、Cl、BrおよびIからなる群から選択され得る。必要に応じた置換基は：オキソ(すなわち=O)、OJ'、COOH、OH、FおよびClからなる群から選択され得る。直鎖状もしくは分枝状の飽和もしくは不飽和のC₁-C₁₀アルキル、または飽和もしくは不飽和の環状C₃-C₁₀アルキルの各々は、例えば、1、2、3、4、5または6個の置換基で置換され得る。

10

【0356】

20

各R³は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₉アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₈アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₇アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₆アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₅アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₄アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₃アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁-C₂アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₂アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₃アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₄アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₅アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₆アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₇アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₈アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₉アルキルであり得る。各R³は、独立して、非置換C₁₀アルキルであり得る。

30

【0357】

各R⁶は、独立して、C₁-C₁₀アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₉アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₈アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₇アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₆アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₅アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₄アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₃アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁-C₂アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₂アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₃アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₄アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₅アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₆アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₇アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₈アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₉アシルであり得る。各R⁶は、独立して、C₁₀アシルであり得る。

40

【0358】

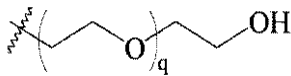
残りの各Zは、独立して、CH、CF、CCl、CBrまたはClであり得る。残りの各Zは、CHであり得る。Xは、CH₂であり得る。Xは、CHR¹であり得る。Xは、CR¹R²であり得る。R²は、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得る。R²は、CH₃であり得る。R¹は、直鎖状ま

50

たは分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。
 R^1 は、 CH_3 であり得る。J は、O であり得る。J² は、O であり得る。J は、O であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M は、 CH_2Cl であり得；L は、H であり得る。J² は、O であり得；m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M² は、 CH_2Cl であり得；L² は、H であり得る。J は、O であり得；n は、1 であり得；M は、 CH_2Cl であり得；L は、H であり得る。J² は、O であり得；m は、1 であり得；M² は、 CH_2Cl であり得；L² は、H であり得る。J は、O であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M は、H であり得；L は、A - D であり得；A は、O であり得；D は、H であり得る。J² は、O であり得；m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M² は、H であり得；L² は、A² - D² であり得；A² は、O であり得；D² は、H であり得る。J は、O であり得；n は、1 であり得；M は、H であり得；L は、A - D であり得；A は、O であり得；D は、H であり得る。J² は、O であり得；m は、1 であり得；M² は、H であり得；L² は、A² - D² であり得；A² は、O であり得；D² は、H であり得る。J は、O であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M は、H であり得；L は、A - D であり得；A は、O であり得；D は、

【0359】

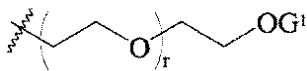
【化305】



であり得る。J は、O であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M は、H であり得；L は、A - D であり得；A は、O であり得；D は、

【0360】

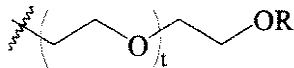
【化306】



であり得る。J は、O であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M は、H であり得；L は、A - D であり得；A は、O であり得；D は、

【0361】

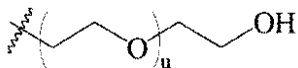
【化307】



であり得る。J² は、O であり得；m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M² は、H であり得；L² は、A² - D² であり得；A² は、O であり得；D² は、

【0362】

【化308】



であり得る。J² は、O であり得；m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得；M² は、H であり得；L² は、A² - D² であり得；A² は、O であり得；D² は、

【0363】

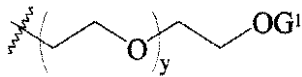
10

20

30

40

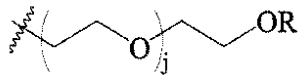
【化309】



であり得る。J²は、Oであり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；M²は、Hであり得；L²は、A² - D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

【0364】

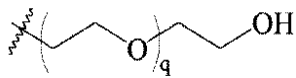
【化310】



であり得る。Jは、Oであり得；nは、1であり得；Mは、Hであり得；Lは、A - Dであり得；Aは、Oであり得；Dは、

【0365】

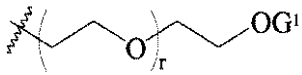
【化311】



であり得る。Jは、Oであり得；nは、1であり得；Mは、Hであり得；Lは、A - Dであり得；Aは、Oであり得；Dは、

【0366】

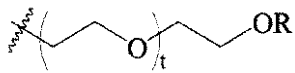
【化312】



であり得る。Jは、Oであり得；nは、1であり得；Mは、Hであり得；Lは、A - Dであり得；Aは、Oであり得；Dは、

【0367】

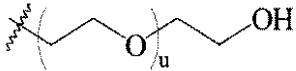
【化313】



であり得る。J²は、Oであり得；mは、1であり得；M²は、Hであり得；L²は、A² - D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

【0368】

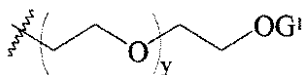
【化314】



であり得る。J²は、Oであり得；mは、1であり得；M²は、Hであり得；L²は、A² - D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

【0369】

【化315】



であり得る。J²は、Oであり得；mは、1であり得；M²は、Hであり得；L²は、A² - D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

【0370】

10

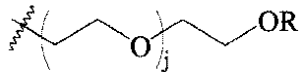
20

30

40

50

【化316】



であり得る。Jは、Oであり得；nは、0であり得；Mは、C₁CHであり得；Lは、Hであり得る。J²は、Oであり得；mは、0であり得；M²は、C₁CHであり得；L²は、Hであり得る。Jは、Oであり得；nは、1であり得；Mは、C₁CHであり得；Lは、A-Dであり得；Aは、Oであり得；Dは、Hであり得る。J²は、Oであり得；mは、1であり得；M²は、C₁CHであり得；L²は、A²-D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、Hであり得る。

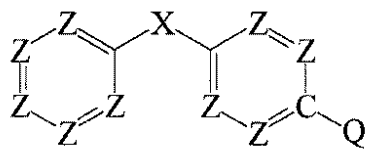
10

【0371】

別の実施形態によると、式IIIの構造を有する化合物

【0372】

【化317】



III

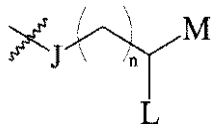
の使用が提供され、ここで：Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり得；R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得るか、またはR¹およびR²は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状C₃-C₁₀アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、CN、SH、SR³、SOR³、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³、OSO₃R³、OR⁶、CO₂R³、CONH₂、CONHR³、CONHR⁶、CONR³₂、NHR⁶、OPO₃H₃、CONR³R⁶、NR³R⁶およびNO₂からなる群から選択され得；各R³は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得；各R⁶は、独立して、C₁-C₁₀アルキルであり得；他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C-Tであり得、残りの各Zは、独立して、C-T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COPO₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得；Qは、

20

30

【0373】

【化318】

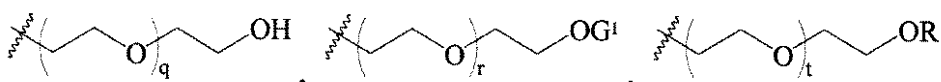


であり得；Jは、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH、NG¹、SO、SO₂またはNRであり得；Mは、H、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、CHBr₂、CBr₃またはC₁CHであり得；Lは、HまたはA-Dであり得；Aは、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂またはN⁺HG¹であり得；Dは、H、G¹、R、

40

【0374】

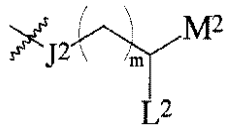
【化319】



50

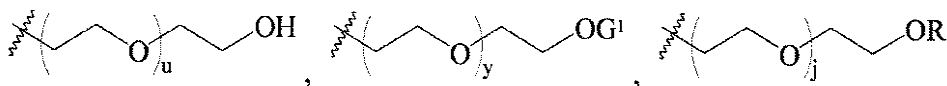
または表 1 から選択される部分であり得； q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得； T は、

【0375】
【化320】



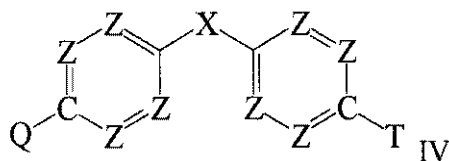
であり得； J^2 は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり得； M^2 は、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ'' 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1'$ 、 G^1OG^1' 、 $G^1OG^1'OG^1''$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ または $C-CH$ であり得； L^2 は、 H または A^2-D^2 であり得； A^2 は、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得； D^2 は、 H 、 G^1 、 R 、

【0376】
【化321】



または表 1 から選択される部分であり得； u 、 y および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得； J'' および J''' の各々は、独立して、表 1 から選択される部分であり得； G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_1-C_{10} アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ''' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^4 は、独立して、非置換 C_1-C_{10} アルキルであり得；各 R^5 は、独立して、 C_1-C_{10} アシルであり得； R は、 C_1-C_{10} アシルであり得；ここで、 OH 基の 1 つ以上は、その H を表 1 から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。別の実施形態によると、式 IV の構造を有する化合物

【0377】
【化322】



の使用が提供され、ここで： X は、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の C_1-C_{10} アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 C_3-C_{10} アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ''' 、 $COOH$ 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3

10

20

30

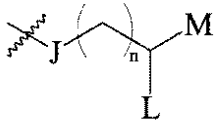
40

50

H、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得；残りの各 Z は、独立して、C-T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 $CNHG^1$ 、 CNG^1_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であり得；Qは、

【0378】

【化323】

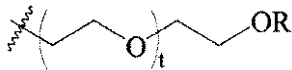
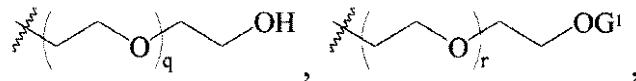


10

であり得；Jは、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 または NR であり得；Mは、H、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 または C-CH であり得；Lは、H または A-D であり得；Aは、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得；Dは、H、 G^1 、R、

【0379】

【化324】

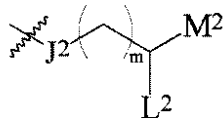


20

または表1から選択される部分であり得；q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；Tは、

【0380】

【化325】



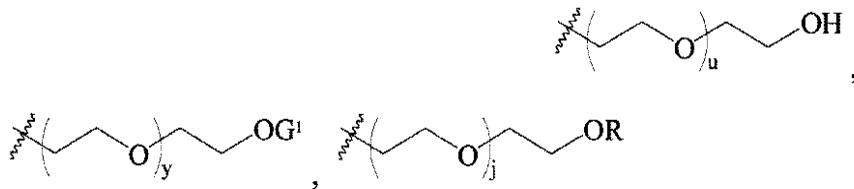
であり得； J^2 は、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 または NR であり得； M^2 は、H、 CH_3 、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ^2 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1$ 、 G^1OG^1 、 $G^1OG^1OG^1$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ または C-CH であり得； L^2 は、H または $A^2 - D^2$ であり得； A^2 は、O、S、SO、 SO_2 、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得； D^2 は、H、 G^1 、R、

【0381】

30

40

【化326】



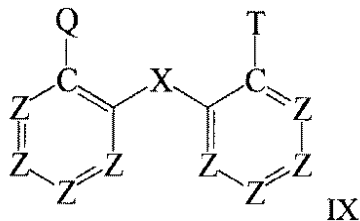
または表1から選択される部分であり得；u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；J”およびJ'”の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；G¹、G^{1'}およびG^{1''}の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'”、COOH、R⁴、OH、OR⁴、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR⁴、NR⁴₂、CN、SH、SR⁴、SO₃H、SO₃R⁴、SO₂R⁴、OSO₃R⁴、OR⁵、CO₂R⁴、CONH₂、CONHR⁴、CONHR⁵、CONR⁴₂、NHR⁵、OPO₃H₃、CONR⁴R⁵、NR⁴R⁵およびNO₂からなる群から選択され得；各R⁴は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得；各R⁵は、独立して、C₁-C₁₀アシルであり得；Rは、C₁-C₁₀アシルであり得；ここで、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。別の実施形態によると、式IXの構造を有する化合物

10

20

【0382】

【化327】



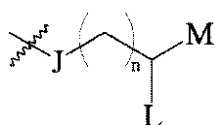
の使用が提供され、ここで：Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり得；R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得るか、またはR¹およびR²は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状C₃-C₁₀アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'”、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、CN、SH、SR³、SOR³、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³、OSO₃R³、OR⁶、CO₂R³、CONH₂、CONHR³、CONHR⁶、CONR³₂、NHR⁶、OPO₃H₃、CONR³R⁶、NR³R⁶およびNO₂からなる群から選択され得；各R³は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得；各R⁶は、独立して、C₁-C₁₀アシルであり得；残りの各Zは、独立して、C-T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COPO₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得；Qは、

30

40

【0383】

【化328】



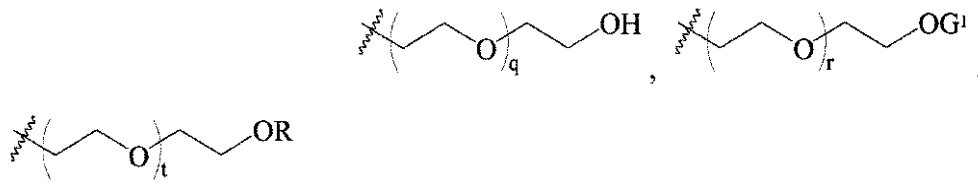
であり得；Jは、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH、NG¹、SO、SO₂またはNRであり得；Mは、H、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、

50

CH_2Br 、 CHBr_2 、 CBr_3 または $\text{C}-\text{CH}$ であり得；L は、H または A - D であり得；A は、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得；D は、H、 G^1 、R、

【0384】

【化329】

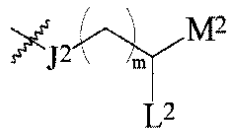


10

または表1から選択される部分であり得；q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；Tは、

【0385】

【化330】

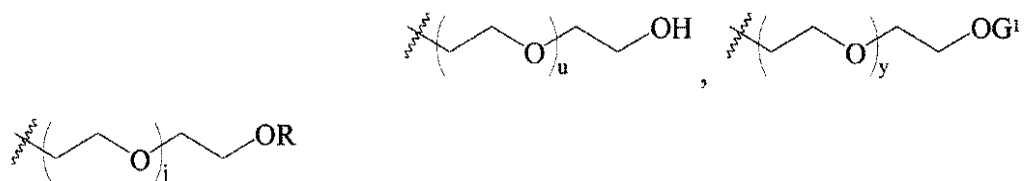


20

であり得； J^2 は、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 または NR であり得； M^2 は、H、 CH_3 、Cl、Br、 CH_2Cl 、 CHCl_2 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 CHBr_2 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ^2 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $\text{CH}_2\text{OG}^1\text{OG}^1$ 、 G^1OG^1 、 $\text{G}^1\text{OG}^1\text{OG}^1$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 CH_2NG^1_2 または $\text{C}-\text{CH}$ であり得； L^2 は、H または $\text{A}^2 - \text{D}^2$ であり得； A^2 は、O、S、SO、 SO_2 、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり得； D^2 は、H、 G^1 、R、

【0386】

【化331】



30

または表1から選択される部分であり得；u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； J^2 および J^1 の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得； $\text{G}^1 - \text{G}^1$ および G^1 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 COOH 、 R^4 、OH、 OR^4 、F、Cl、Br、I、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、CN、SH、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 CONH_2 、 CONHR^4 、 CONHR^5 、 CONR^4_2 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 CONR^4R^5 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^4 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得；各 R^5 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり得；R は、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり得；ここで、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。

40

【0387】

J は、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、NH、SO または NR であり得る。J

50

は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 または CG^1_2 であり得る。Jは、 O 、 NH 、 SO または NR であり得る。Jは、 O であり得る。

【0388】

Mは、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 または CCH であり得る。Mは、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ または CBr_3 であり得る。Mは、 Br 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ または CBr_3 であり得る。Mは、 Cl 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ または CCl_3 であり得る。Mは、 CH_2Cl 、 CH_2Br または CCH であり得る。Mは、 CH_2Br または CCH であり得る。Mは、 CH_2Cl または CCH であり得る。Mは、 CH_2Br であり得る。Mは、 CH_2Cl であり得る。Mは、 CCH であり得る。Mは、 H であり得る。

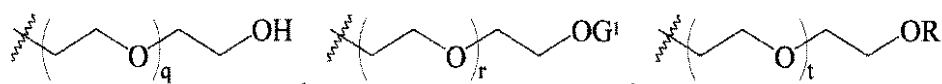
10

【0389】

Lは、 H であり得る。Lは、 $A - D$ であり得る。Aは、 O または S であり得る。Aは、 O であり得る。Dは、 H 、 R 、

【0390】

【化332】



または表1から選択される部分であり得； q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Dは、 H であり得る。Dは、 R であり得る。Rは、 $C_1 - C_4$ アシルであり得る。Rは、

20

【0391】

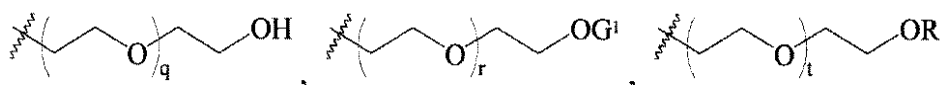
【化333】



であり得る。Dは、

【0392】

【化334】

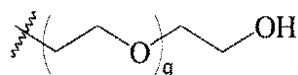


または表1から選択される部分であり得； q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Dは、

30

【0393】

【化335】

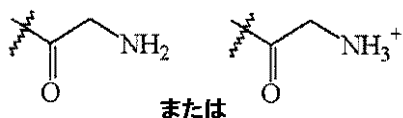


40

であり得、 q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。 q は、1であり得る。Dは、表1から選択される部分であり得る。表1から選択される部分は、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。表1から選択される部分は、

【0394】

【化336】



であり得る。

50

【0395】

nは、0、1、2、3、4または5であり得る。nは、0であり得る。nは、1、2、3、4または5であり得る。nは、1であり得る。

【0396】

J²は、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、NH、SOまたはNRであり得る。J²は、G¹、O、CH₂、CHG¹またはCG¹₂であり得る。J²は、O、NH、SOまたはNRであり得る。J²は、Oであり得る。

【0397】

M²は、H、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、CHBr₂、CBr₃、CH₂OH、CH₂OJⁿ、CH₂OG¹、CH₂ORまたはC—CH₂—であり得る。M²は、H、CH₂Cl、CH₂OH、CH₂OJⁿ、CH₂OG¹またはC—CH₂—であり得る。M²は、H、CH₂OH、CH₂OJⁿ、CH₂OG¹またはC—CH₂—であり得る。M²は、H、CH₂OH、CH₂OJⁿまたはCH₂OG¹であり得る。M²は、CH₂Clであり得る。M²は、CH₂OG¹であり得る。M²は、CH₂OJⁿであり得る。M²は、CH₂OHであり得る。M²は、Hであり得る。M²は、C—CH₂—であり得る。

10

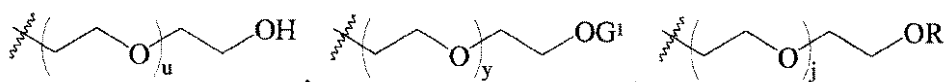
【0398】

L²は、Hであり得る。L²は、A²—D²であり得る。A²は、OまたはSであり得る。A²は、Oであり得る。D²は、H、R、

【0399】

20

【化337】



または表1から選択される部分であり得；u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。D²は、Hであり得る。D²は、Rであり得る。Rは、C₁—C₄アシルであり得る。Rは、

【0400】

【化338】

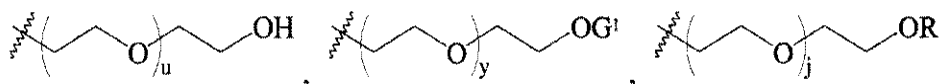


30

であり得る。D²は、

【0401】

【化339】

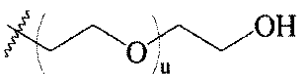


または表1から選択される部分であり得；u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。D²は、

40

【0402】

【化340】

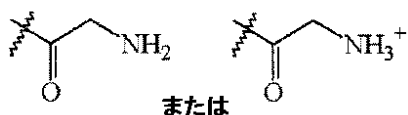


であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。uは、1であり得る。D²は、表1から選択される部分であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。表1から選択される部分は、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。表1から選択される部分は、

50

【0403】

【化341】



であり得る。

【0404】

mは、0、1、2、3、4または5であり得る。mは、0であり得る。mは、1、2、3、4または5であり得る。mは、1であり得る。

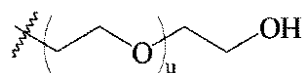
10

【0405】

Mは、C-CHであり得；M²は、CH₂Clであり得；Lは、Hであり得る。L²は、Hであり得る。L²は、A²-D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、Hであり得る。nは、0であり得る。mは、1、2、3、4または5であり得る。Jは、Oであり得、J²は、Oであり得る。Mは、CH₂Clであり得、Lは、Hであり得る。M²は、H、CH₂OH、CH₂OG¹またはCH₂Clであり得る。Mは、CH₂Clであり得；Lは、Hであり得；M²は、H、CH₂OH、CH₂OG¹またはCH₂Clであり得る。L²は、A²-D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、Hであり得る。L²は、A²-D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

【0406】

【化342】

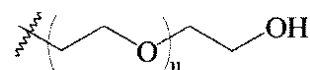


であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。nは、1、2、3、4または5であり得る。mは、1、2、3、4または5であり得る。Jは、Oであり得、J²は、Oであり得る。Mは、CH₂Clであり得；Lは、A-Dであり得；Aは、Oであり得；Dは、Hであり得；M²は、Hであり得；L²は、A²-D²であり得；A²は、Oであり得；D²は、

20

【0407】

【化343】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。nは、1、2、3、4または5であり得る。mは、1、2、3、4または5であり得る。Jは、Oであり得、J²は、Oであり得る。

30

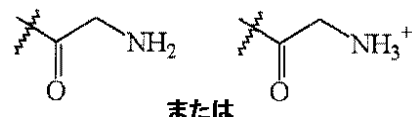
【0408】

J"およびJ'"の各々は、存在するとき、独立して、表1から選択されるアミノ酸ペー

40

【0409】

【化344】



であり得る。

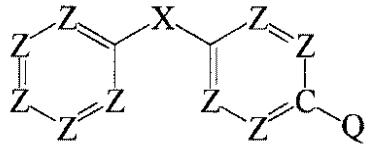
【0410】

別の実施形態によると、式IIIの構造を有する化合物

50

【 0 4 1 1 】

【 化 3 4 5 】



III

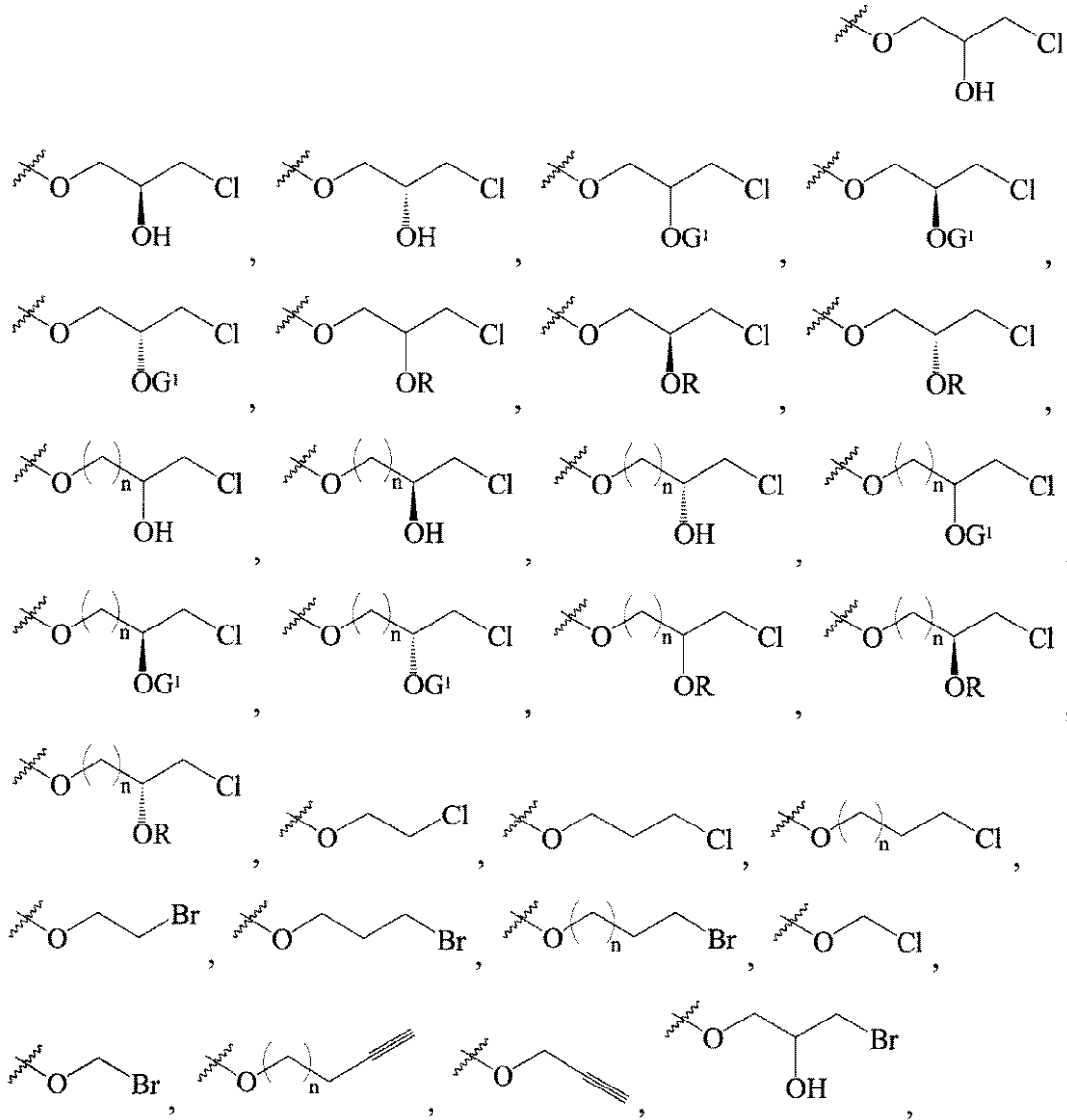
の使用が提供され、ここで：Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり得；ここで、Qは、

10

【 0 4 1 2 】

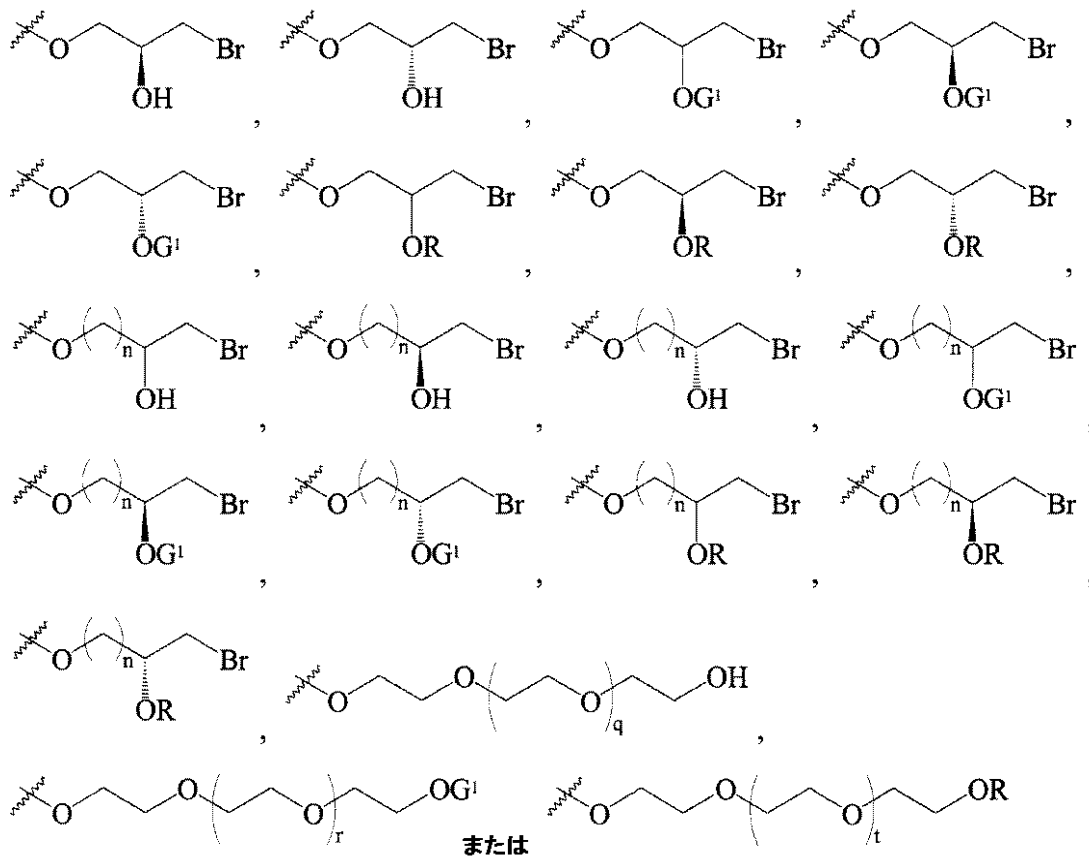
20

【化 3 4 6】



【 0 4 1 3 】

【化 3 4 7】



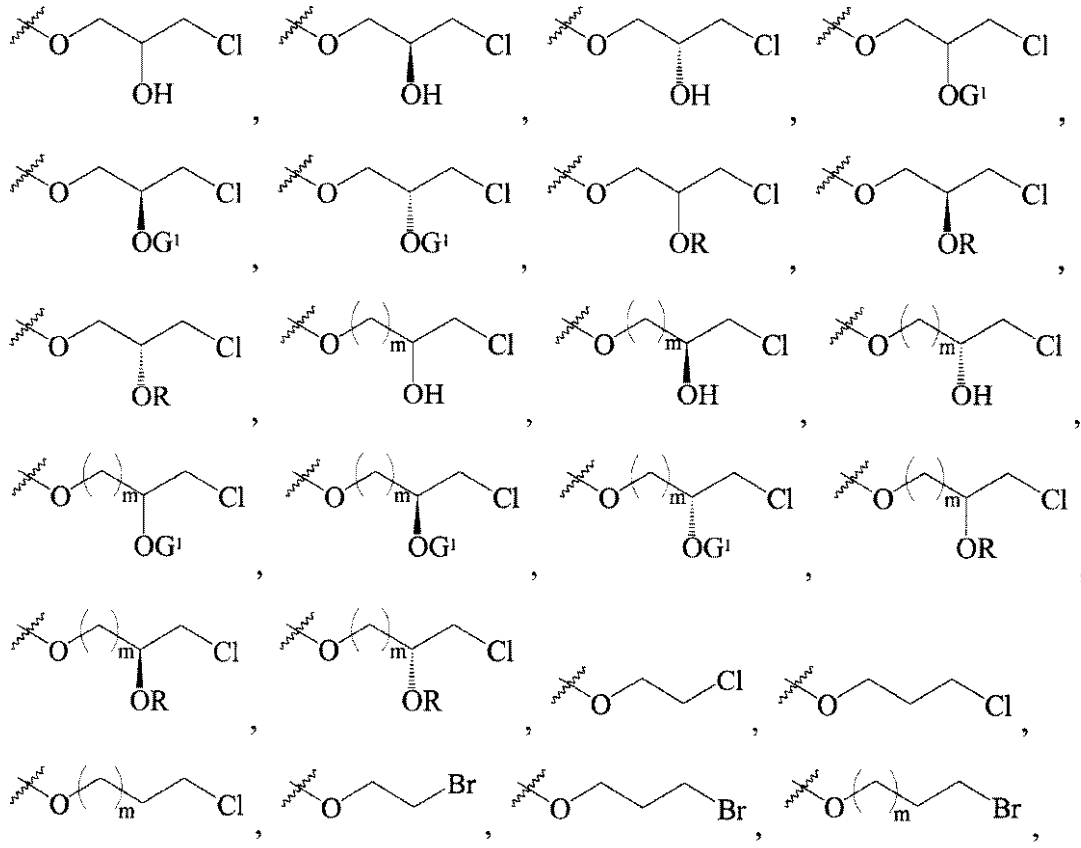
10

20

であり得；他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Tであり得、ここで、Tは、

【 0 4 1 4 】

【化 3 4 8】

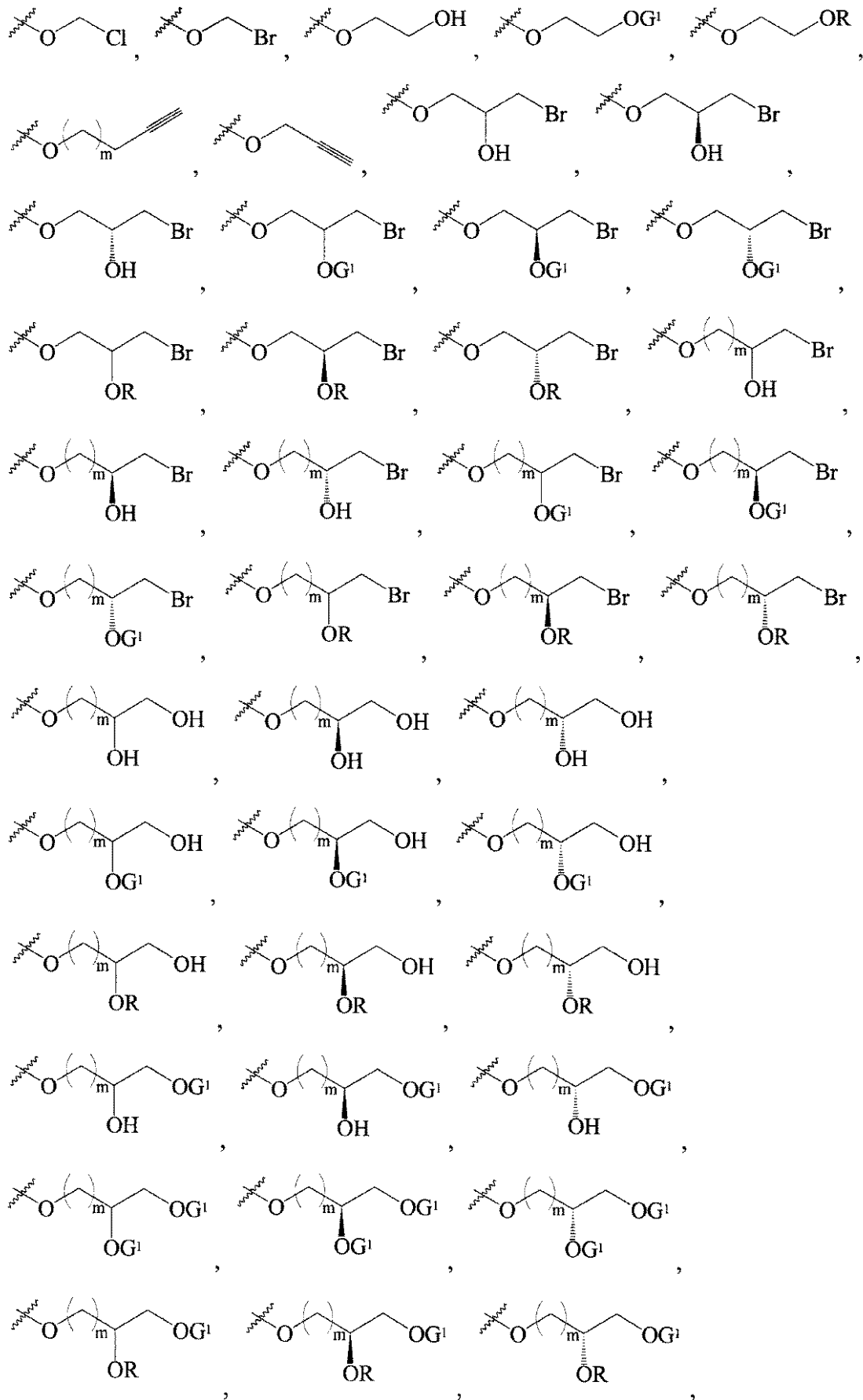


10

20

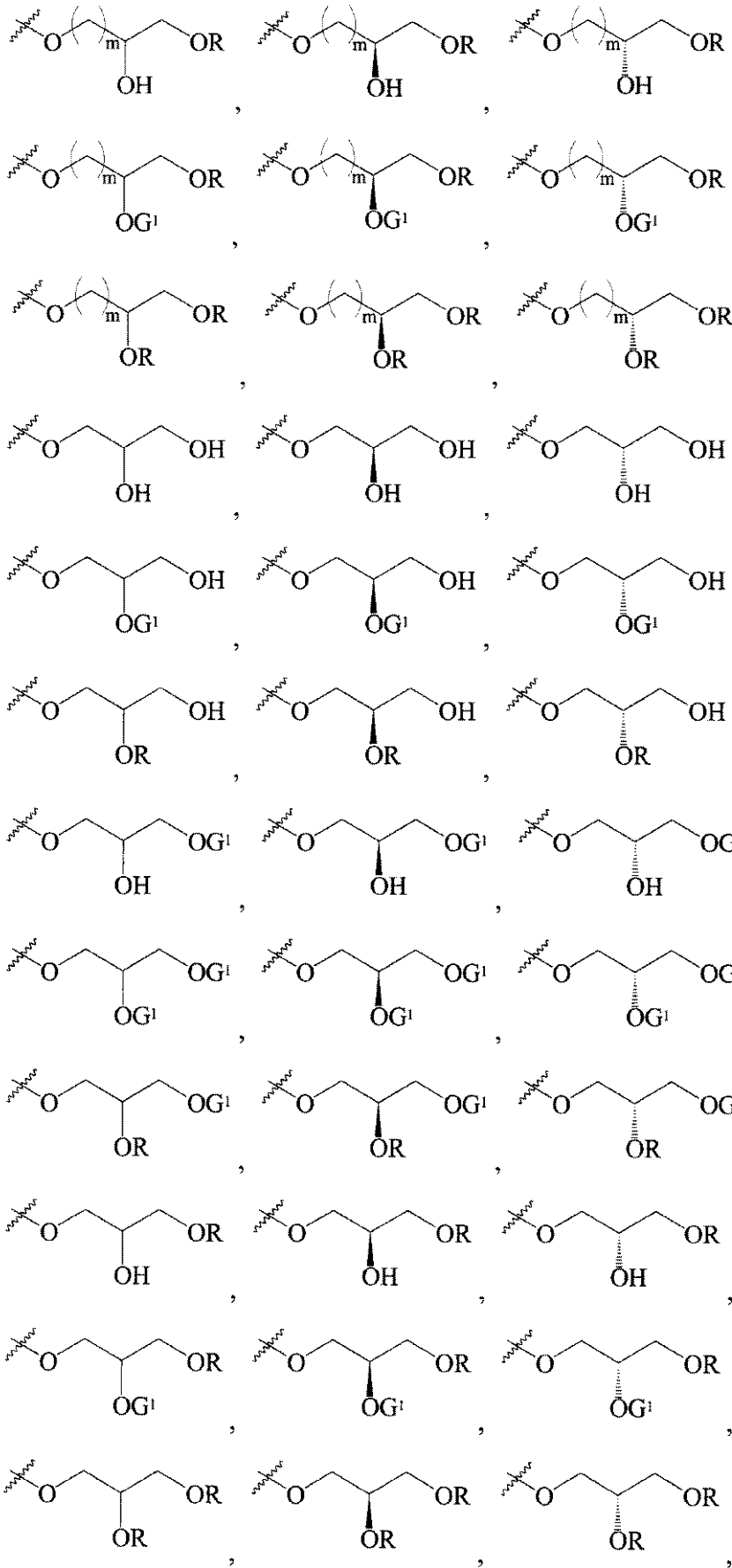
【 0 4 1 5 】

【化 3 4 9】



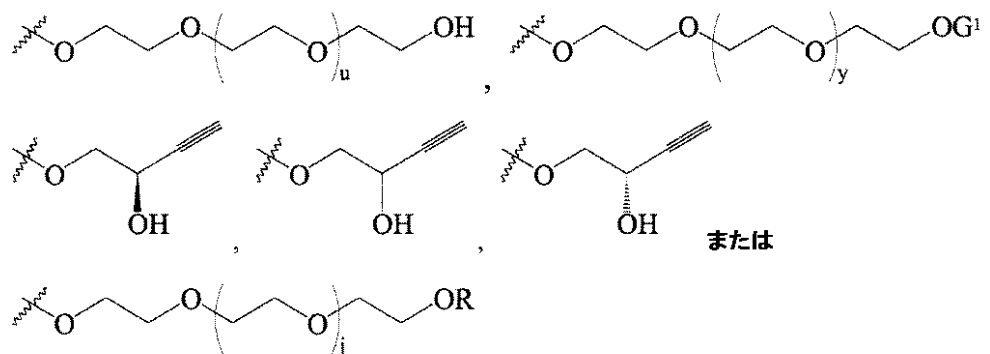
【 0 4 1 6 】

【化 3 5 0】



【 0 4 1 7 】

【化351】



10

であり得；残りの各Zは、独立して、C-T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COP₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；G¹、G¹'およびG¹"の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、R⁴、OH、OR⁴、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR⁴、NR⁴₂、CN、SH、SR⁴、SO₃H、SO₃R⁴、SO₂R⁴、OSO₃R⁴、OR⁵、CO₂R⁴、CONH₂、CONHR⁴、CONHR⁵、CONR⁴₂、NHR⁵、OPO₃H₃、CONR⁴R⁵、NR⁴R⁵およびNO₂からなる群から選択され得；各R⁴は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得；各R⁵は、独立して、C₁-C₁₀アシルであり得；Rは、C₁-C₁₀アシルであり得；J'およびJ''の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；ここで、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、OJ'、F、Cl、Br、IまたはNH₂からなる群から選択され得る。残りの各Zは、独立して、CG¹、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得る。各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。

20

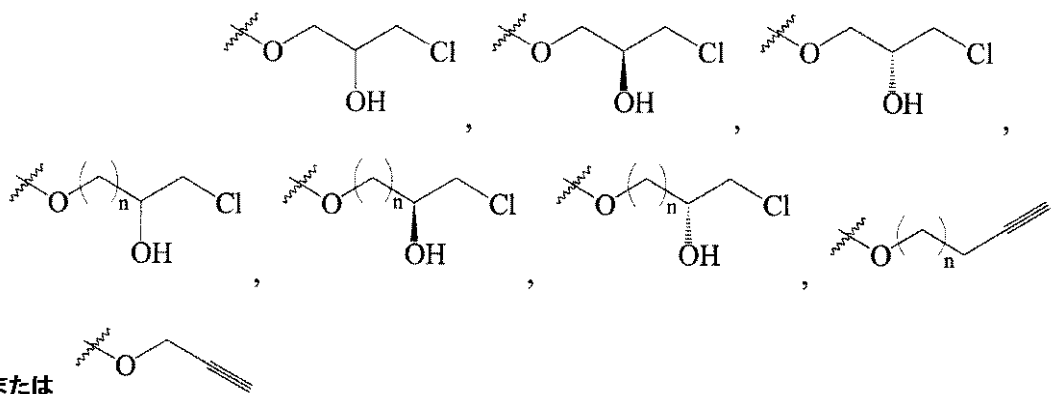
30

【0418】

Qは、

【0419】

【化 3 5 2】

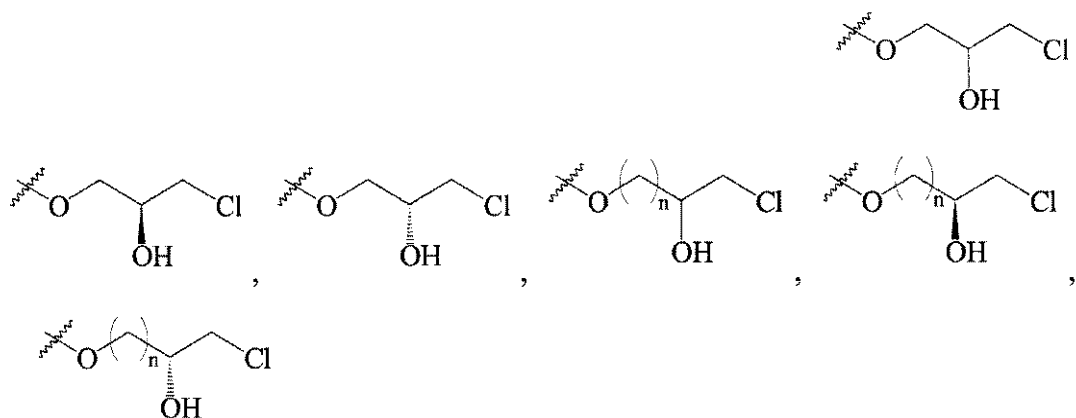


10

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【 0 4 2 0】

【化 3 5 3】

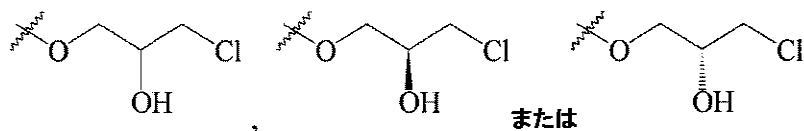


20

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【 0 4 2 1】

【化 3 5 4】

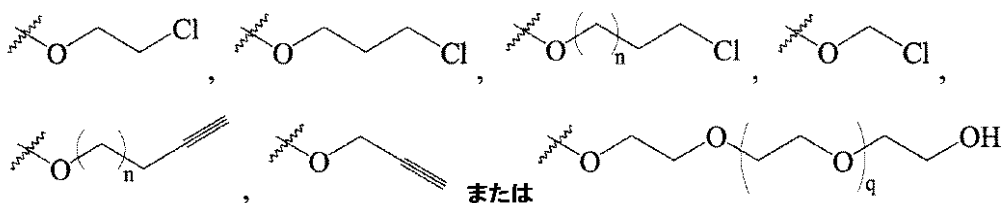


30

であり得る。Qは、

【 0 4 2 2】

【化 3 5 5】



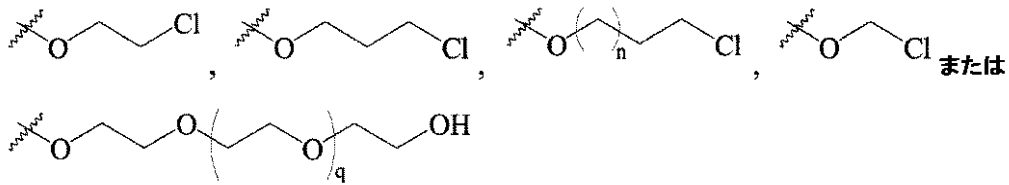
40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

50

【0423】

【化356】

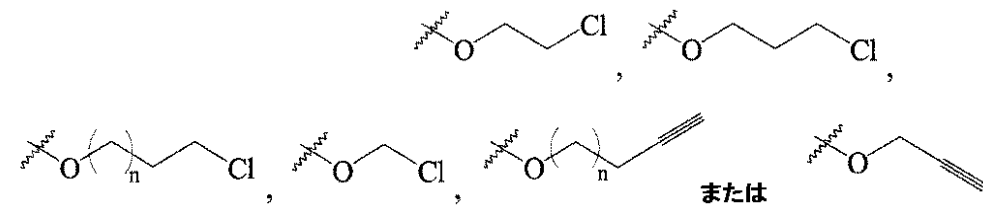


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

10

【0424】

【化357】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

20

【0425】

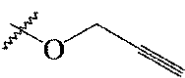
【化358】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0426】

【化359】

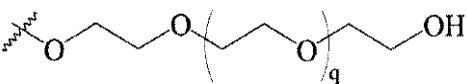


30

であり得る。Qは、

【0427】

【化360】

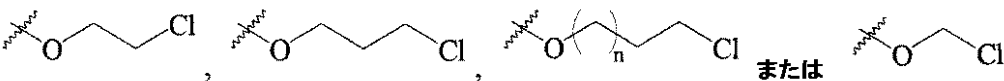


であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。Qは、

40

【0428】

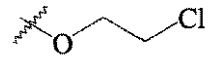
【化361】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0429】

【化362】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0430】

【化363】

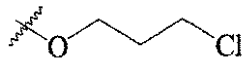
10



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0431】

【化364】



であり得る。

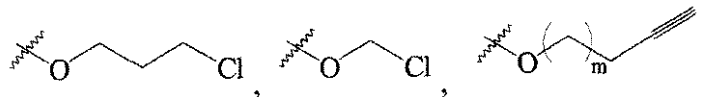
20

【0432】

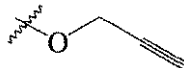
Tは、

【0433】

【化365】



または

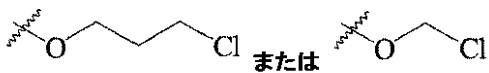


30

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0434】

【化366】

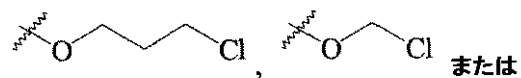


であり得る。Tは、

【0435】

【化367】

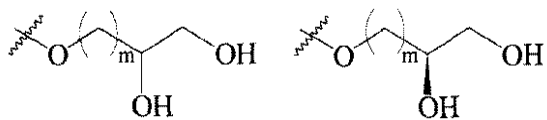
40



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Tは、

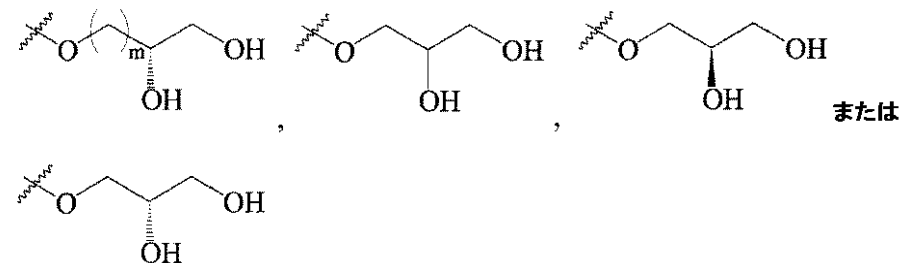
【0436】

【化368】



【0437】

【化369】

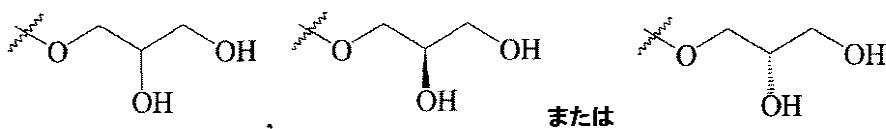


10

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0438】

【化370】

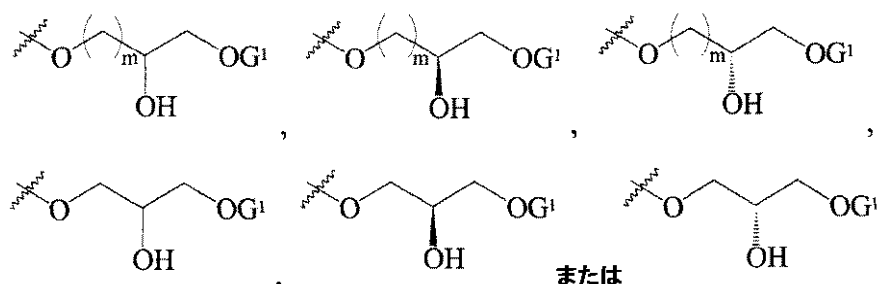


20

であり得る。Tは、

【0439】

【化371】



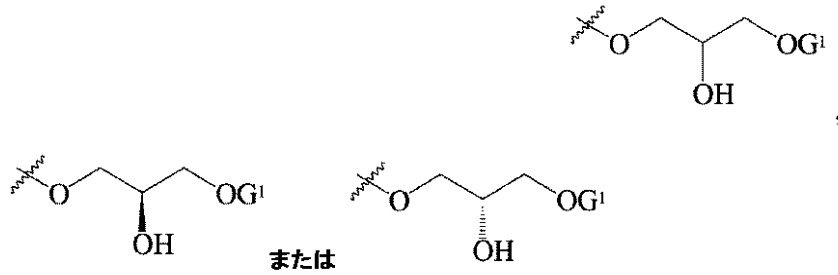
30

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂

40

【0440】

【化372】



であり得、各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Tは、

10

【0441】

【化373】

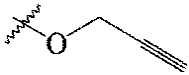


であり得、 m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

20

【0442】

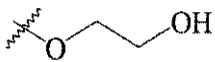
【化374】



であり得る。Tは、

【0443】

【化375】



30

であり得る。Tは、

【0444】

【化376】



であり得、 u は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。

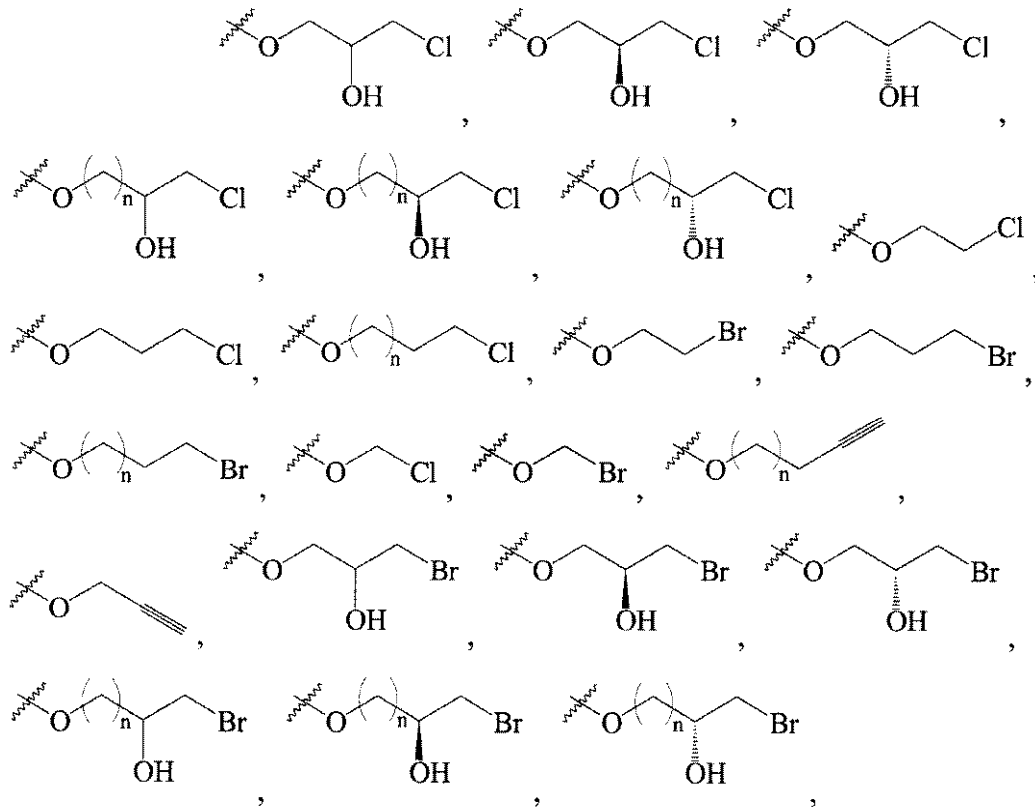
【0445】

Qは、

【0446】

40

【化377】

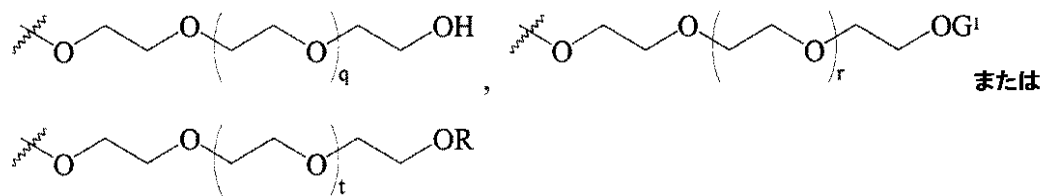


10

20

【0447】

【化378】



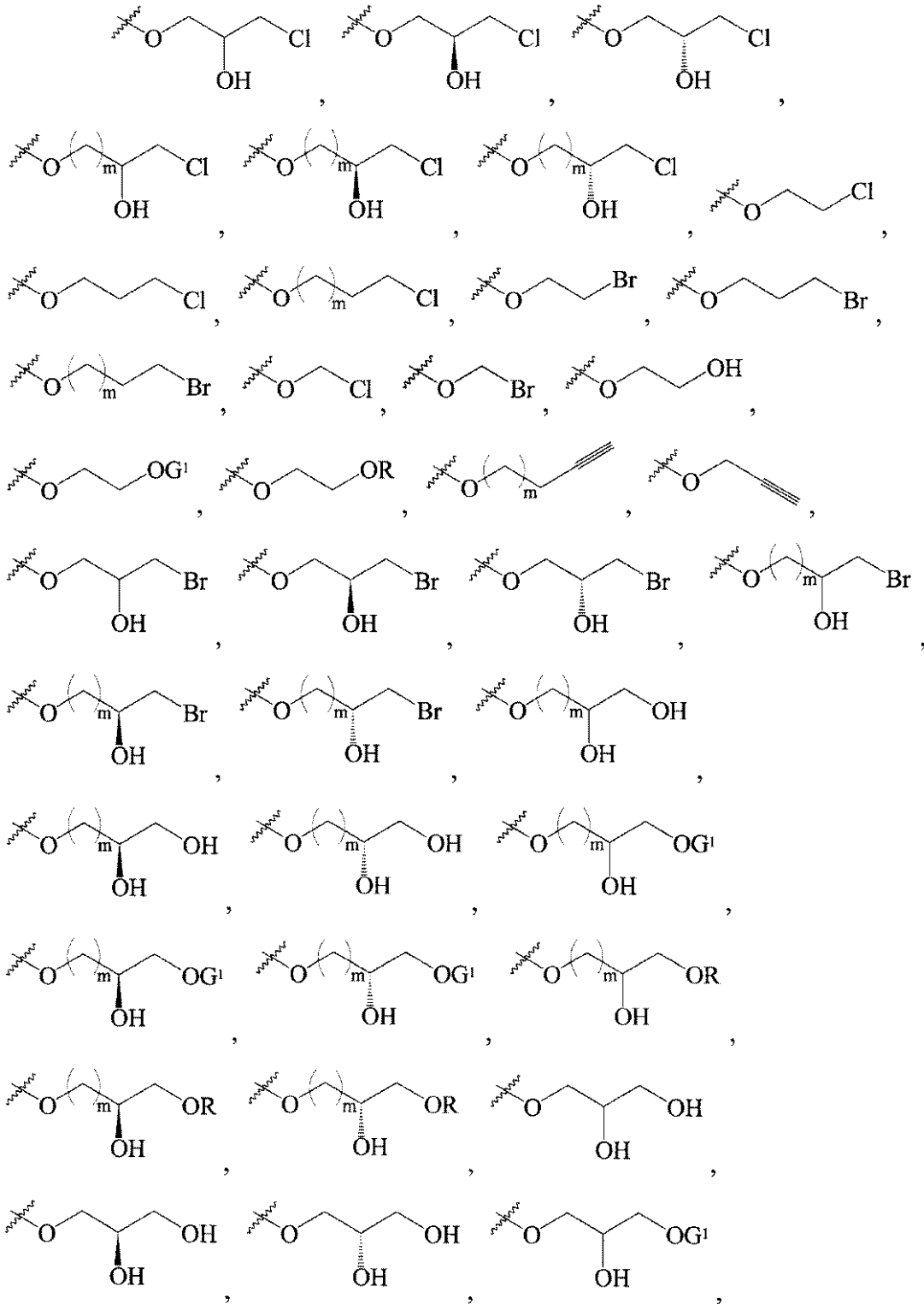
30

であり得；

Tは、

【0448】

【化 3 7 9】



10

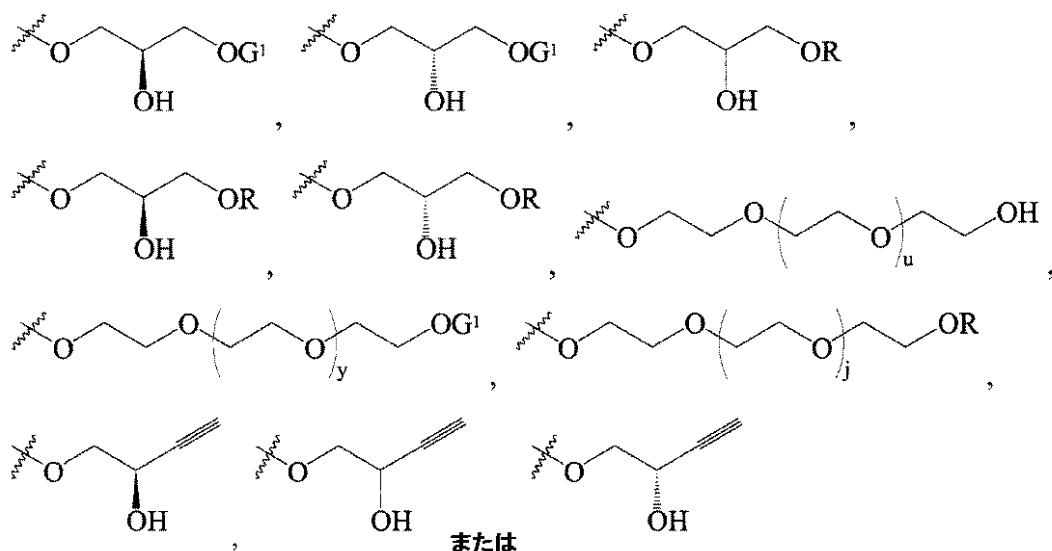
20

30

40

【 0 4 4 9】

【化380】



10

であり得；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

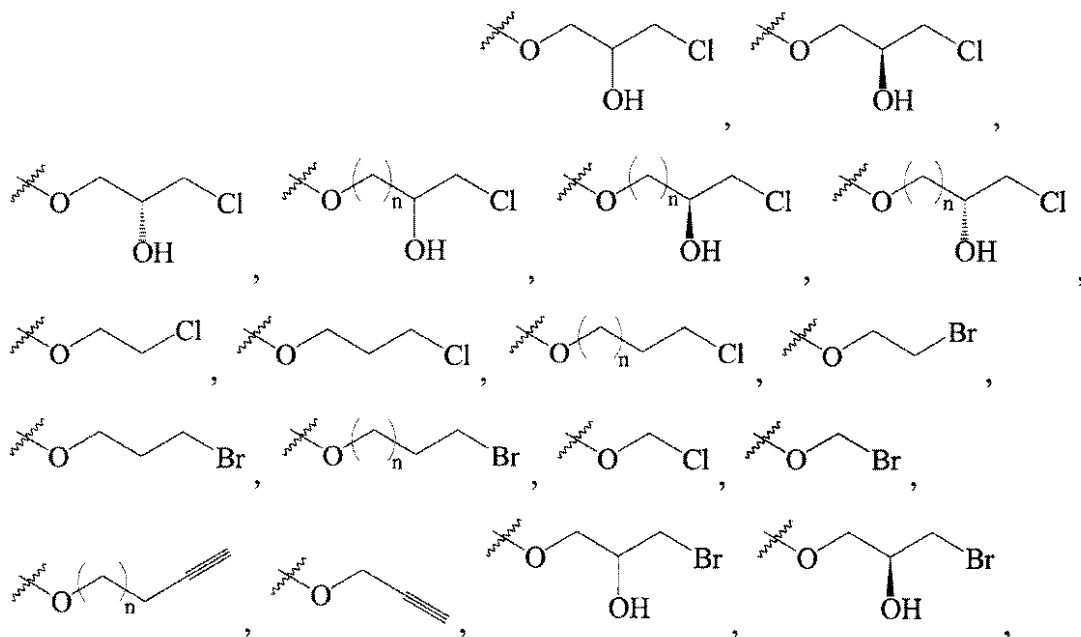
20

u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0450】

【化381】

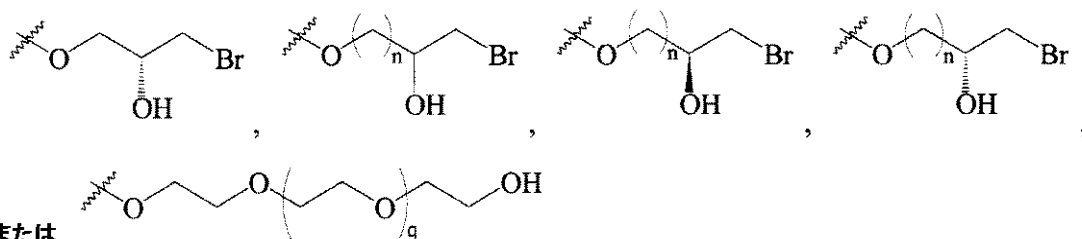


30

40

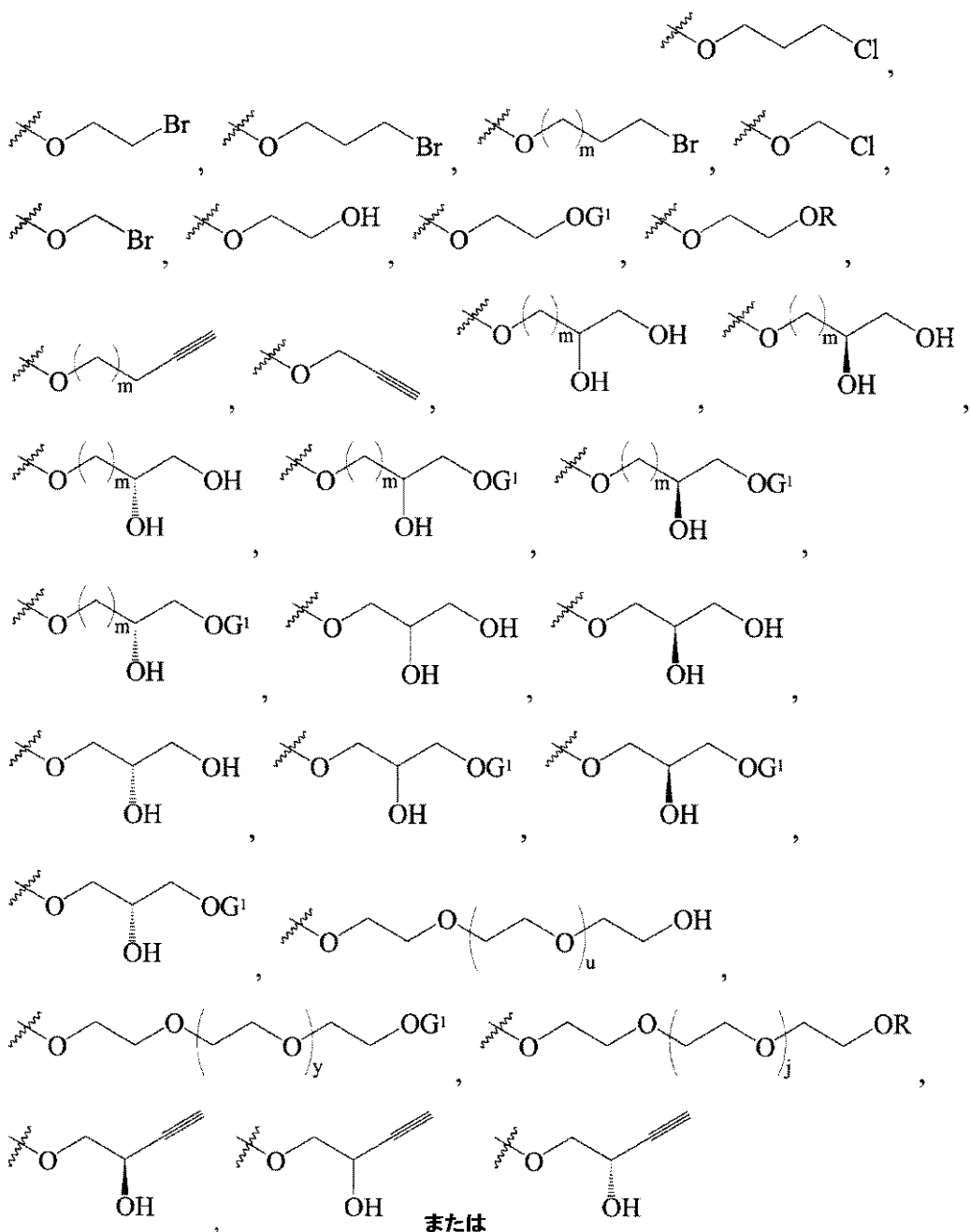
【0451】

【化382】



であり得；Tは、
 【0452】
 【化383】

10



20

30

40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であ

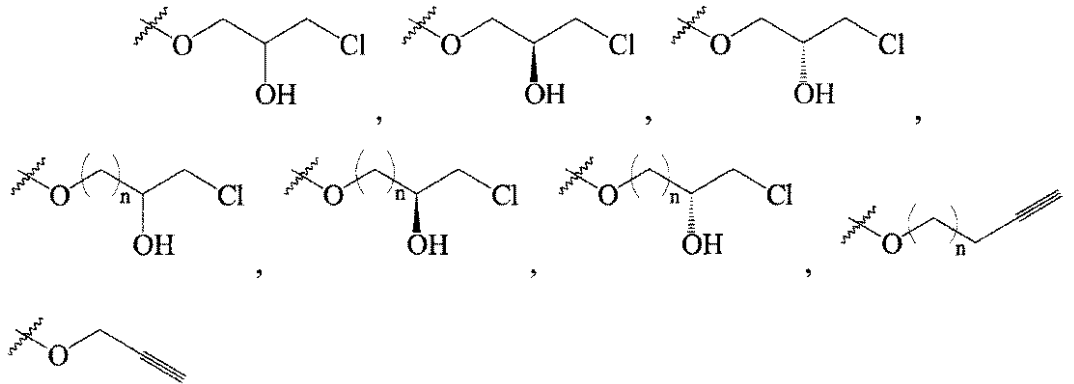
50

り得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 $OP(O)_3H_3$ および NO_2 からなる群から選択され得； J および J' の各々は、独立して、表 1 から選択される部分であり得る。

Q は、

【0453】

【化384】



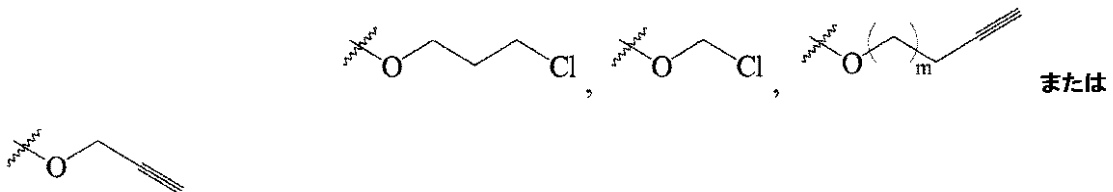
10

20

であり得；Tは、

【0454】

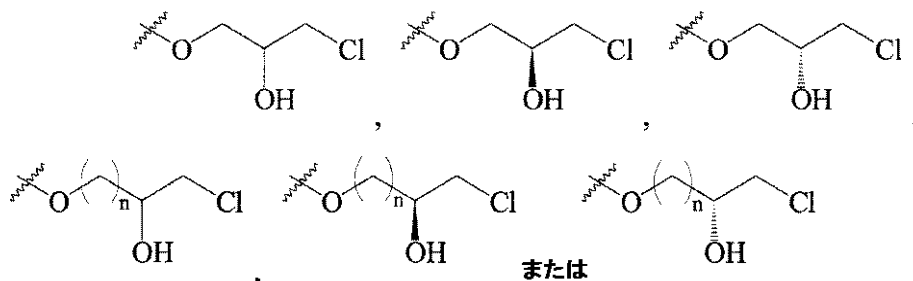
【化385】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0455】

【化386】

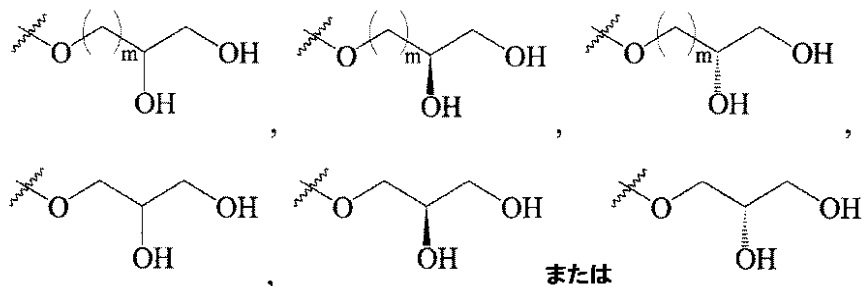


40

であり得；Tは、

【0456】

【化387】

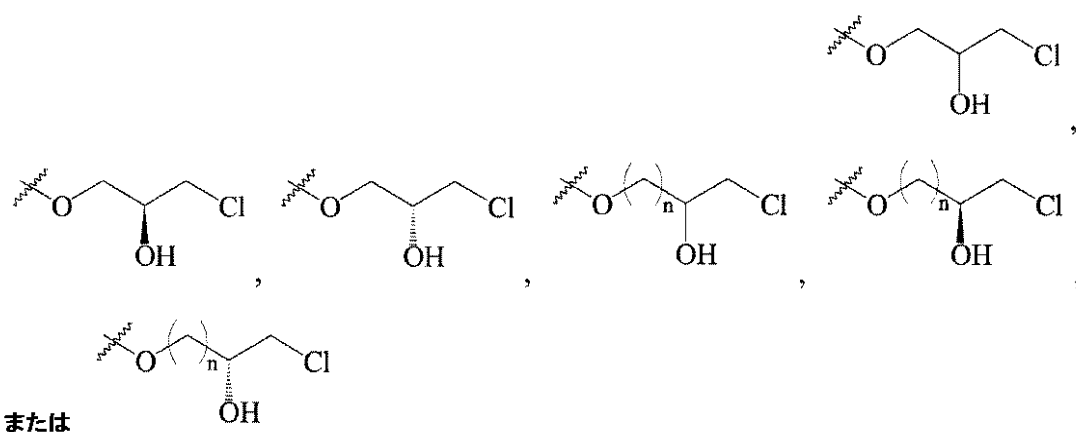


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0457】

【化388】

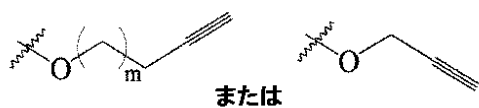


20

であり得；Tは、

【0458】

【化389】

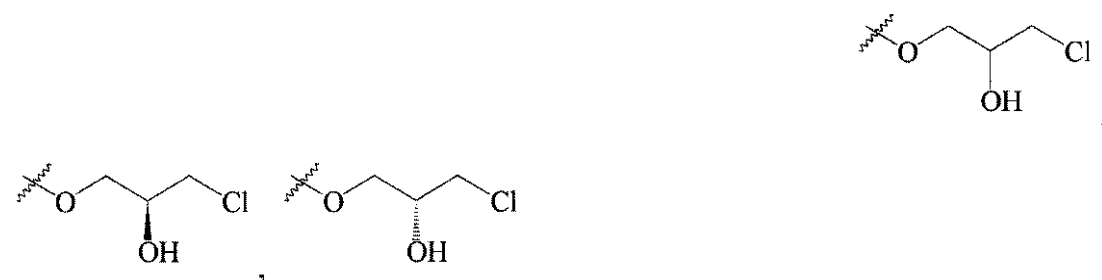


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0459】

【化390】



40

であり得；Tは、

【0460】

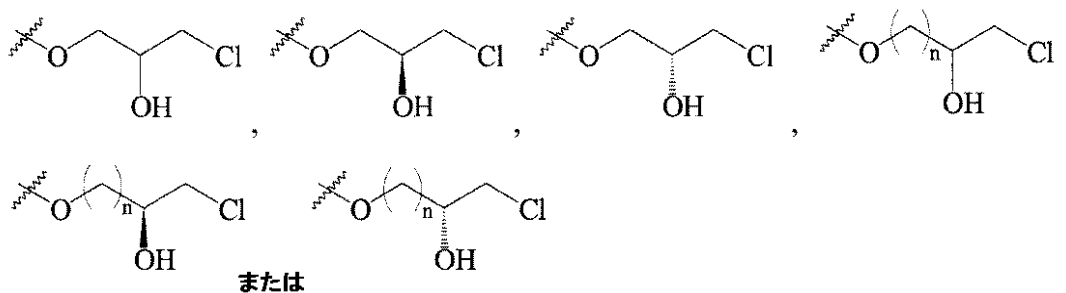
【化391】



であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0461】

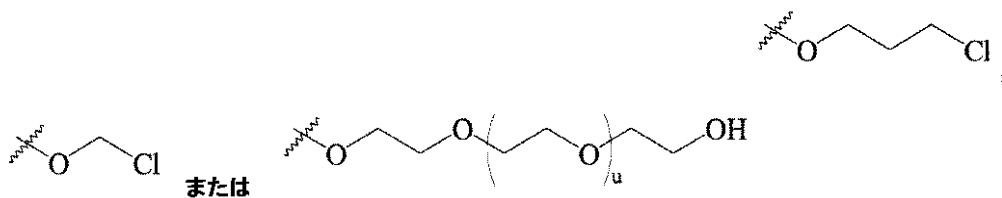
【化392】



であり得；Tは、

【0462】

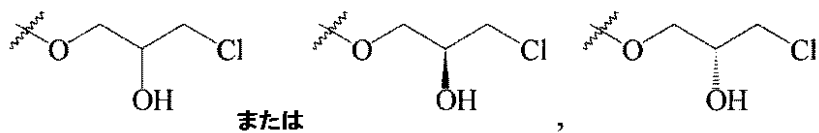
【化393】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0463】

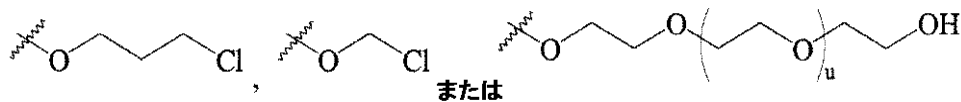
【化394】



であり得、Tは、

【0464】

【化395】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0465】

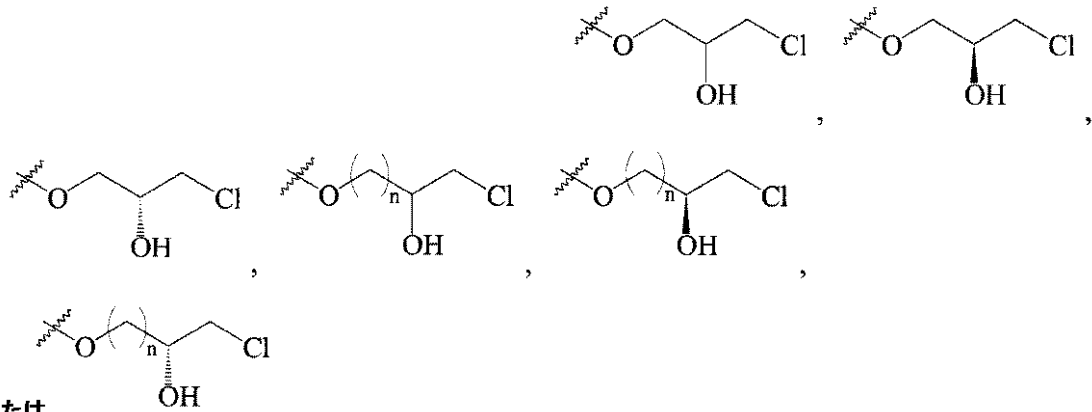
10

20

30

40

【化396】



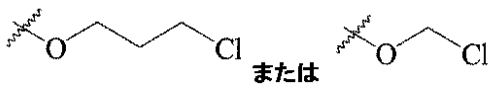
10

または

であり得；Tは、

【0466】

【化397】

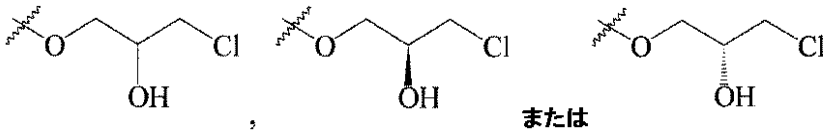


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0467】

【化398】

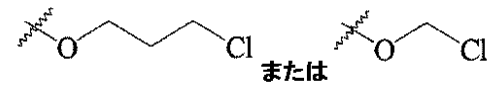


30

であり得；Tは、

【0468】

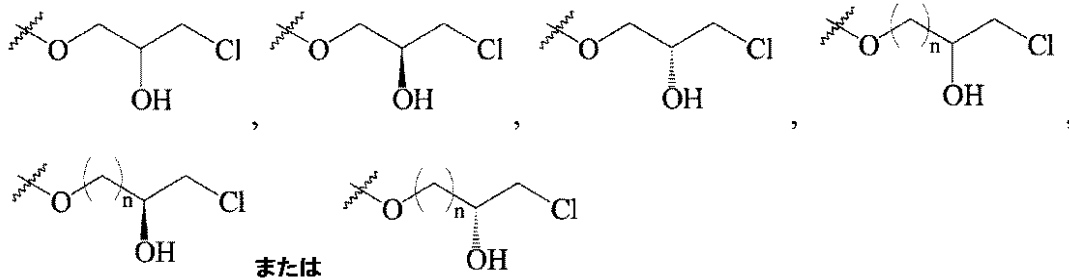
【化399】



であり得る。Qは、

【0469】

【化400】

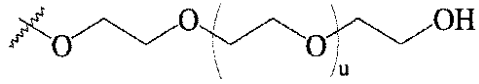


40

であり得；Tは、

【0470】

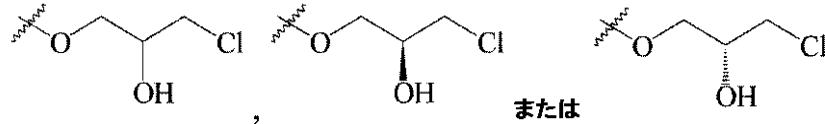
【化401】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0471】

【化402】



10

であり得；Tは、

【0472】

【化403】

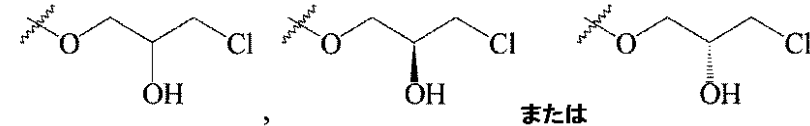


であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

20

【0473】

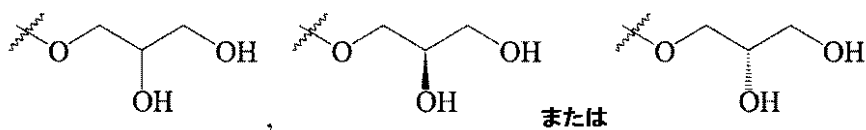
【化404】



であり得、Tは、

【0474】

【化405】

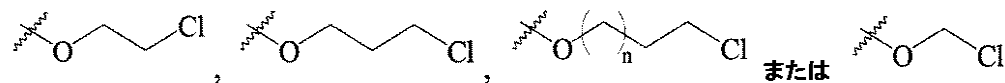


30

であり得る。Qは、

【0475】

【化406】

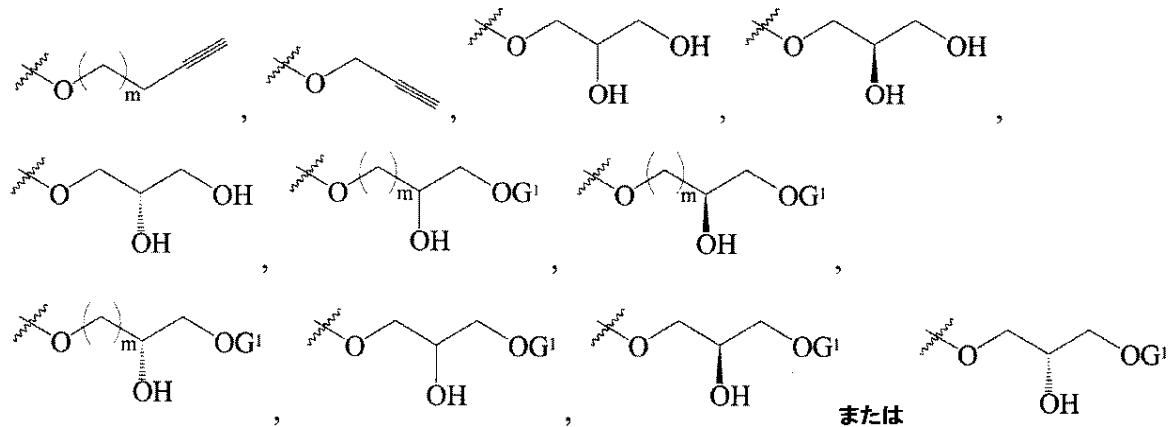


40

であり得；Tは、

【0476】

【化407】



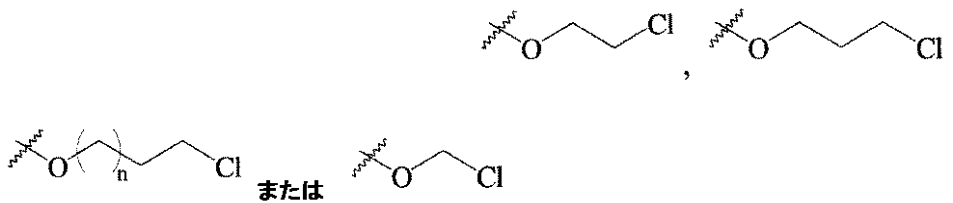
10

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Qは、

20

【0477】

【化408】



であり得；Tは、

30

【0478】

【化409】

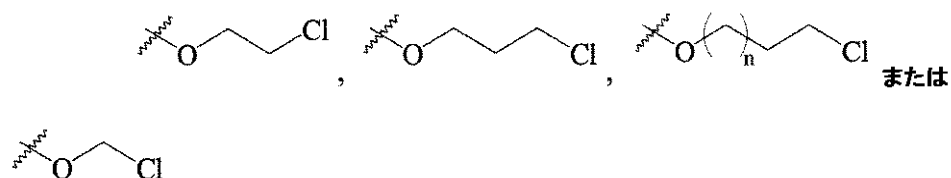


であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

40

【0479】

【化410】

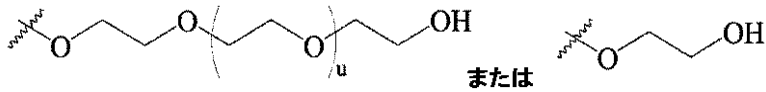


であり得；Tは、

50

【0480】

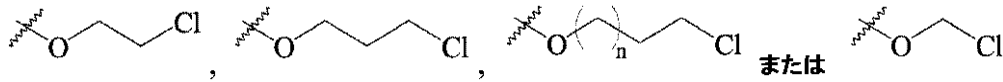
【化411】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0481】

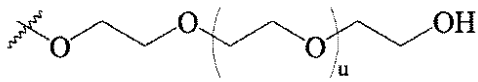
【化412】



であり得；Tは、

【0482】

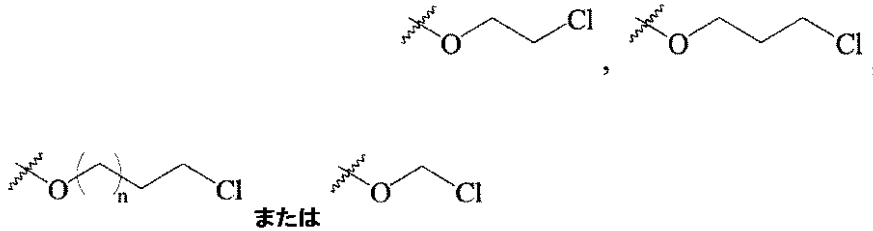
【化413】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0483】

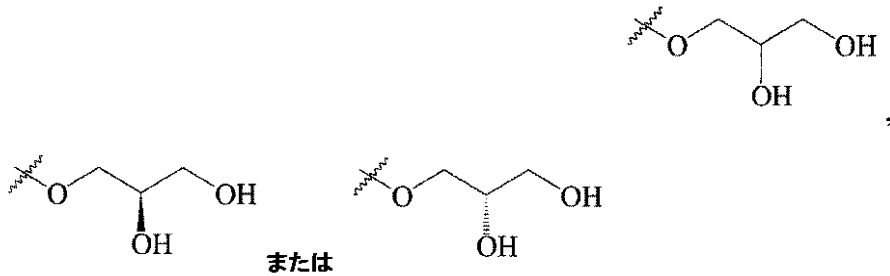
【化414】



であり得；Tは、

【0484】

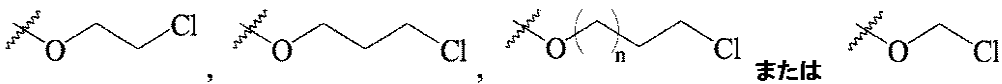
【化415】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0485】

【化416】



であり得；Tは、

【0486】

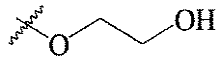
10

20

30

40

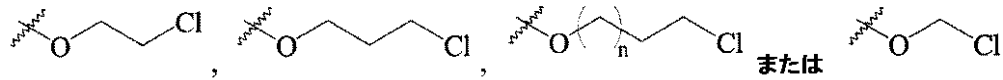
【化417】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0487】

【化418】

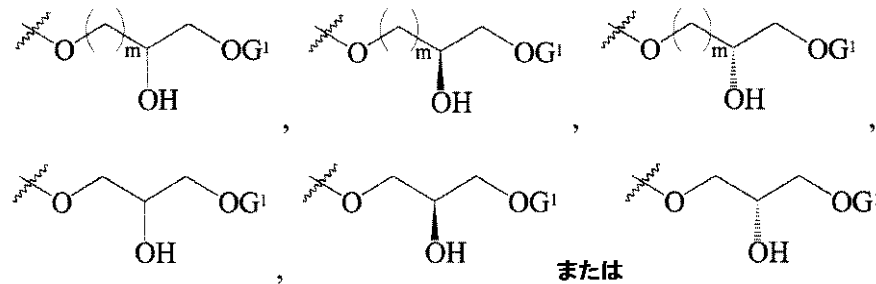


10

であり得；Tは、

【0488】

【化419】

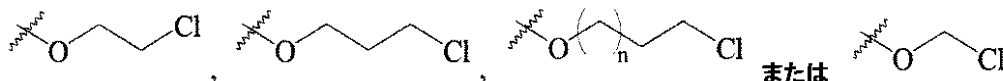


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0489】

【化420】

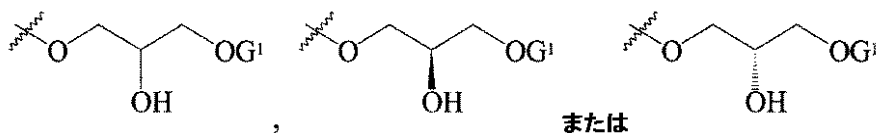


30

であり得；Tは、

【0490】

【化421】



40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。

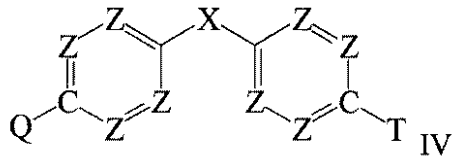
【0491】

別の実施形態によると、式IVの構造を有する化合物

50

【 0 4 9 2 】

【 化 4 2 2 】



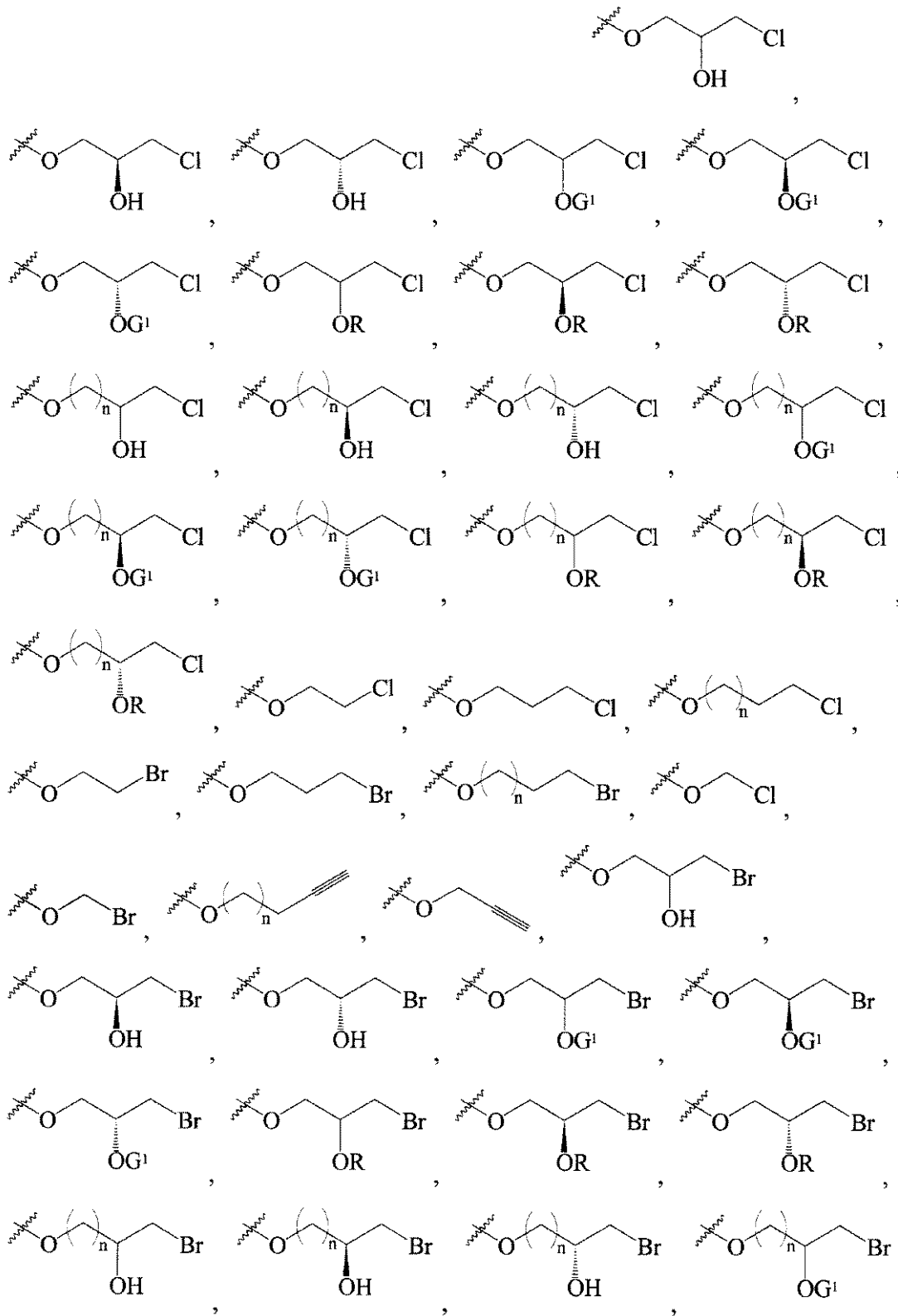
の使用が提供され、ここで：Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得るか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり得；残りの各Zは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり得；ここで、Qは、

10

20

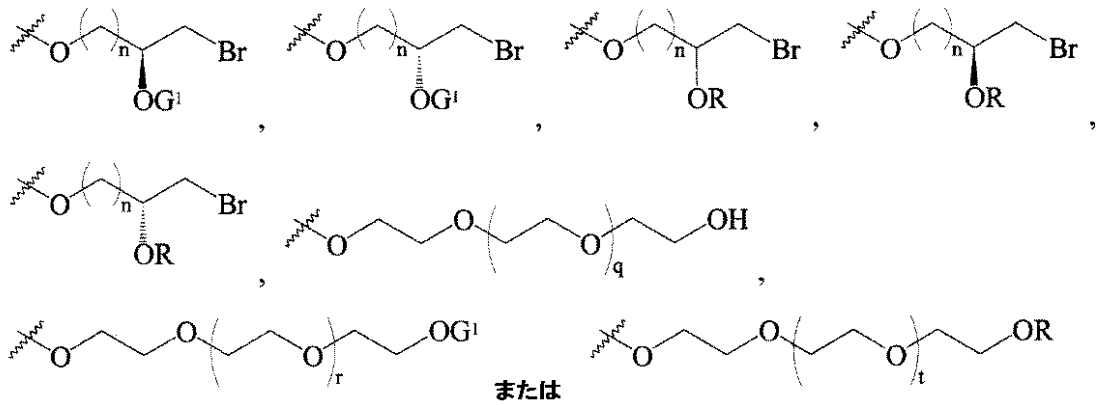
【 0 4 9 3 】

【化 4 2 3】



【 0 4 9 4 】

【化424】



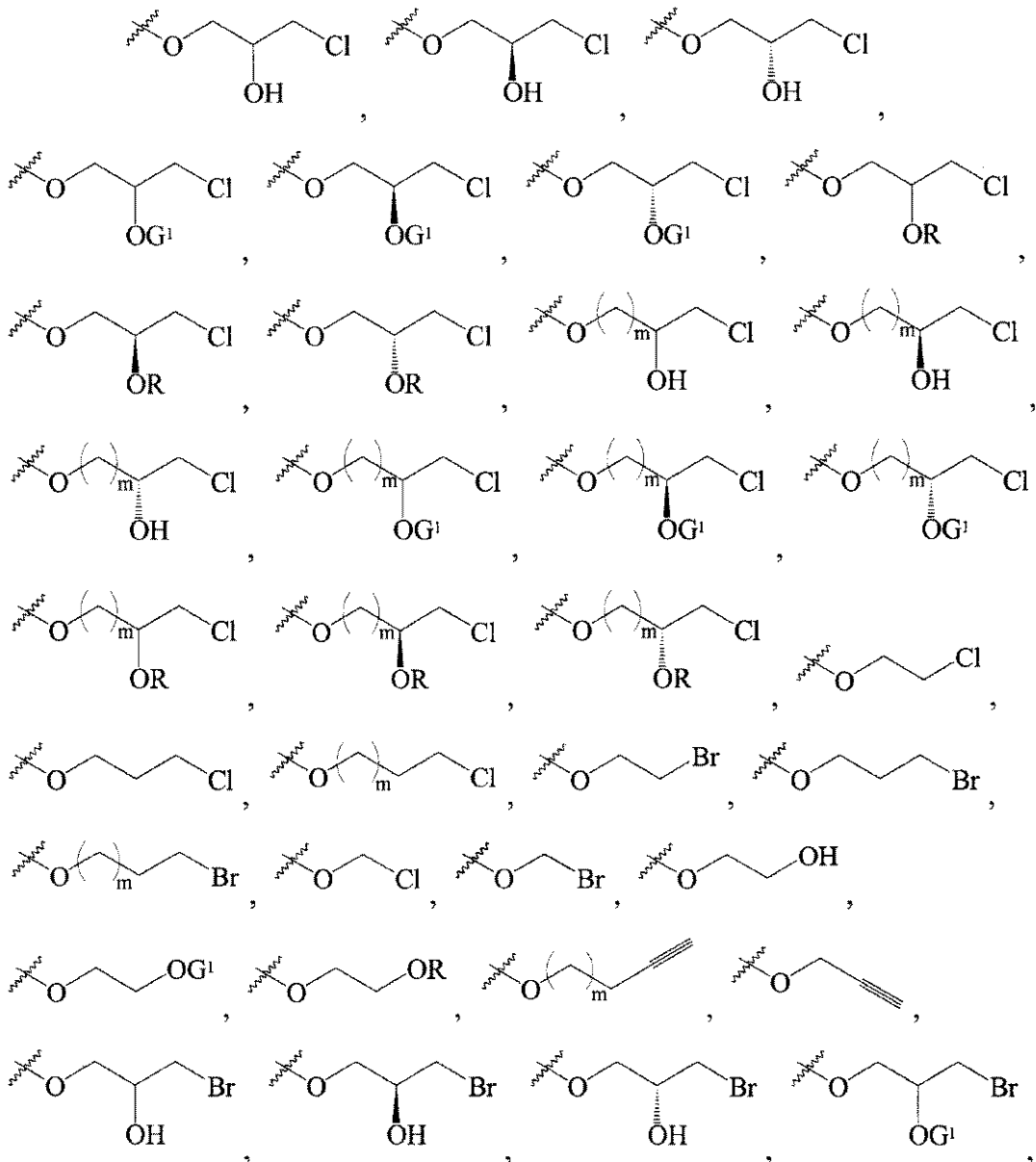
10

であり得；

Tは、

【0495】

【化425】



20

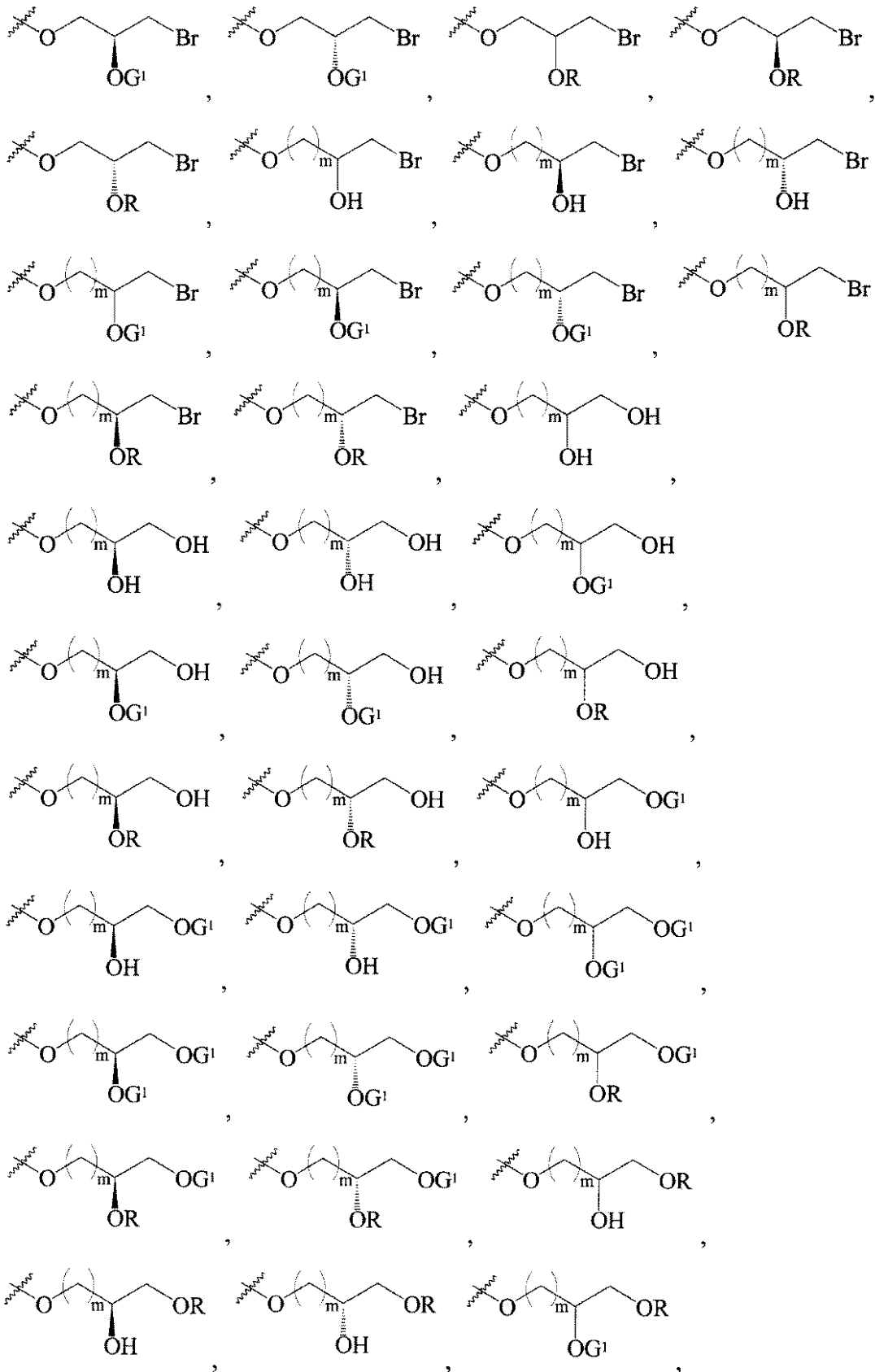
30

40

【0496】

50

【化 4 2 6】



10

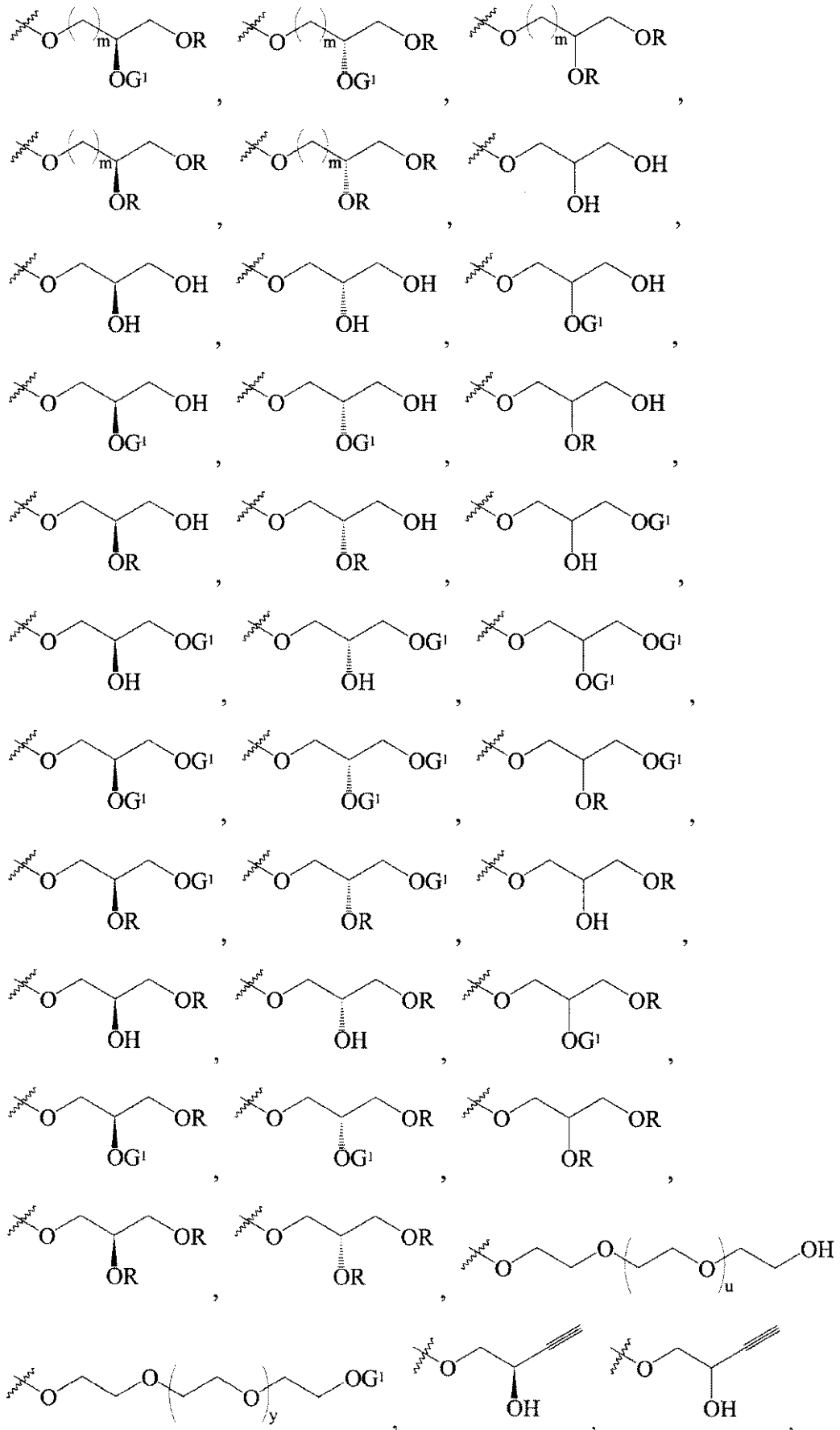
20

30

40

【 0 4 9 7】

【化 4 2 7】



10

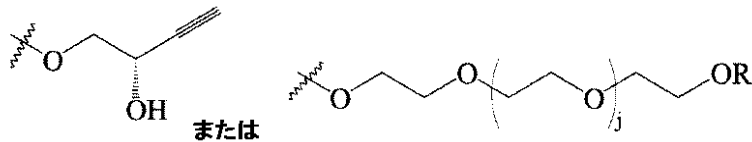
20

30

40

【 0 4 9 8】

【化428】



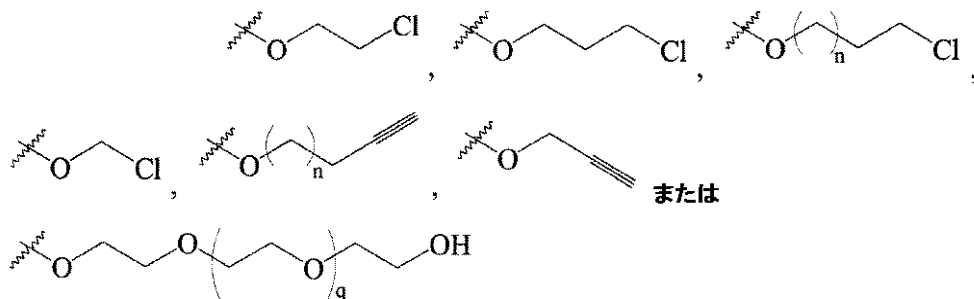
であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u 、 j および y の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； G^1 、 $G^{1'}$ および $G^{1''}$ の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 $OJ^{1''}$ 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得； R は、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得； J および $J^{1''}$ の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；ここで、 OH 基の1つ以上は、その H を表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 $OJ^{1''}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I または NH_2 からなる群から選択され得る。各 Z は、独立して、 CG^1 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI または COH であり得る。各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 $OJ^{1''}$ 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。

【0499】

Qは、

【0500】

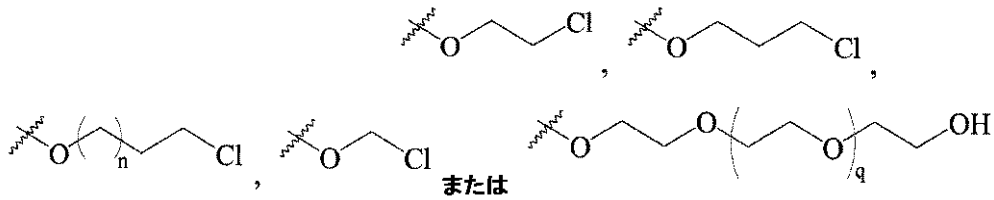
【化429】



であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0501】

【化430】

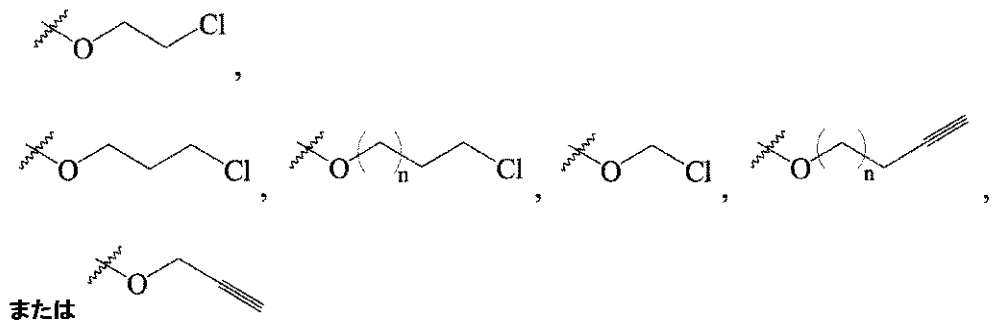


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

10

【0502】

【化431】

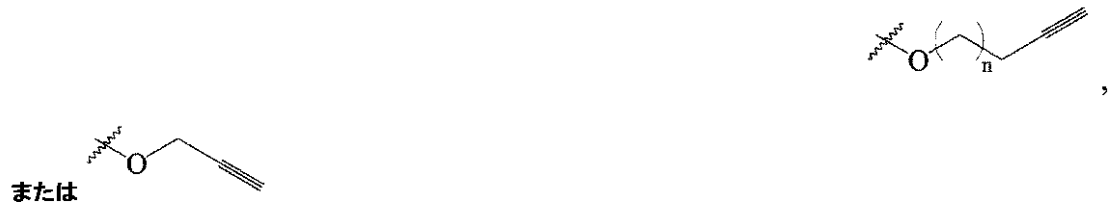


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0503】

【化432】

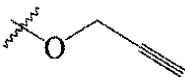


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0504】

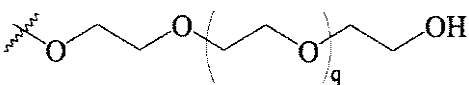
【化433】



であり得る。Qは、

【0505】

【化434】

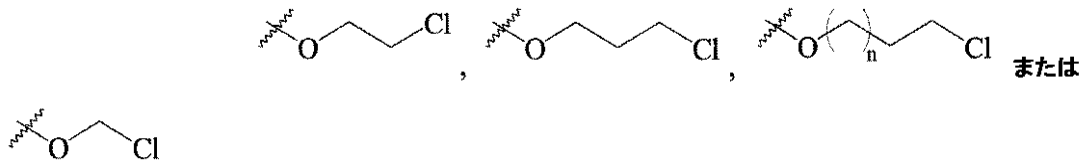


であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。Qは、

40

【0506】

【化435】

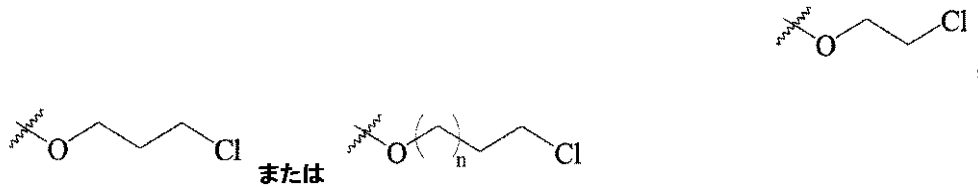


であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0507】

【化436】

10

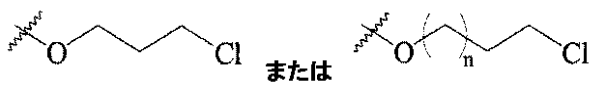


であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0508】

【化437】

20



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0509】

【化438】



であり得る。

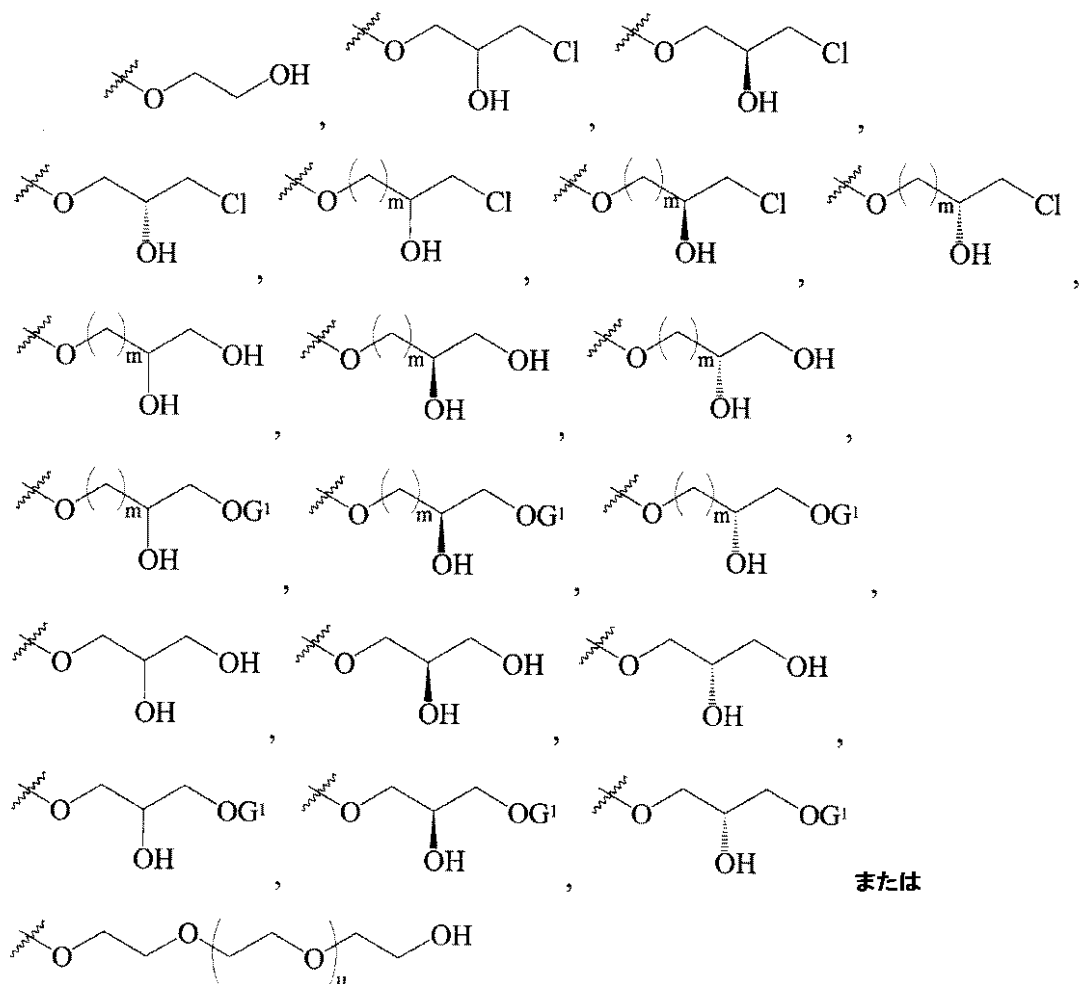
【0510】

Tは、

【0511】

30

【化440】



10

20

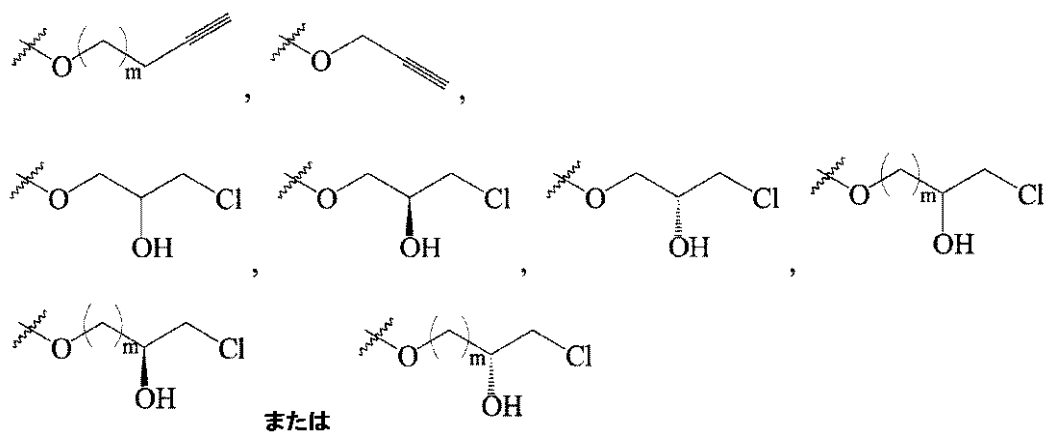
または

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

30

【0513】

【化441】



40

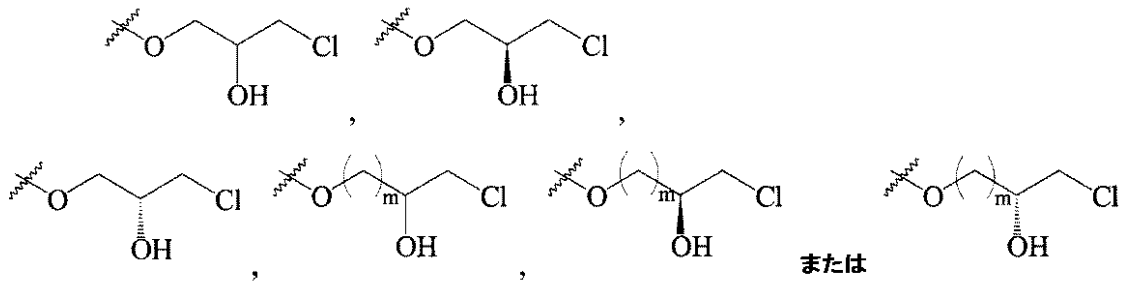
または

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

50

【0514】

【化442】

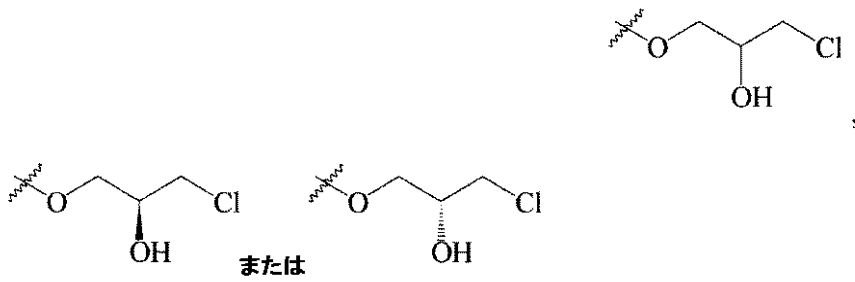


10

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0515】

【化443】

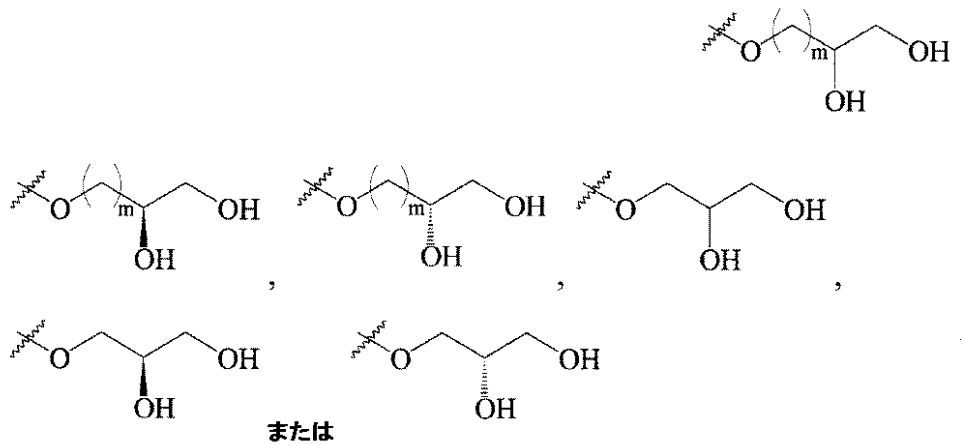


20

であり得る。Tは、

【0516】

【化444】

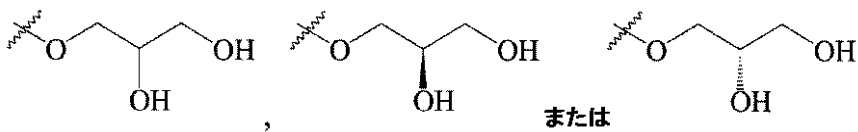


30

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0517】

【化445】

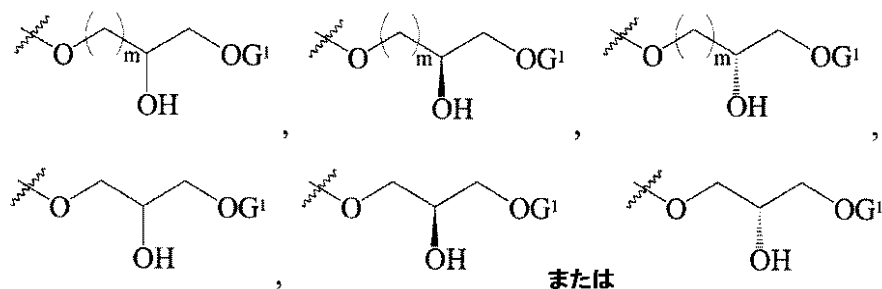


40

であり得る。Tは、

【0518】

【化446】

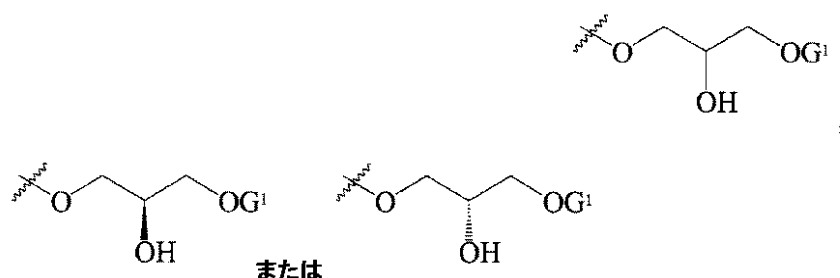


10

であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Tは、

【0519】

【化447】



20

であり得、各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Tは、

【0520】

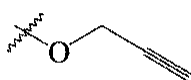
【化448】



であり得、 m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0521】

【化449】

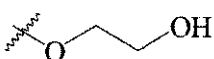


40

であり得る。Tは、

【0522】

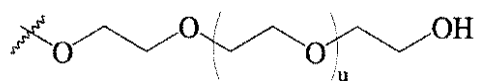
【化450】



であり得る。Tは、

【0523】

【化451】



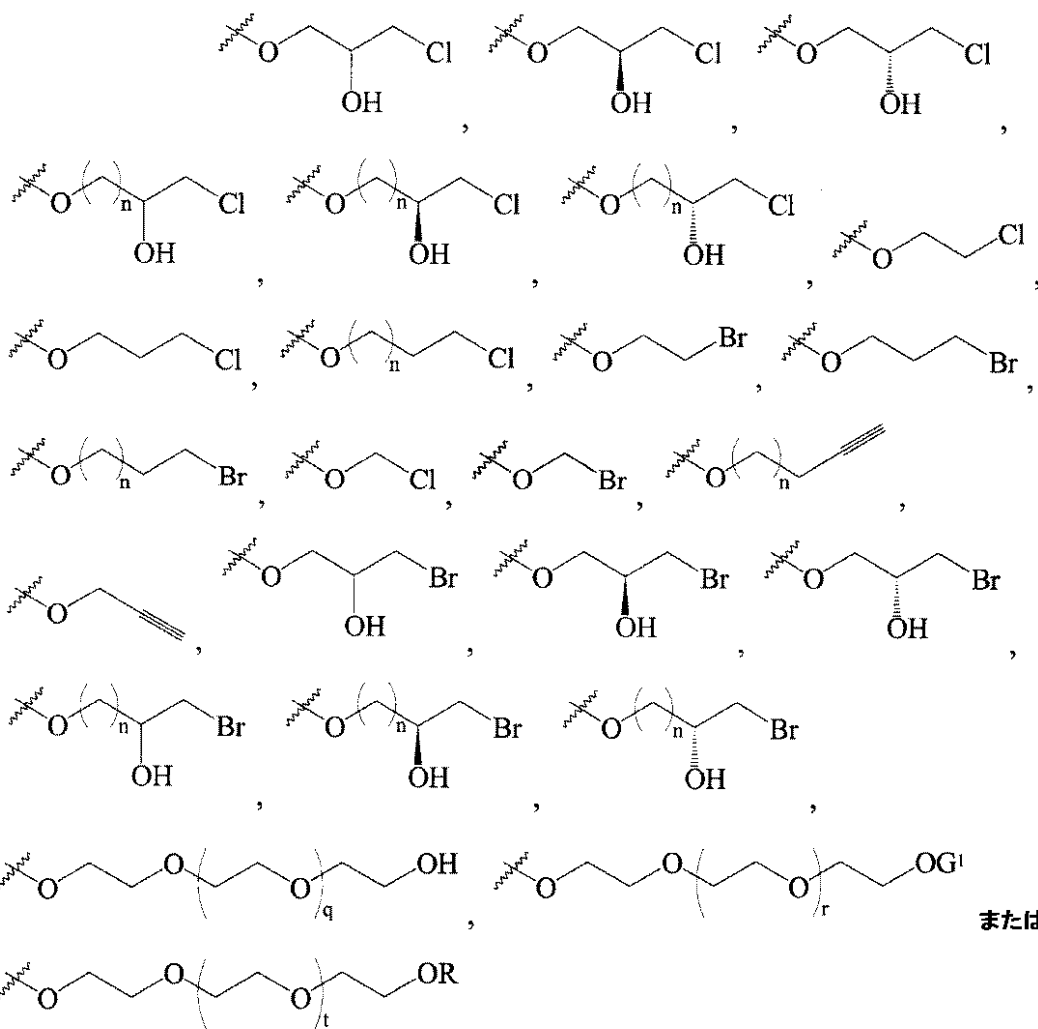
であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。

【0524】

Qは、

【0525】

【化452】



であり得；

Tは、

【0526】

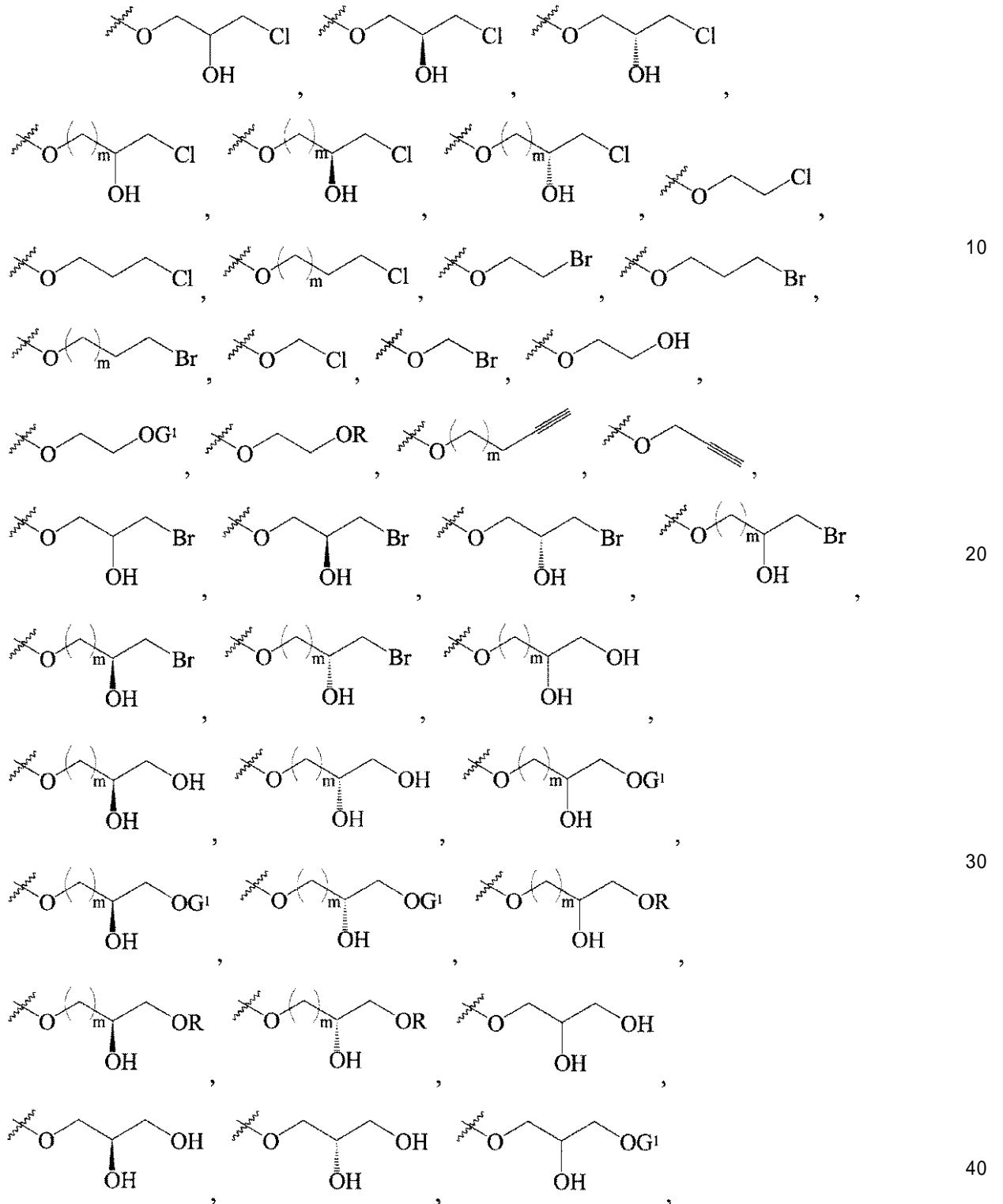
10

20

30

40

【化 4 5 3】



【 0 5 2 7】

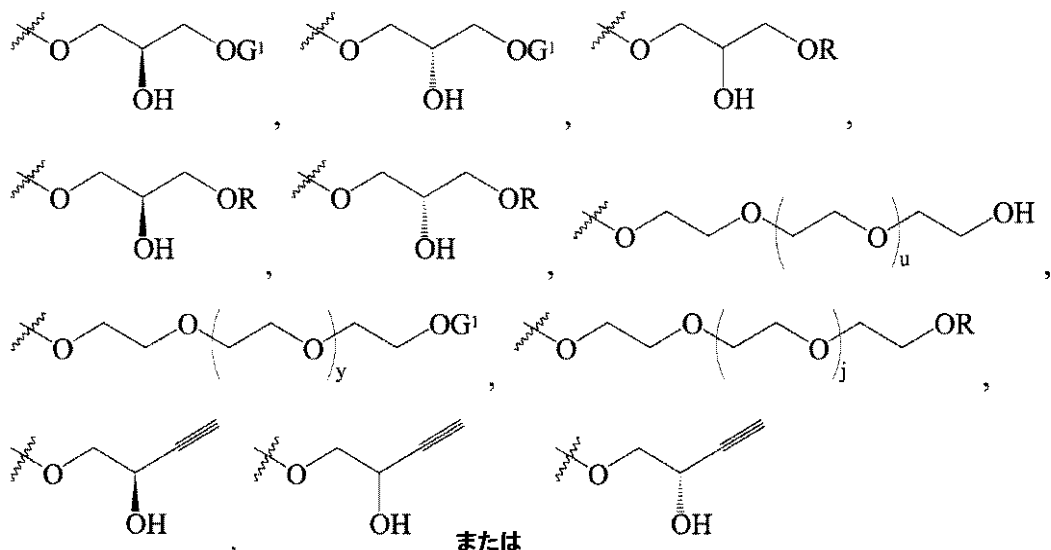
10

20

30

40

【化454】



10

であり得；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

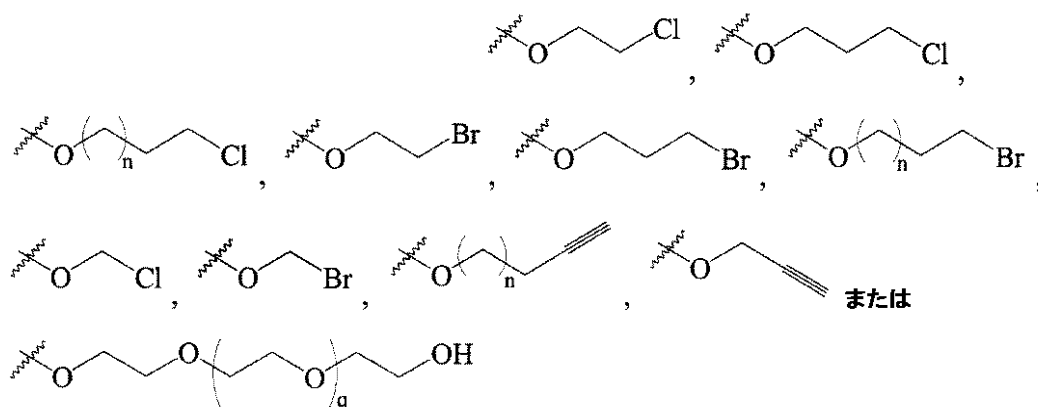
mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0528】

【化455】



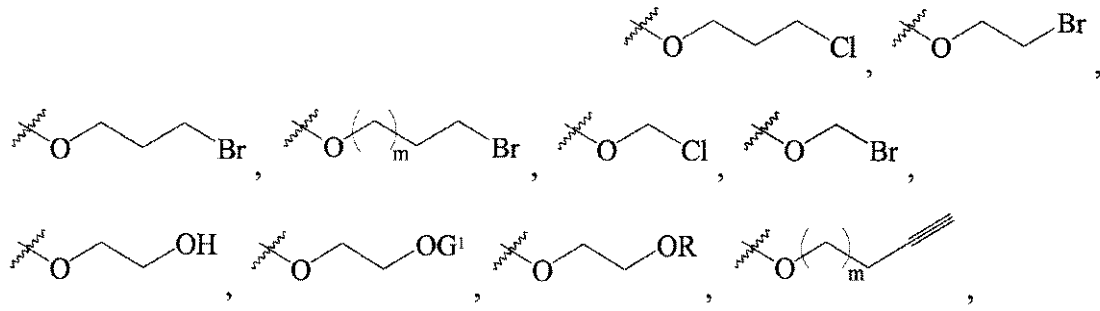
30

であり得；Tは、

【0529】

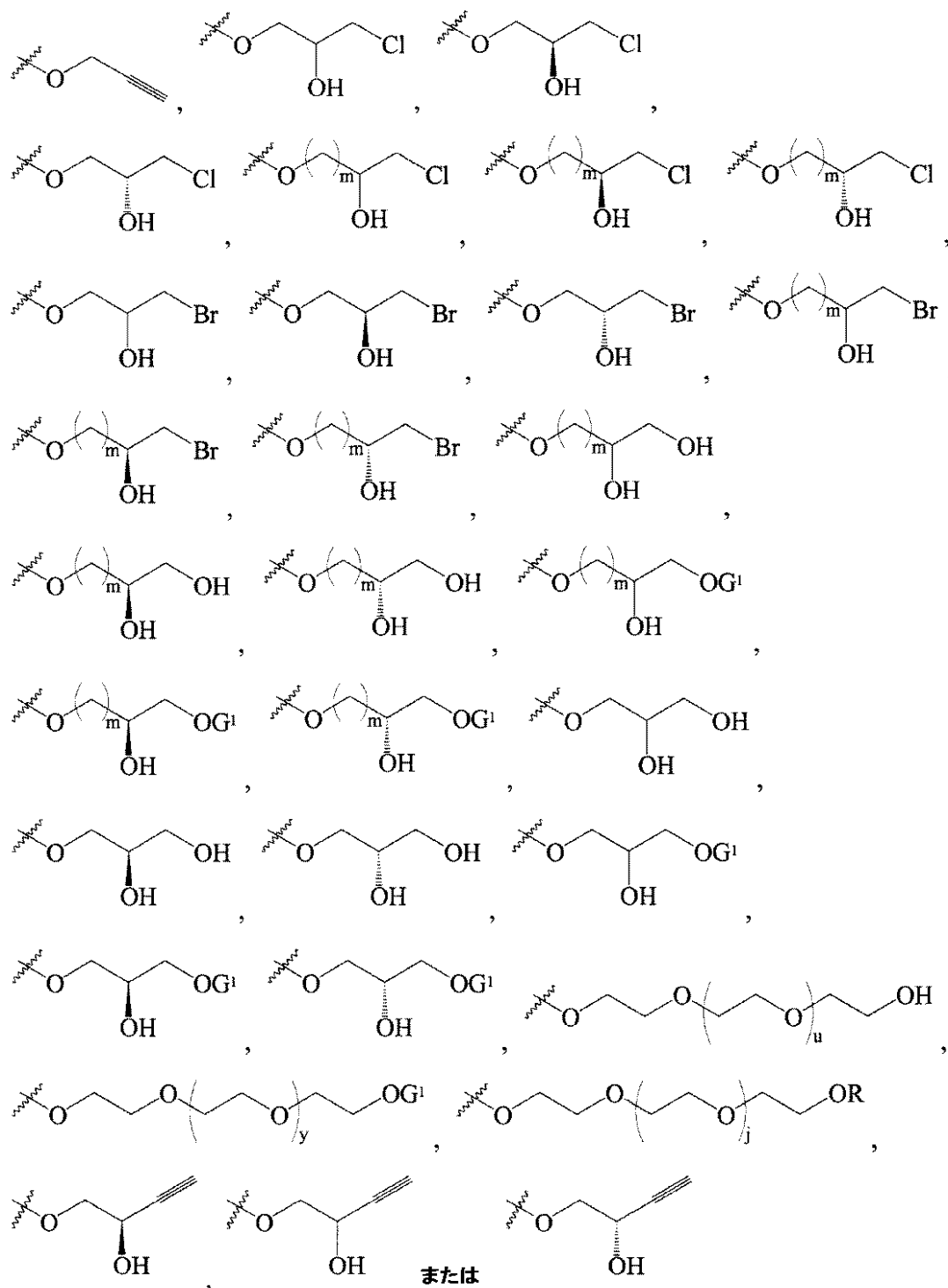
40

【化 4 5 6】



【 0 5 3 0 】

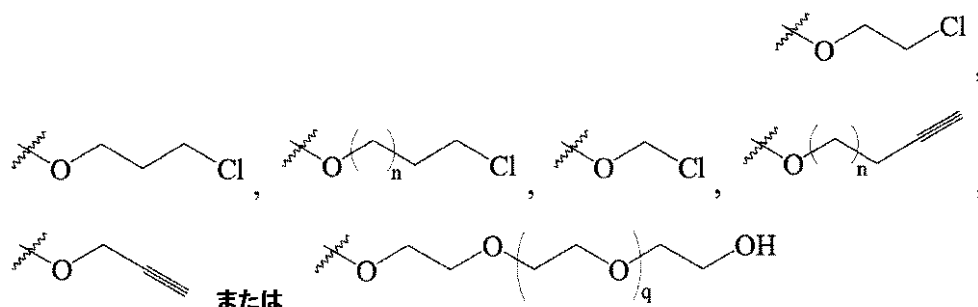
【化 4 5 7】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得；J'およびJ''の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得る。Qは、

【0531】

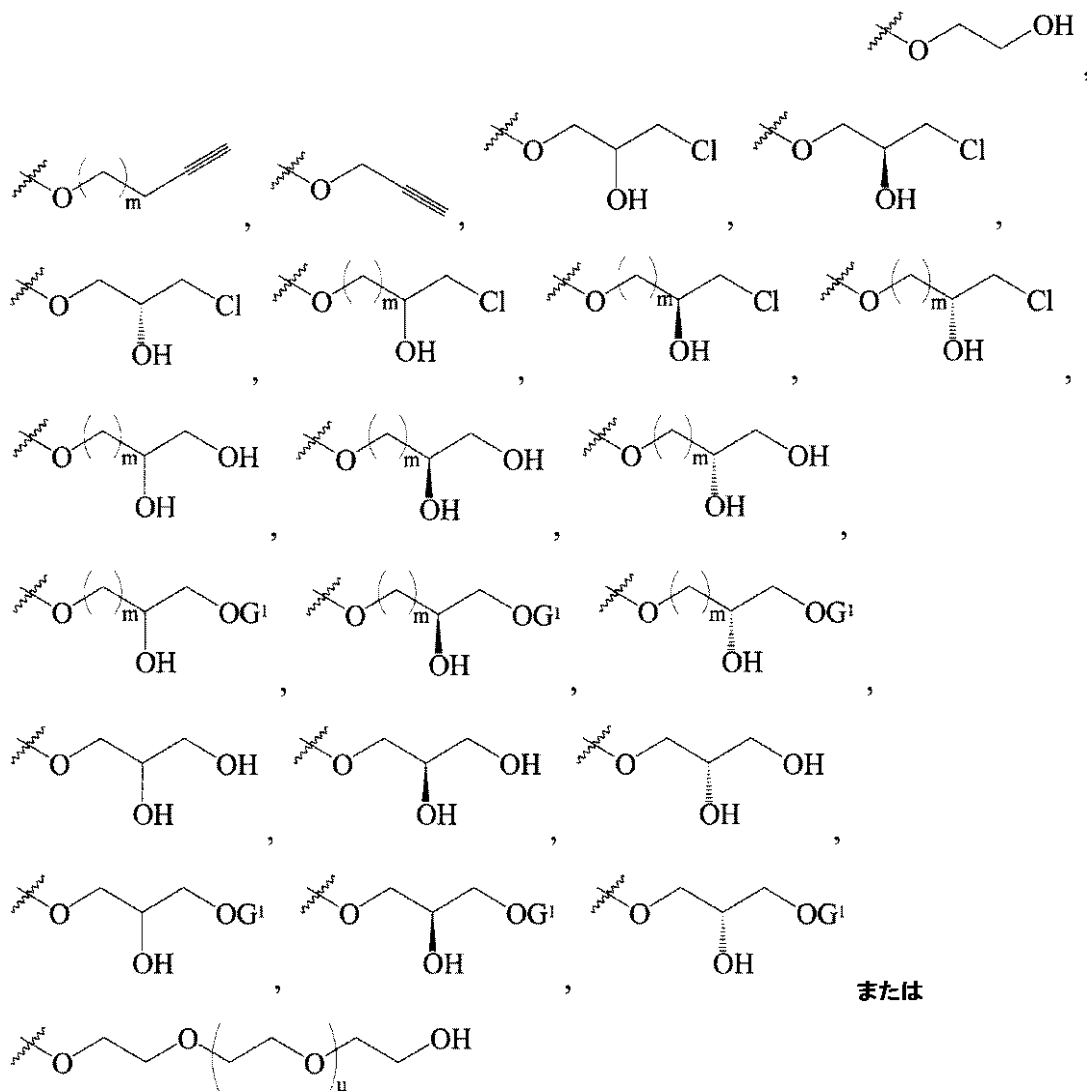
【化458】



であり得；Tは、

【0532】

【化459】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

10

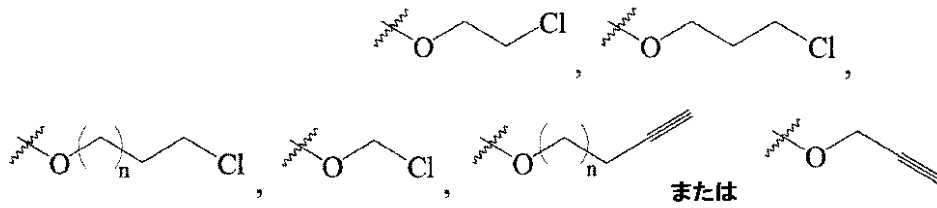
20

30

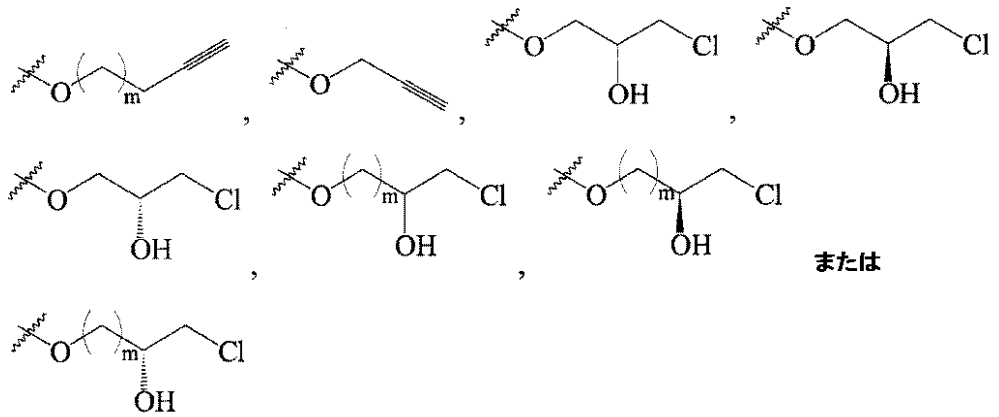
40

50

【0533】
【化460】



であり得；Tは、
【0534】
【化461】

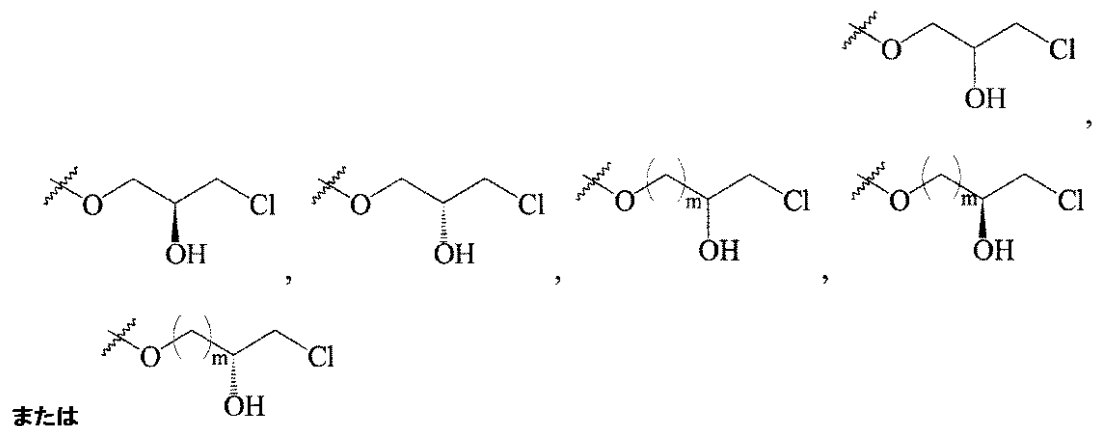


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0535】
【化462】



であり得；Tは、
【0536】
【化463】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

10

20

30

40

50

【0537】

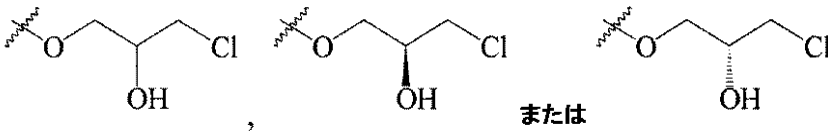
【化464】



であり得；Tは、

【0538】

【化465】

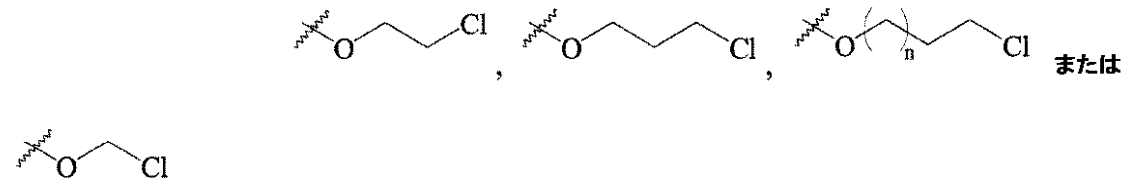


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7であり得る。Qは、

【0539】

【化466】



20

であり得；Tは、

【0540】

【化467】

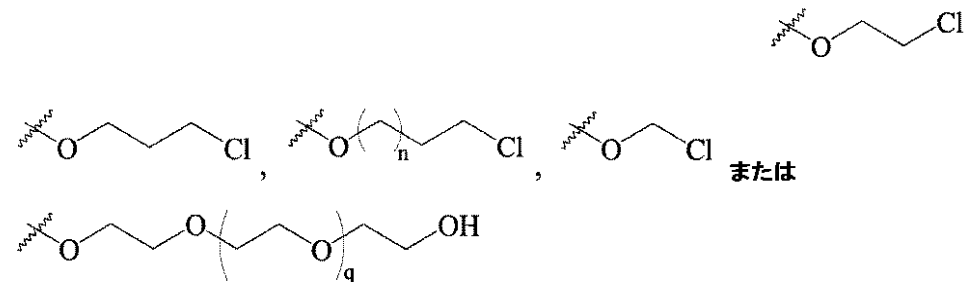


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0541】

【化468】

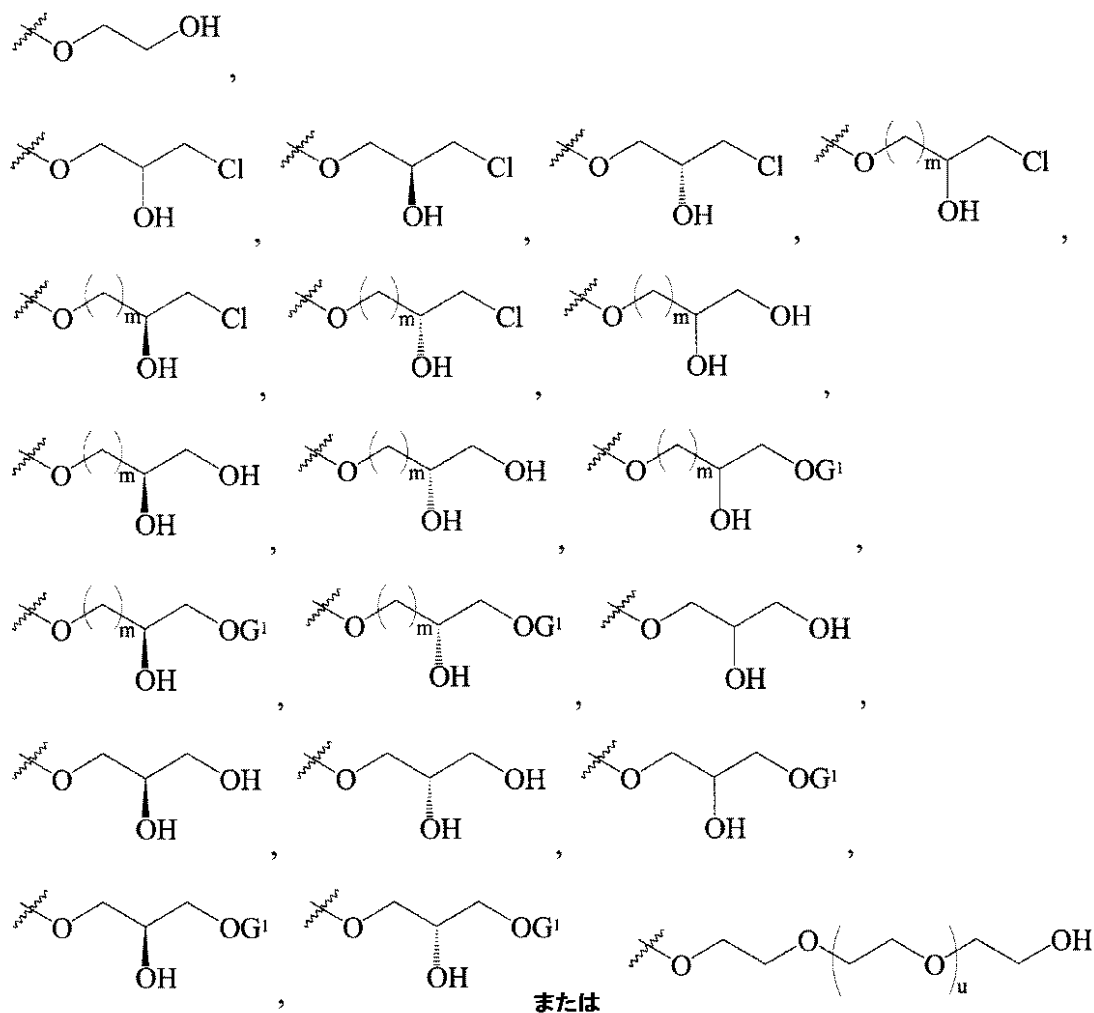


40

であり得；Tは、

【0542】

【化469】



10

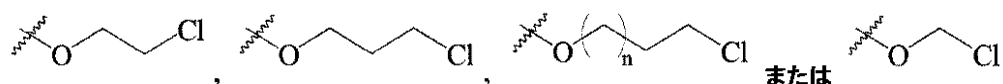
20

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。 Q は、

30

【0543】

【化470】

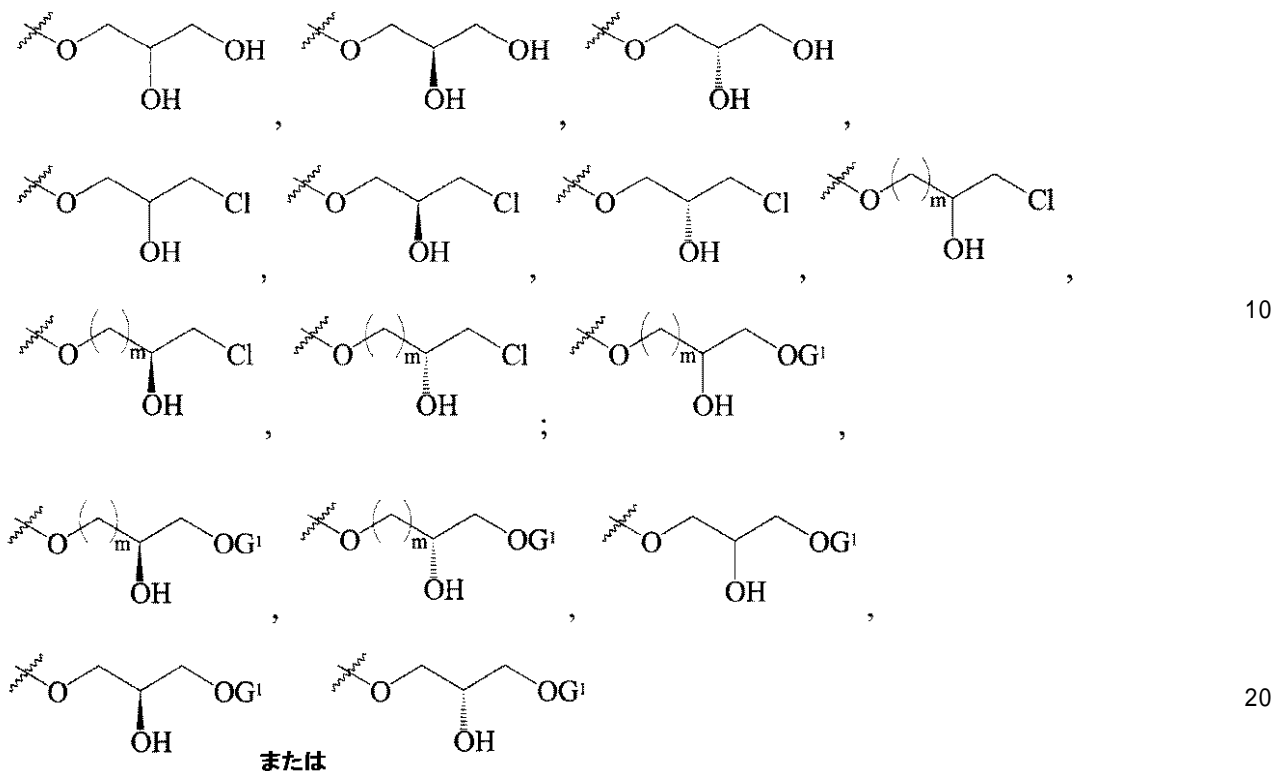


40

であり得； T は、

【0544】

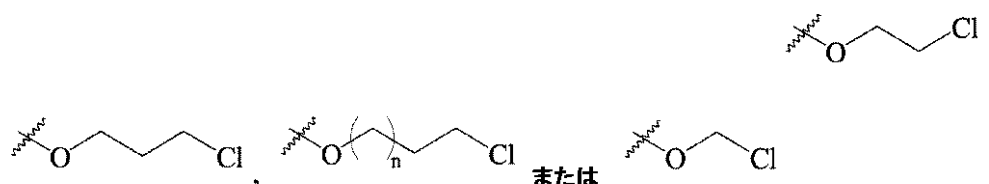
【化471】



であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。 Q は、

【0545】

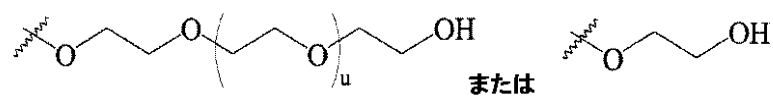
【化472】



であり得； T は、

【0546】

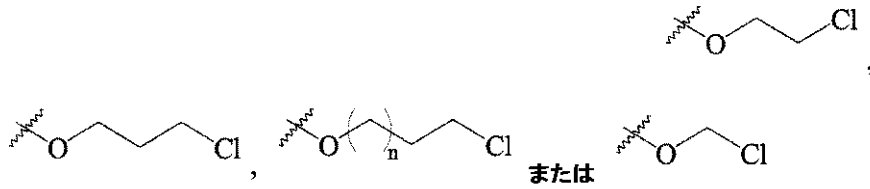
【化473】



であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。 Q は、

【0547】

【化474】

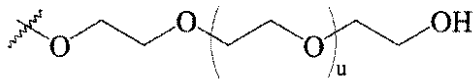


であり得；Tは、

【0548】

【化475】

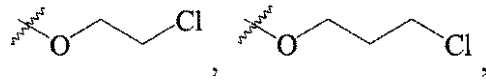
10



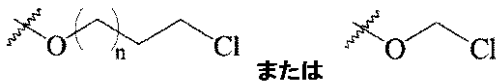
であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0549】

【化476】



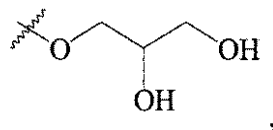
20



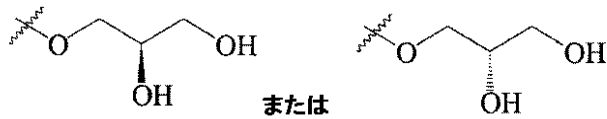
であり得；Tは、

【0550】

【化477】



30

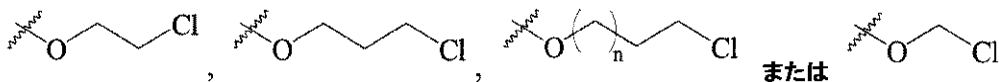


であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0551】

【化478】

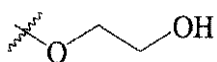
40



であり得；Tは、

【0552】

【化479】

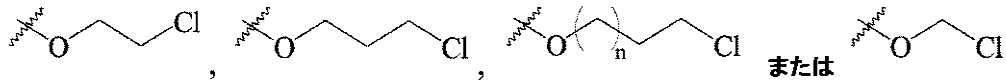


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0553】

50

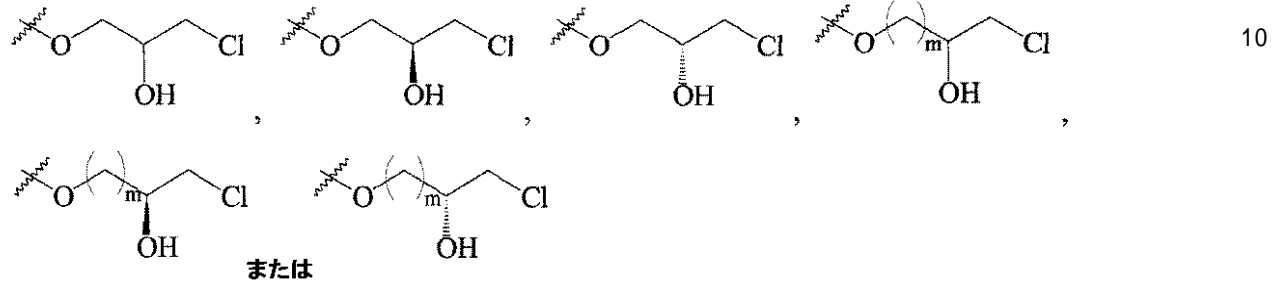
【化480】



であり得；Tは、

【0554】

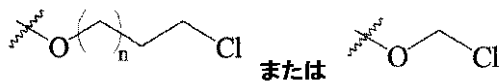
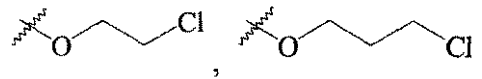
【化481】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0555】

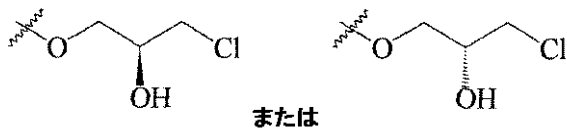
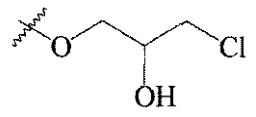
【化482】



であり得；Tは、

【0556】

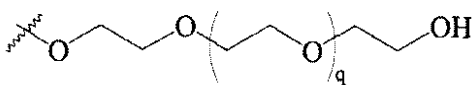
【化483】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0557】

【化484】



であり得；Tは、

【0558】

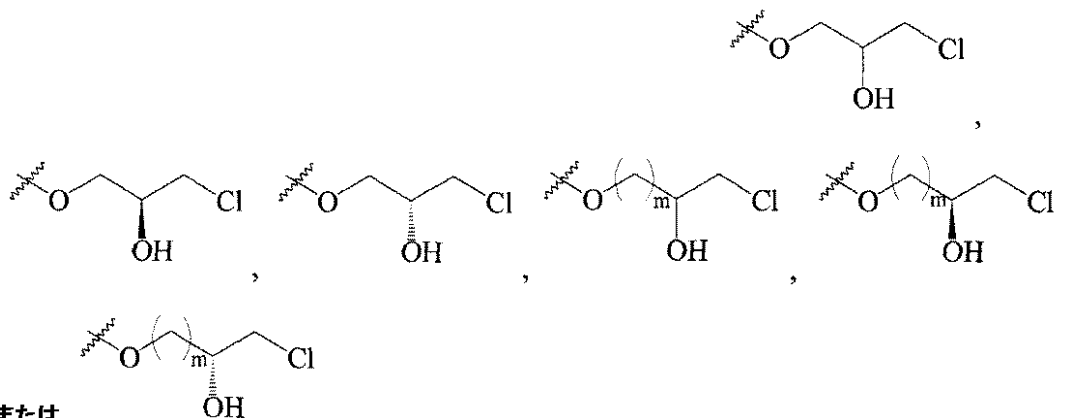
10

20

30

40

【化485】



であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0559】

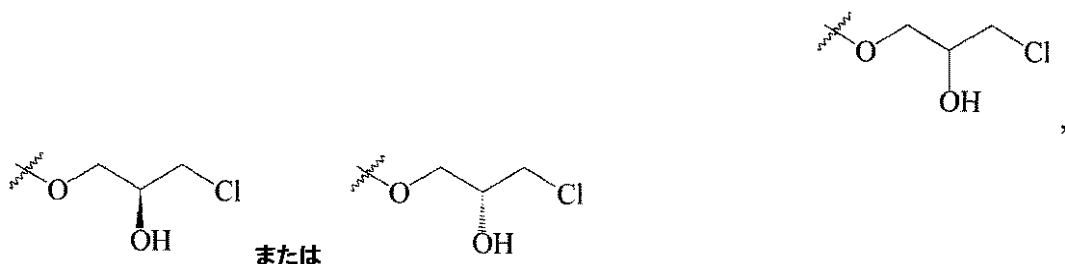
【化486】



であり得；Tは、

【0560】

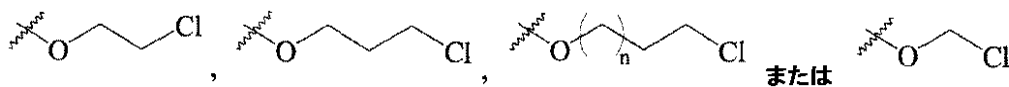
【化487】



であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0561】

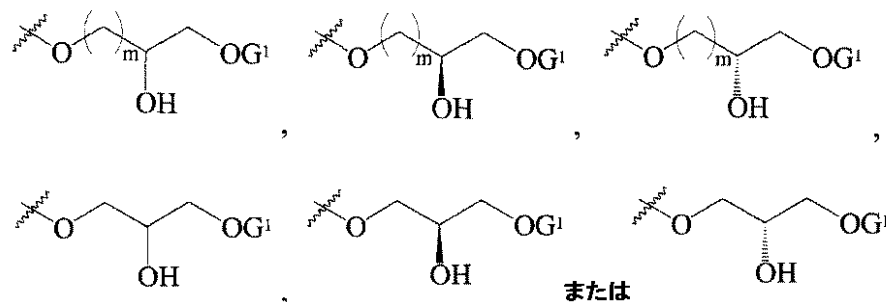
【化488】



であり得；Tは、

【0562】

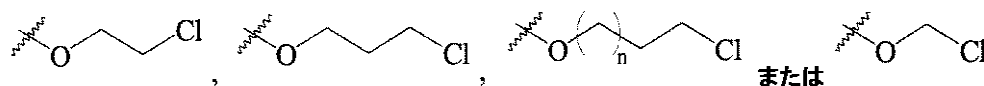
【化489】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0563】

【化490】

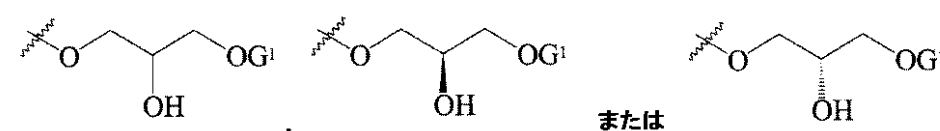


10

であり得；Tは、

【0564】

【化491】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。

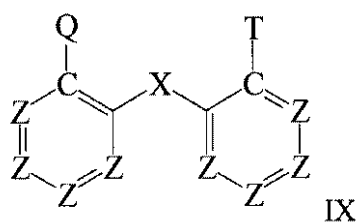
20

【0565】

別の実施形態によると、式IXの構造を有する化合物

【0566】

【化492】



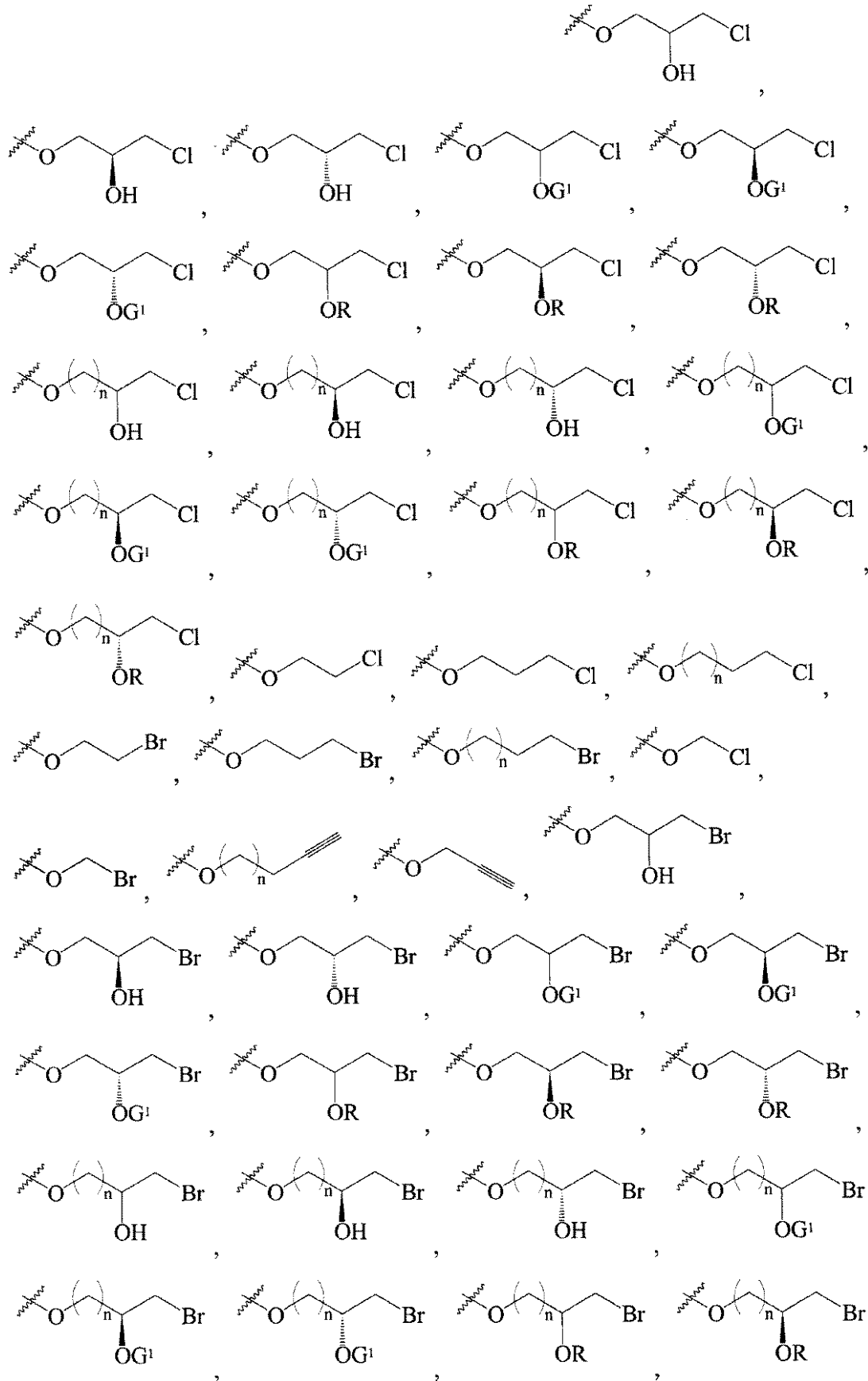
30

の使用が提供され、ここで：Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり得；R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得るか、またはR¹およびR²は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状C₃-C₁₀アルキルを形成し得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、R³、OH、OR³、F、Cl、Br、I、NH₂、NHR³、NR³₂、CN、SH、SR³、SOR³、SO₃H、SO₃R³、SO₂R³、OSO₃R³、OR⁶、CO₂R³、CONH₂、CONHR³、CONHR⁶、CONR³₂、NHR⁶、OPO₃H₃、CONR³R⁶、NR³R⁶およびNO₂からなる群から選択され得；各R³は、独立して、非置換C₁-C₁₀アルキルであり得；各R⁶は、独立して、C₁-C₁₀アルキルであり得；残りの各Zは、独立して、C-T、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CG¹、COG¹、CNH₂、CNHG¹、CNG¹₂、COSO₃H、COPO₃H₂、CSG¹、CSOG¹またはCSO₂G¹であり得；ここで、Qは、

40

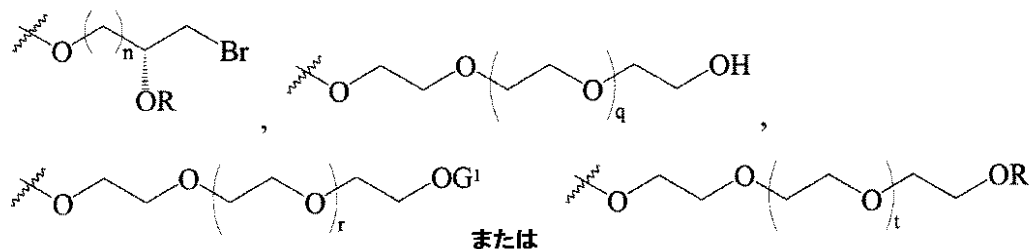
【0567】

【化 4 9 3】



【 0 5 6 8】

【化494】



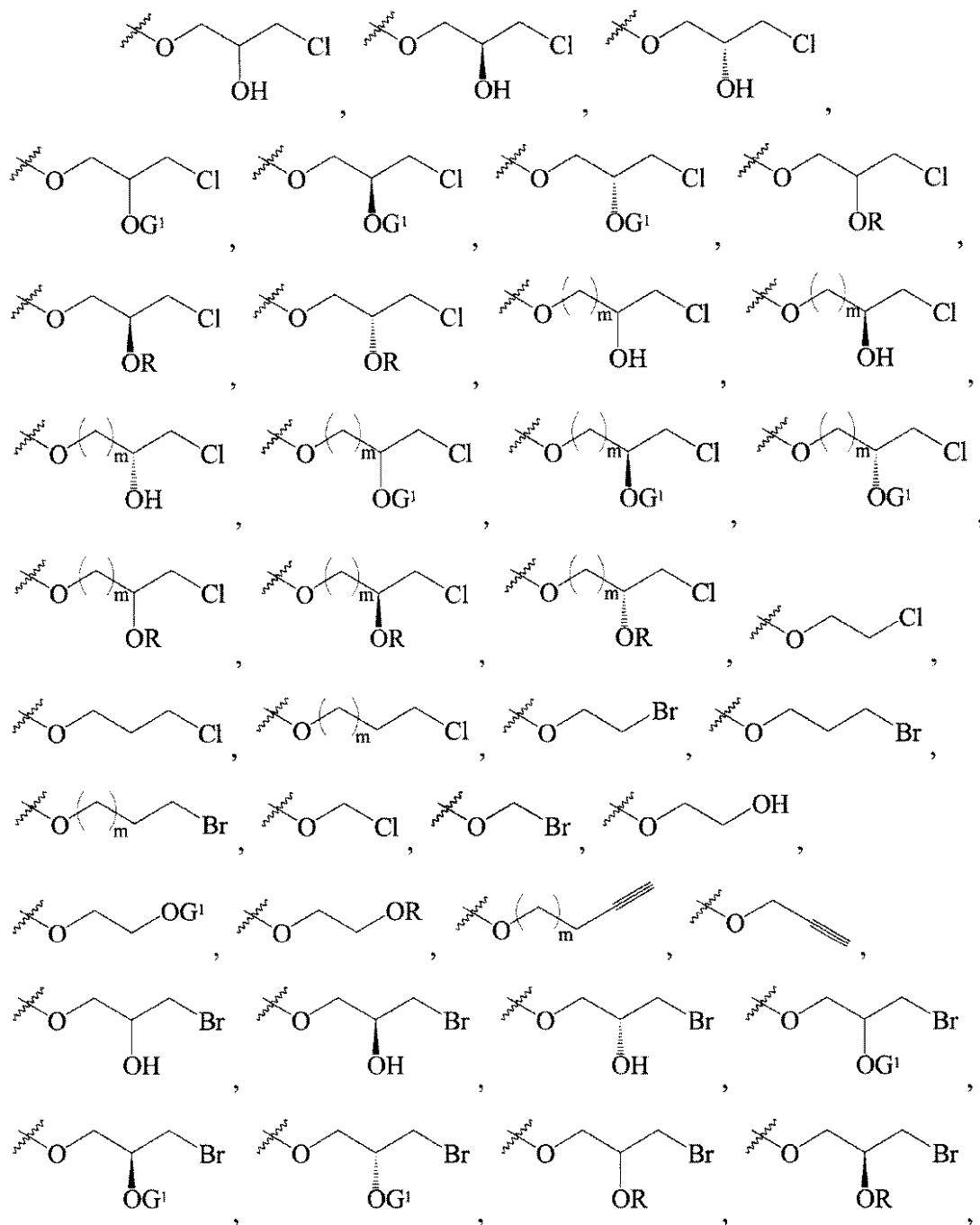
であり得；

10

Tは、

【0569】

【化495】



20

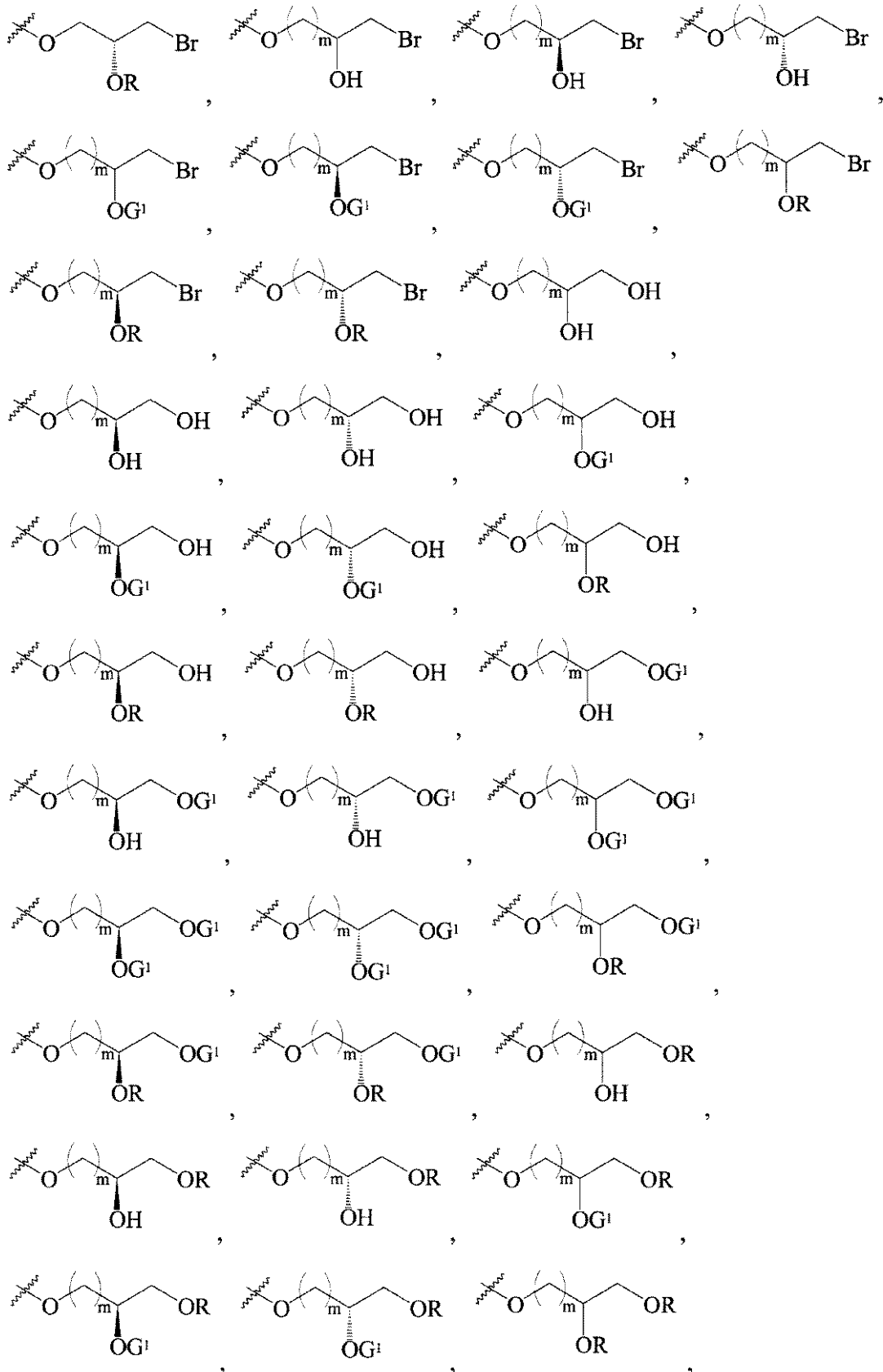
30

40

【0570】

50

【化 4 9 6】



10

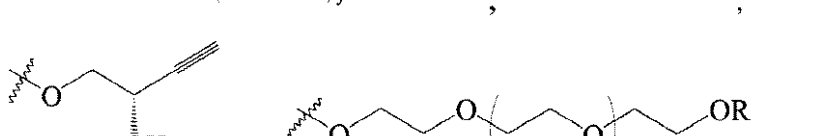
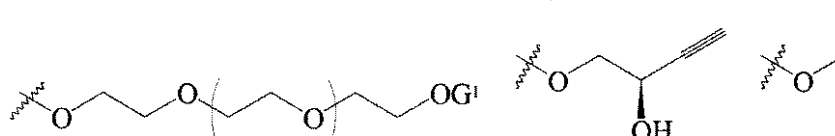
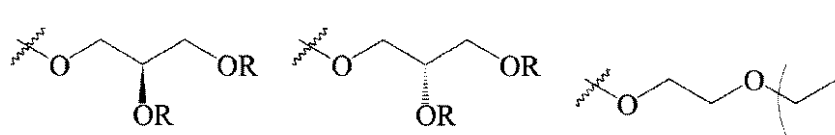
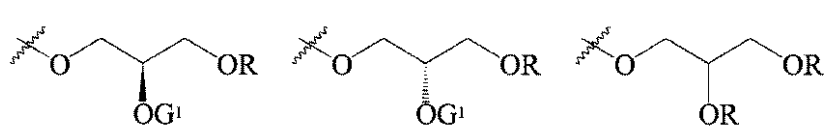
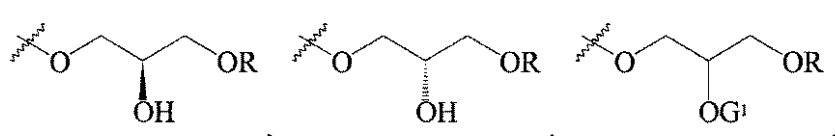
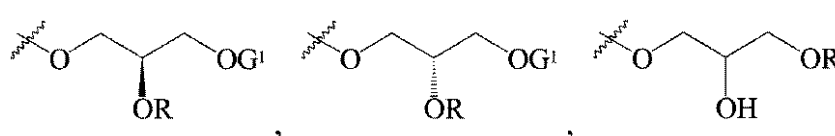
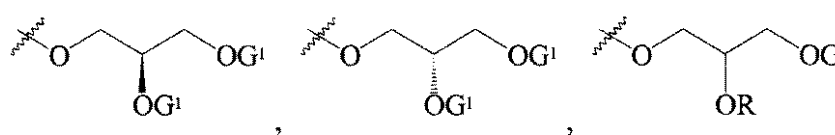
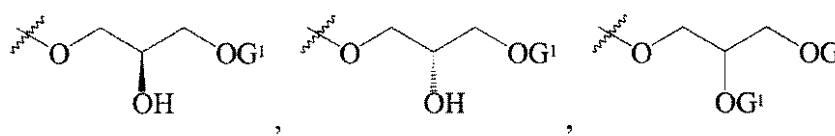
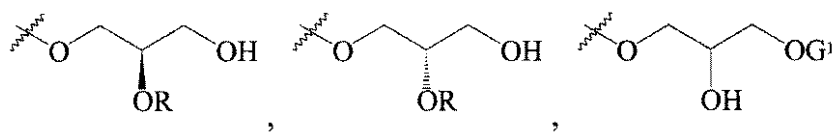
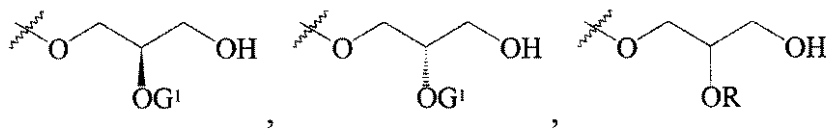
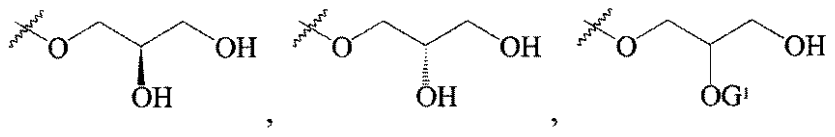
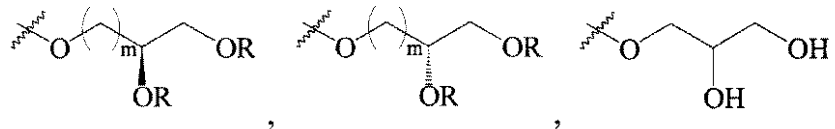
20

30

40

【 0 5 7 1 】

【化 4 9 7】



または

であり得 ; n は、 0、 1、 2、 3、 4、 5、 6、 7 または 8 であり得 ; q、 r および t の

10

20

30

40

50

各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； G^1 、 $G^{1'}$ および $G^{1''}$ の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 $OJ^{1''}$ 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4 、 R^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得； R は、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得； $J^{1''}$ および $J^{1'}$ の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；ここで、 OH 基の1つ以上は、その H を表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。 R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 $OJ^{1''}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I または NH_2 からなる群から選択され得る。各 Z は、独立して、 CG^1 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI または COH であり得る。各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 $OJ^{1''}$ 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から

10

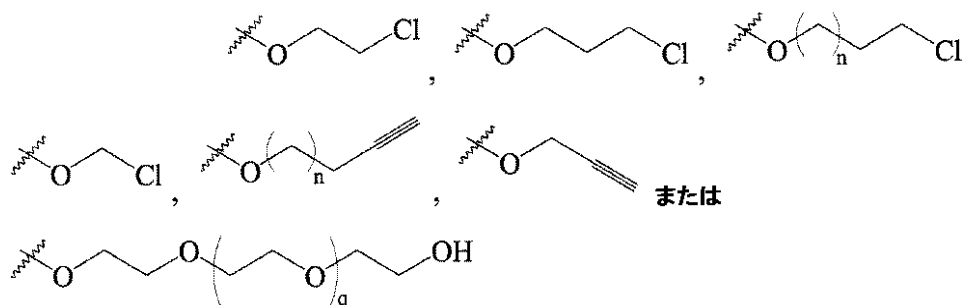
20

【0572】

Qは、

【0573】

【化498】

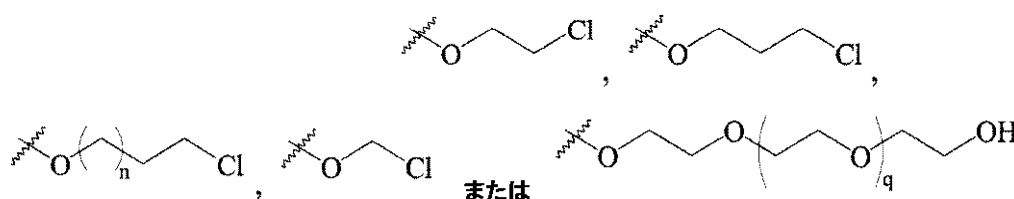


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0574】

【化499】

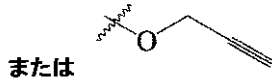
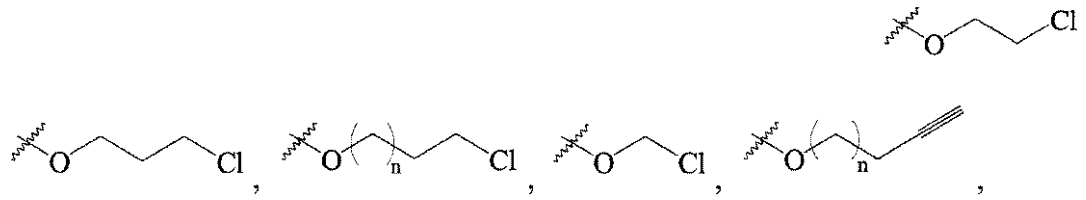


40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0575】

【化500】

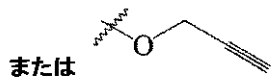
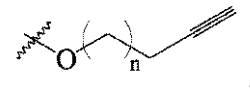


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0576】

【化501】

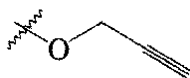


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0577】

【化502】

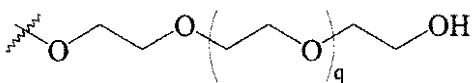


であり得る。Qは、

【0578】

【化503】

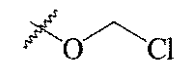
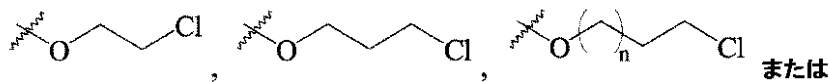
30



であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。Qは、

【0579】

【化504】

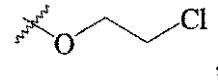


40

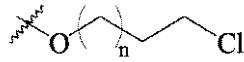
であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0580】

【化505】



または



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

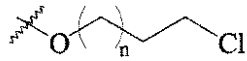
【0581】

【化506】

10



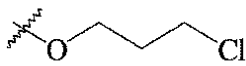
または



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0582】

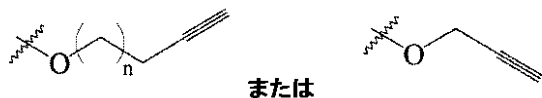
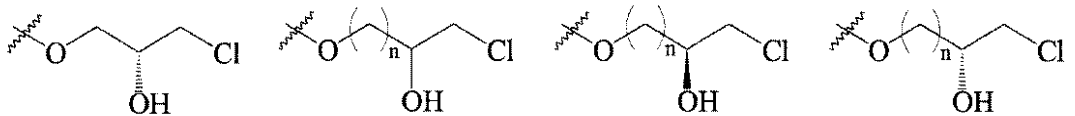
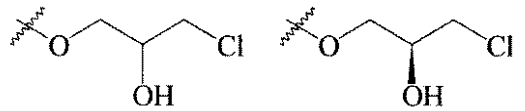
【化507】



であり得る。Qは、

【0583】

【化508】

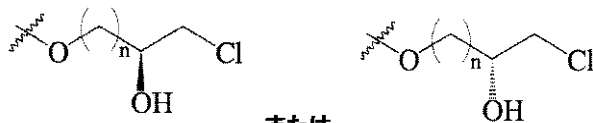
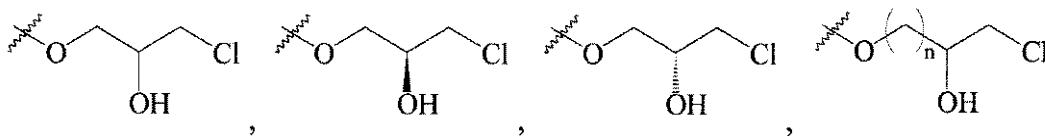


または

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0584】

【化509】



または

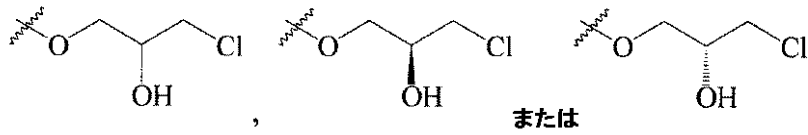
であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0585】

40

30

【化510】



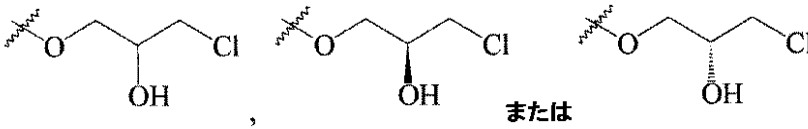
であり得る。

【0586】

Tは、

【0587】

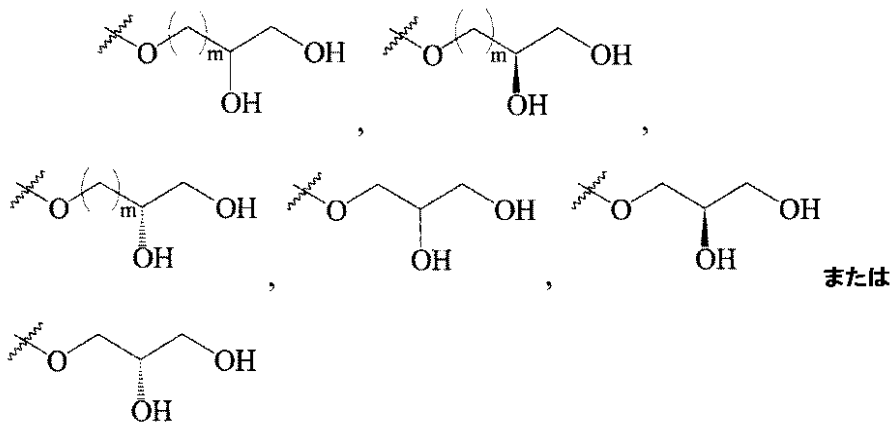
【化511】



であり得る。Tは、

【0588】

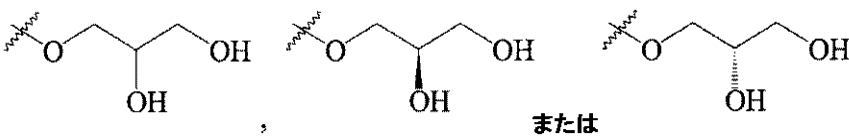
【化512】



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0589】

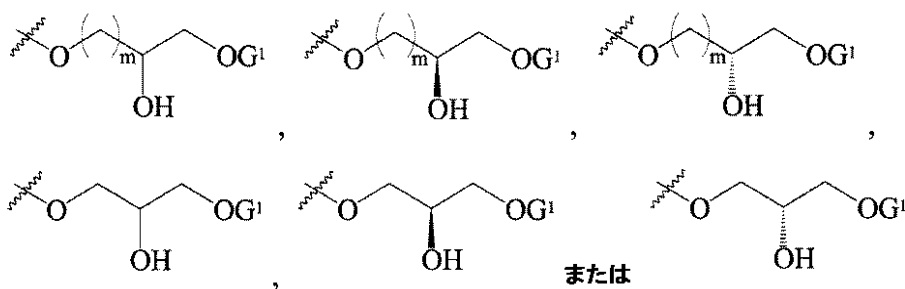
【化513】



であり得る。Tは、

【0590】

【化514】



10

20

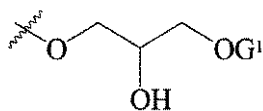
30

40

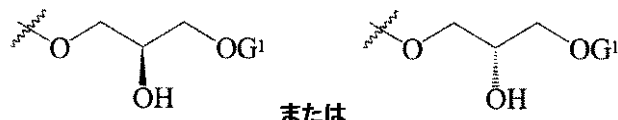
50

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

【0591】
【化515】



10



であり得、各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

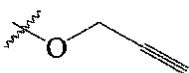
【0592】
【化516】

20



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

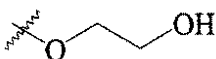
【0593】
【化517】



30

であり得る。Tは、

【0594】
【化518】



であり得る。Tは、

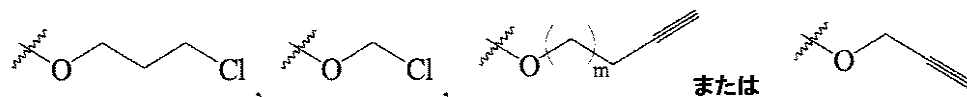
【0595】
【化519】

40



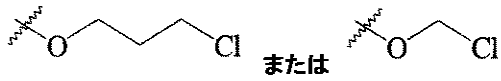
であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Tは、

【0596】
【化520】

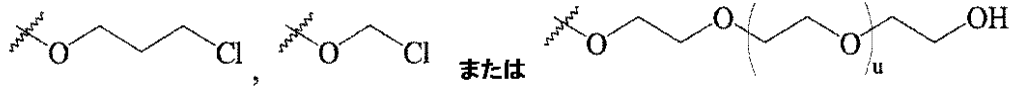


50

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、
【0597】
【化521】

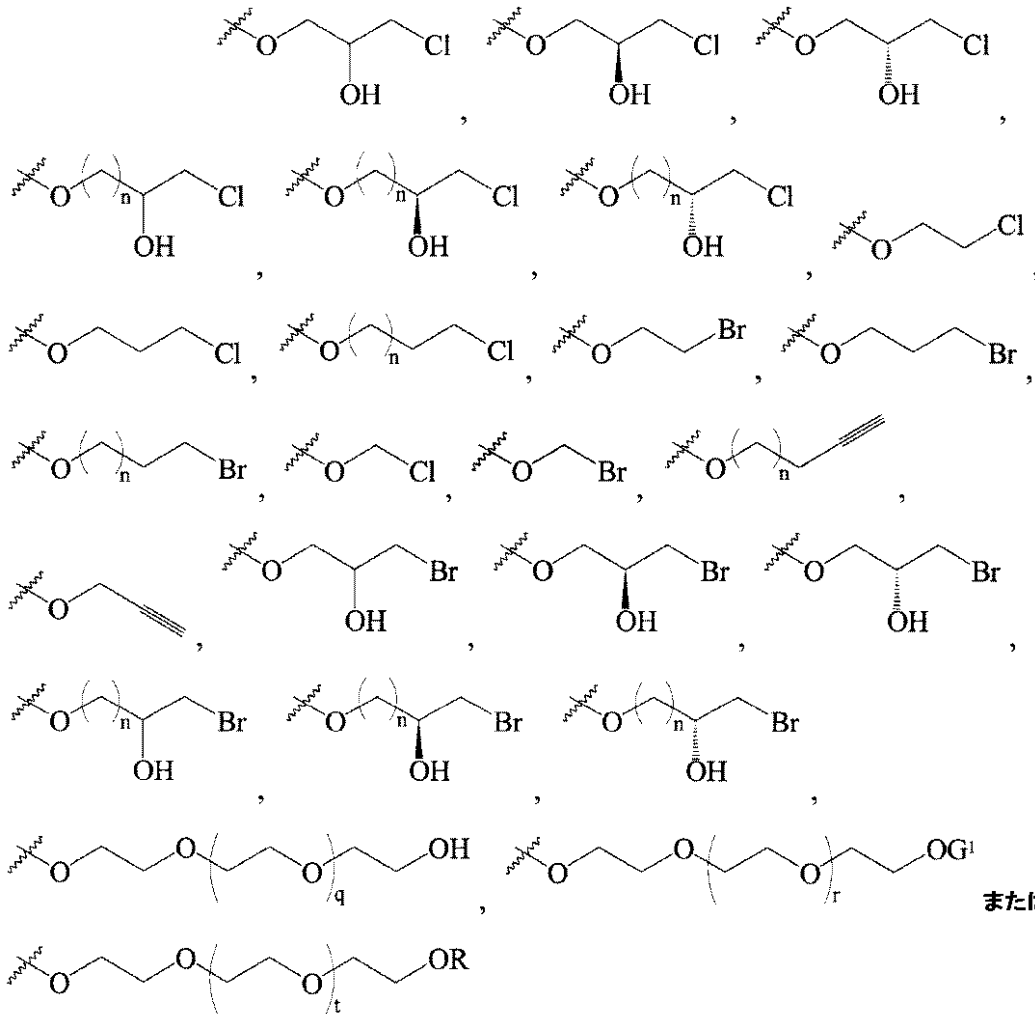


であり得る。Tは、
【0598】
【化522】



10

であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。
【0599】
Qは、
【0600】
【化523】



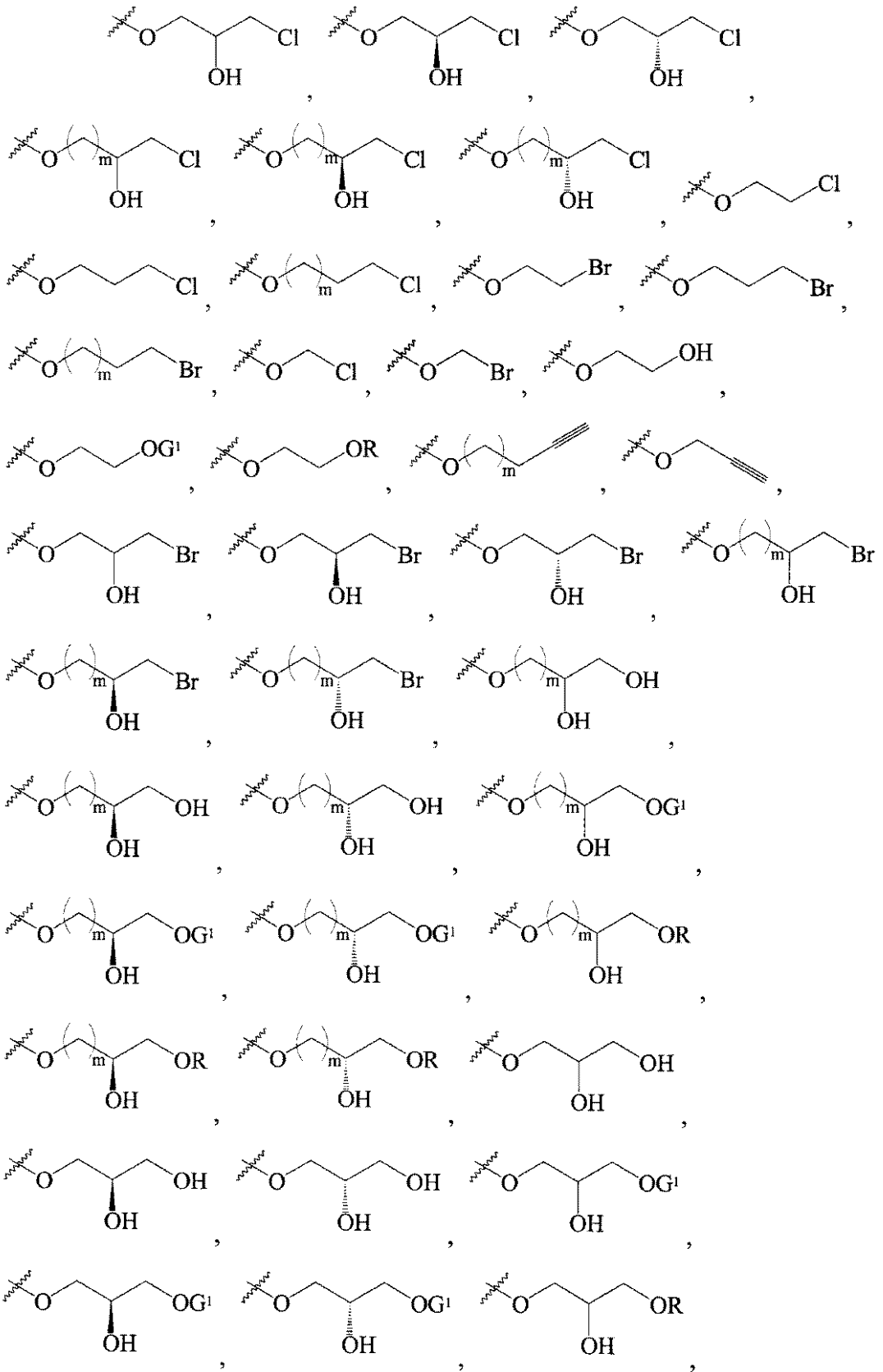
20

30

40

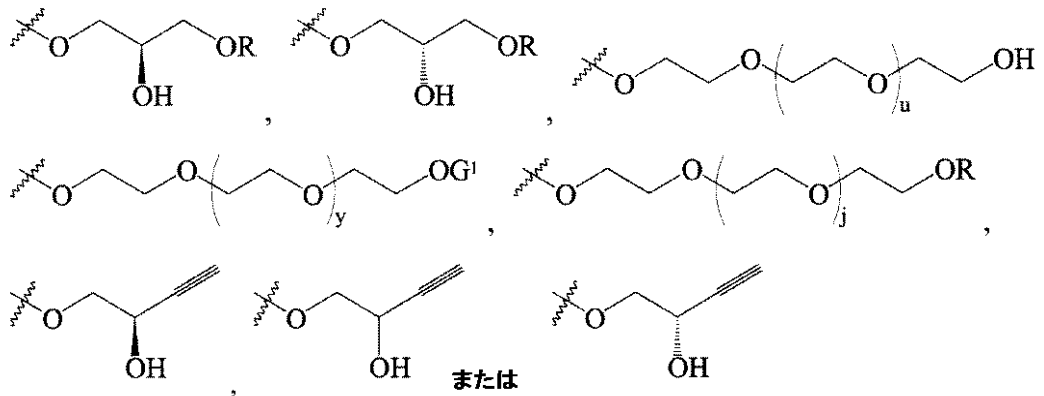
であり得；
Tは、
【0601】

【化524】



【0602】

【化525】



10

であり得；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

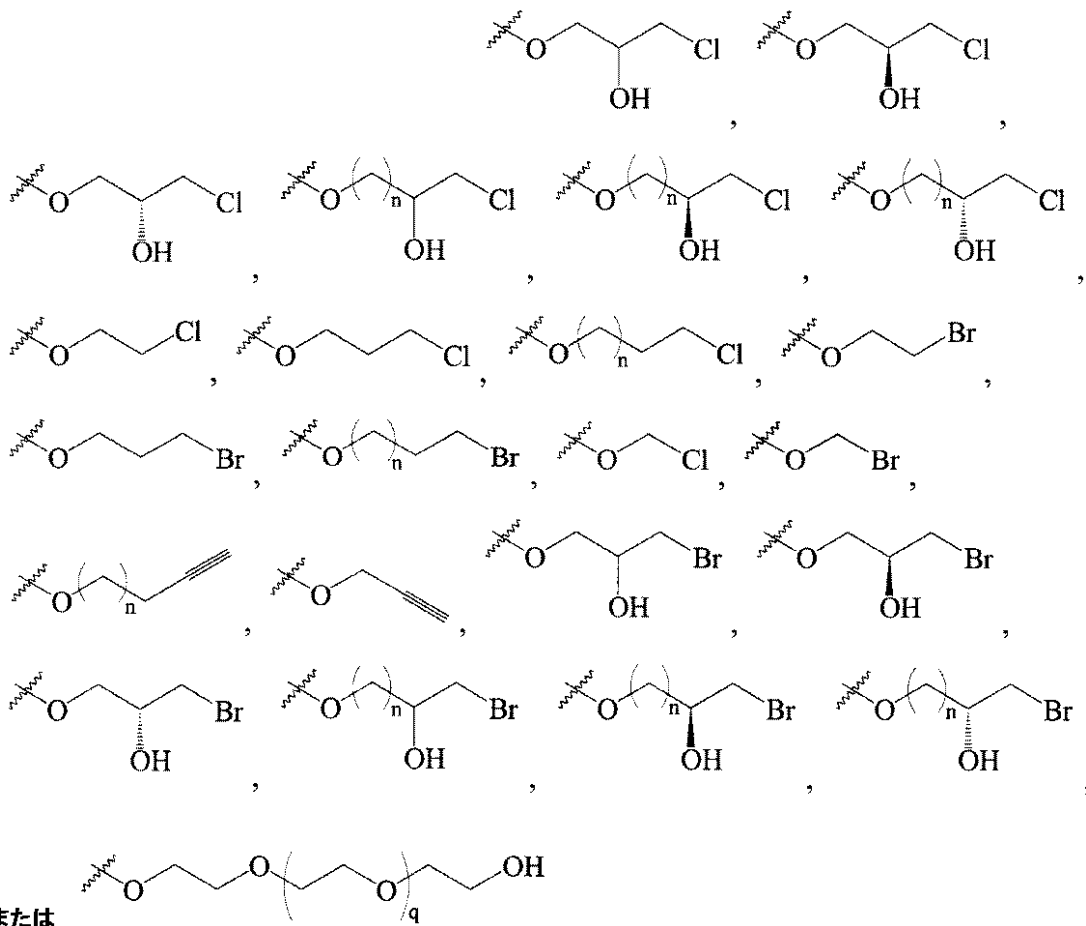
mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；

u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；

各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COO 20 H、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ およびNO₂ からなる群から選択され得る。Qは、

【0603】

【化526】



30

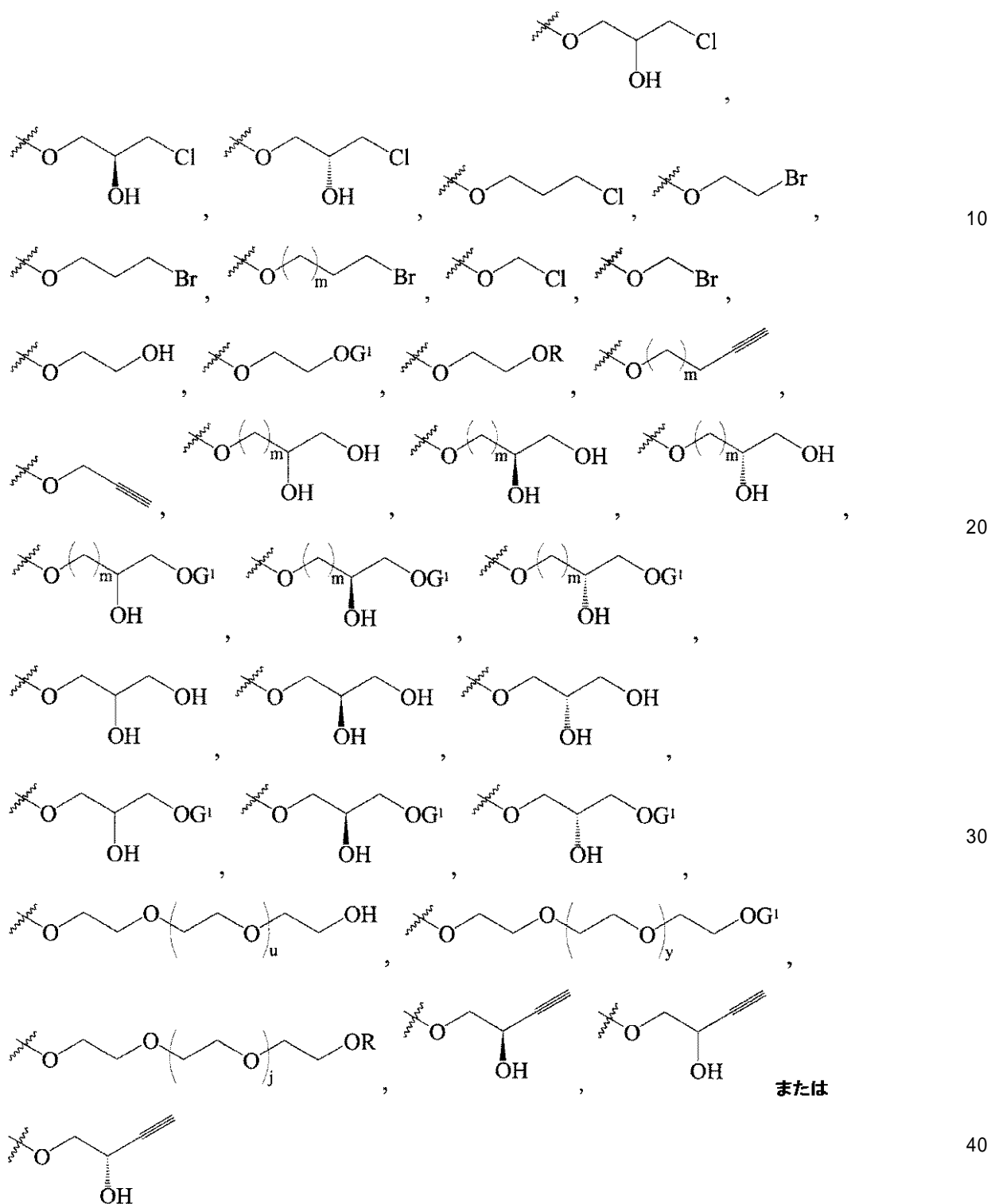
40

であり得；Tは、

50

【 0 6 0 4 】

【 化 5 2 7 】



であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u 、 j および y の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 PO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得； J'' および J''' の各々は、独立し

10

20

30

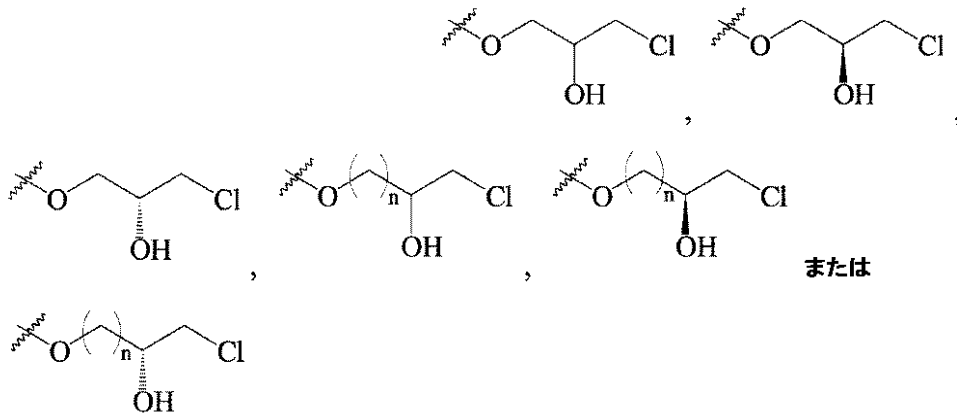
40

50

て、表 1 から選択される部分であり得る。Q は、

【 0 6 0 5 】

【 化 5 2 8 】

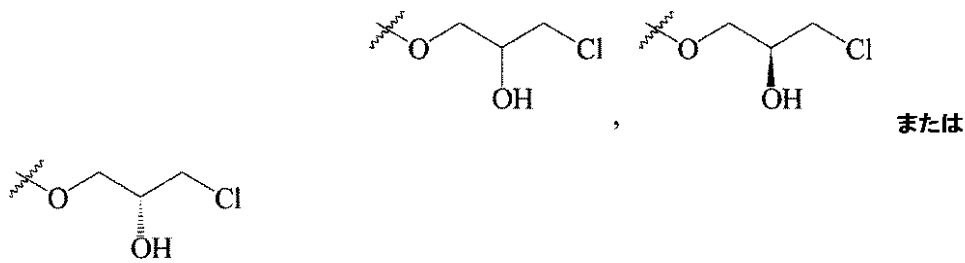


10

であり得、T は、

【 0 6 0 6 】

【 化 5 2 9 】

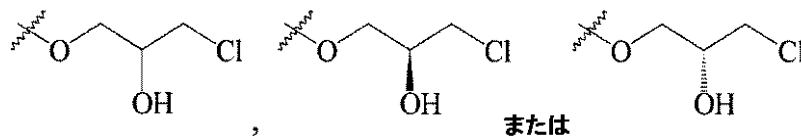


20

であり得；n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり得る。Q は、

【 0 6 0 7 】

【 化 5 3 0 】

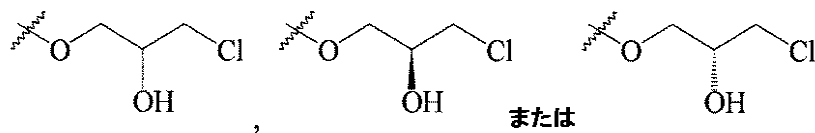


30

であり得、T は、

【 0 6 0 8 】

【 化 5 3 1 】

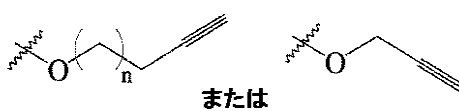


40

であり得る。Q は、

【 0 6 0 9 】

【 化 5 3 2 】

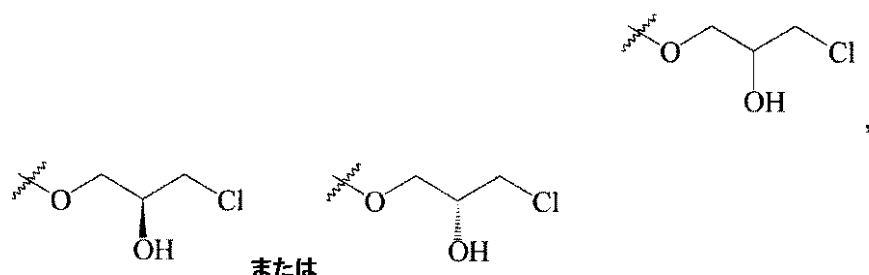


であり得；T は、

50

【0610】

【化533】

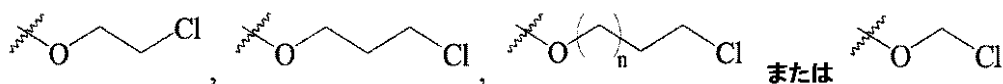


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7であり得る。Qは、

【0611】

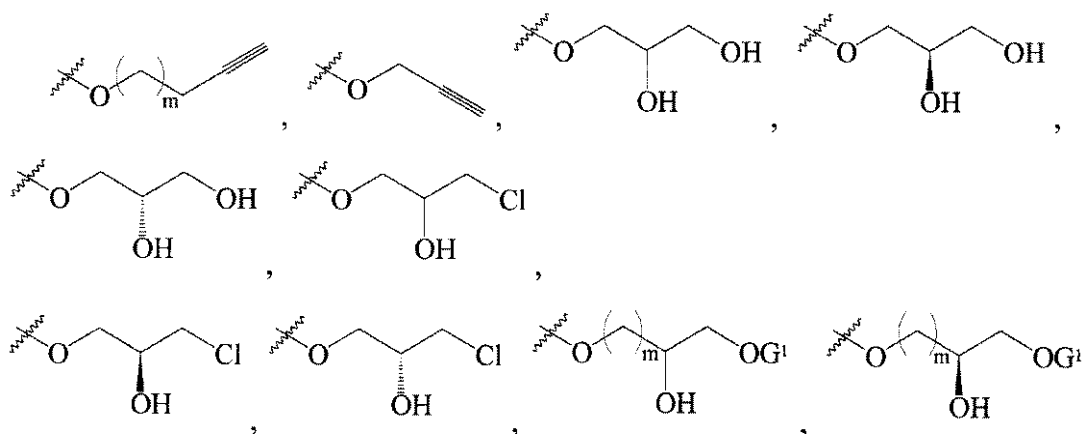
【化534】



であり得；Tは、

【0612】

【化535】

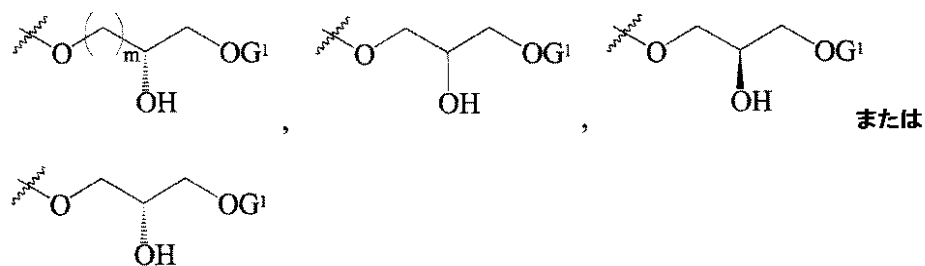


20

30

【0613】

【化536】



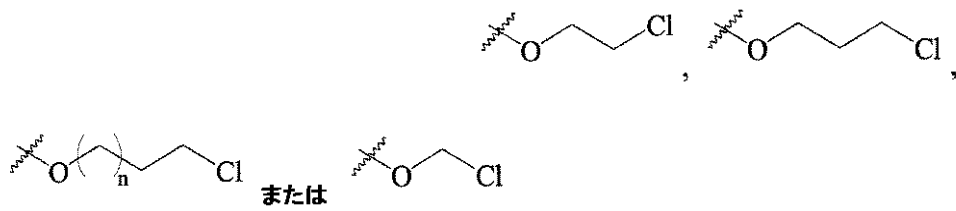
40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

50

【0614】

【化537】



であり得；Tは、

【0615】

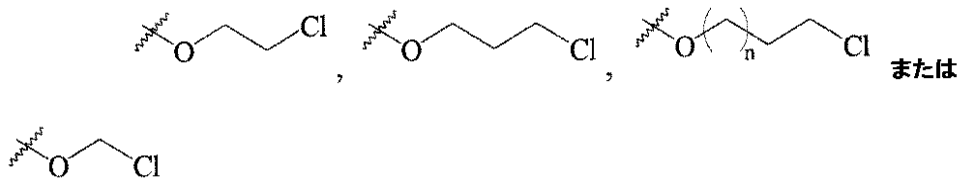
【化538】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0616】

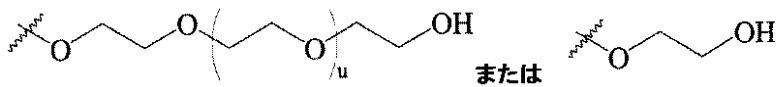
【化539】



であり得；Tは、

【0617】

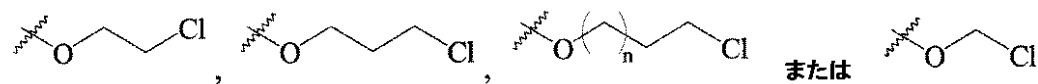
【化540】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0618】

【化541】



であり得；Tは、

【0619】

【化542】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

10

20

30

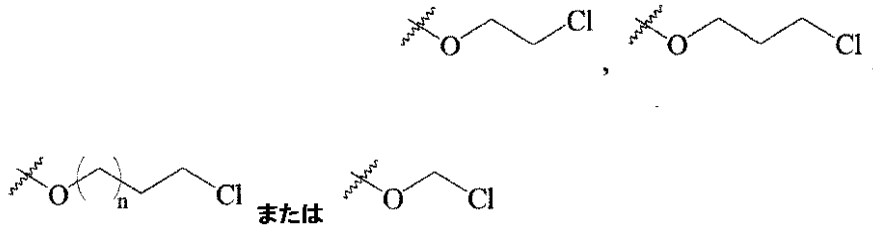
40

50

、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0620】

【化543】

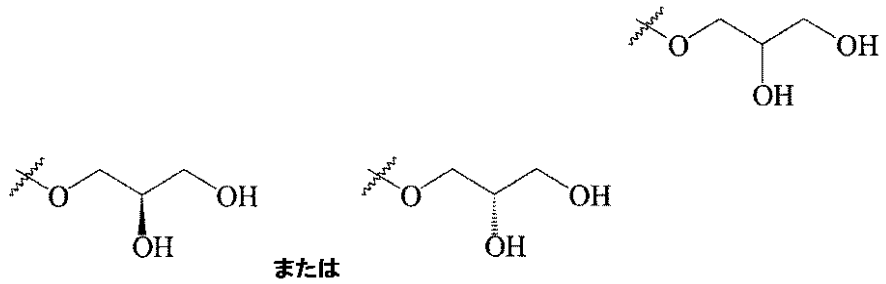


10

であり得；Tは、

【0621】

【化544】

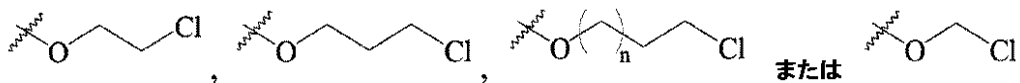


20

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0622】

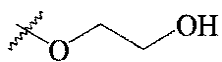
【化545】



であり得；Tは、

【0623】

【化546】

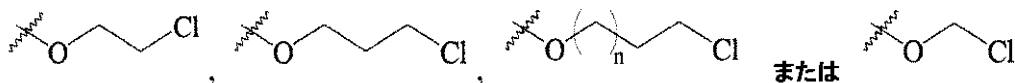


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0624】

【化547】

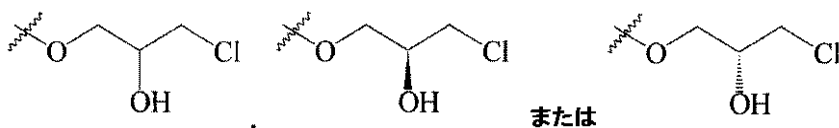


40

であり得；Tは、

【0625】

【化548】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0626】

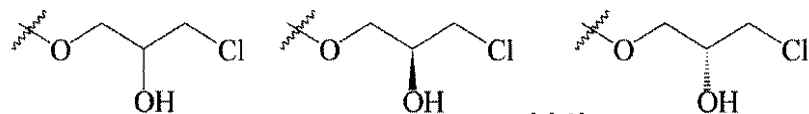
【化549】



であり得；Tは、

【0627】

【化550】

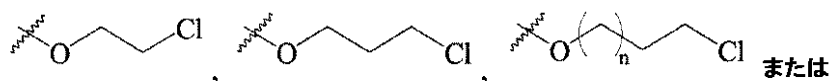


または

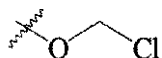
であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0628】

【化551】



または



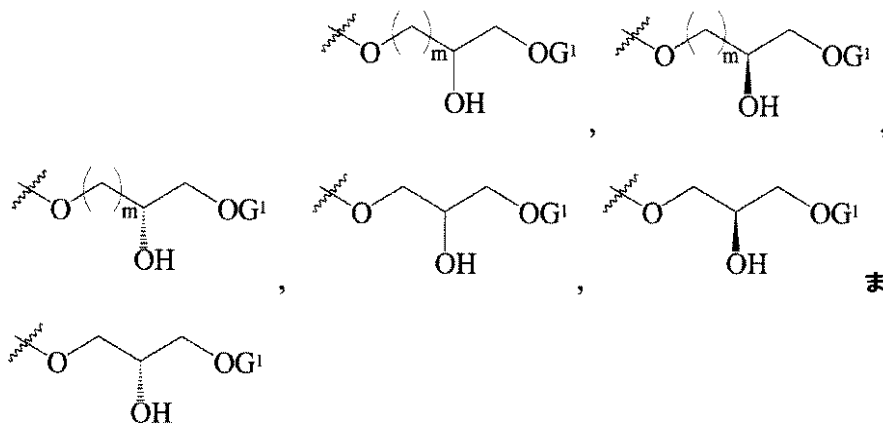
10

20

であり得；Tは、

【0629】

【化552】



または

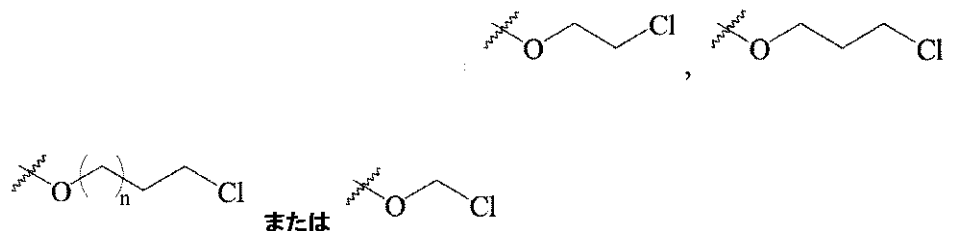
30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0630】

40

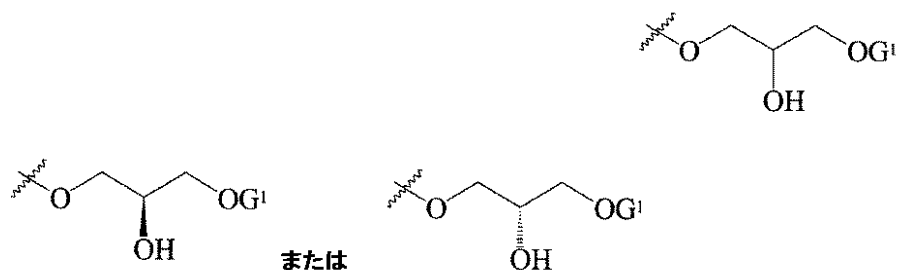
【化553】



であり得；Tは、

【0631】

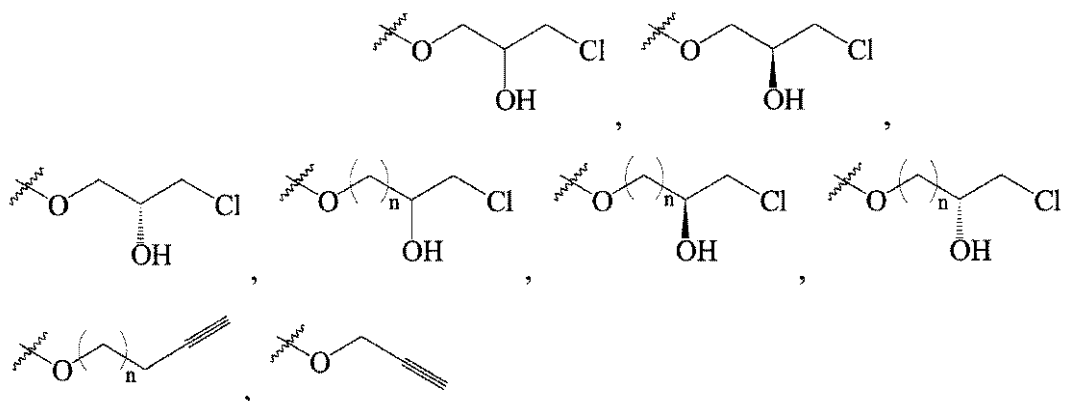
【化554】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0632】

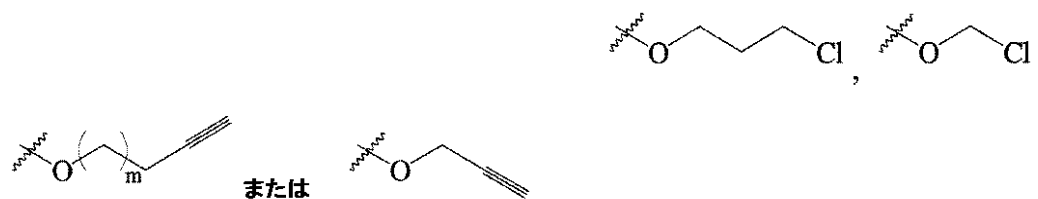
【化555】



であり得；Tは、

【0633】

【化556】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

10

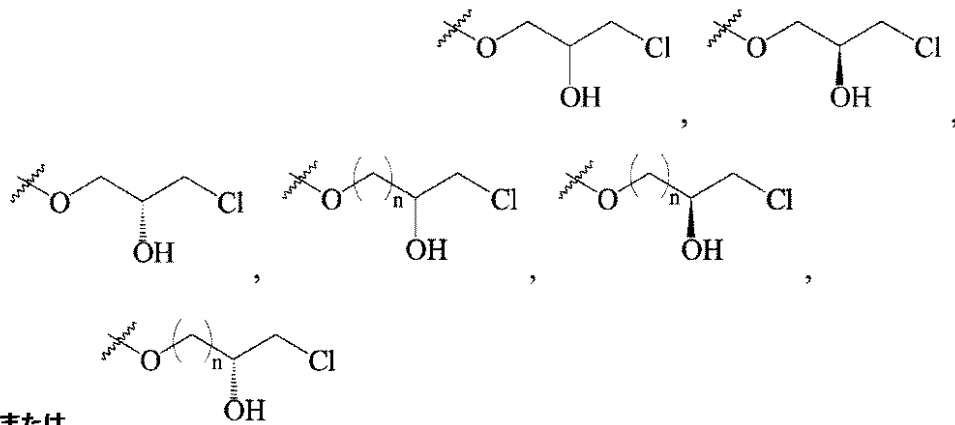
20

30

40

50

【0634】
【化557】

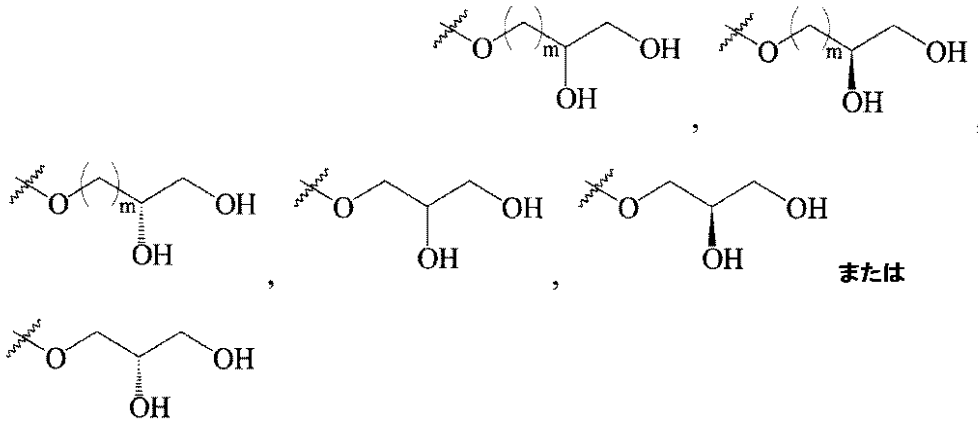


10

または

であり得；Tは、

【0635】
【化558】

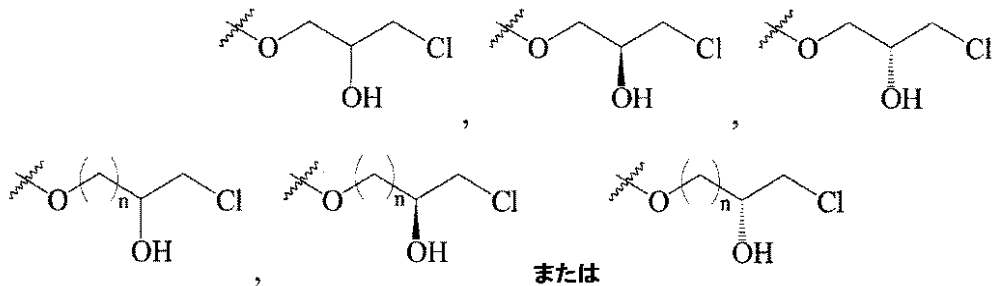


20

または

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0636】
【化559】



40

または

であり得；Tは、

【0637】

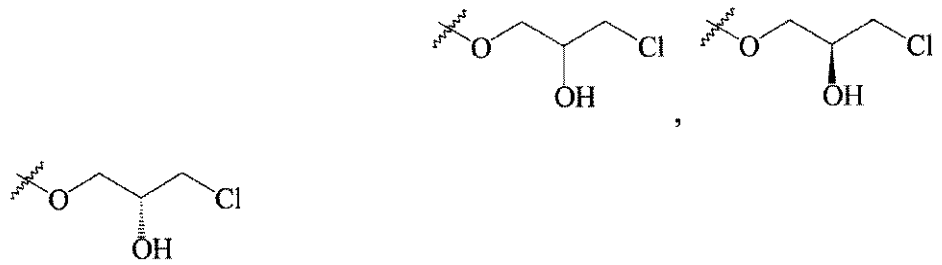
【化560】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0638】

【化561】



10

であり得；Tは、

【0639】

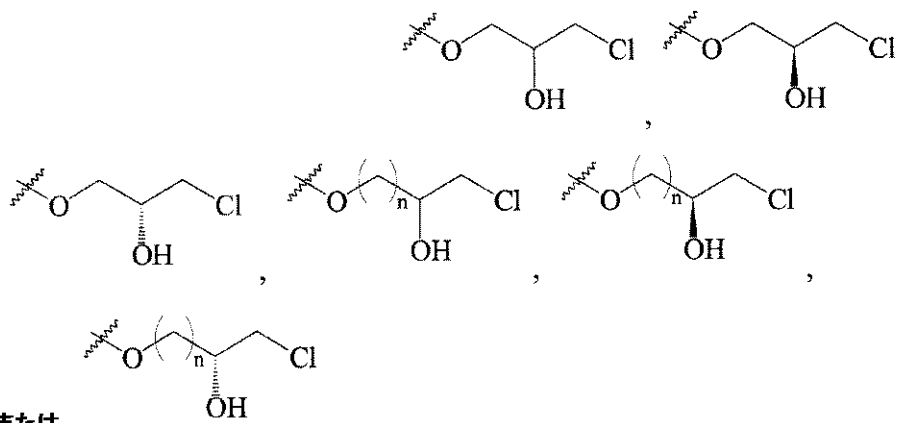
【化562】



であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0640】

【化563】



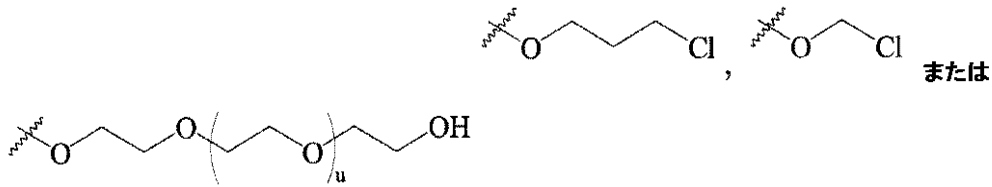
30

であり得；Tは、

【0641】

40

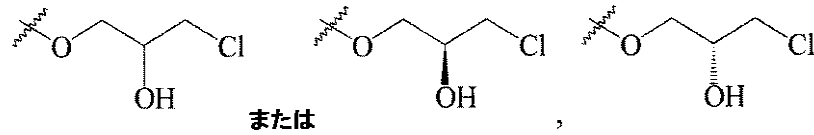
【化564】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0642】

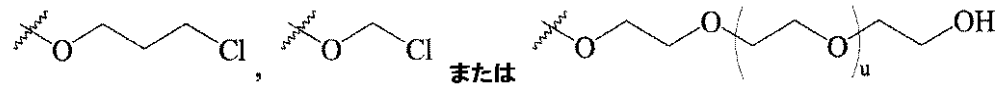
【化565】



であり得、Tは、

【0643】

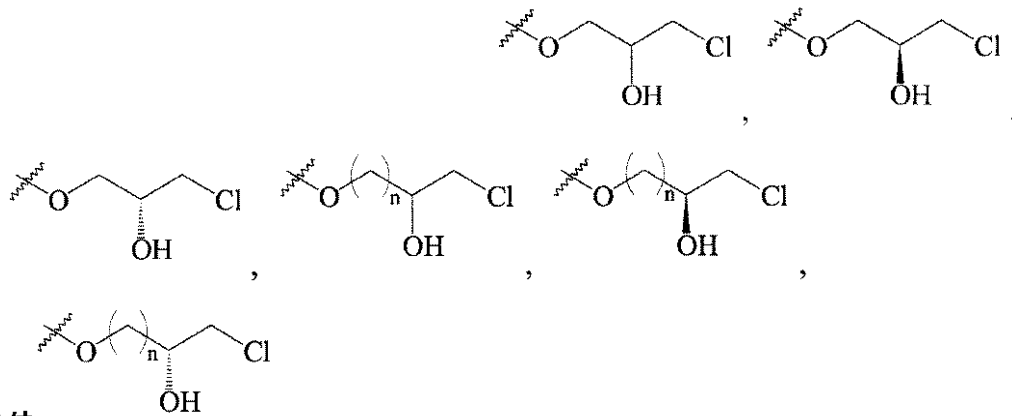
【化566】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0644】

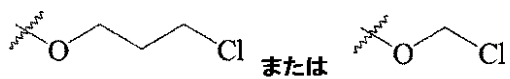
【化567】



であり得；Tは、

【0645】

【化568】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0646】

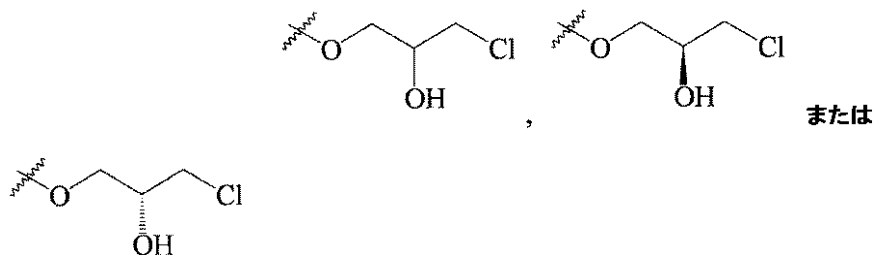
10

20

30

40

【化569】

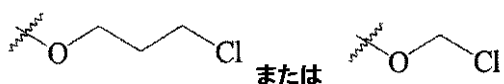


10

であり得；Tは、

【0647】

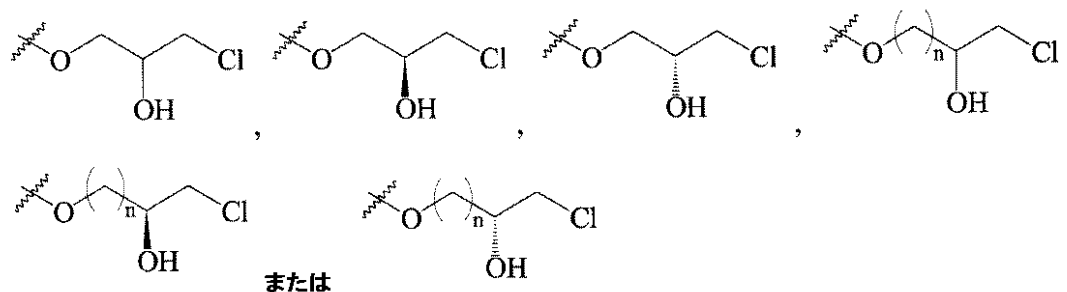
【化570】



であり得る。Qは、

【0648】

【化571】

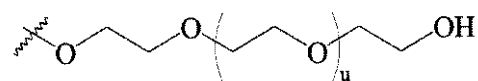


20

であり得；Tは、

【0649】

【化572】

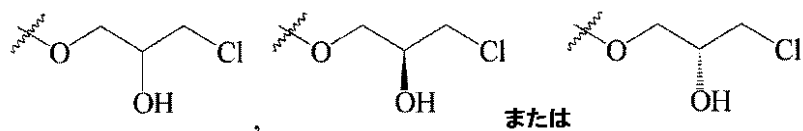


30

であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0650】

【化573】



40

であり得；Tは、

【0651】

【化574】

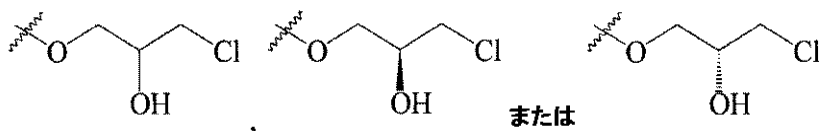


であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0652】

50

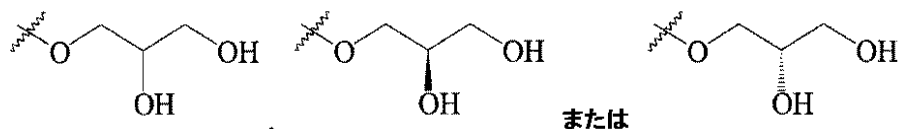
【化575】



であり得、Tは、

【0653】

【化576】

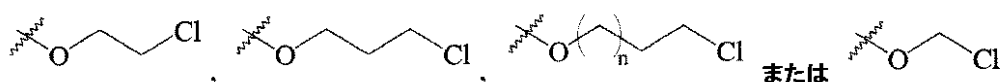


10

であり得る。Qは、

【0654】

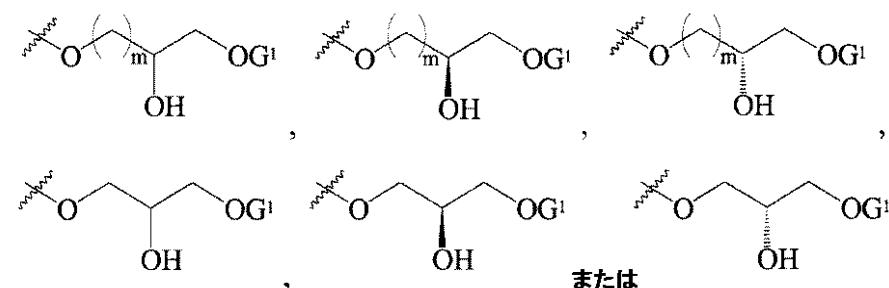
【化577】



であり得；Tは、

【0655】

【化578】

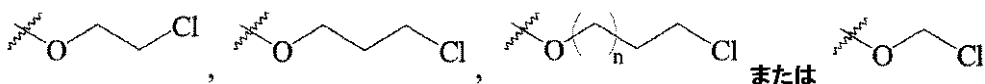


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0656】

【化579】

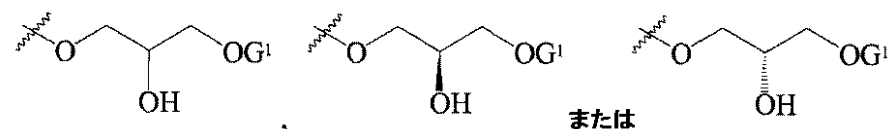


40

であり得；Tは、

【0657】

【化580】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立し

50

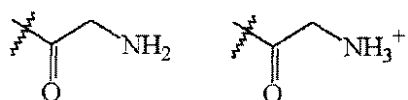
て、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。

【0658】

「J」および「J'」の各々は、存在するとき、独立して、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。「J」および「J'」の各々は、存在するとき、独立して、

【0659】

【化581】



または

であり得る。

【0660】

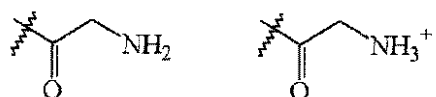
G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、存在するとき、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルである。 G^1 は、存在するとき、シクロヘキシル、 $CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $CH_2C(CH_3)_2$ または $CH(CH_3)_2$ であり得る。 G^1' は、存在するとき、 $CH_2C(CH_3)_2$ または $CH(CH_3)_2$ であり得る。

【0661】

化合物の OH 基の1つ以上は、その H を表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。その表1から選択される部分は、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。その表1から選択される部分は、

【0662】

【化582】



または

であり得る。

【0663】

残りの Z の各々は、独立して、 N ； CG^1 ； CH ； CF ； CCl ； CBr ；および CI から選択され得る。残りの各 Z は、独立して、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI または CG^1 であり得る。残りの Z の各々は、独立して、 CG^1 ； CH ； CCl ；および CBr から選択され得る。残りの各 Z は、独立して、 CH 、 CBr または CG^1 であり得る。残りの各 Z は、独立して、 CH 、 CBr または CCH_3 であり得る。 X に対してメタ位の残りの各 Z は、独立して、 CBr または CG^1 であり得る。 X に対してメタ位の残りの各 Z は、独立して、 CBr または CCH_3 であり得る。 X に対してオルト位の残りの各 Z は、独立して、 CH であり得る。 X に対してメタ位の残りの各 Z は、独立して、 CBr または CCH_3 であり得、 X に対してオルト位の残りの各 Z は、 CH であり得る。残りの各 Z は、 CH であり得る。

【0664】

X は、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルで

10

20

30

40

50

あり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。X は、 CH_2 であり得る。X は、 CHR^1 であり得； R^1 は、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。R¹ は、直鎖状または分枝状の非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。R¹ は、直鎖状または分枝状の非置換の飽和 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。R¹ は、 CH_3 であり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得るか、または R¹ および R² は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² の各々は、 CH_3 であり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² は、一緒になって、置換または非置換の飽和または不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² は、一緒になって、置換または非置換の飽和環状 C_6 アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 R^3 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され得；各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得；各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり得る。X は、 CR^1R^2 であり得；R¹ および R² は、一緒になって、非置換の飽和環状 C_6 アルキルを形成する。

【0665】

本化合物は、以下：

【0666】

10

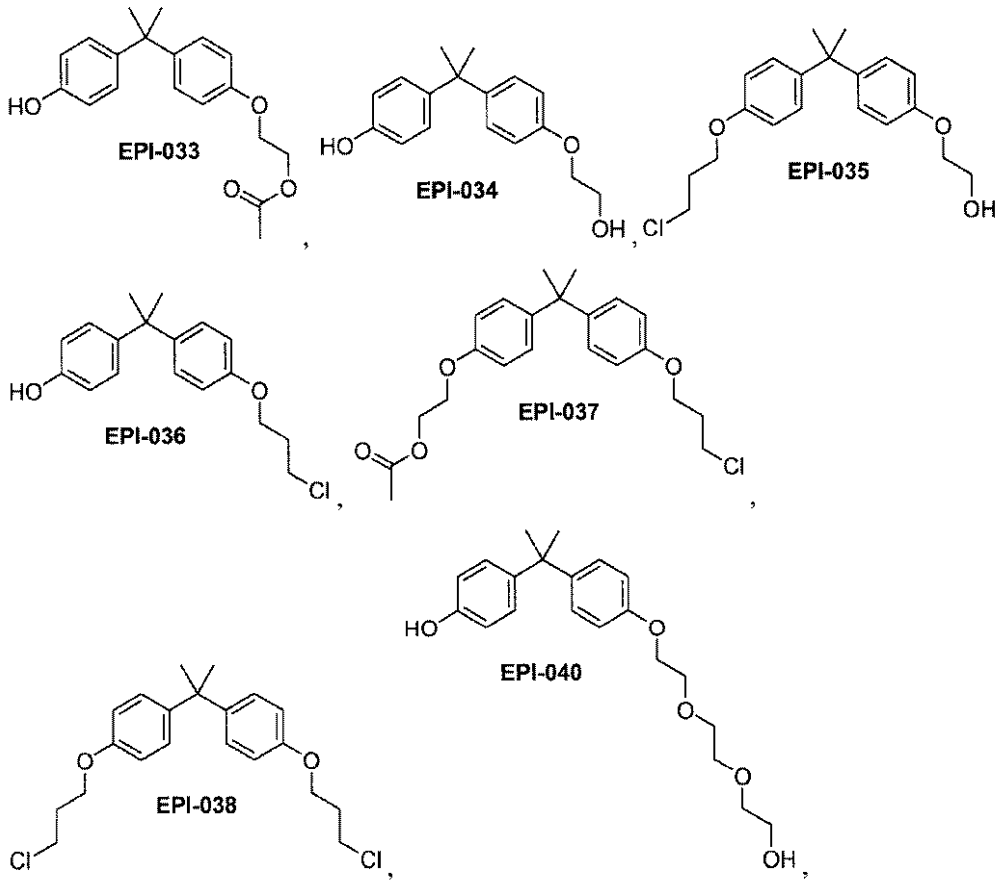
20

30

40

50

【化 5 8 3】

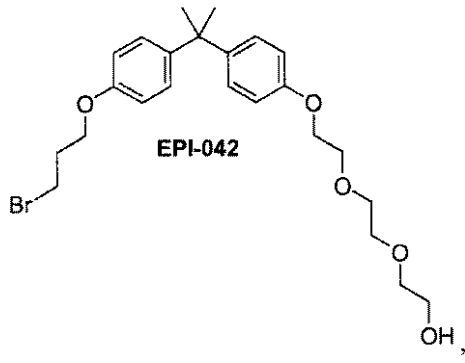
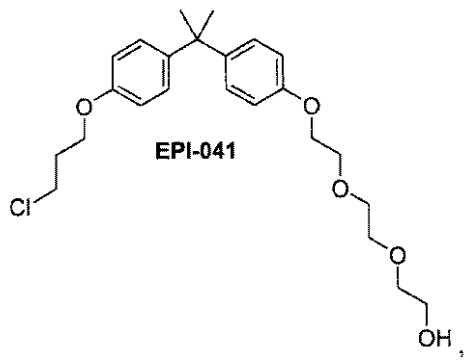


10

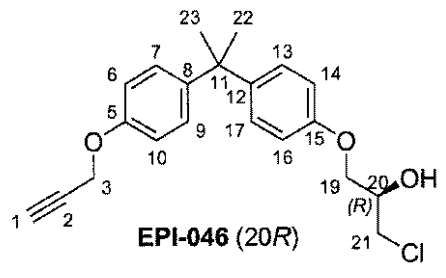
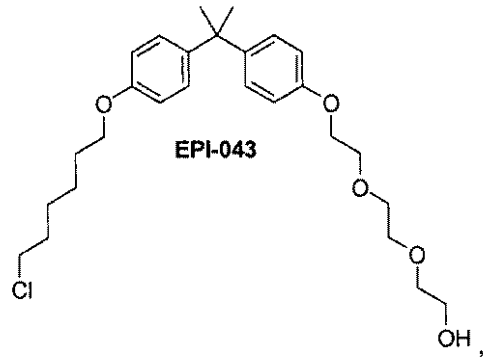
20

【 0 6 6 7 】

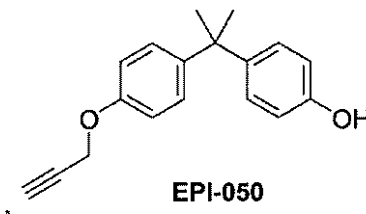
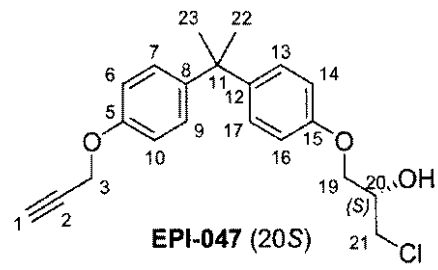
【化584】



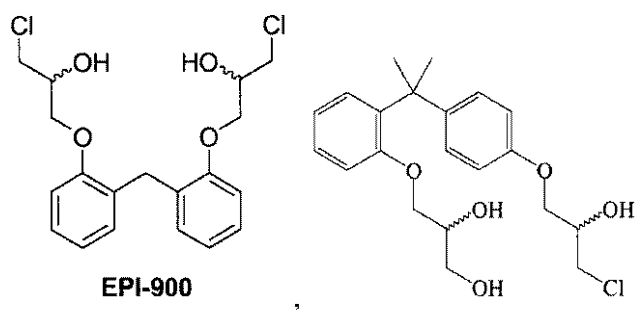
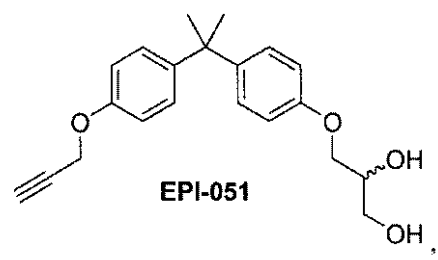
10



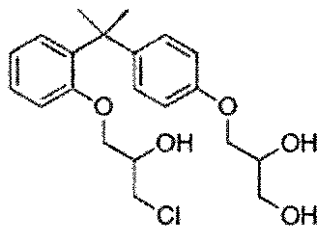
20



30



または

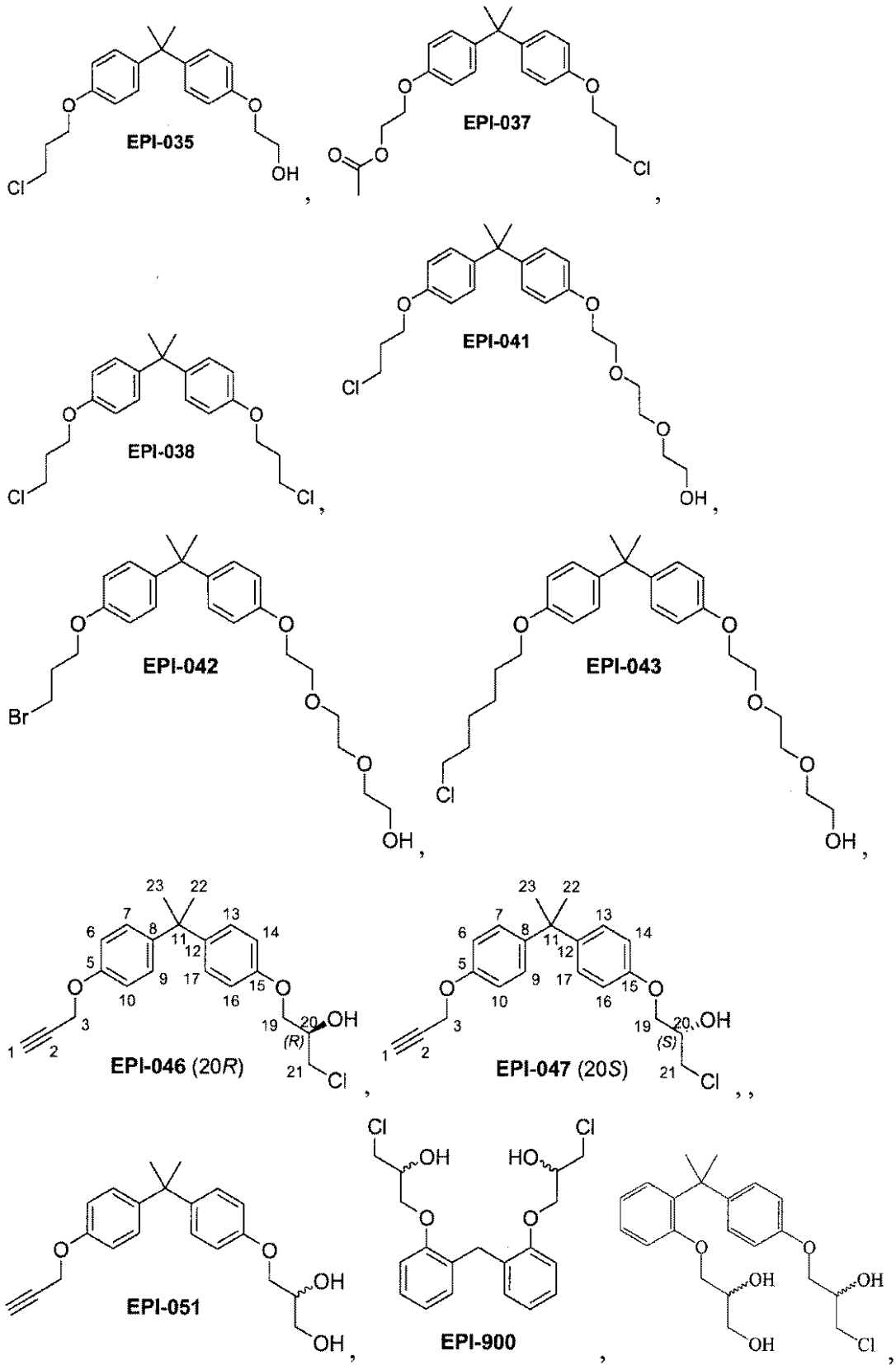


40

のうちの1つ以上から選択され得る。本化合物は、以下：

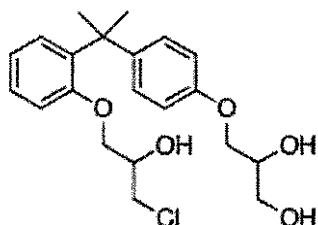
【0668】

【化 5 8 5】



【 0 6 6 9】

【化 5 8 6】



または

のうちの1つ以上から選択され得る。本化合物は、表2の化合物のうちの1つ以上から選択され得る。

10

【0670】

本明細書中に記載される化合物は、本明細書中に示されるか否かに関係なく、すべてのラセミ混合物およびすべての個別のエナンチオマーまたはそれらの組み合わせを含むと意味される。あるいは、上記化合物上のOH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように置換され得る。

【0671】

別の実施形態によると、アンドロゲンレセプター（AR）を調節するための医薬を調製するための、本明細書中のいずれかの箇所に記載されるような化合物の使用が提供される。

20

【0672】

別の実施形態によると、アンドロゲンレセプター（AR）を調節するための式I~XXIのいずれか1つの構造を有する化合物が提供される。

【0673】

別の実施形態によると、上に示された式I~XXIのいずれか1つの構造を有する化合物および薬学的に許容され得る賦形剤を含む薬学的組成物が提供される。

【0674】

別の実施形態によると、AR活性を調節するための方法が提供され、その方法は、上に示された式I~XXIのいずれか1つの構造を有する化合物を哺乳動物細胞に投与する工程を包含する。

30

【0675】

アンドロゲンレセプター（AR）活性の調節は、哺乳動物細胞におけるものであり得る。アンドロゲンレセプター（AR）活性の調節は、哺乳動物におけるものであり得る。その哺乳動物は、ヒトであり得る。

【0676】

あるいは、投与は、哺乳動物への投与であり得る。投与は、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するために有効な量での、それを必要とする哺乳動物への投与であり得る。

【0677】

40

哺乳動物細胞は、ヒト細胞であり得る。AR活性の調節は、ARのN末端ドメインの活性を阻害するためのものであり得る。AR活性の調節は、AR活性を阻害するためのものであり得る。調節は、インビボにおけるものであり得る。AR活性の調節は、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するためのものであり得る。その適応症は、前立腺癌であり得る。その前立腺癌は、アンドロゲン非依存性前立腺癌であり得る。その前立腺癌は、アンドロゲン依存性前立腺癌であり得る。

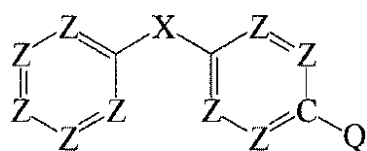
【0678】

別の実施形態によると、式IIIの構造を有する化合物

50

【0679】

【化587】



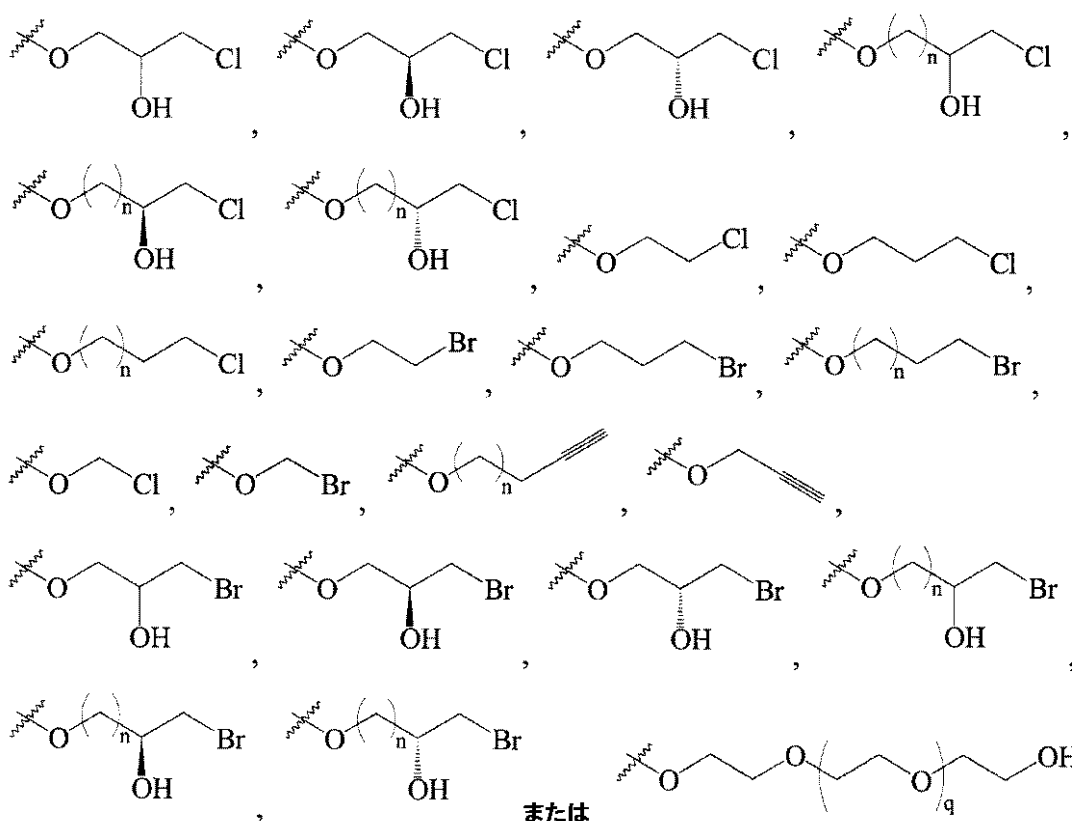
III

またはその薬学的に許容され得る塩が提供され、ここで：Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり得； R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、 OJ' 、 F 、 Cl 、 Br 、 I または NH_2 からなる群から選択され得；ここで、Qは、

10

【0680】

【化588】



20

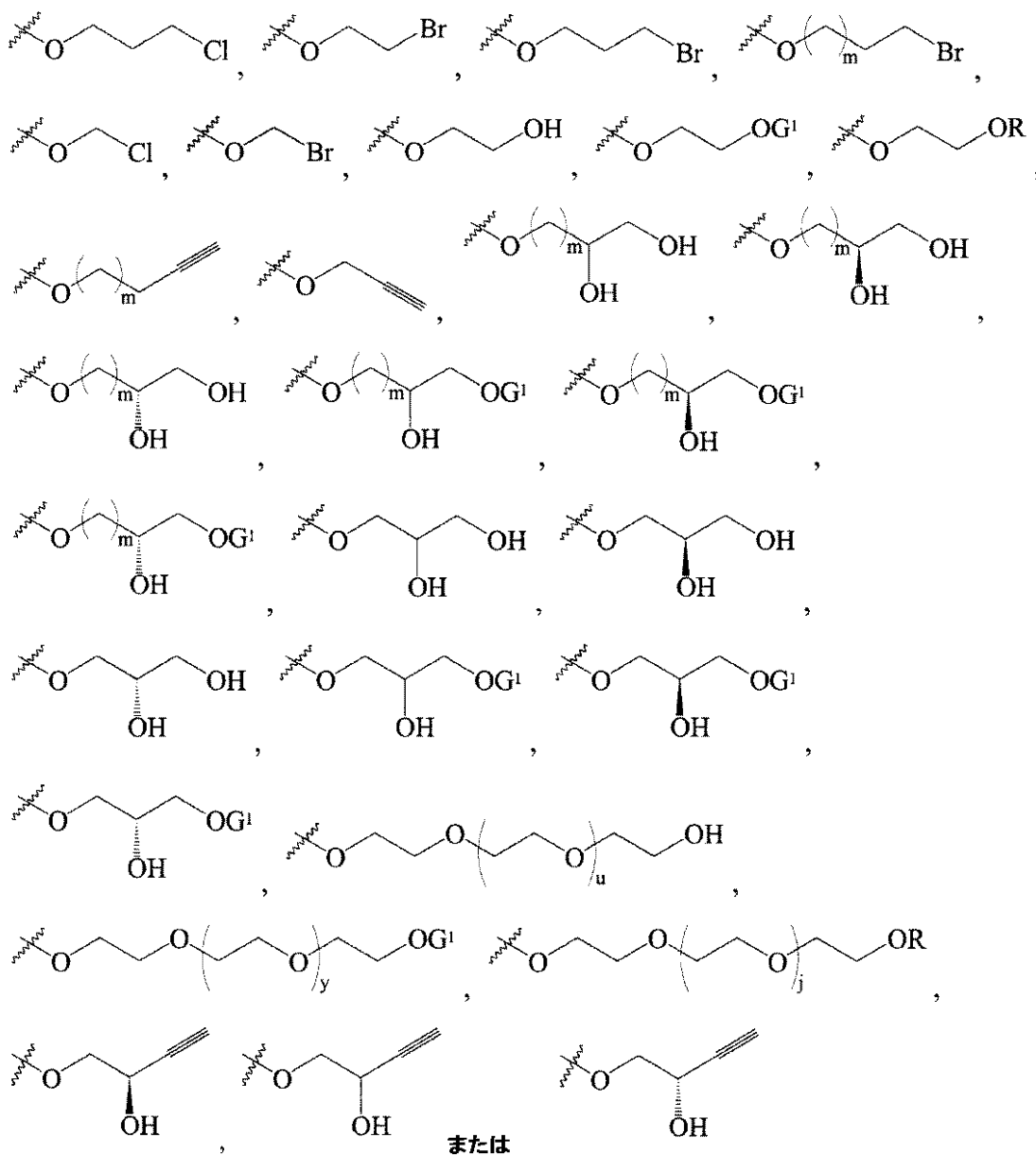
30

であり得；他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ であり得、ここで、Tは、

【0681】

40

【化589】



であり得；残りの各Zは、独立して、CG¹、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、

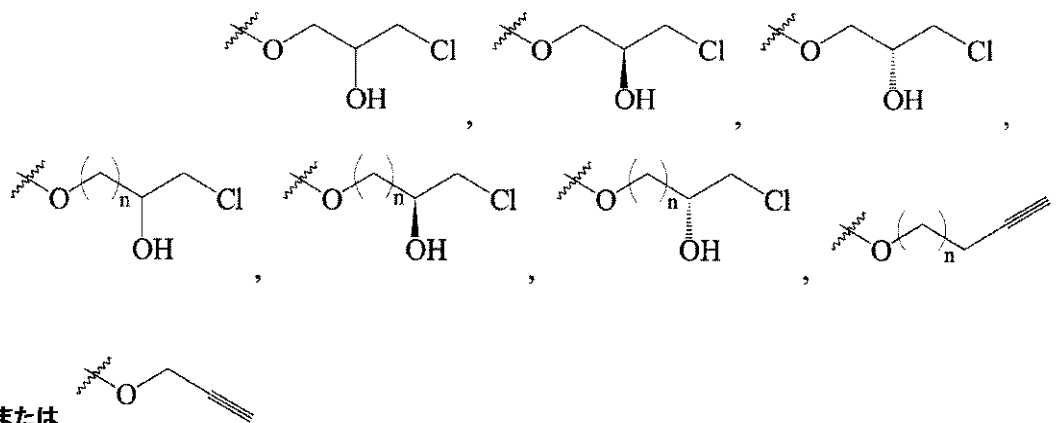
40

【0682】

Qは、

【0683】

【化590】

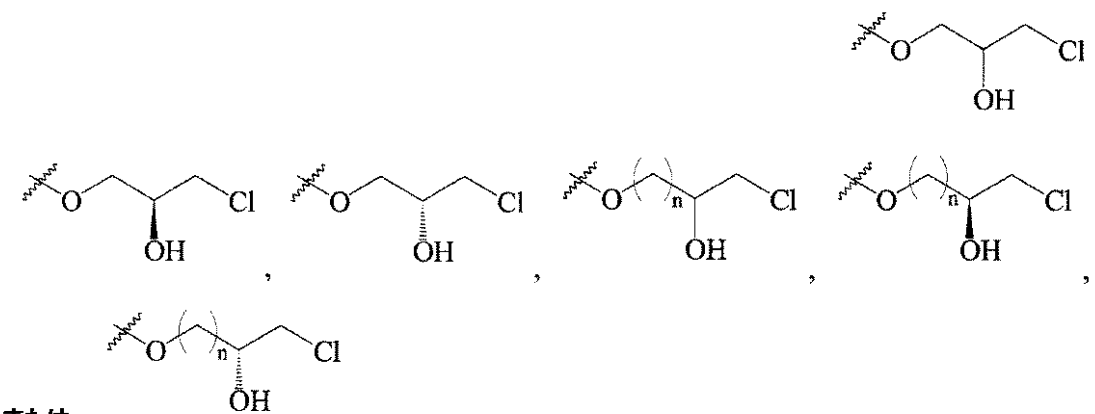


10

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0684】

【化591】

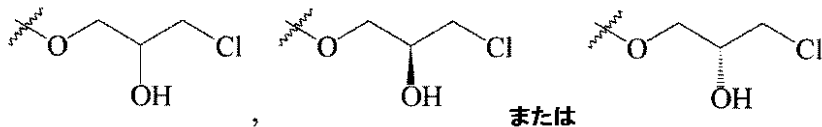


20

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0685】

【化592】

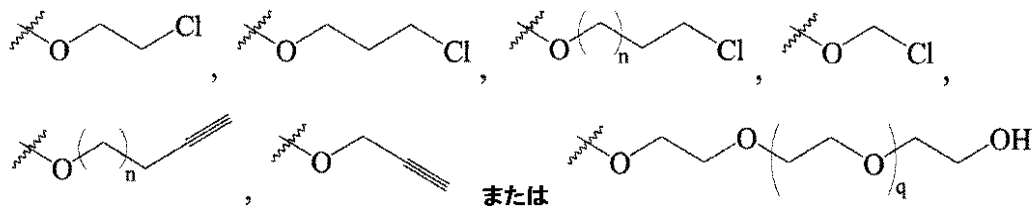


30

であり得る。Qは、

【0686】

【化593】

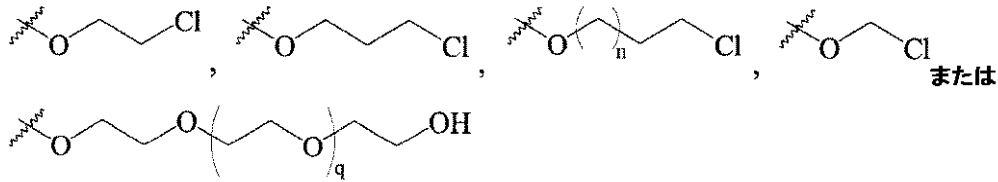


40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0687】

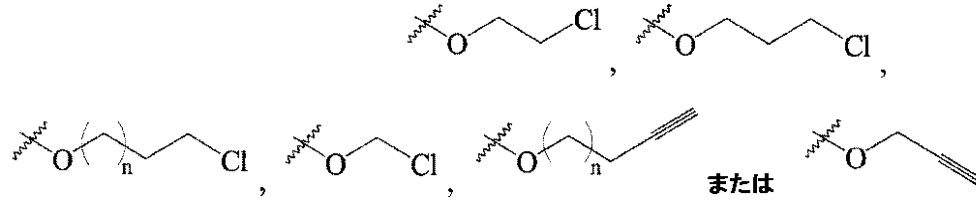
【化594】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0688】

【化595】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0689】

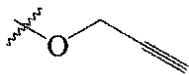
【化596】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0690】

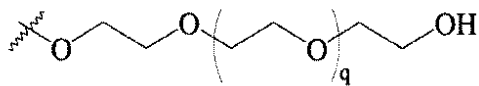
【化597】



であり得る。Qは、

【0691】

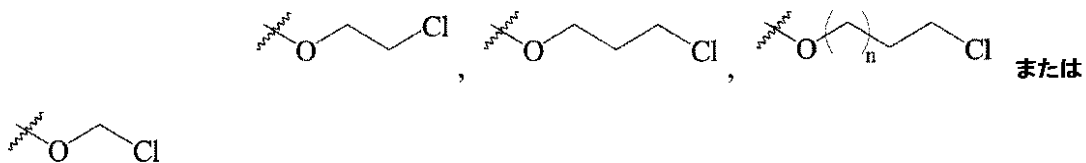
【化598】



であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。Qは、

【0692】

【化599】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0693】

10

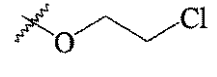
20

30

40

50

【化600】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0694】

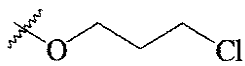
【化601】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0695】

【化602】



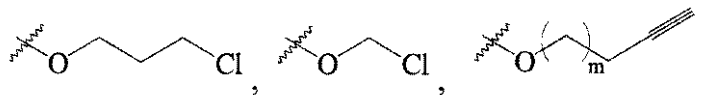
であり得る。

【0696】

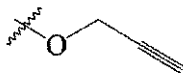
Tは、

【0697】

【化603】



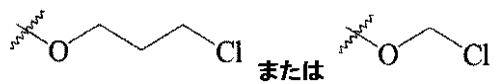
または



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0698】

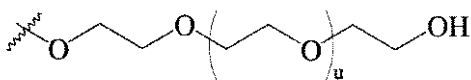
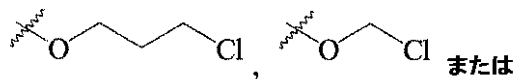
【化604】



であり得る。Tは、

【0699】

【化605】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Tは、

【0700】

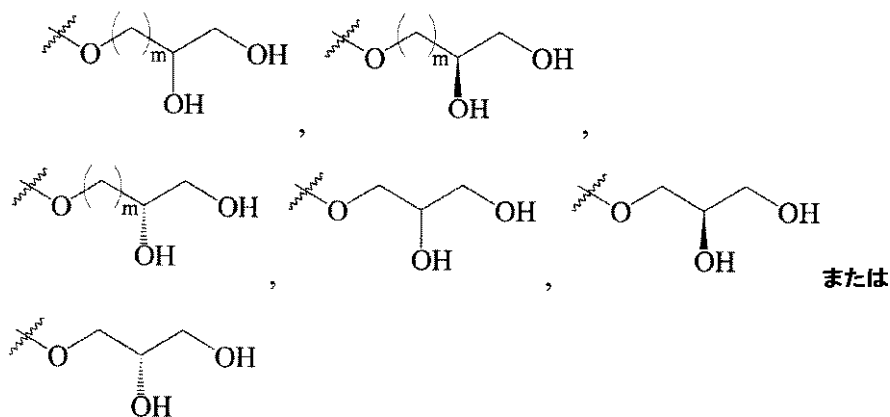
10

20

30

40

【化606】

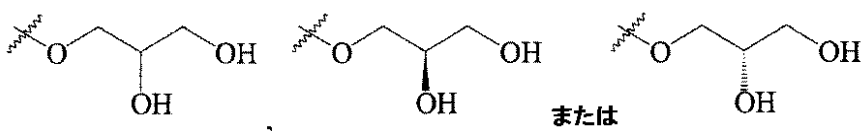


10

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0701】

【化607】

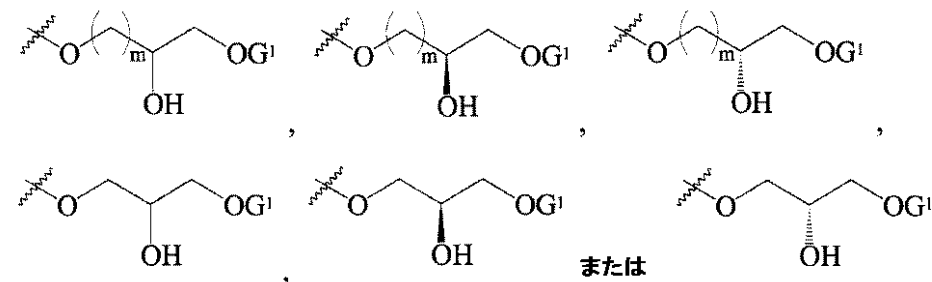


20

であり得る。Tは、

【0702】

【化608】

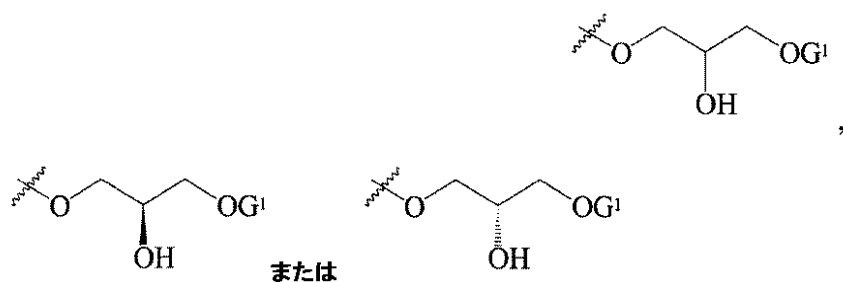


30

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Tは、

【0703】

【化609】



40

であり得、各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'

50

”、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ およびNO₂ からなる群から選択され得る。Tは、

【0704】

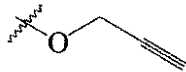
【化610】



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0705】

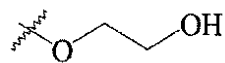
【化611】



であり得る。Tは、

【0706】

【化612】



であり得る。Tは、

【0707】

【化613】



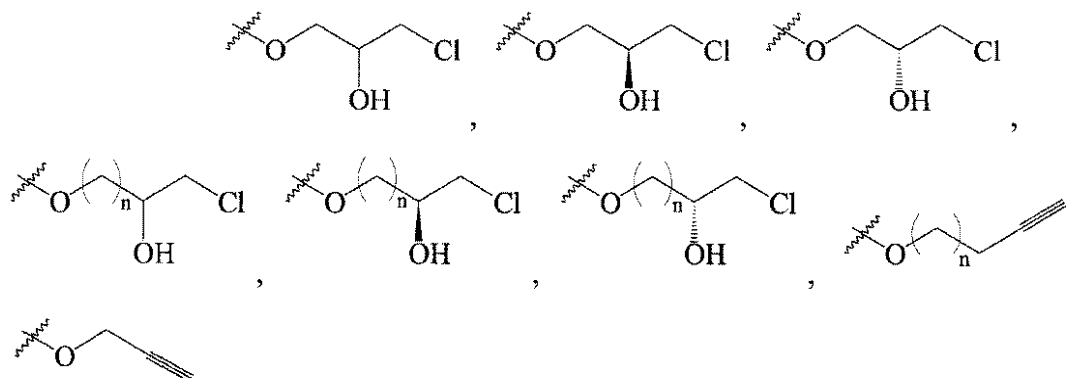
であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。

【0708】

Qは、

【0709】

【化614】



であり得；Tは、

【0710】

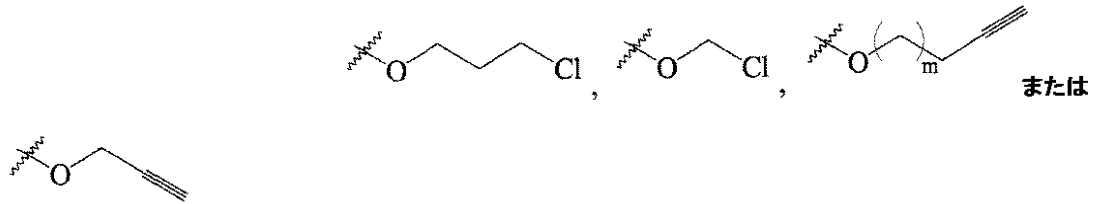
10

20

30

40

【化615】

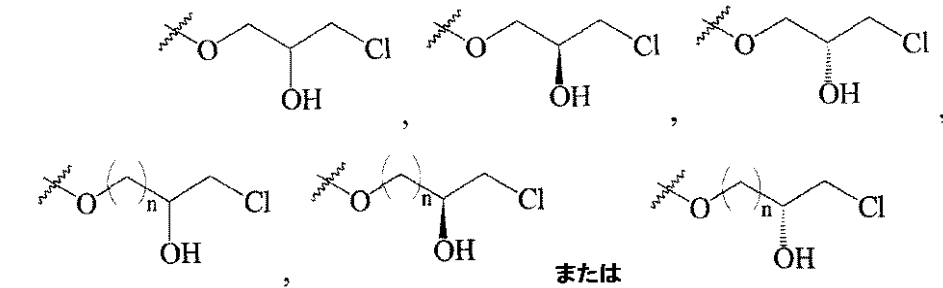


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

10

【0711】

【化616】

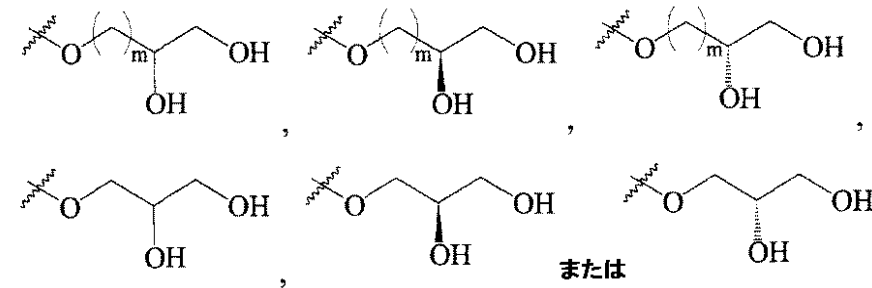


20

であり得；Tは、

【0712】

【化617】

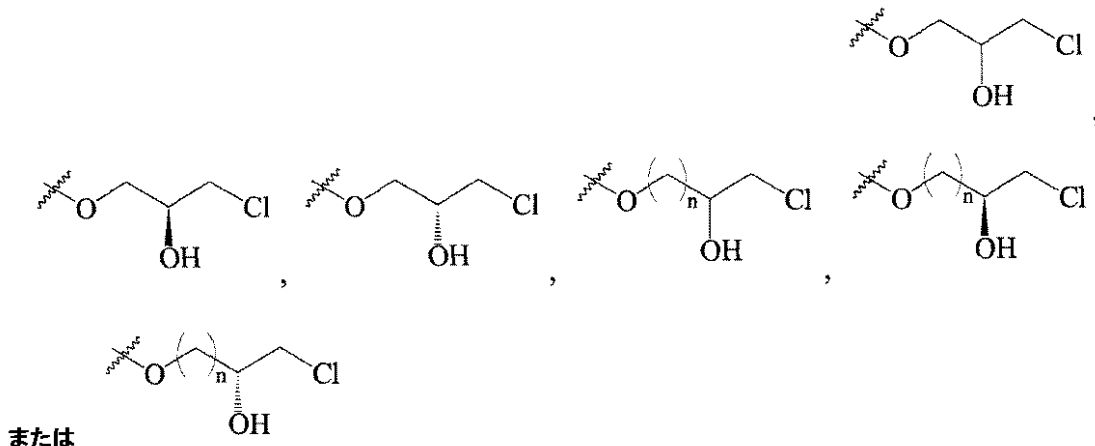


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0713】

【化618】



40

であり得；Tは、

【0714】

50

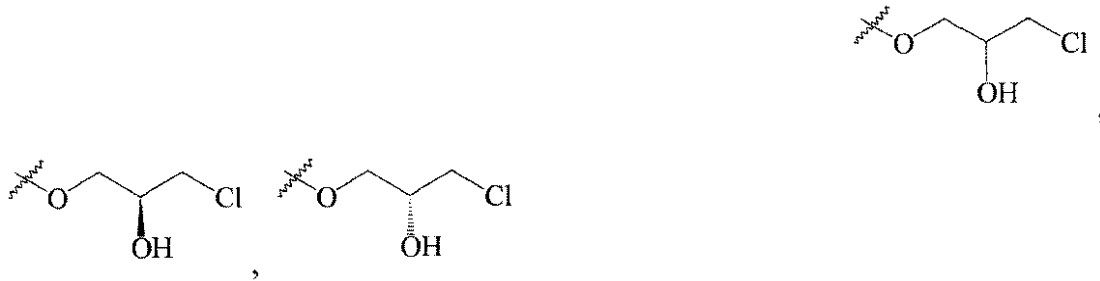
【化619】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0715】

【化620】

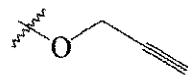
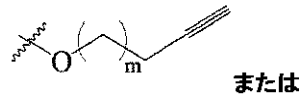


10

であり得；Tは、

【0716】

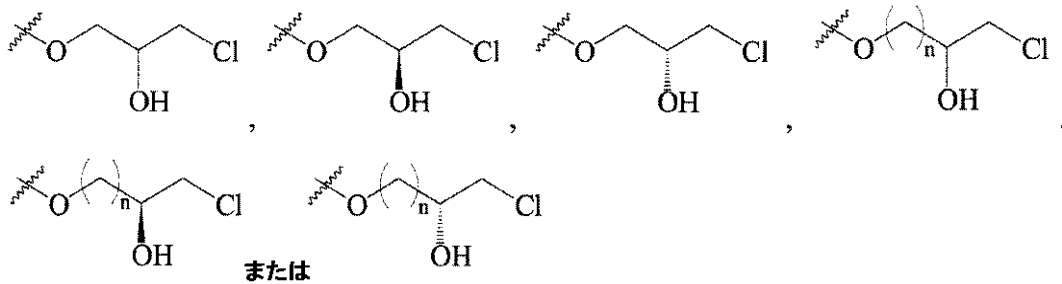
【化621】



であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0717】

【化622】

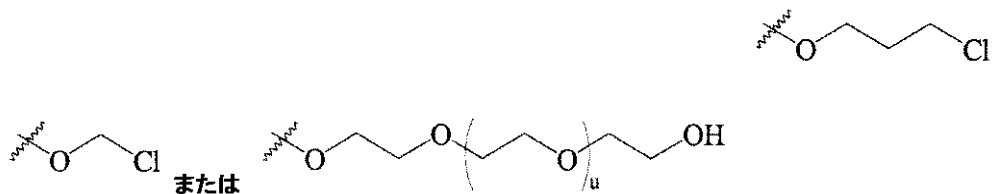


20

であり得；Tは、

【0718】

【化623】



30

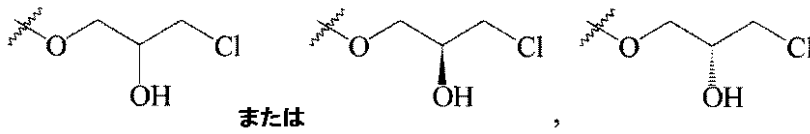
40

50

であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0719】

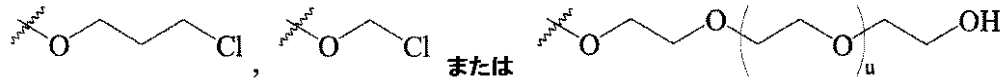
【化624】



であり得、Tは、

【0720】

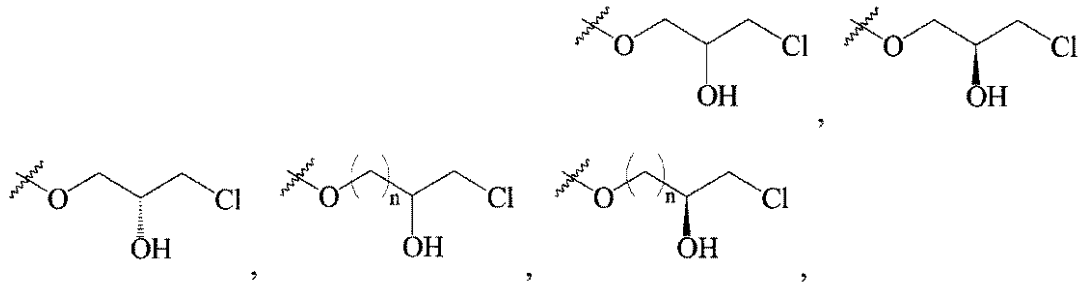
【化625】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0721】

【化626】

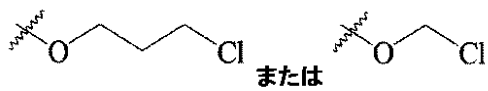


または

であり得；Tは、

【0722】

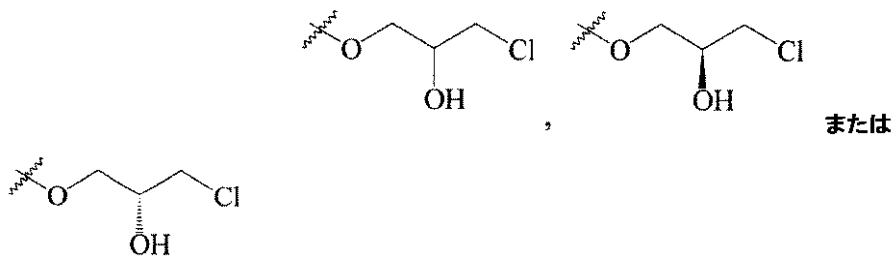
【化627】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0723】

【化628】



であり得；Tは、

【0724】

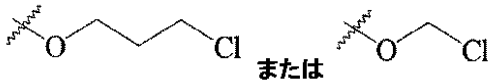
10

20

30

40

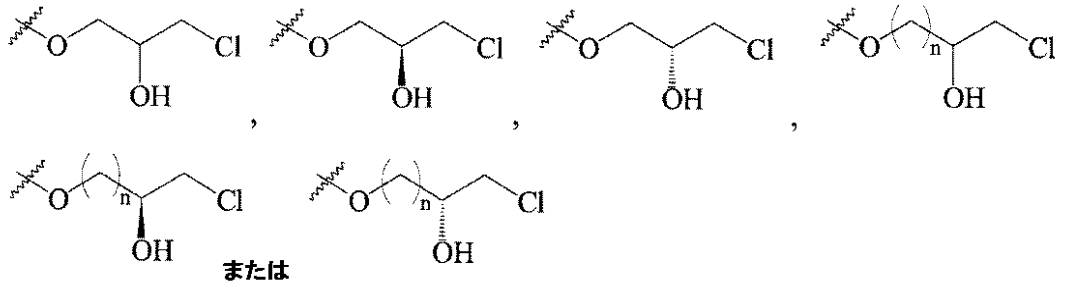
【化629】



であり得る。Qは、

【0725】

【化630】



10

であり得；Tは、

【0726】

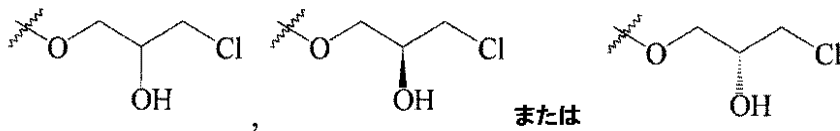
【化631】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0727】

【化632】



30

であり得；Tは、

【0728】

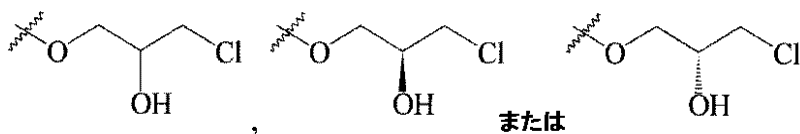
【化633】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0729】

【化634】

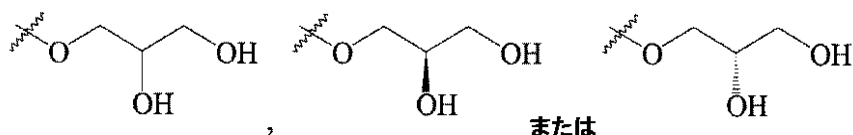


40

であり得、Tは、

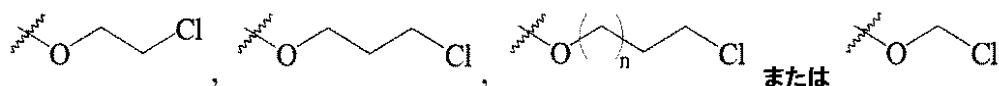
【0730】

【化 6 3 5】



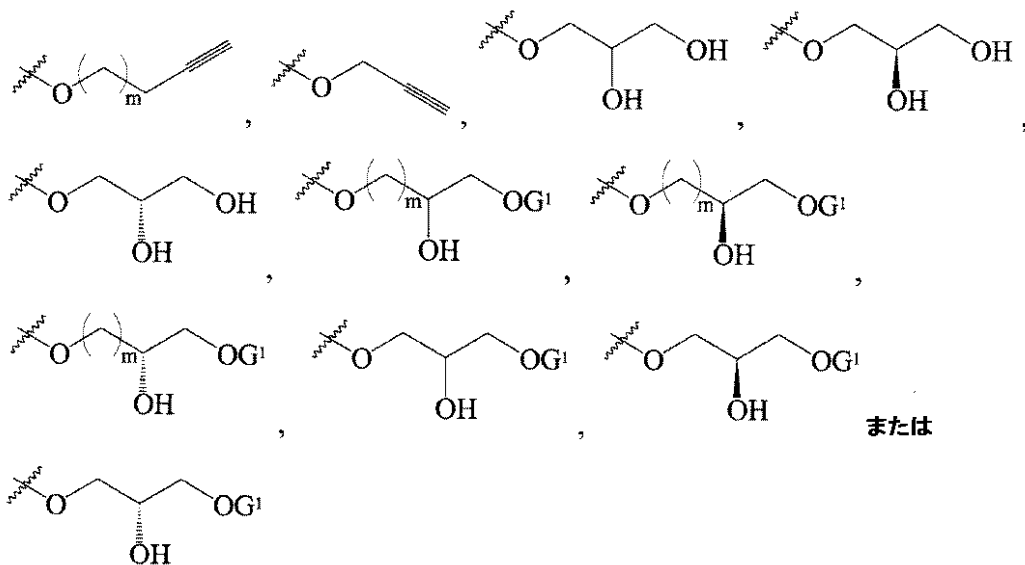
【0 7 3 1】

【化 6 3 6】



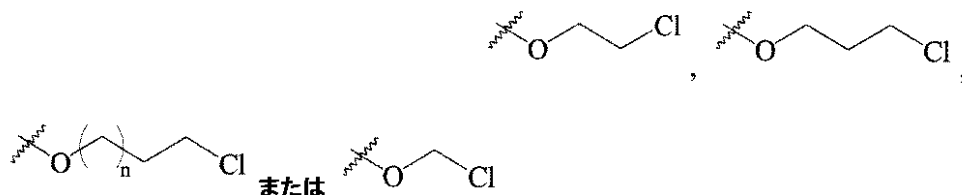
【0 7 3 2】

【化 6 3 7】



【0 7 3 3】

【化 6 3 8】



【0 7 3 4】

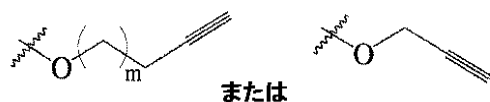
10

20

30

40

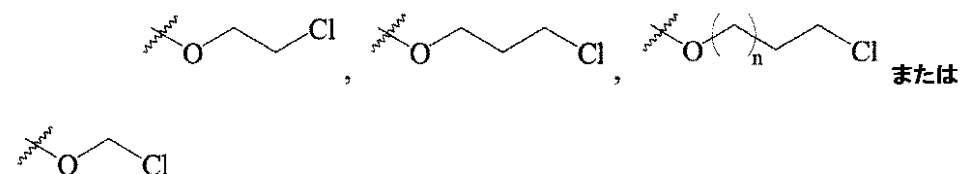
【化639】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0735】

【化640】

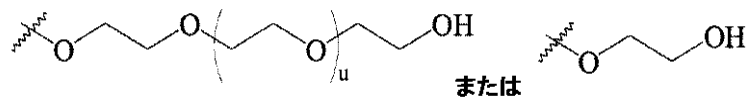


10

であり得；Tは、

【0736】

【化641】

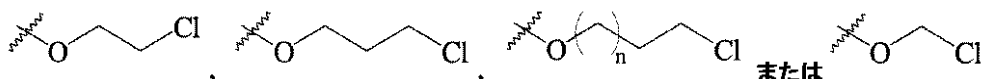


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0737】

【化642】



30

であり得；Tは、

【0738】

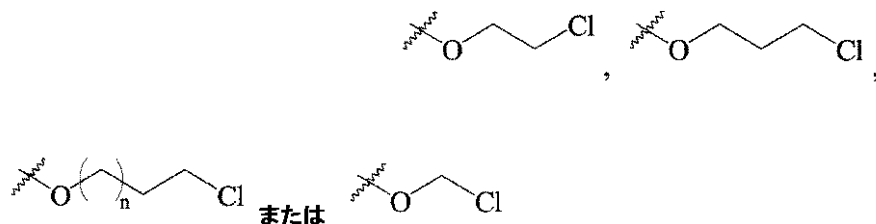
【化643】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0739】

【化644】

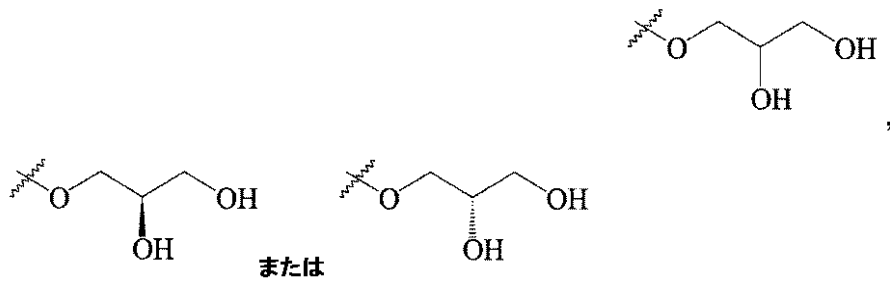


40

であり得；Tは、

【0740】

【化645】

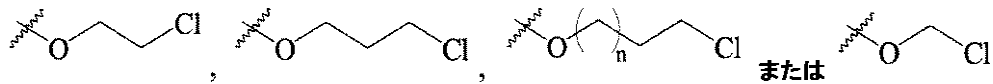


10

であり得、 n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0741】

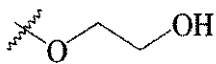
【化646】



であり得；Tは、

【0742】

【化647】

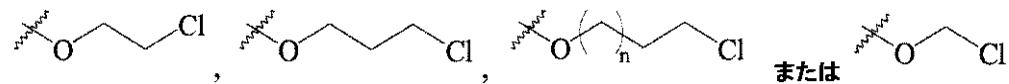


20

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0743】

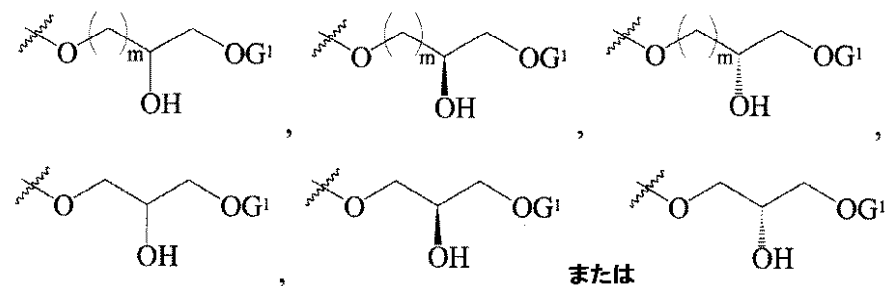
【化648】



であり得；Tは、

【0744】

【化649】



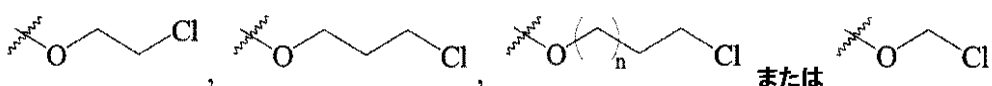
30

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Qは、

40

【0745】

【化650】

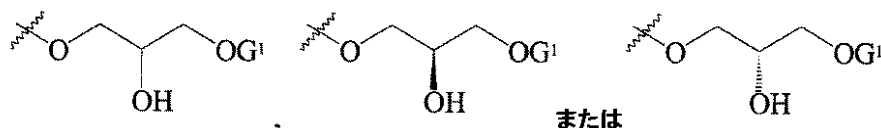


50

であり得；Tは、

【0746】

【化651】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。

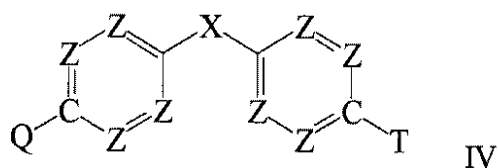
10

【0747】

別の実施形態によると、式IVの構造を有する化合物

【0748】

【化652】

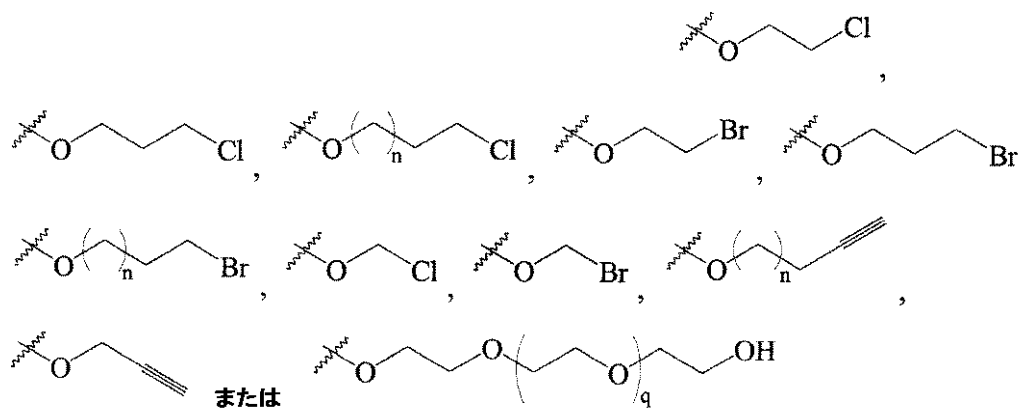


20

またはその薬学的に許容され得る塩が提供され、ここで：Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり得；R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、OJ'、F、Cl、Br、IまたはNH₂からなる群から選択され得；各Zは、独立して、CG¹、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得；ここで、Qは、

【0749】

【化653】

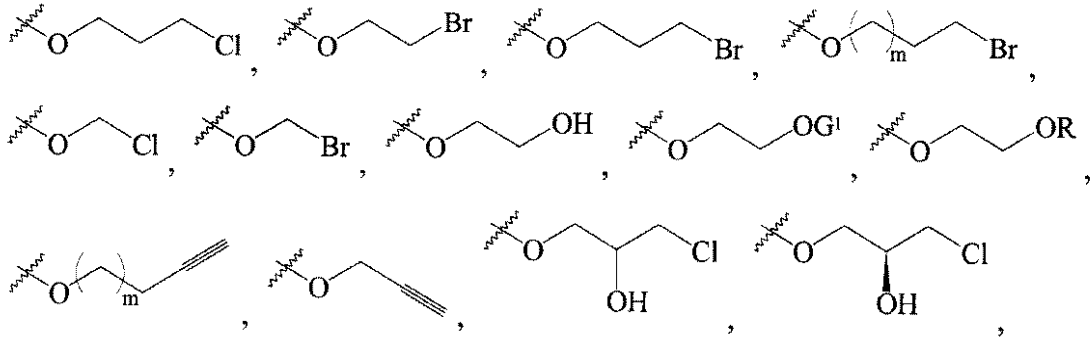


40

であり得；Tは、

【0750】

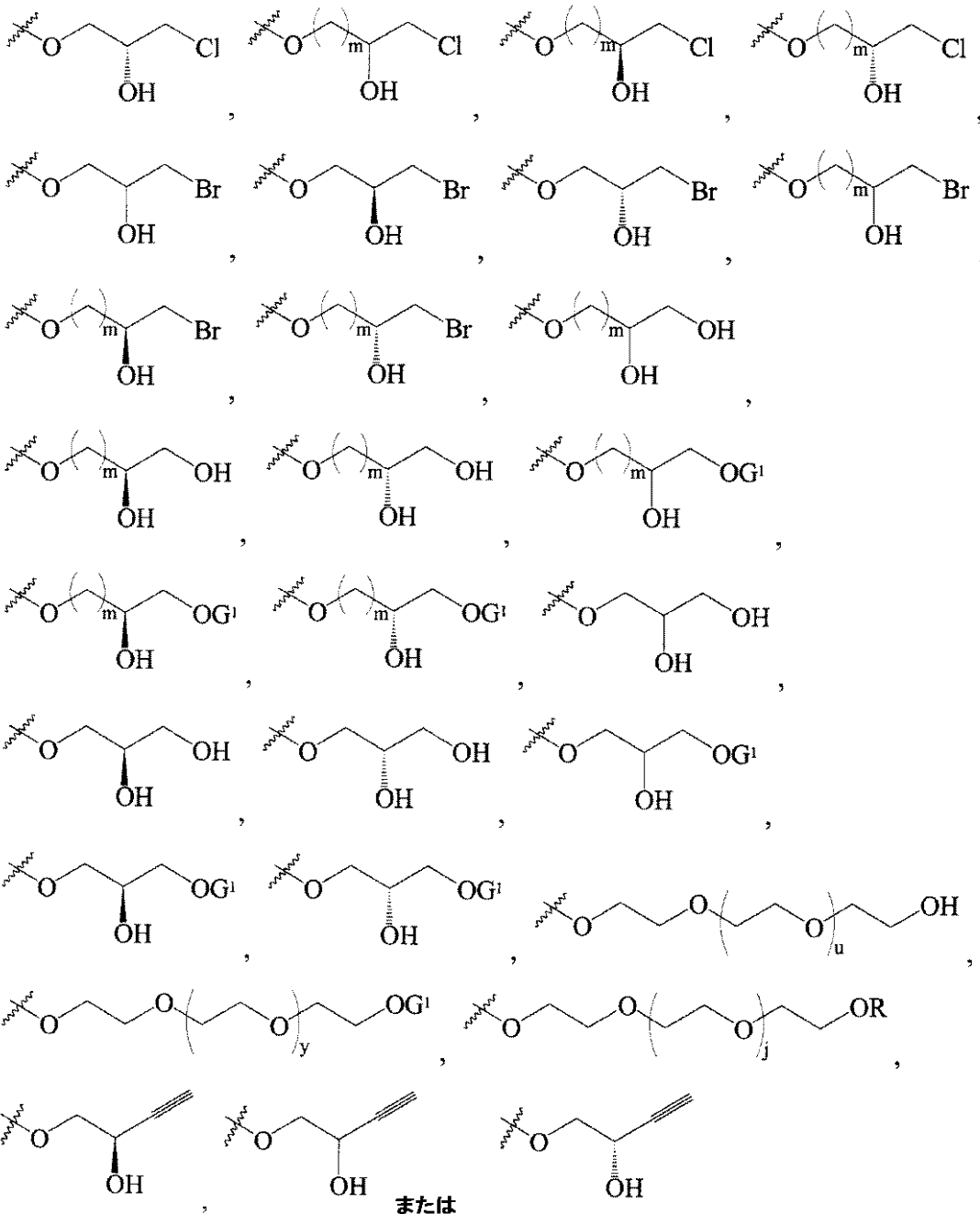
【化654】



10

【0751】

【化655】



20

30

40

または

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8で

50

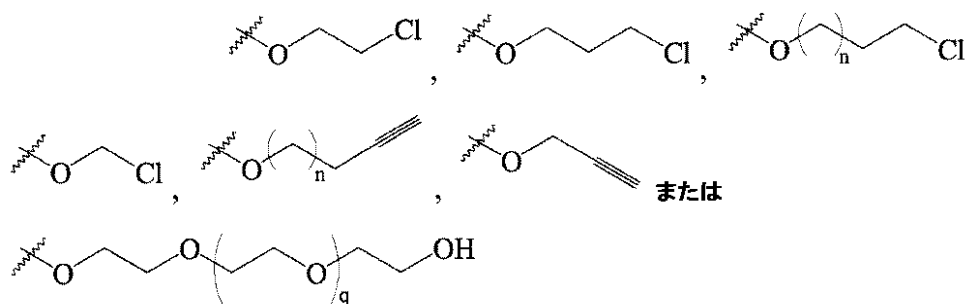
あり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、"OJ'", COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得；"J"および"J'"の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；ここで、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。

【0752】

Qは、

【0753】

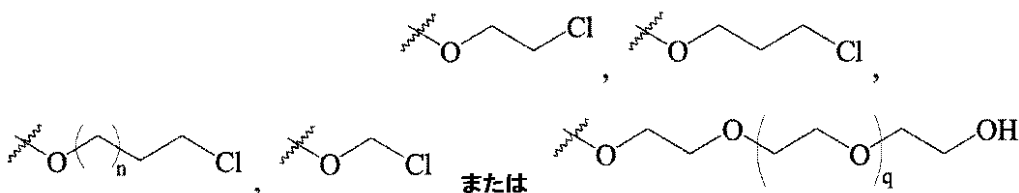
【化656】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0754】

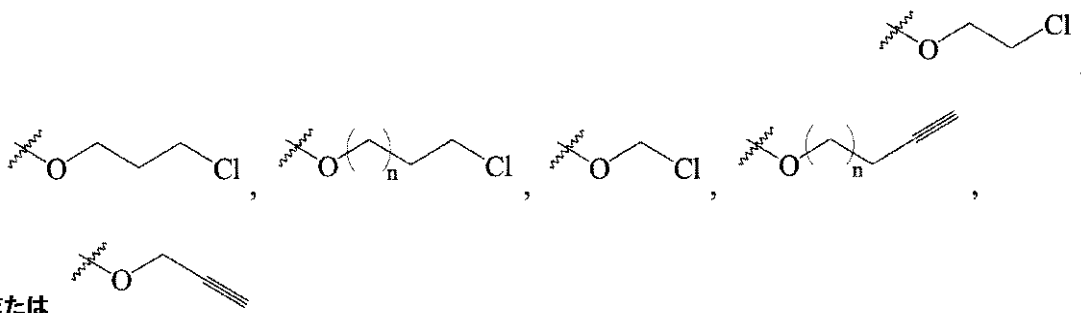
【化657】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0755】

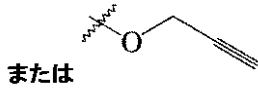
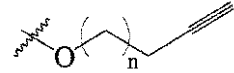
【化658】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0756】

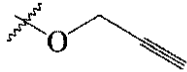
【化659】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0757】

【化660】

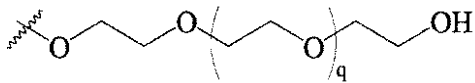


10

であり得る。Qは、

【0758】

【化661】

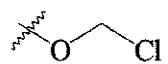
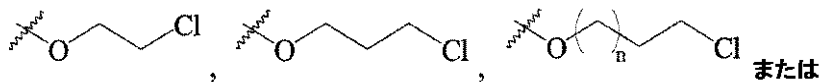


20

であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。Qは、

【0759】

【化662】

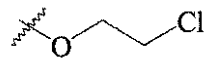


30

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0760】

【化663】

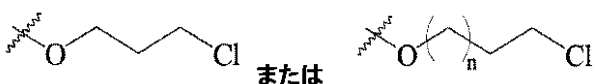


40

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0761】

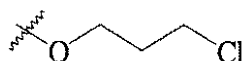
【化664】



であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0762】

【化 6 6 5】



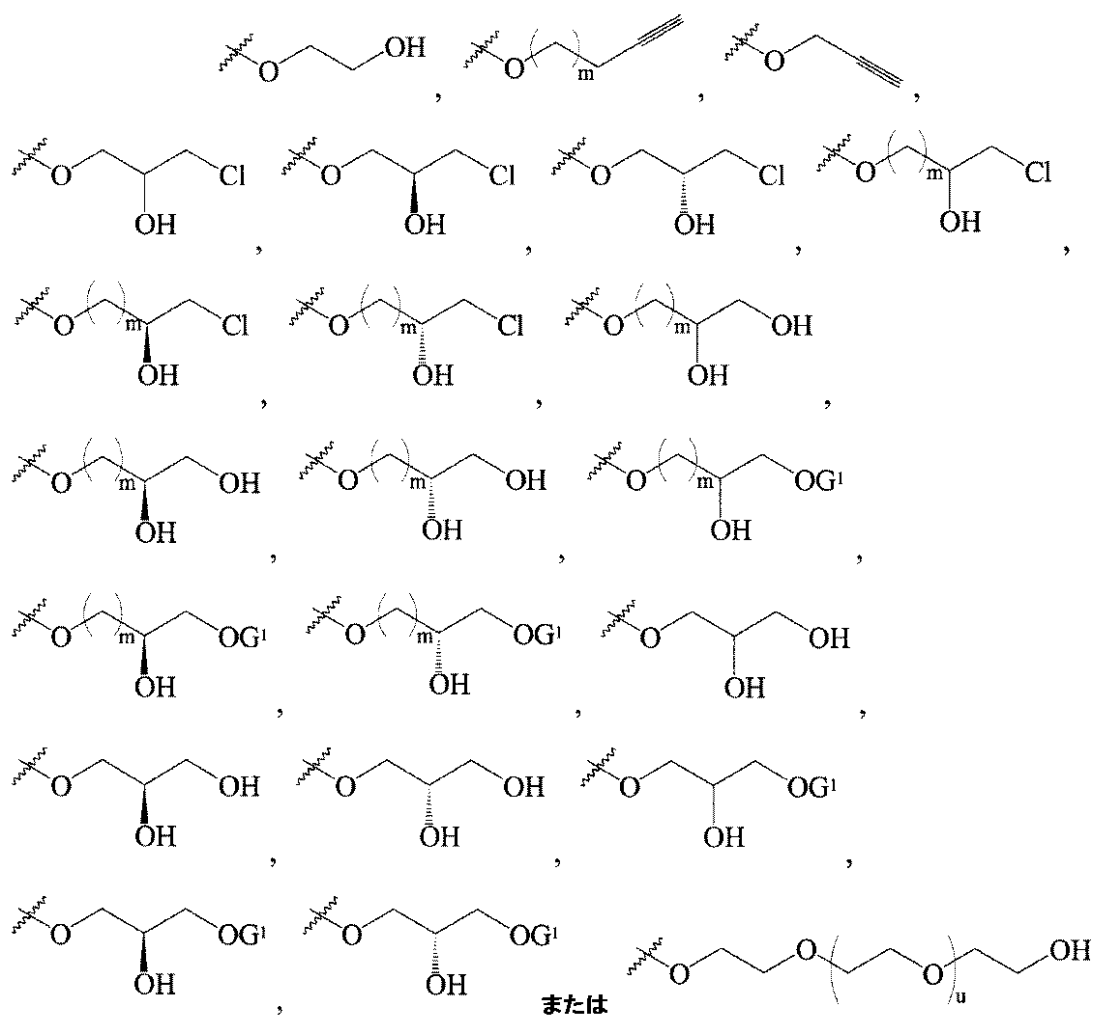
であり得る。

【 0 7 6 3】

Tは、

【 0 7 6 4】

【化 6 6 6】



10

20

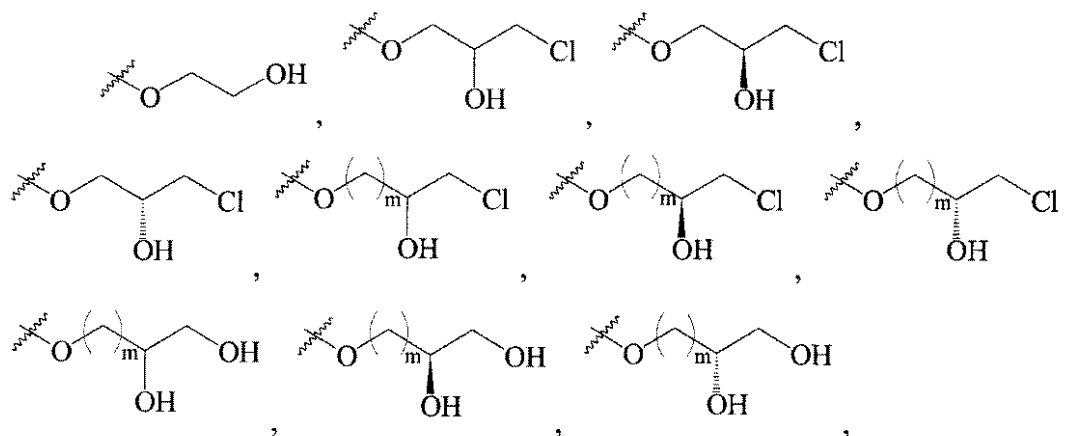
30

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、S

40

【 0 7 6 5】

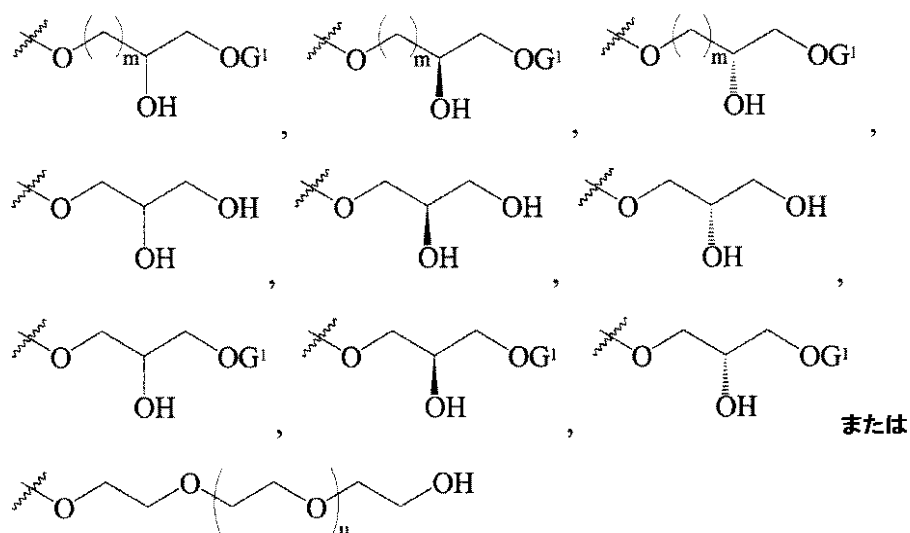
【化667】



10

【0766】

【化668】



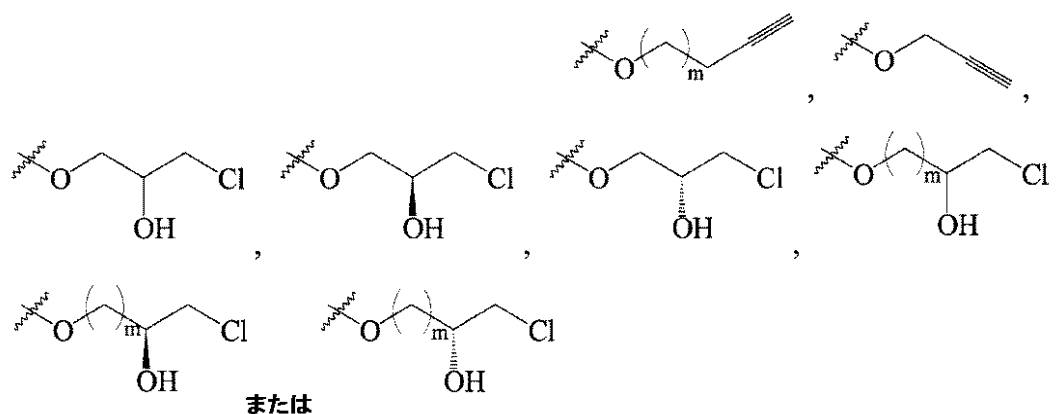
20

30

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

【0767】

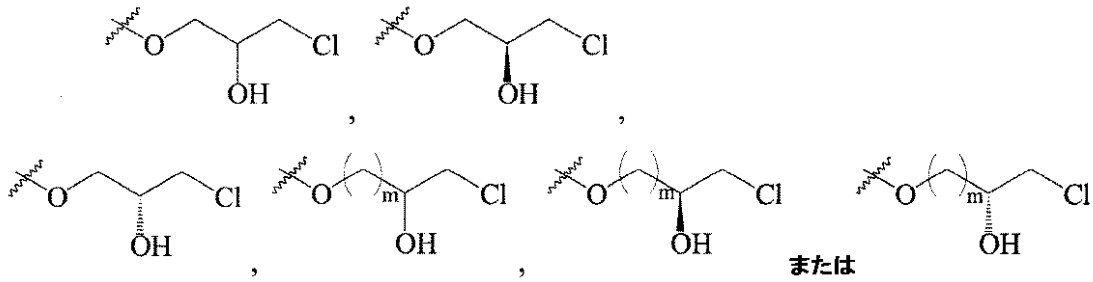
【化669】



40

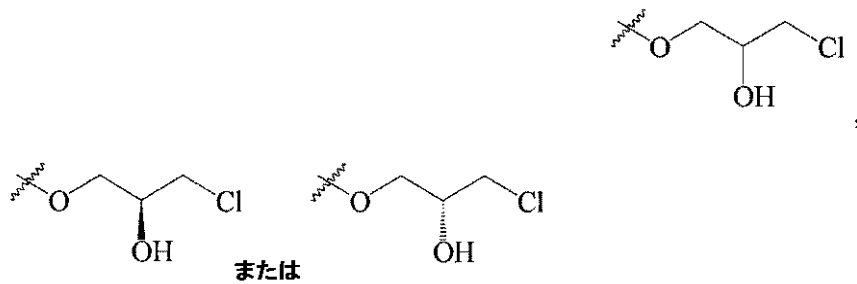
50

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、
 【0768】
 【化670】



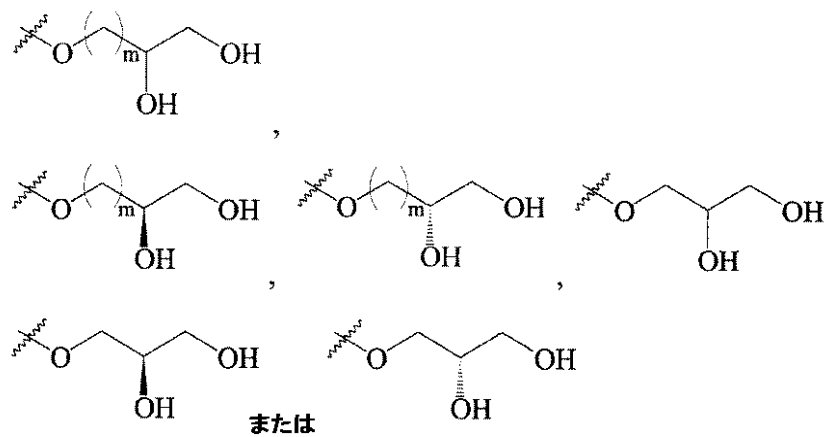
10

であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、
 【0769】
 【化671】



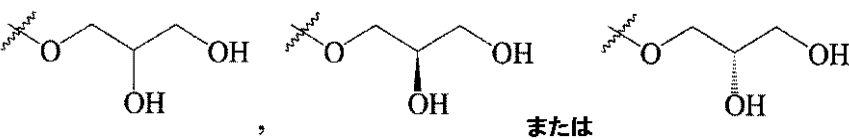
20

であり得る。Tは、
 【0770】
 【化672】



30

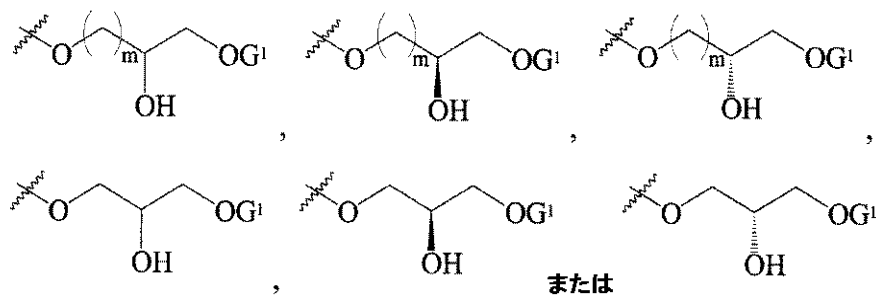
であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、
 【0771】
 【化673】



40

であり得る。Tは、
 【0772】

【化674】

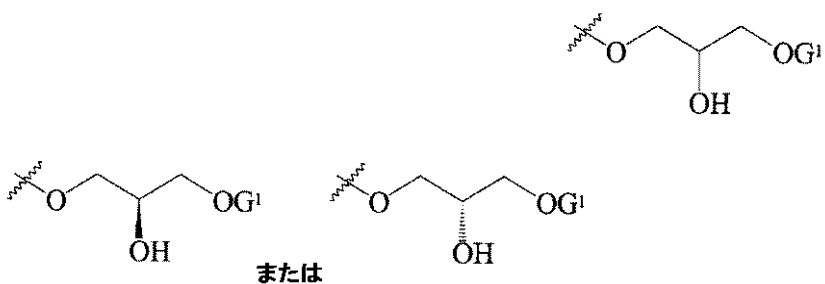


10

であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

【0773】

【化675】

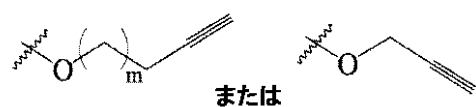


20

であり得、各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Tは、

【0774】

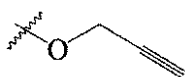
【化676】



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0775】

【化677】

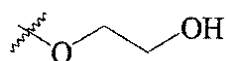


40

であり得る。Tは、

【0776】

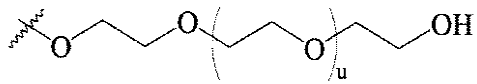
【化678】



であり得る。Tは、

【0777】

【化679】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。

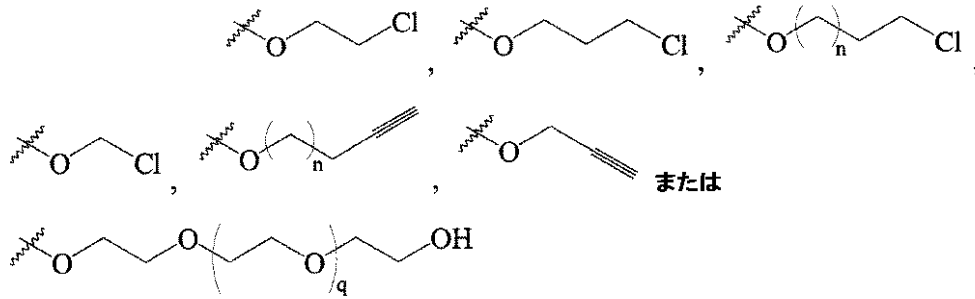
【0778】

Qは、

【0779】

【化680】

10

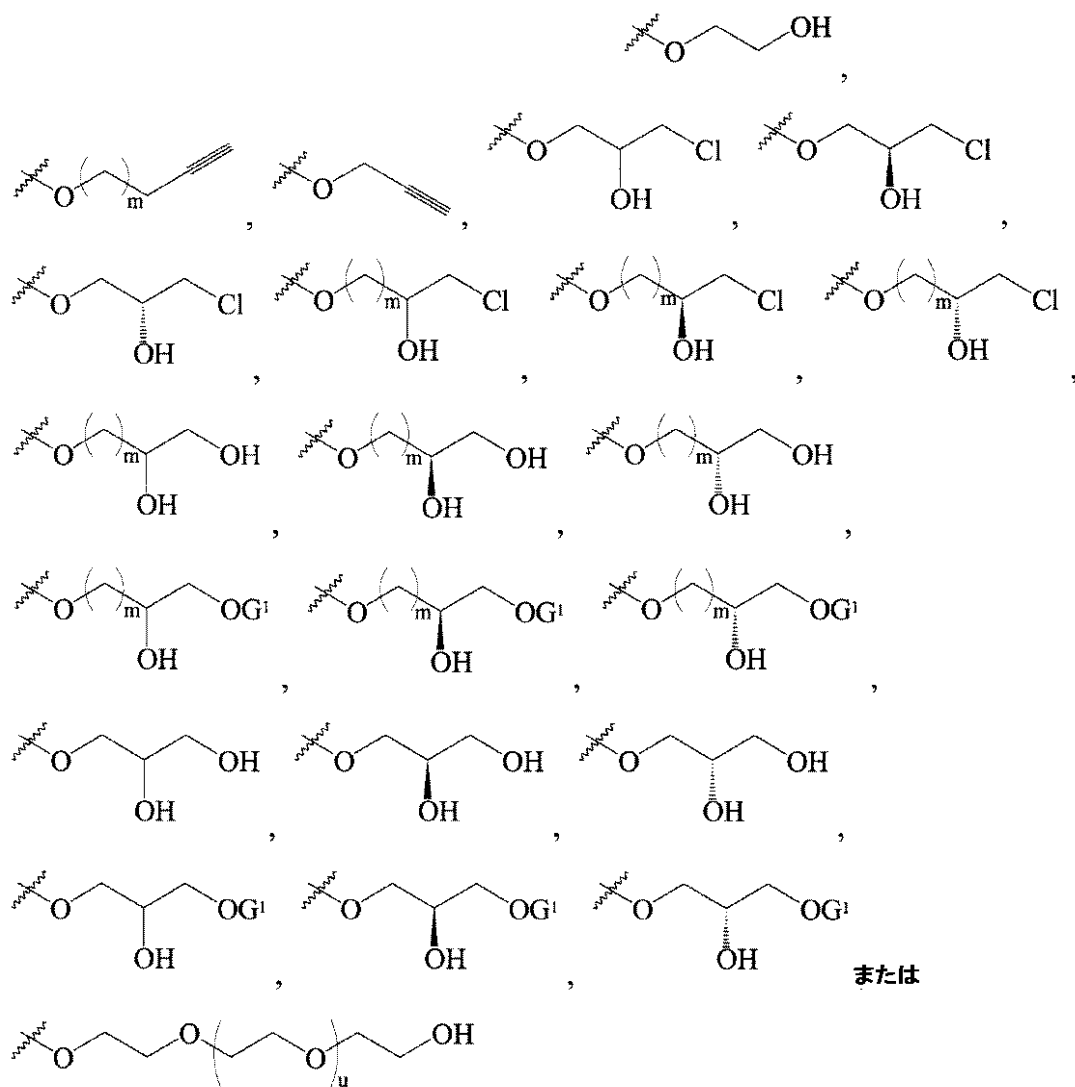


であり得；Tは、

【0780】

20

【化681】



10

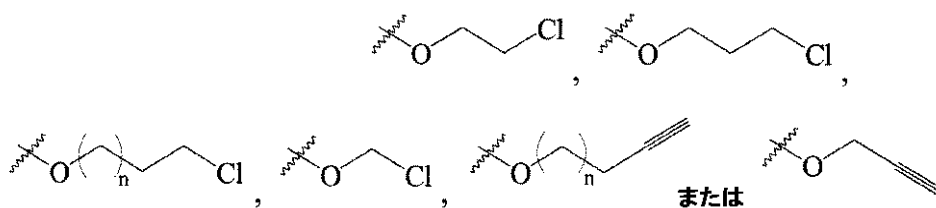
20

30

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。 Q は、

【0781】

【化682】

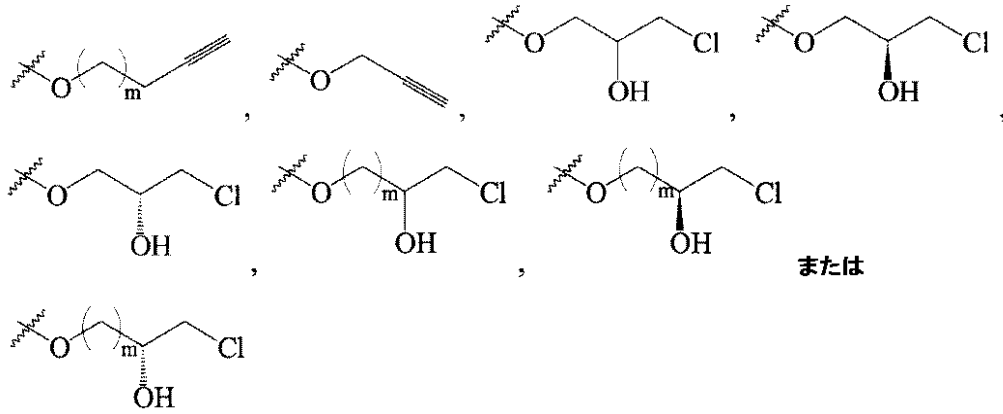


40

であり得； T は、

【0782】

【化683】



10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0783】

【化684】

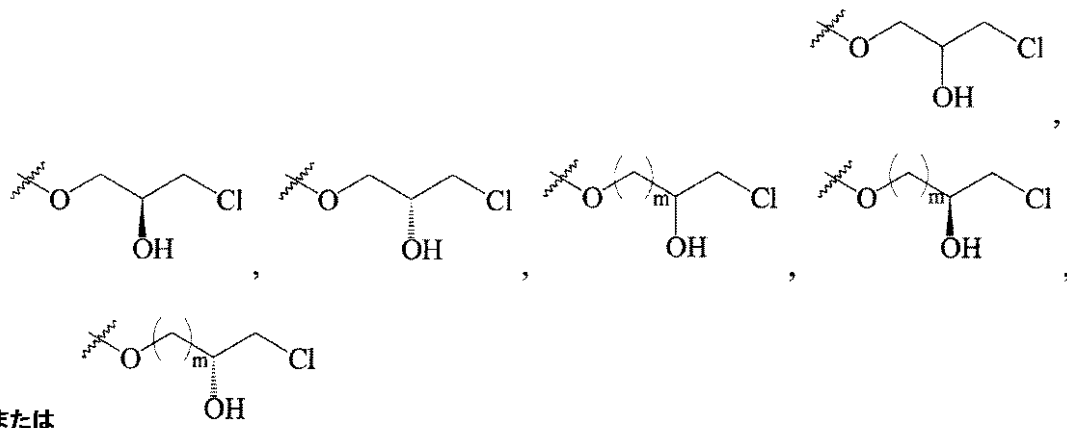


20

であり得；Tは、

【0784】

【化685】



30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0785】

【化686】

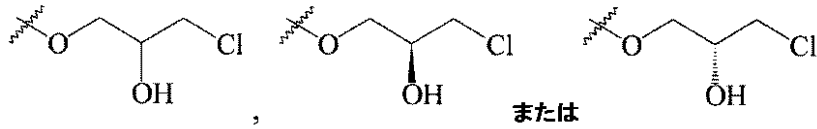


40

であり得；Tは、

【0786】

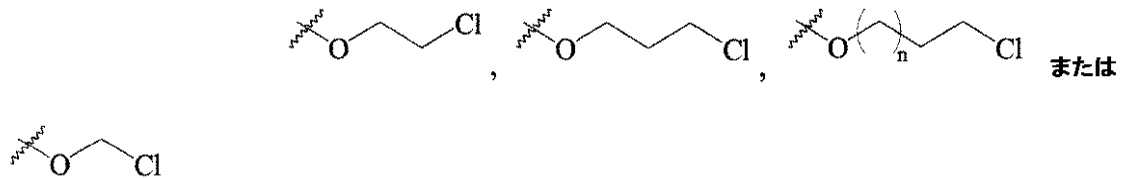
【化687】



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7であり得る。Qは、

【0787】

【化688】



10

であり得；Tは、

【0788】

【化689】

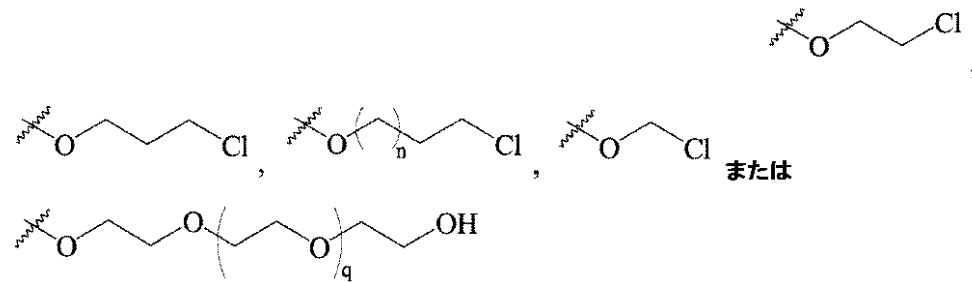


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0789】

【化690】

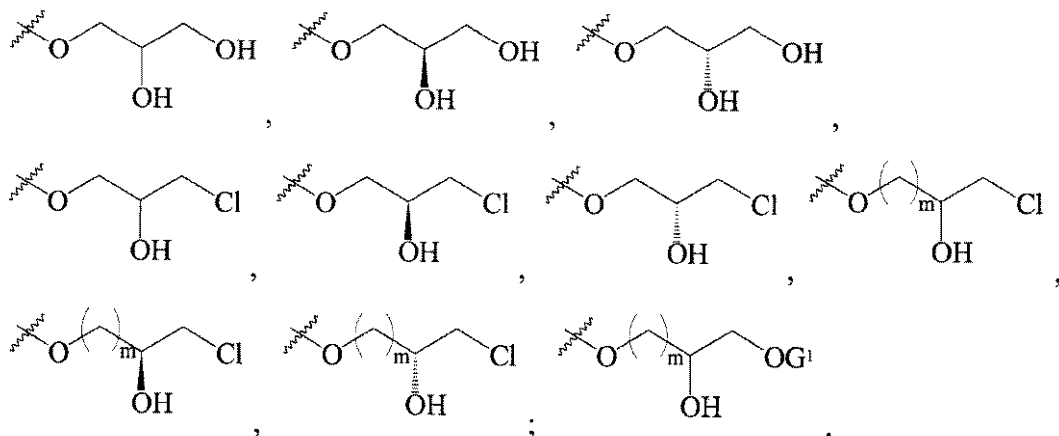


30

であり得；Tは、

【0790】

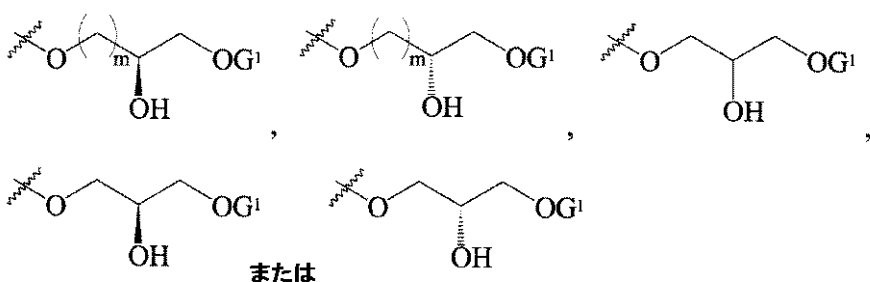
【化693】



10

【0793】

【化694】



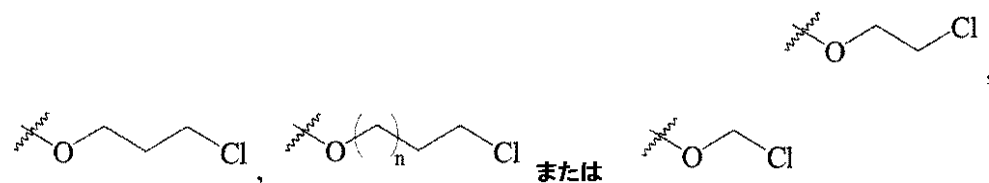
20

であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Qは、

30

【0794】

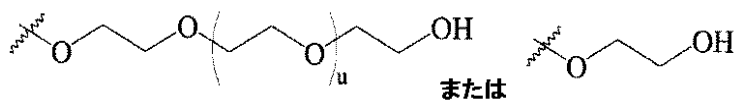
【化695】



であり得； T は、

【0795】

【化696】

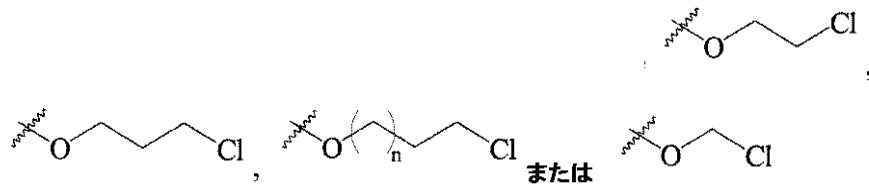


であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； u は、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0796】

40

【化697】



であり得；Tは、

【0797】

【化698】

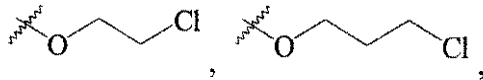
10



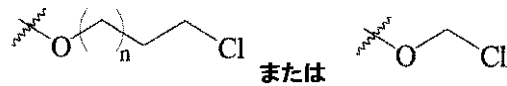
であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0798】

【化699】



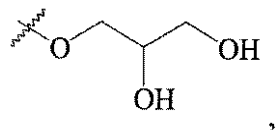
20



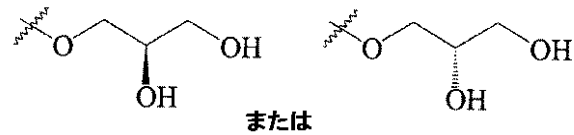
であり得；Tは、

【0799】

【化700】



30

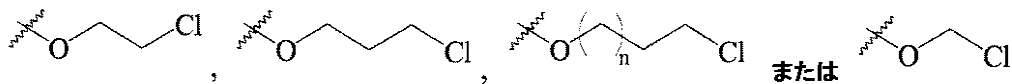


であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0800】

【化701】

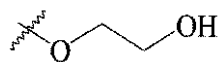
40



であり得；Tは、

【0801】

【化702】

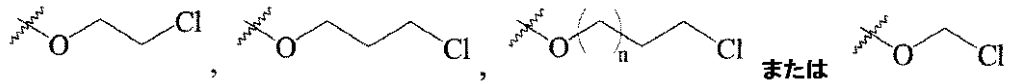


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0802】

50

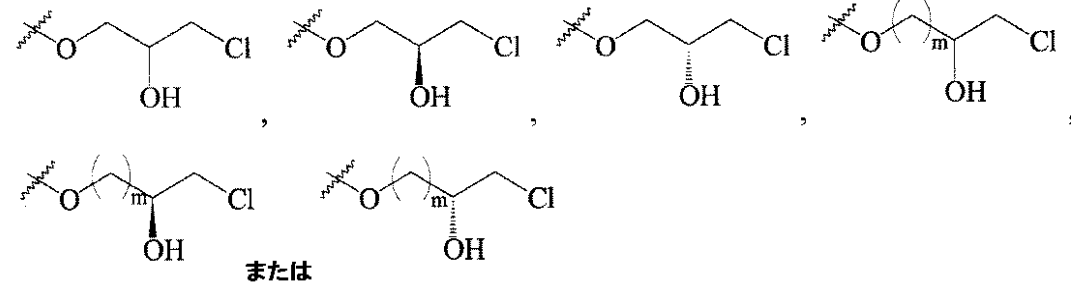
【化703】



であり得；Tは、

【0803】

【化704】



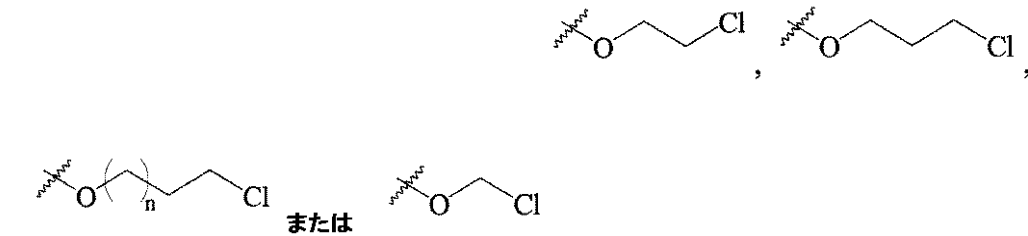
10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0804】

【化705】

20

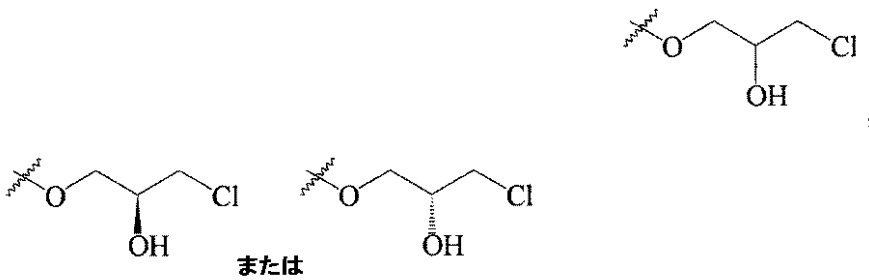


であり得；Tは、

【0805】

【化706】

30

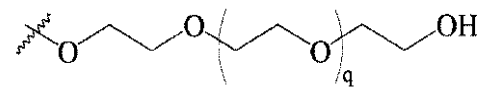


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0806】

【化707】

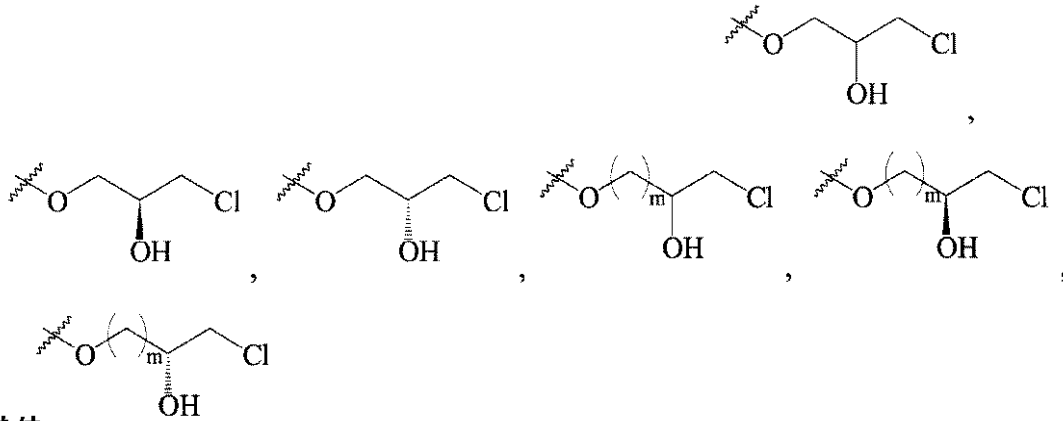
40



であり得；Tは、

【0807】

【化708】



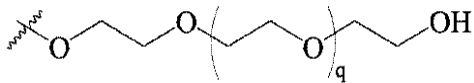
10

または

であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0808】

【化709】

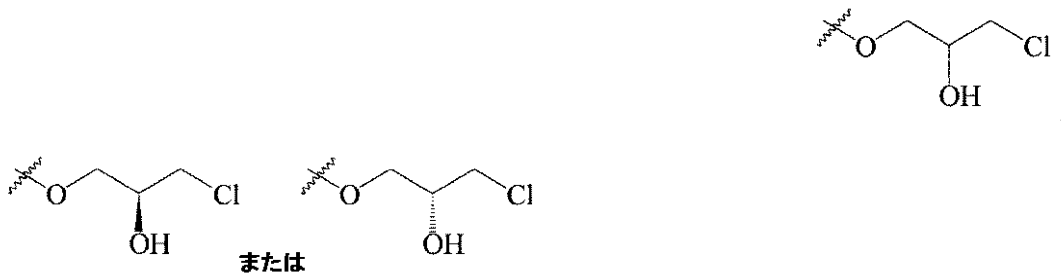


20

であり得；Tは、

【0809】

【化710】

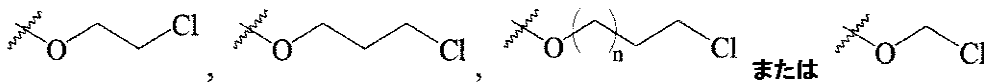


30

であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0810】

【化711】

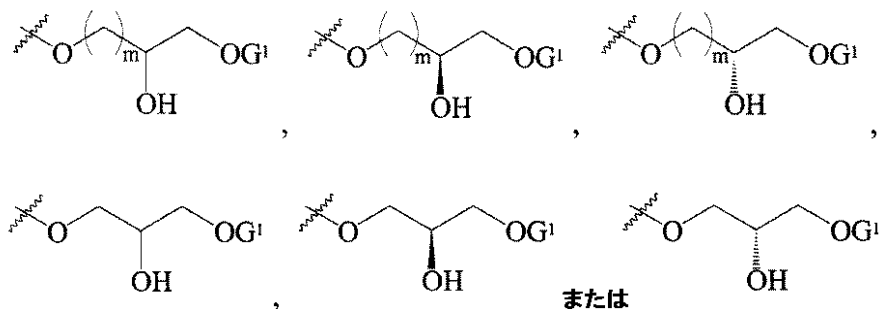


であり得；Tは、

【0811】

40

【化712】

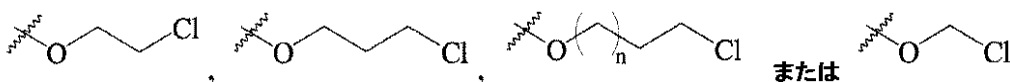


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0812】

【化713】

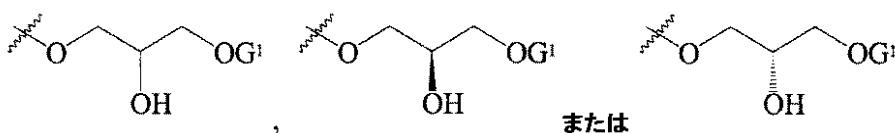


20

であり得；Tは、

【0813】

【化714】



30

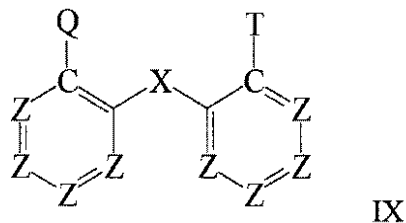
であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。

【0814】

別の実施形態によると、式IXの構造を有する化合物

【0815】

【化715】



40

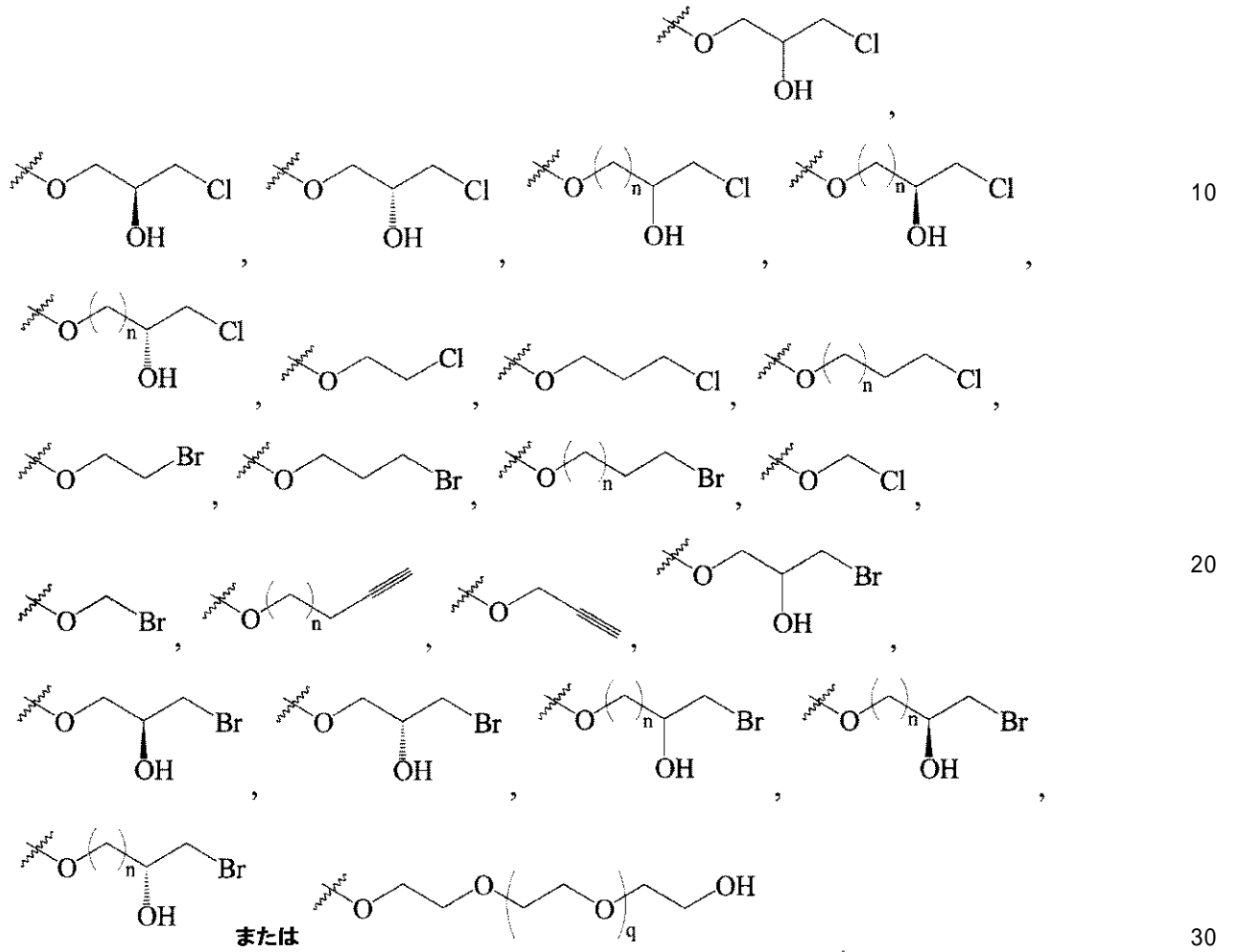
またはその薬学的に許容され得る塩が提供され、ここで：Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり得；R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、OJ'、F、Cl、Br、IまたはNH₂からなる群から選択され得；各Z

50

は、独立して、CG¹、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり得；
ここで、Qは、

【0816】

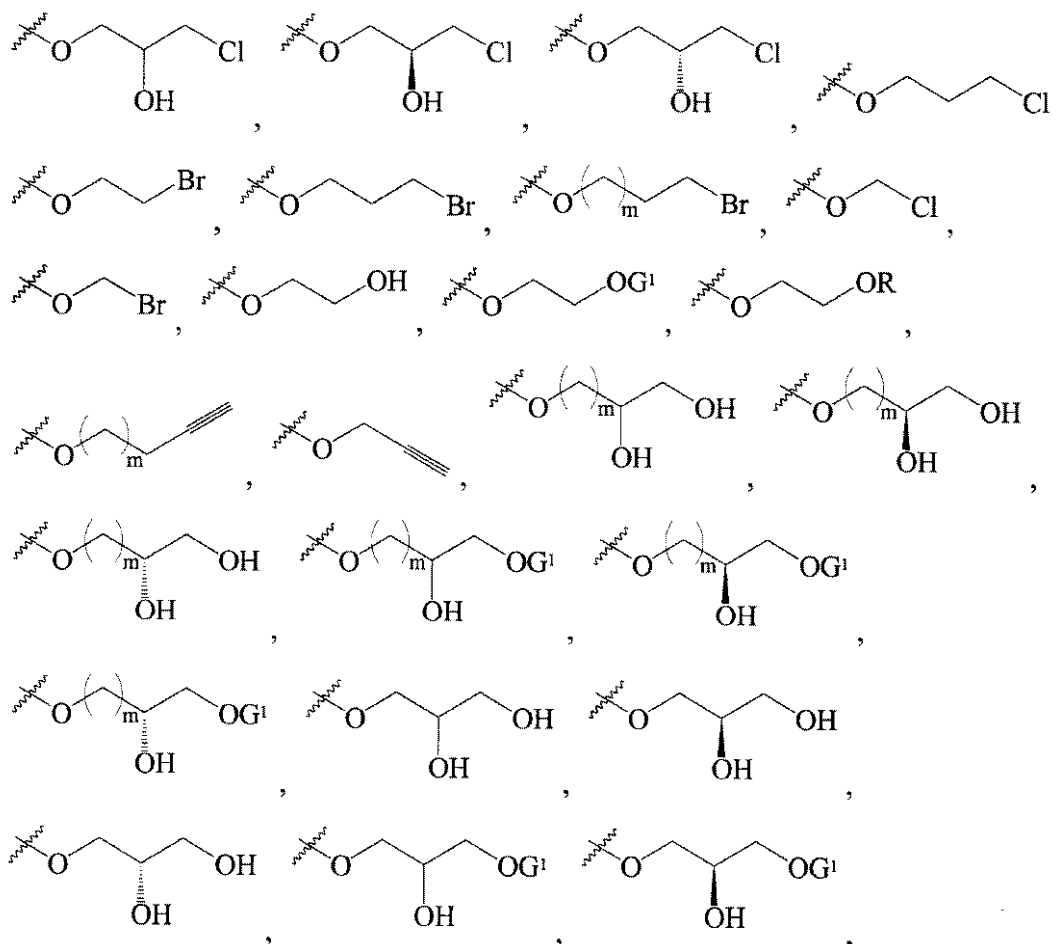
【化716】



であり得；Tは、

【0817】

【化717】

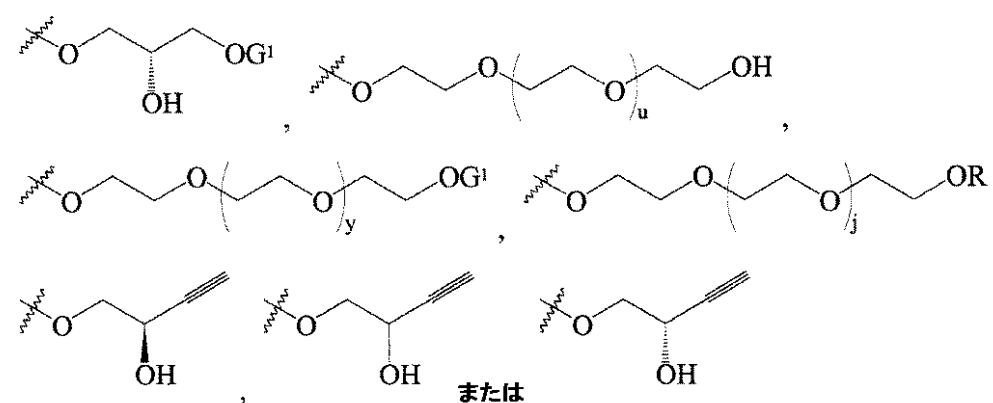


10

20

【0818】

【化718】



30

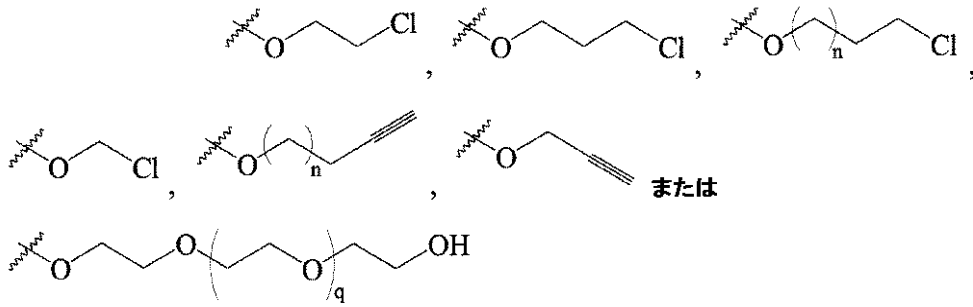
40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；u、jおよびyの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得；J"およびJ'"の各々は、独立して、表1から選択される部分であり得；ここで、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。

【0819】

50

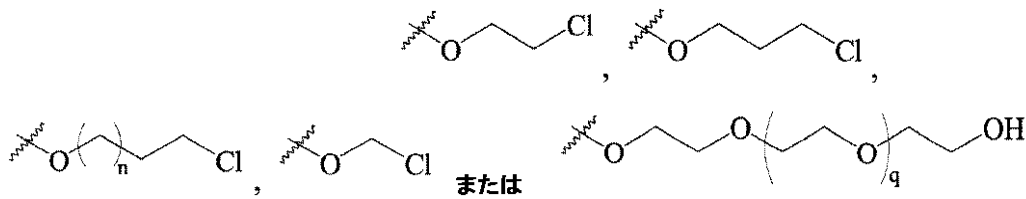
Qは、
【0820】
【化719】



10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

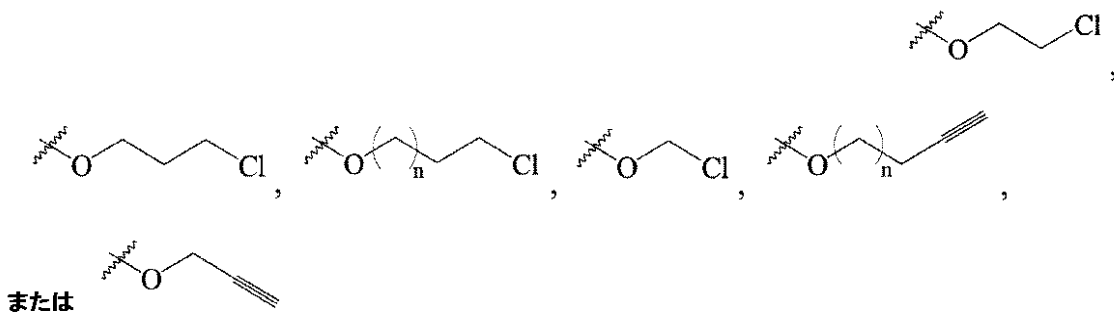
【0821】
【化720】



20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0822】
【化721】



30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

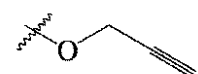
【0823】
【化722】



40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0824】
【化723】



であり得る。Qは、

50

【 0 8 2 5 】

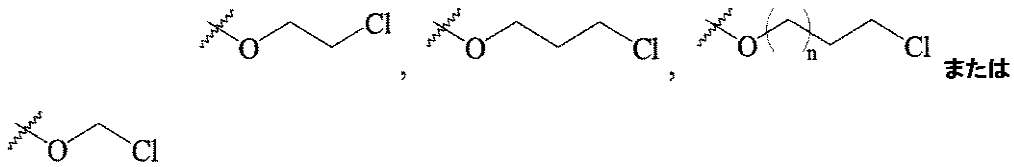
【 化 7 2 4 】



であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。qは、1であり得る。

【 0 8 2 6 】

【 化 7 2 5 】

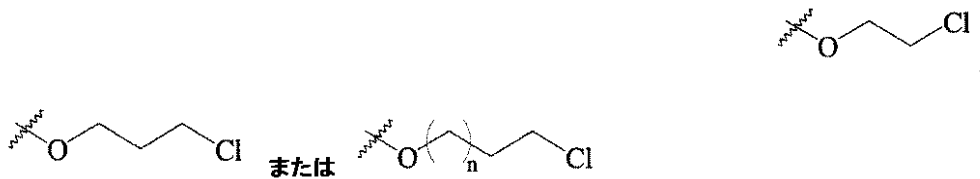


10

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【 0 8 2 7 】

【 化 7 2 6 】



20

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【 0 8 2 8 】

【 化 7 2 7 】

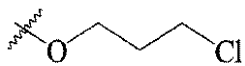


30

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【 0 8 2 9 】

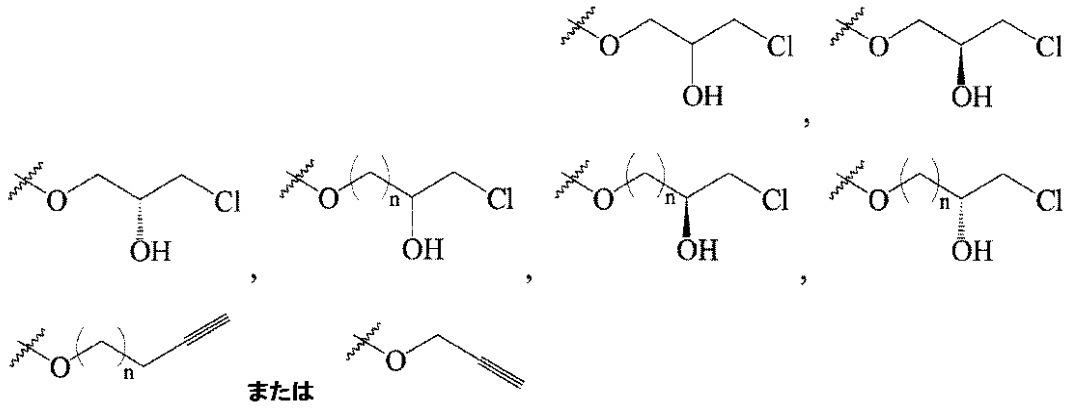
【 化 7 2 8 】



であり得る。Qは、

【 0 8 3 0 】

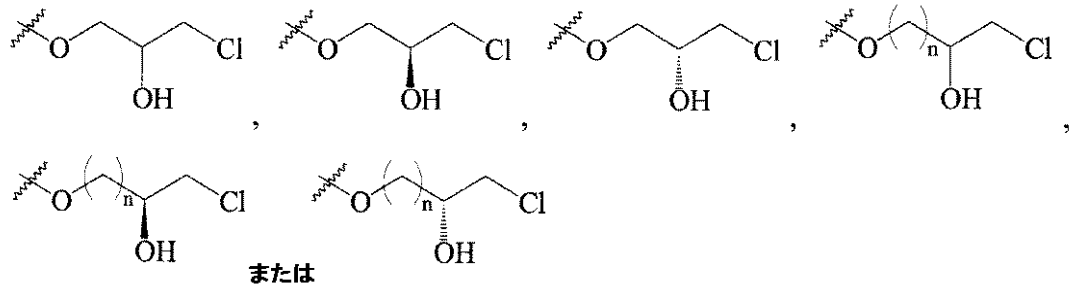
【化729】



10

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、
【0831】

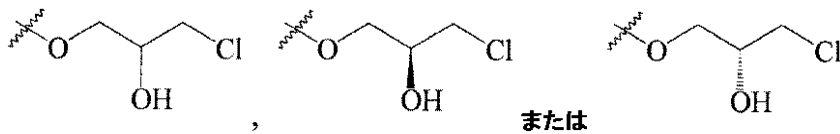
【化730】



20

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、
【0832】

【化731】

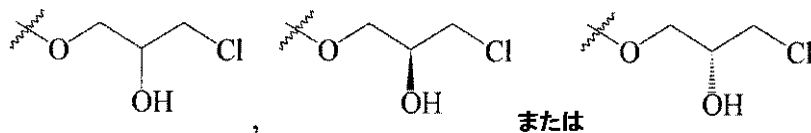


30

であり得る。
【0833】

Tは、

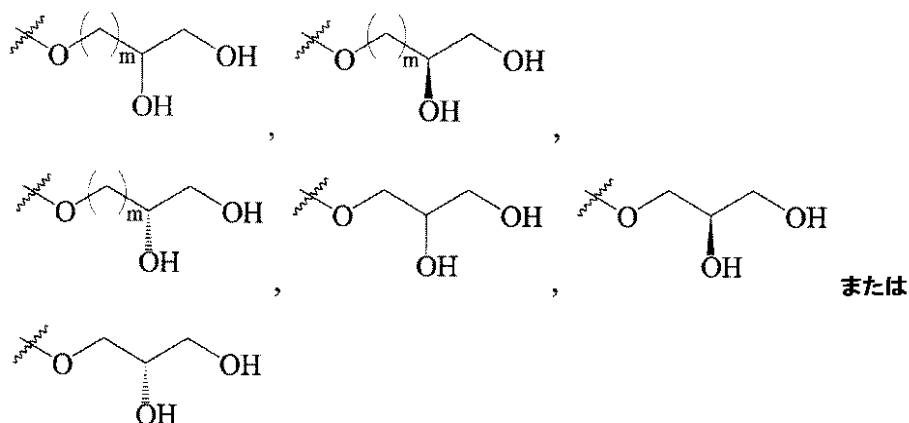
【化732】



40

であり得る。Tは、
【0835】

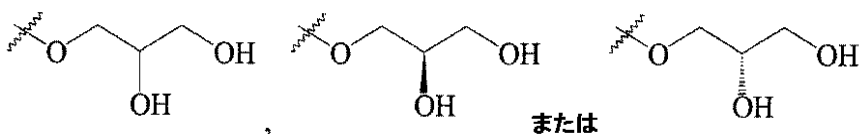
【化733】



であり得、 m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0836】

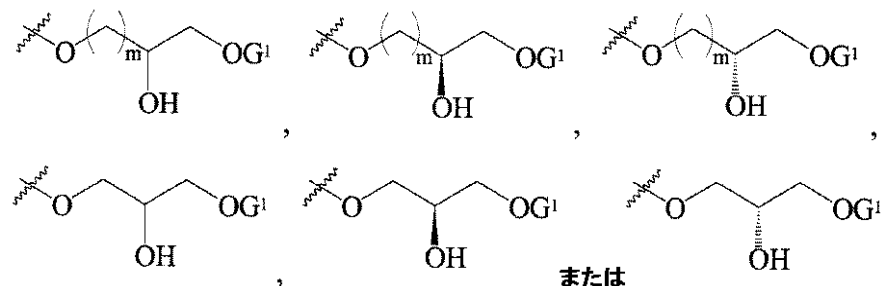
【化734】



であり得る。Tは、

【0837】

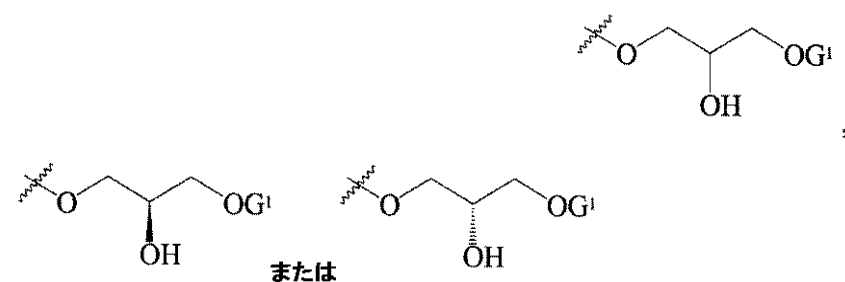
【化735】



であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。Tは、

【0838】

【化736】



であり得、各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'

50

”、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ およびNO₂ からなる群から選択され得る。Tは、

【0839】

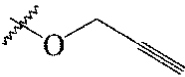
【化737】



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0840】

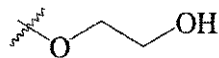
【化738】



であり得る。Tは、

【0841】

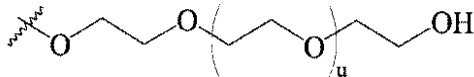
【化739】



であり得る。Tは、

【0842】

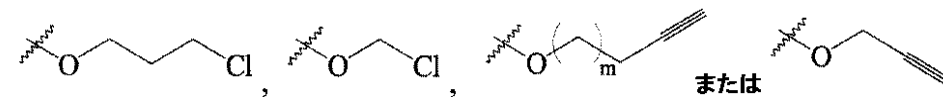
【化740】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Tは、

【0843】

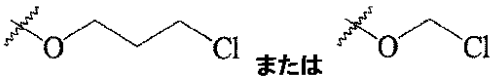
【化741】



であり得、mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Tは、

【0844】

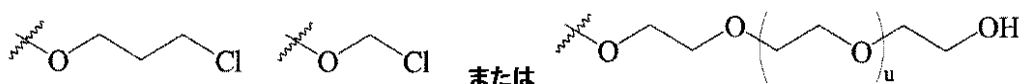
【化742】



であり得る。Tは、

【0845】

【化743】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。

【0846】

Qは、

【0847】

10

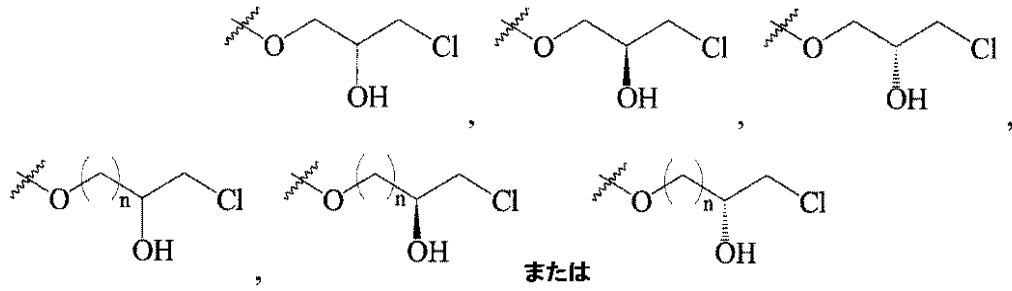
20

30

40

50

【化744】

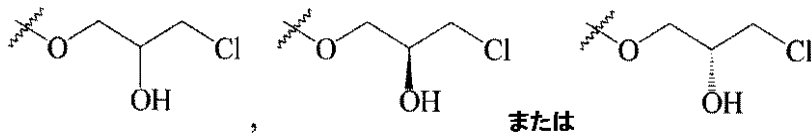


10

であり得、Tは、

【0848】

【化745】

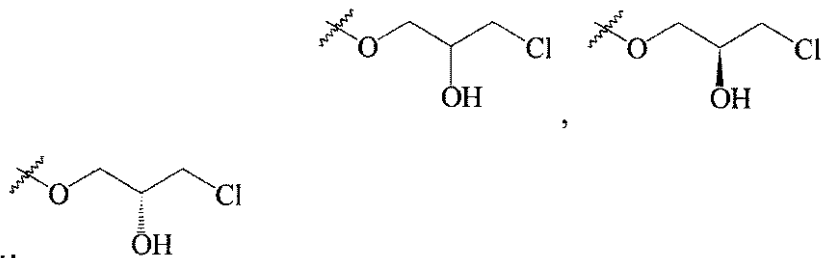


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0849】

20

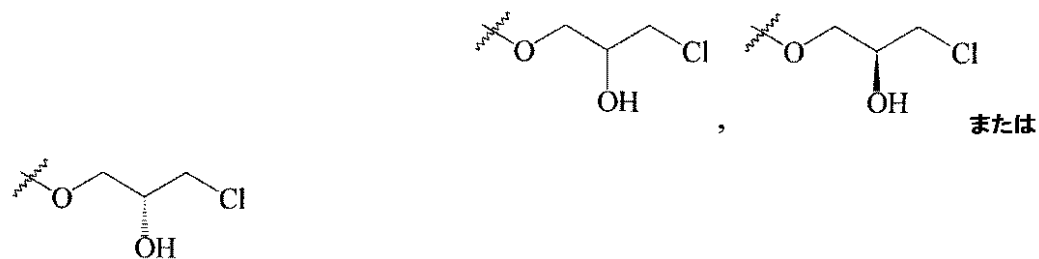
【化746】



であり得、Tは、

【0850】

【化747】



30

であり得る。Qは、

【0851】

【化748】

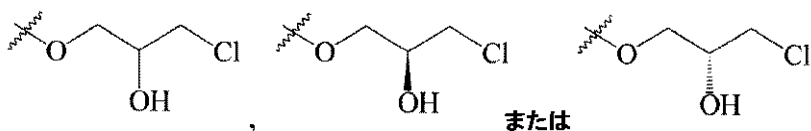


であり得；Tは、

【0852】

40

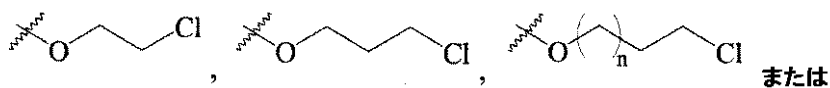
【化749】



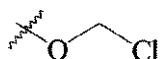
であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7であり得る。Qは、

【0853】

【化750】



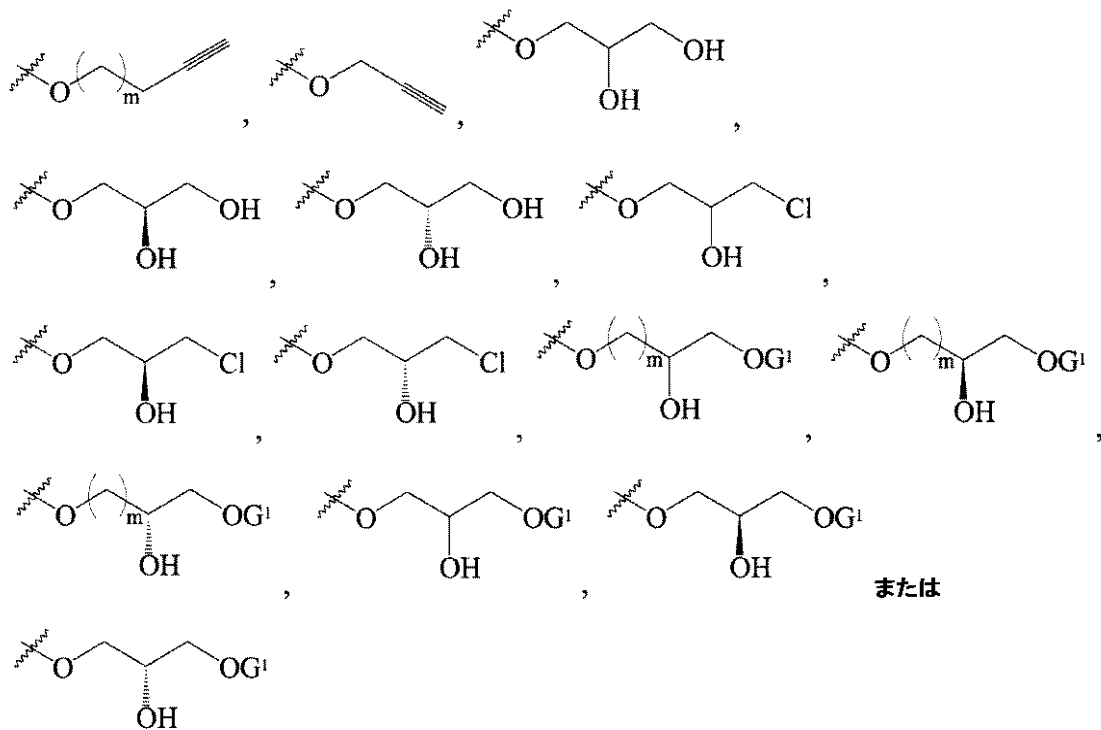
10



であり得；Tは、

【0854】

【化751】



20

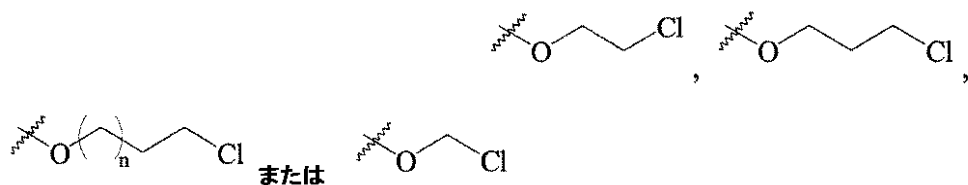
30

40

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

【0855】

【化752】

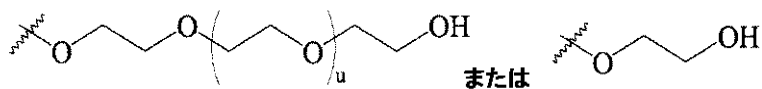


であり得；Tは、

【0856】

【化753】

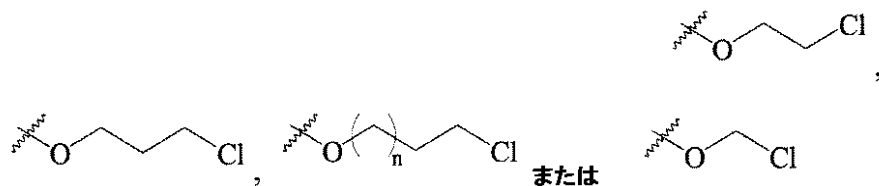
10



であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0857】

【化754】

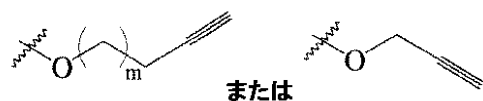


20

であり得；Tは、

【0858】

【化755】

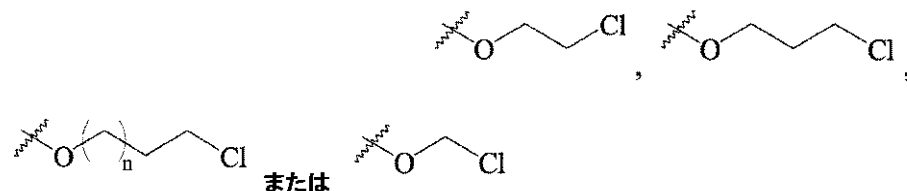


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0859】

【化756】

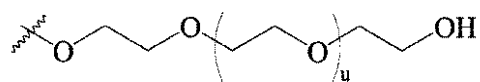


40

であり得；Tは、

【0860】

【化757】

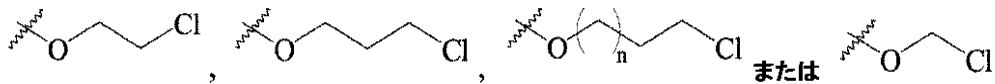


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

50

【0861】

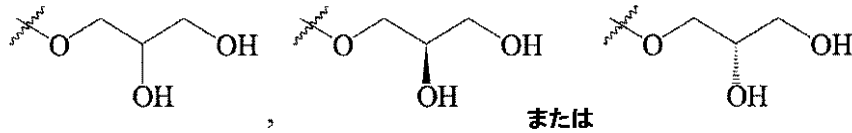
【化758】



であり得；Tは、

【0862】

【化759】

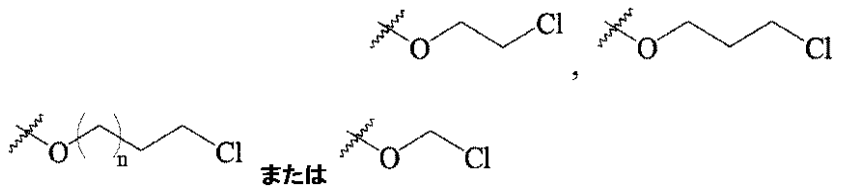


10

であり得、nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0863】

【化760】

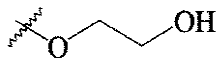


20

であり得；Tは、

【0864】

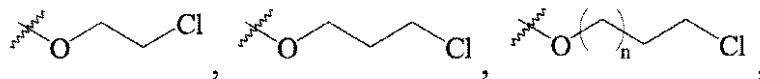
【化761】



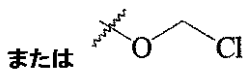
であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0865】

【化762】



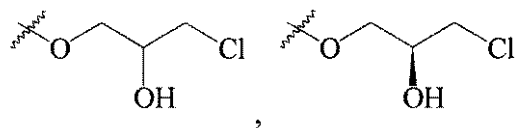
30



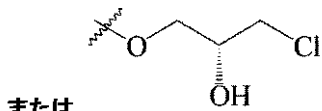
であり得；Tは、

【0866】

【化763】



40

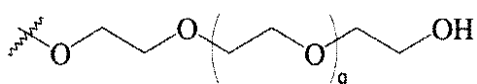


であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

50

【0867】

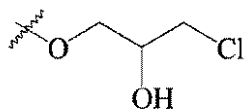
【化764】



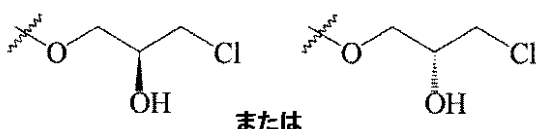
であり得；Tは、

【0868】

【化765】



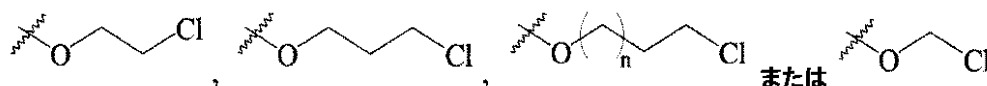
10



であり得、qは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0869】

【化766】

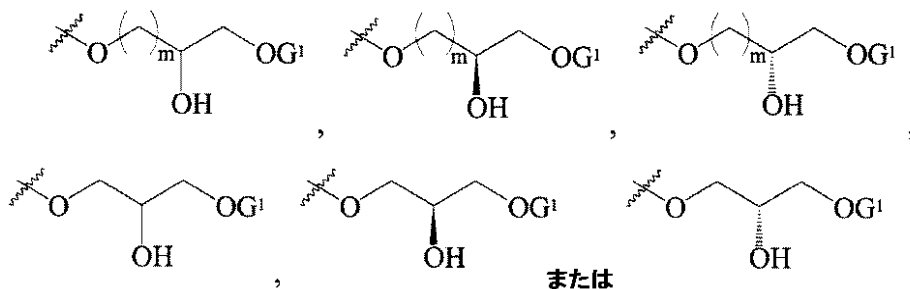


20

であり得；Tは、

【0870】

【化767】



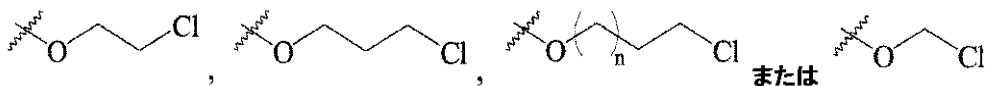
30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

40

【0871】

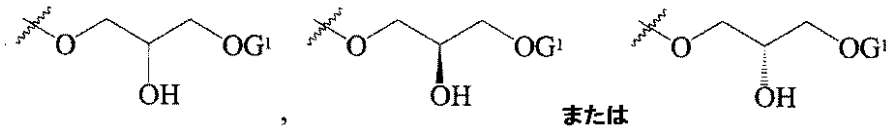
【化768】



であり得；Tは、

【0872】

【化769】



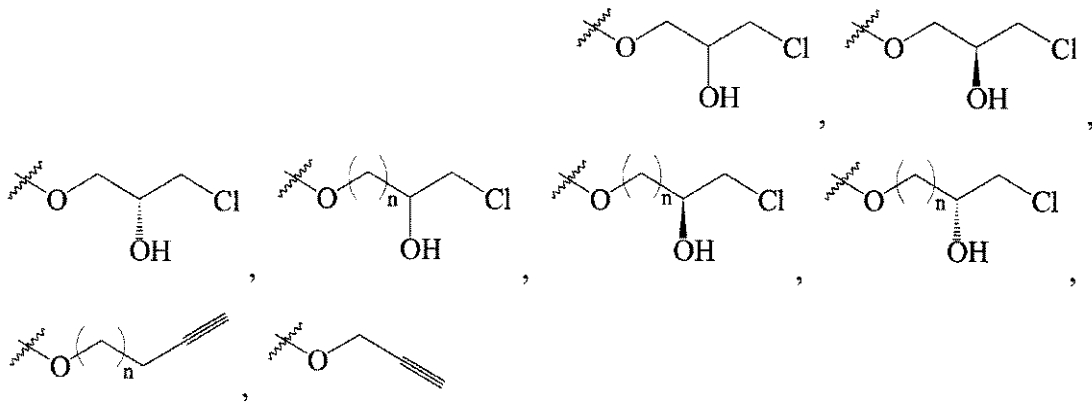
または

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各G¹は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択され得る。Qは、

10

【0873】

【化770】

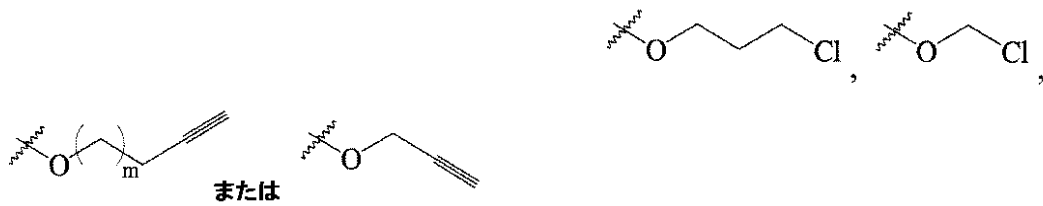


20

であり得；Tは、

【0874】

【化771】

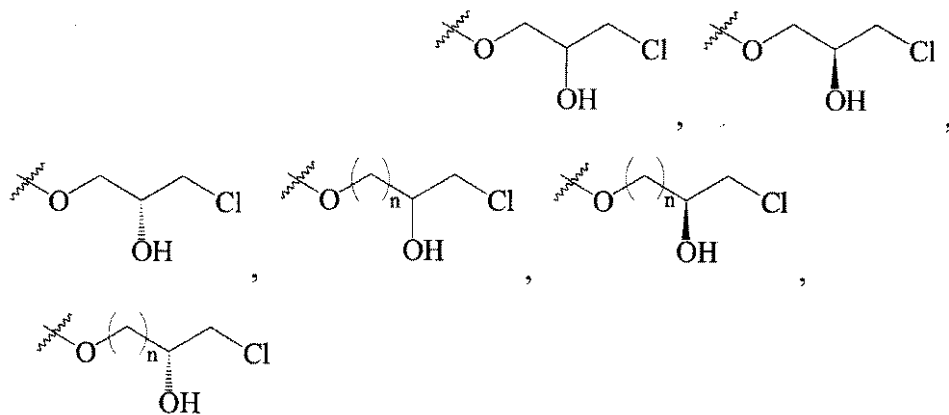


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0875】

【化772】



40

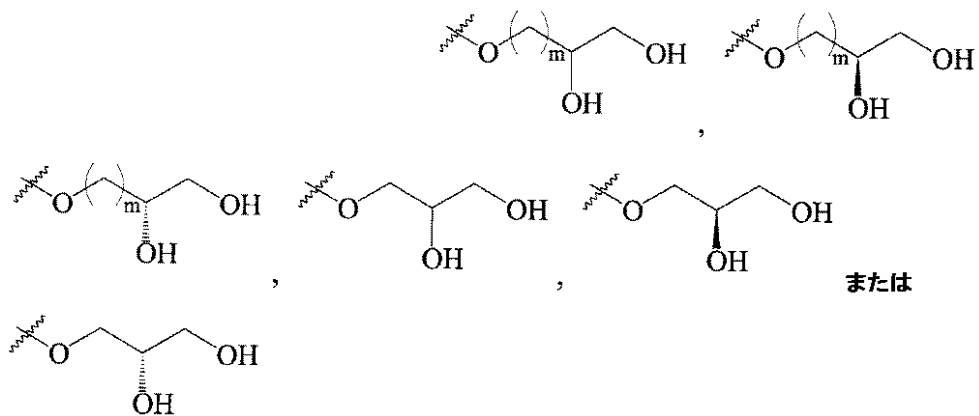
または

50

であり得；Tは、

【0876】

【化773】

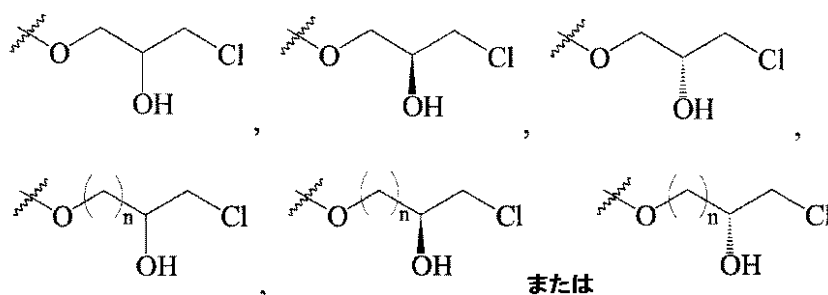


10

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0877】

【化774】



20

であり得；Tは、

【0878】

【化775】

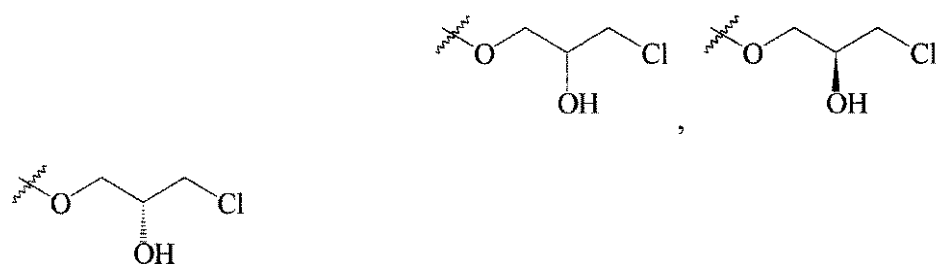


30

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0879】

【化776】



40

であり得；Tは、

【0880】

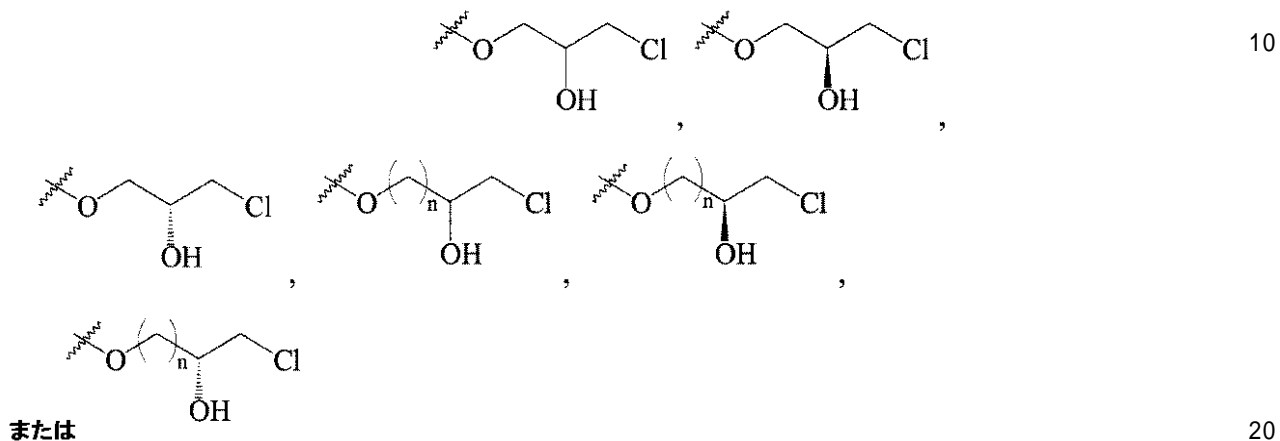
【化777】



であり得；mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0881】

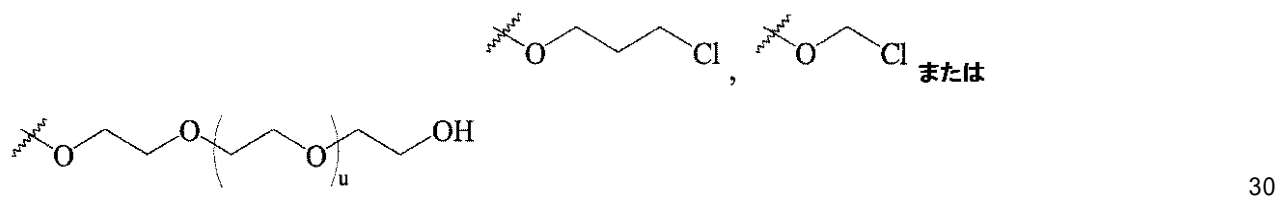
【化778】



であり得；Tは、

【0882】

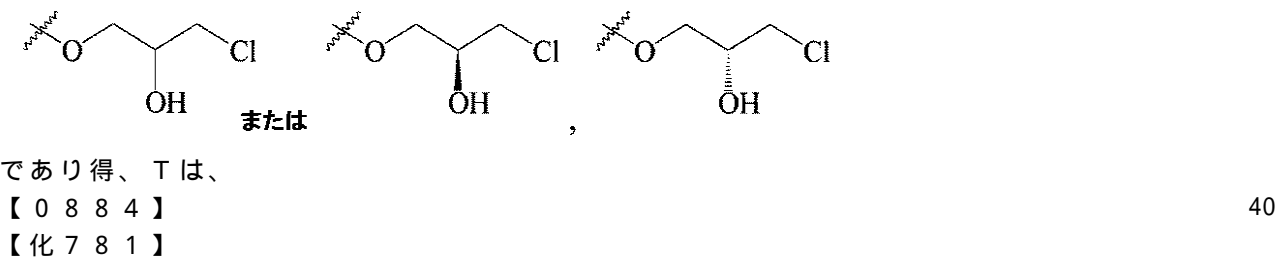
【化779】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0883】

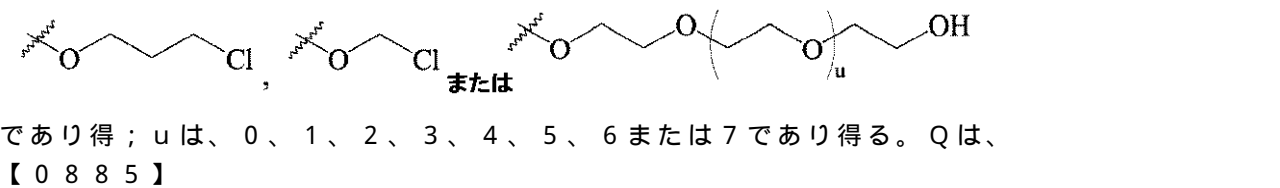
【化780】



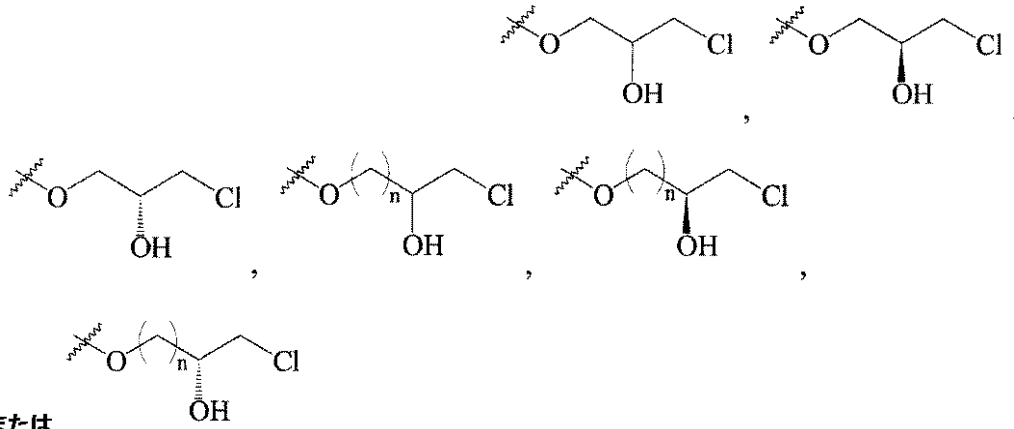
であり得、Tは、

【0884】

【化781】



【化782】

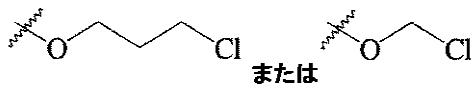


10

であり得；Tは、

【0886】

【化783】

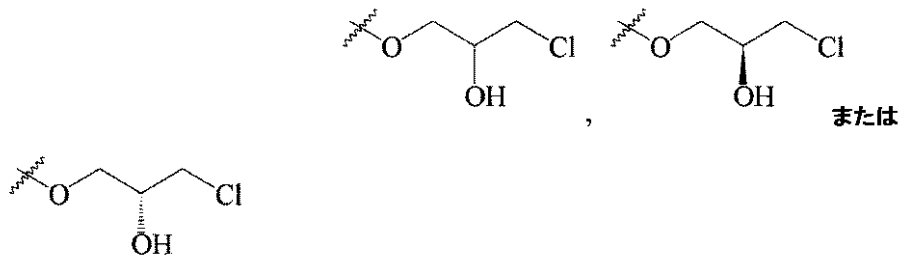


20

であり得；nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得る。Qは、

【0887】

【化784】

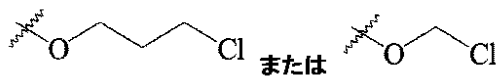


30

であり得；Tは、

【0888】

【化785】

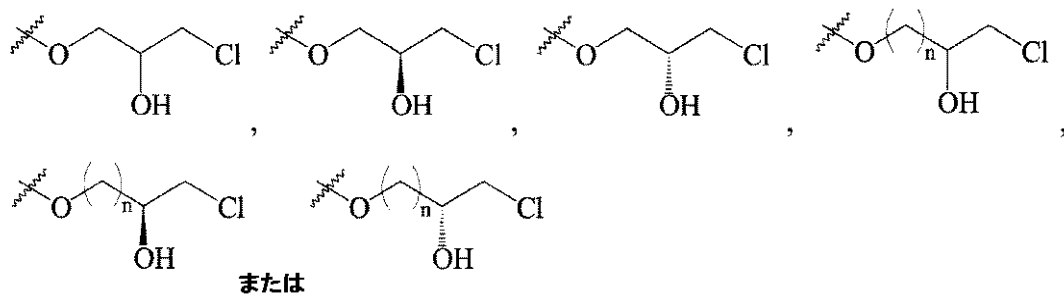


であり得る。Qは、

【0889】

40

【化786】



10

であり得；Tは、

【0890】

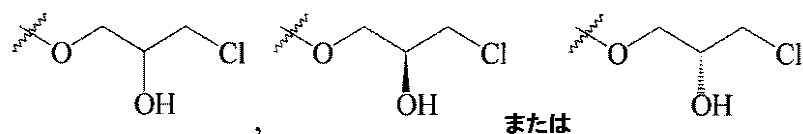
【化787】



であり得；uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0891】

【化788】



20

であり得；Tは、

【0892】

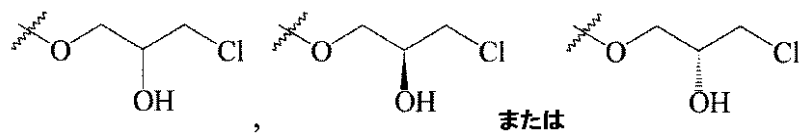
【化789】



であり得、uは、0、1、2、3、4、5、6または7であり得る。Qは、

【0893】

【化790】

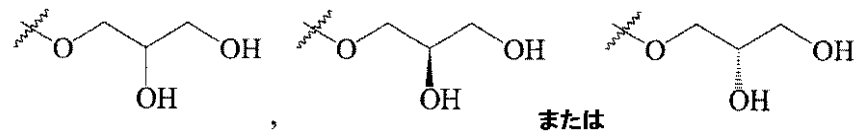


30

であり得、Tは、

【0894】

【化791】

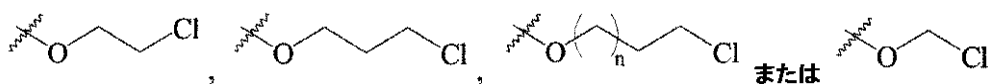


40

であり得る。Qは、

【0895】

【化792】

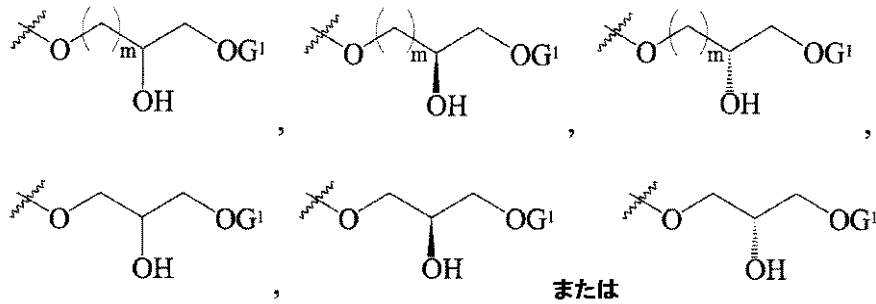


であり得；Tは、

50

【0896】

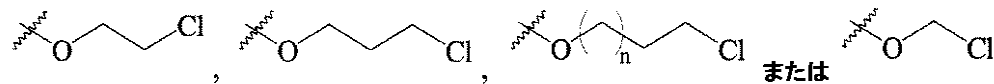
【化793】



であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得； m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。 Q は、

【0897】

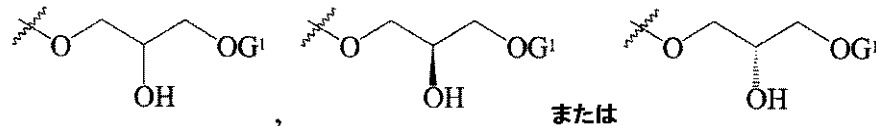
【化794】



であり得； T は、

【0898】

【化795】



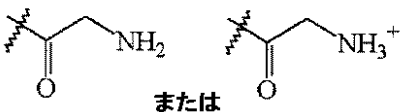
であり得； n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり得；各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり得、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され得る。

【0899】

J および J' の各々は、存在するとき、独立して、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。 J および J' の各々は、存在するとき、独立して、

【0900】

【化796】



であり得る。

【0901】

G^1 、 G^1 および G^1 の各々は、存在するとき、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルである。 G^1 は、存在するとき、シクロヘキシル、 $CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $CH_2C(CH_3)_2$ であり得る。 G^1 は、存在するとき、 $CH_2C(CH_3)_2$ であり得る。

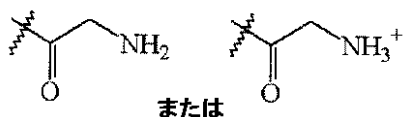
50

【0902】

本化合物のOH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され得る。その表1から選択される部分は、表1から選択されるアミノ酸ベースの部分であり得る。その表1から選択される部分は、

【0903】

【化797】



であり得る。

【0904】

残りのZの各々は、独立して、N; CG¹; CH; CF; CCl; CBr; およびCIから選択され得る。残りの各Zは、独立して、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCG¹であり得る。残りのZの各々は、独立して、CG¹; CH; CCl; およびCBrから選択され得る。残りの各Zは、独立して、CH、CBrまたはCG¹であり得る。残りの各Zは、独立して、CH、CBrまたはCCH₃であり得る。Xに対してメタ位の残りの各Zは、独立して、CBrまたはCG¹であり得る。Xに対してメタ位の残りの各Zは、独立して、CBrまたはCCH₃であり得る。Xに対してオルト位の残りの各Zは、CHであり得る。Xに対してメタ位の残りの各Zは、独立して、CBrまたはCCH₃であり得、Xに対してオルト位の残りの各Zは、CHであり得る。残りの各Zは、CHであり得る。

【0905】

Xは、CH₂であり得る。Xは、CHR¹であり得、R¹は、直鎖状または分枝状の非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得る。R¹は、直鎖状または分枝状の非置換の飽和C₁-C₁₀アルキルであり得る。R¹は、CH₃であり得る。Xは、CR¹R²であり得; R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり得る。R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の非置換の飽和C₁-C₁₀アルキルであり得る。R¹およびR²の各々は、CH₃であり得る。

【0906】

本化合物は、以下:

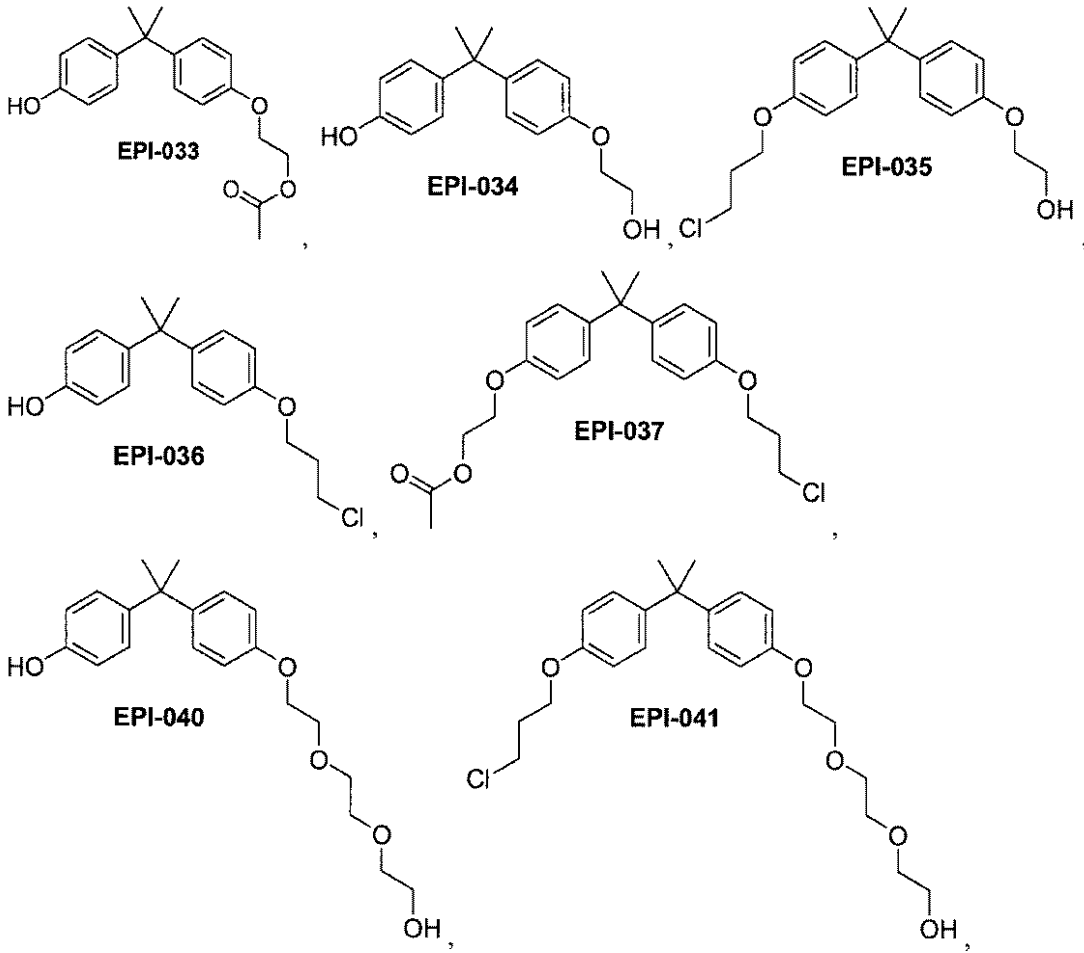
【0907】

10

20

30

【化 7 9 8】

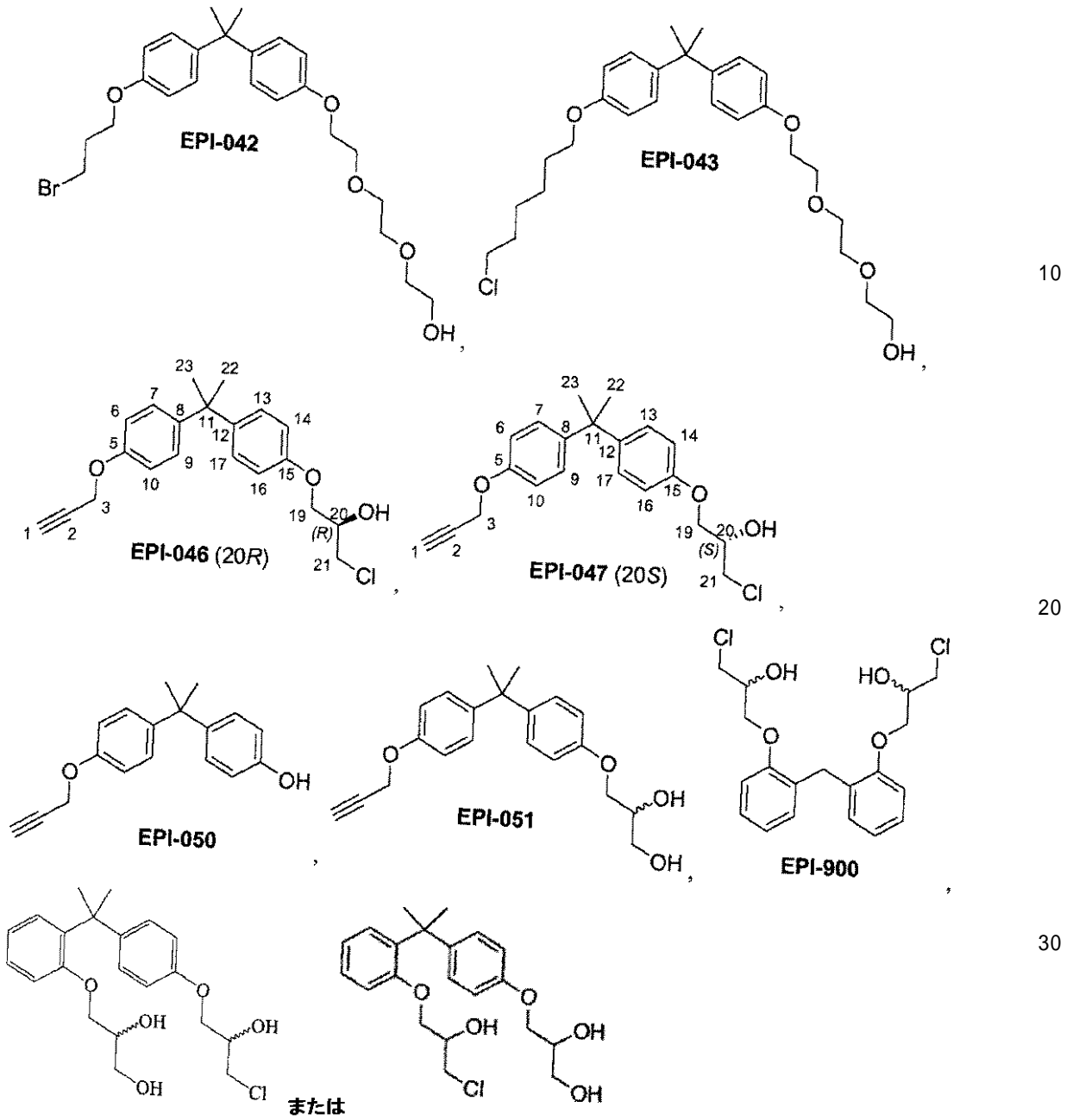


10

20

【 0 9 0 8 】

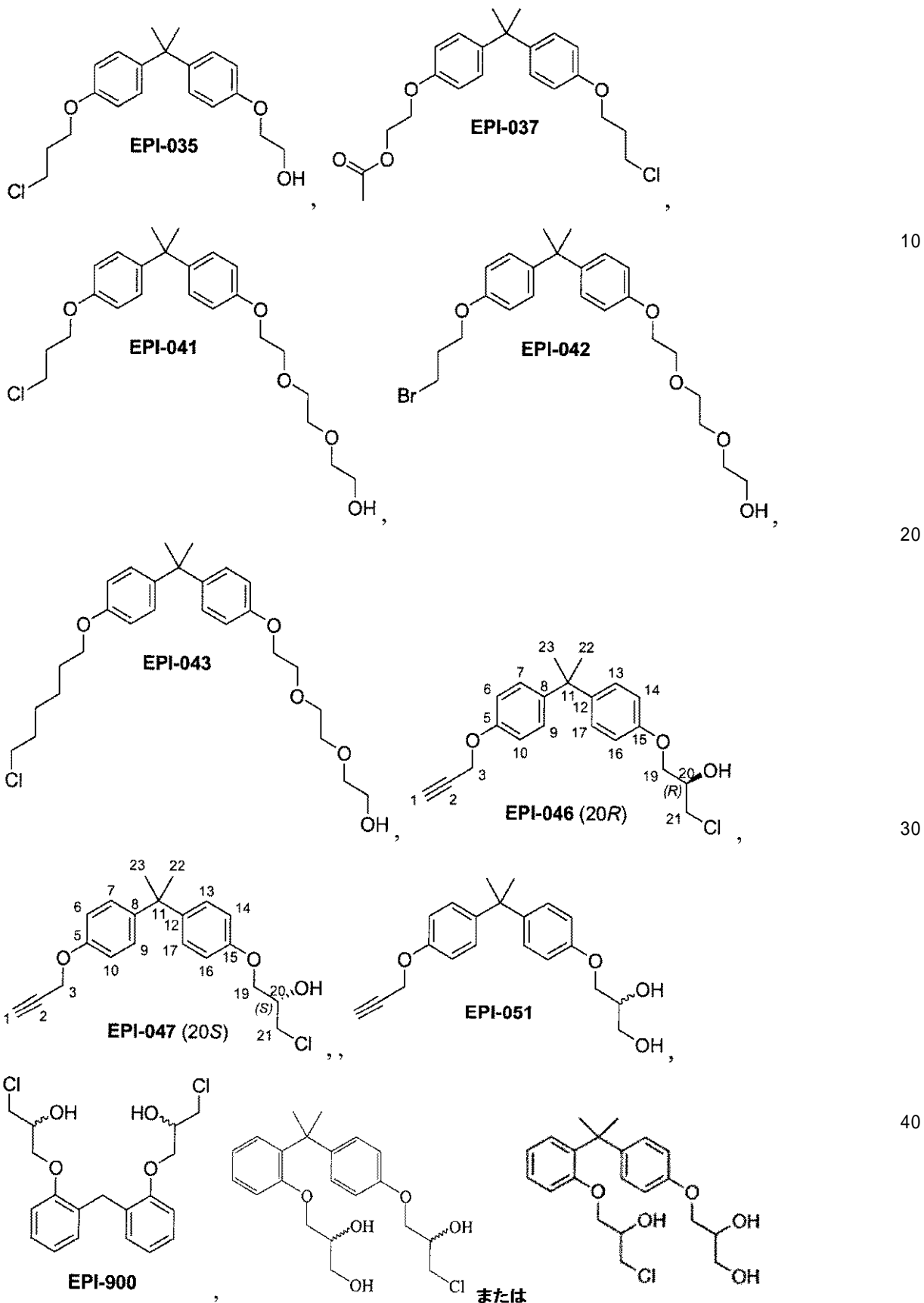
【化799】



のうちの1つ以上から選択され得る。本化合物は、以下：

【0909】

【化 8 0 0】



のうちの1つ以上から選択され得る。本化合物は、表2の化合物の1つ以上から選択され得る。

【0910】

本明細書中に記載される化合物は、本明細書中に示されるか否かに関係なく、すべての

ラセミ混合物およびすべての個別のエナンチオマーまたはそれらの組み合わせを含むと意味される。あるいは、OH基の1つ以上は、そのHを表1から選択される部分で置き換えるように置換され得る。

【0911】

別の実施形態によると、上記化合物のいずれか1つの化合物および薬学的に許容され得る賦形剤を含む薬学的組成物が提供される。その薬学的組成物は、以下：前立腺癌；乳癌；卵巣癌；子宮内膜癌；脱毛；ざ瘡；多毛症；卵巣嚢胞；多嚢胞性卵巣疾患；性的早熟症；および加齢黄斑変性症のうちの1つ以上を処置するためのものであり得る。

【0912】

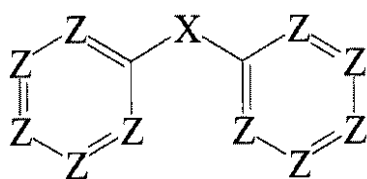
さらなる実施形態によると、アンドロゲンレセプター調節化合物についてスクリーニングする方法が提供され、ここで、スクリーニングされる化合物は、本明細書中のいずれかの箇所に記載されるような化合物から選択される。

例えば、本発明は、以下の項目を提供する。

(項目1)

アンドロゲンレセプター(A R)活性を調節するための、式Iの構造を有する化合物

【化820】



I

またはその薬学的に許容され得る塩の使用であって、

ここで：

Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり；

R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであるか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され；

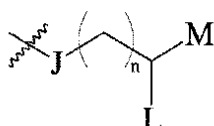
各 R^3 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり；

各 R^6 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり；

一方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Qであり、他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - T、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり、残りの各Zは、独立して、C - T、N、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり；

Qは、

【化821】



10

20

30

40

50

であり；

Jは、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり；

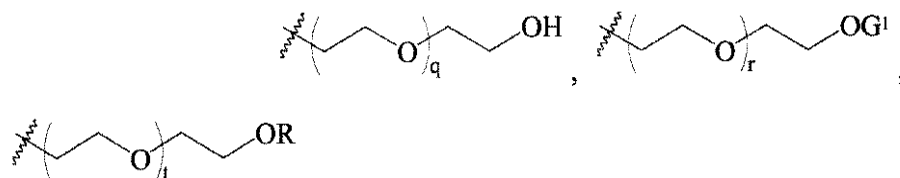
Mは、H、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 またはC—CHであり；

Lは、HまたはA—Dであり；

Aは、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

Dは、H、 G^1 、R、

【化822】



10

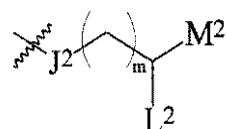
または表1から選択される部分であり；

q、rおよびtの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

Tは、

【化823】



20

であり；

J²は、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NH、 NG^1 、SO、 SO_2 またはNRであり；

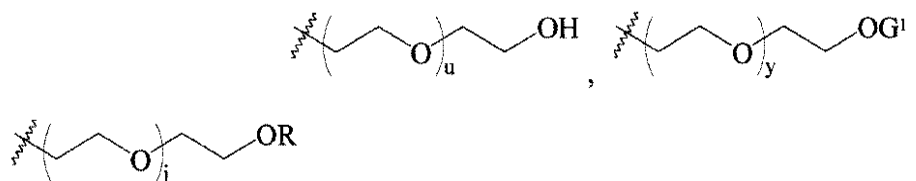
M²は、H、 CH_3 、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ^2 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1$ 、 G^1OG^1 、 $G^1OG^1OG^1$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ またはC—CHであり；

L²は、HまたはA²—D²であり；

A²は、O、S、SO、 SO_2 、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

D²は、H、 G^1 、R、

【化824】



40

または表1から選択される部分であり；

u、yおよびjの各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

mは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

50

J”およびJ’”の各々は、独立して、表1から選択される部分であり；

G^1 、 G^1 ’および G^1 ”の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 ’”、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され；

各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

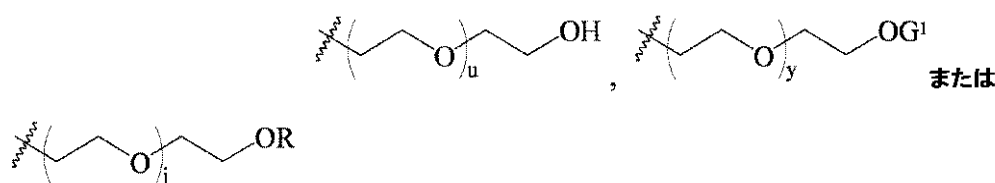
Rは、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

ここで、OH基の1つ以上は、該Hを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換され、

ただし：

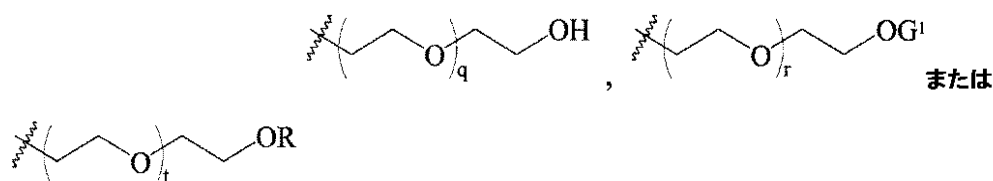
i) 該芳香族環上のXに対してパラ位の1つのZが、C - Qであり；nが、1であり；Jが、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NHまたは NG^1 であり；Lが、A - Dであり；Aが、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；Dが、Hまたは表1から選択される部分であるとき、他方の芳香族環上のXに対してパラ位のZは、N、CH、CF、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CNH_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、C - Tであり、ここで、mが、1であり、 J^2 が、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NHまたは NG^1 であるとき、 L^2 は、Hまたは $A^2 - D^2$ であり、ここで、 A^2 は、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり、 D^2 は、 G^1 、R、

【化825】



またはC - Qであり、ここで、nが、1であり、Jが、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NHまたは NG^1 であるとき、Lは、HまたはA - Dであり、ここで、Aは、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり、Dは、 G^1 、R、

【化826】



であり；

ii) 該芳香族環上のXに対してパラ位の1つのZが、 CG^1 、 COG^1 、 $CNHG^1$ 、 CNG^1_2 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であるとき、他方の芳香族環上のXに対してパラ位のZは、N、CH、CF、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CNH_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、C - Tであり、ここで、mが、1であり、 J^2 が、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、S、NHまたは NG^1 であるとき、 L^2 は、Hまたは $A^2 - D^2$ であり、ここで、 A^2 は、O、S、NH、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり； D^2 は、 G^1 、R、

10

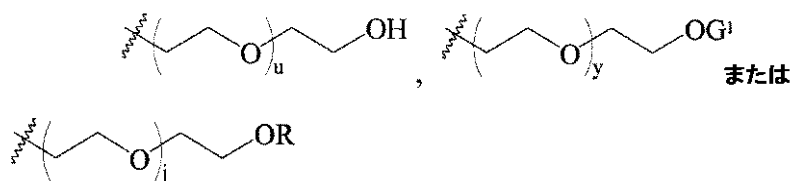
20

30

40

50

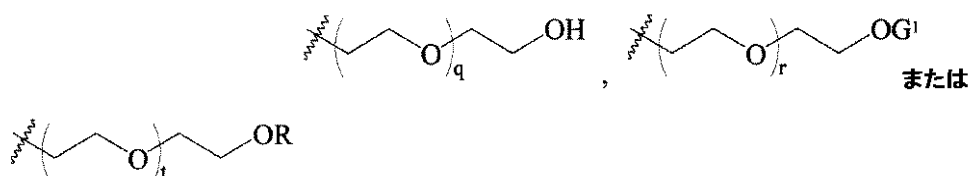
【化 8 2 7】



または C - Q であり、ここで、n が、1 であり、J が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH または NG¹ であるとき、L は、H または A - D であり、ここで、A は、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂ または N⁺HG¹ であり、D は、G¹、R、

10

【化 8 2 8】



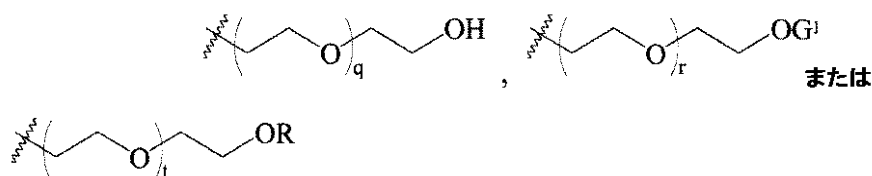
であり；

i i i) 該芳香族環上の X に対してパラ位の 1 つの Z が、C - T であり；m が、1 であり；J² が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH または NG¹ であり；L² が、A² - D² であり；A² が、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂ または N⁺HG¹ であり；D² が、H または表 1 から選択される部分であるとき、他方の芳香族環上の X に対してパラ位の Z は、N、CH、CF、CCl、CBr、CI、COH、CNH₂、COSO₃H、COPO₃H₂、C - Q であり、ここで、n が、1 であり、J が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH または NG¹ であるとき、L は、H または A - D であり、ここで、A は、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂ または N⁺HG¹ であり；D は、G¹、R、

20

30

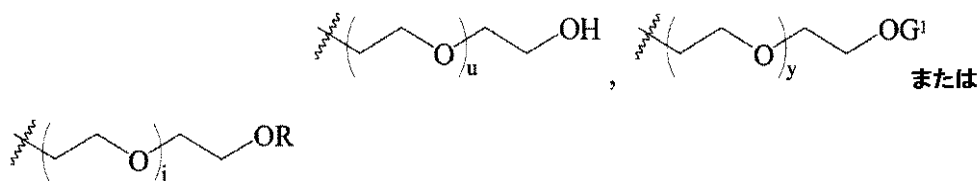
【化 8 2 9】



または C - T であり、ここで、m が、1 であり、J² が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH または NG¹ であるとき、L² は、H または A² - D² であり、ここで、A² は、O、S、NH、NG¹、N⁺H₂ または N⁺HG¹ であり、D² は、G¹、R、

40

【化 8 3 0】



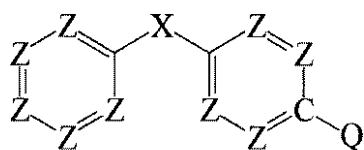
50

である、使用。

(項目2)

前記化合物が、式IIIの構造

【化831】



III

10

を有し、ここで：

Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり；

R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであるか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 COOH 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 CONH_2 、 CONHR^3 、 CONHR^6 、 CONR^3_2 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 CONR^3R^6 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され；

20

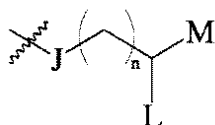
各 R^3 は、独立して、非置換 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり；

各 R^6 は、独立して、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アシルであり；

他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ であり、残りの各Zは、独立して、 $\text{C} - \text{T}$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 CNHG^1 、 CNG^1_2 、 COSO_3H 、 COPO_3H_2 、 CSG^1 、 CSOG^1 または CSO_2G^1 であり；

Qは、

【化832】



30

であり；

Jは、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり；

Mは、 H 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 CHCl_2 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 CHBr_2 、 CBr_3 または $\text{C} - \text{CH}$ であり；

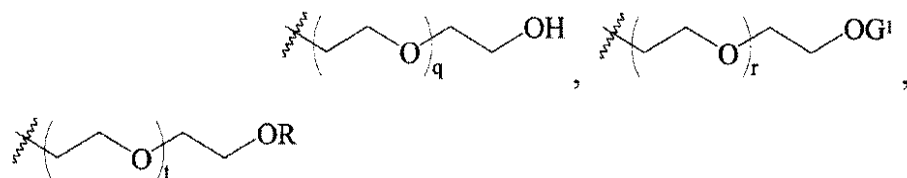
40

Lは、 H または $\text{A} - \text{D}$ であり；

Aは、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

Dは、 H 、 G^1 、 R 、

【化 8 3 3】



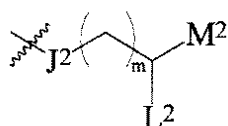
または表 1 から選択される部分であり；

q、r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

T は、

【化 8 3 4】



であり；

J² は、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、S、NH、NG¹、SO、SO₂ または NR であり；

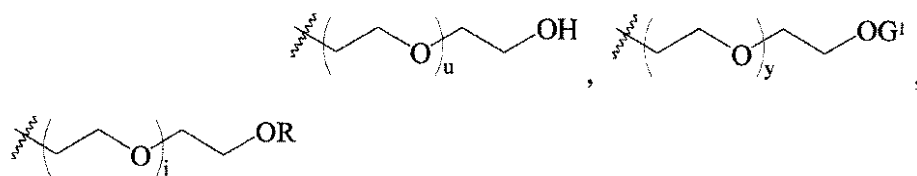
M² は、H、CH₃、Cl、Br、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂Br、C
HBr₂、CBr₃、CH₂OH、CH₂OJ²、G¹、CH₂OG¹、CH₂OR、C
H₂OG¹OG¹'、G¹OG¹'、G¹OG¹'OG¹'、CH₂SG¹、CH₂NH
₂、CH₂NHG¹、CH₂NG¹₂ または C—CH であり；

L² は、H または A²—D² であり；

A² は、O、S、SO、SO₂、NH、NG¹、N⁺H₂ または N⁺HG¹ であり；

D² は、H、G¹、R、

【化 8 3 5】



または表 1 から選択される部分であり；

u、y および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

J² および J²' の各々は、独立して、表 1 から選択される部分であり；

G¹、G¹' および G¹'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状
もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の C₁—C₁₀ アルキルで
あり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ²'、COOH、R⁴、OH、OR⁴、
F、Cl、Br、I、NH₂、NHR⁴、NR⁴₂、CN、SH、SR⁴、SO₃H
、SO₃R⁴、SO₂R⁴、OSO₃R⁴、OR⁵、CO₂R⁴、CONH₂、CONH
R⁴、CONHR⁵、CONR⁴₂、NHR⁵、OPO₃H₃、CONR⁴R⁵、NR⁴
R⁵ および NO₂ からなる群から選択され；

各 R⁴ は、独立して、非置換 C₁—C₁₀ アルキルであり；

10

20

30

40

50

各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

R は、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

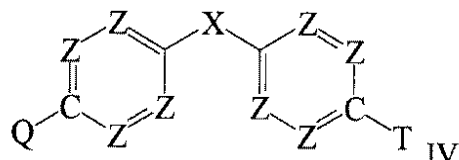
ここで、OH基の1つ以上は、該Hを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、

項目1に記載の使用。

(項目3)

前記化合物が、式IVの構造

【化836】



10

を有し、ここで：

X は、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり；

R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであるか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され；

20

各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

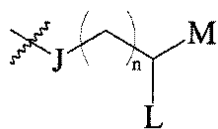
各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

残りの各 Z は、独立して、 $C - T$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 $CNHG^1$ 、 CNG^1_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であり；

30

Q は、

【化837】



であり；

J は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり；

40

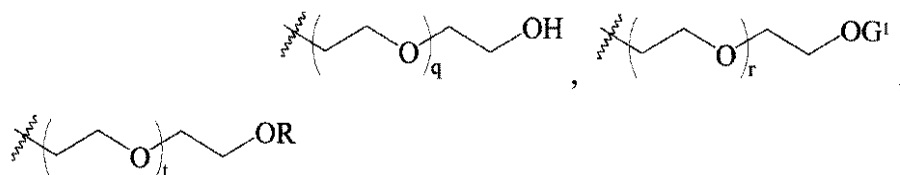
M は、 H 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 または $C - CH$ であり；

L は、 H または $A - D$ であり；

A は、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

D は、 H 、 G^1 、 R 、

【化838】



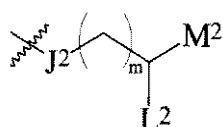
または表1から選択される部分であり；

q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

Tは、

【化839】



であり；

J^2 は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり；

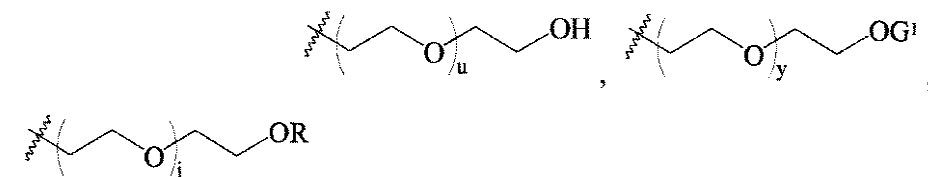
M^2 は、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ'' 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1'$ 、 G^1OG^1' 、 $G^1OG^1'OG^1''$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ または $C-CH$ であり；

L^2 は、 H または $A^2 - D^2$ であり；

A^2 は、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

D^2 は、 H 、 G^1 、 R 、

【化840】



または表1から選択される部分であり；

u 、 y および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

J'' および J''' の各々は、独立して、表1から選択される部分であり；

G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ''' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され；

各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

10

20

30

40

50

Rは、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

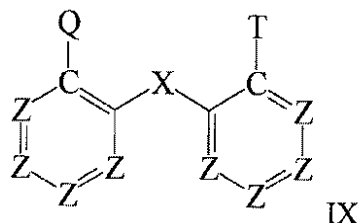
ここで、OH基の1つ以上は、該Hを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、

項目1に記載の使用。

(項目4)

前記化合物が、式IXの構造

【化841】



10

を有し、ここで：

Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり；

R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状の置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであるか、または R^1 および R^2 は、一緒になって、置換もしくは非置換の飽和もしくは不飽和の環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルを形成し、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 $COOH$ 、 R^3 、 OH 、 OR^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^3 、 NR^3_2 、 CN 、 SH 、 SR^3 、 SOR^3 、 SO_3H 、 SO_3R^3 、 SO_2R^3 、 OSO_3R^3 、 OR^6 、 CO_2R^3 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^3$ 、 $CONHR^6$ 、 $CONR^3_2$ 、 NHR^6 、 OPO_3H_3 、 $CONR^3R^6$ 、 NR^3R^6 および NO_2 からなる群から選択され；

20

各 R^3 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

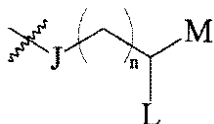
各 R^6 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

残りの各Zは、独立して、 $C - T$ 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI 、 COH 、 CG^1 、 COG^1 、 CNH_2 、 $CNHG^1$ 、 CNG^1_2 、 $COSO_3H$ 、 $COPO_3H_2$ 、 CSG^1 、 $CSOG^1$ または CSO_2G^1 であり；

30

Qは、

【化842】



であり；

Jは、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり；

40

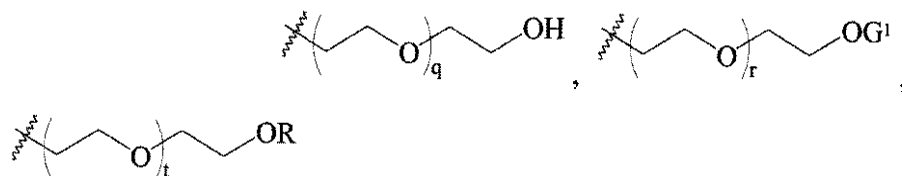
Mは、 H 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 または $C - CH$ であり；

Lは、 H または $A - D$ であり；

Aは、 O 、 S 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

Dは、 H 、 G^1 、 R 、

【化843】



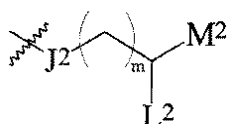
または表1から選択される部分であり；

q 、 r および t の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

T は、

【化844】



であり；

J^2 は、 G^1 、 O 、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、 S 、 NH 、 NG^1 、 SO 、 SO_2 または NR であり；

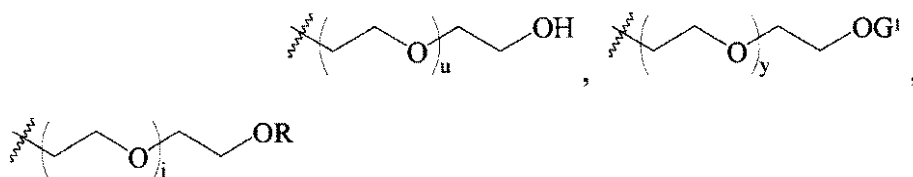
M^2 は、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 CBr_3 、 CH_2OH 、 CH_2OJ'' 、 G^1 、 CH_2OG^1 、 CH_2OR 、 $CH_2OG^1OG^1'$ 、 G^1OG^1' 、 $G^1OG^1'OG^1''$ 、 CH_2SG^1 、 CH_2NH_2 、 CH_2NHG^1 、 $CH_2NG^1_2$ または $C-CH$ であり；

L^2 は、 H または $A^2 - D^2$ であり；

A^2 は、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NG^1 、 N^+H_2 または N^+HG^1 であり；

D^2 は、 H 、 G^1 、 R 、

【化845】



または表1から選択される部分であり；

u 、 y および j の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

J'' および J''' の各々は、独立して、表1から選択される部分であり；

G^1 、 G^1' および G^1'' の各々は、独立して、直鎖状もしくは分枝状または芳香族環状もしくは非芳香族環状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 $COOH$ 、 R^4 、 OH 、 OR^4 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 NHR^4 、 NR^4_2 、 CN 、 SH 、 SR^4 、 SO_3H 、 SO_3R^4 、 SO_2R^4 、 OSO_3R^4 、 OR^5 、 CO_2R^4 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONHR^5$ 、 $CONR^4_2$ 、 NHR^5 、 OPO_3H_3 、 $CONR^4R^5$ 、 NR^4R^5 および NO_2 からなる群から選択され；

各 R^4 は、独立して、非置換 $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

各 R^5 は、独立して、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

10

20

30

40

50

Rは、 $C_1 - C_{10}$ アシルであり；

ここで、OH基の1つ以上は、該Hを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、

項目1に記載の使用。

(項目5)

Jが、 G^1 、O、 CH_2 、 CHG^1 、 CG^1_2 、NH、SOまたはNRである、項目1から4のいずれか1項に記載の使用。

(項目6)

Jが、Oである、項目1から4のいずれか1項に記載の使用。

(項目7)

Mが、Cl、Br、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2Br 、 $CHBr_2$ 、 $CB r_3$ またはC—CHである、項目1から6のいずれか1項に記載の使用。

(項目8)

Mが、 CH_2Cl 、 CH_2Br またはC—CHである、項目1から6のいずれか1項に記載の使用。

(項目9)

Mが、 CH_2Cl である、項目1から6のいずれか1項に記載の使用。

(項目10)

Mが、C—CHである、項目1から6のいずれか1項に記載の使用。

(項目11)

Mが、Hである、項目1から6のいずれか1項に記載の使用。

(項目12)

Lが、Hである、項目1から11のいずれか1項に記載の使用。

(項目13)

Lが、A—Dである、項目1から11のいずれか1項に記載の使用。

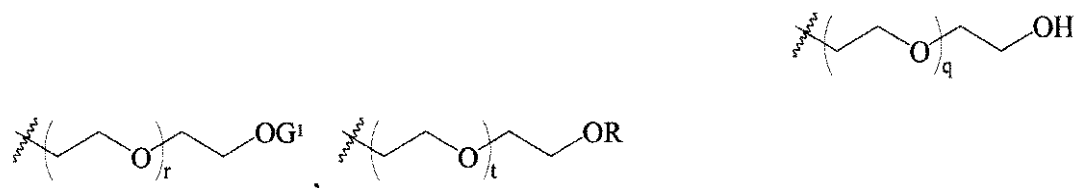
(項目14)

Aが、Oである、項目13に記載の使用。

(項目15)

Dが、H、R、

【化846】



または表1から選択される部分であり；q、rおよびtの各々が、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目13または14に記載の使用。

(項目16)

Dが、Hである、項目13または14に記載の使用。

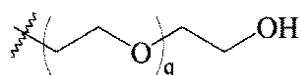
(項目17)

Dが、Rである、項目13または14に記載の使用。

(項目18)

Dが、

【化847】



10

20

30

40

50

であり、q が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、項目 13 または 14 に記載の使用。

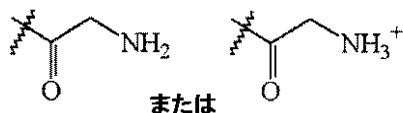
(項目 19)

D が、表 1 から選択される部分である、項目 13 または 14 に記載の使用。

(項目 20)

表 1 から選択される前記部分が、

【化 848】



10

である、項目 19 に記載の使用。

(項目 21)

n が、0 である、項目 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 22)

n が、1、2、3、4 または 5 である、項目 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 23)

n が、1 である、項目 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の使用。

20

(項目 24)

J² が、G¹、O、CH₂、CHG¹、CG¹₂、NH、SO または NR である、項目 1 から 23 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 25)

J² が、O である、項目 1 から 23 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 26)

M² が、H、CH₂Cl、CH₂OH、CH₂OJⁿ、CH₂OG¹ または C—CH である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 27)

M² が、CH₂Cl である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

30

(項目 28)

M² が、CH₂OG¹ である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 29)

M² が、CH₂OJⁿ である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 30)

M² が、CH₂OH である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 31)

M² が、H である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 32)

M² が、C—CH である、項目 1 から 25 のいずれか 1 項に記載の使用。

40

(項目 33)

L² が、H である、項目 1 から 32 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 34)

L² が、A² - D² である、項目 1 から 32 のいずれか 1 項に記載の使用。

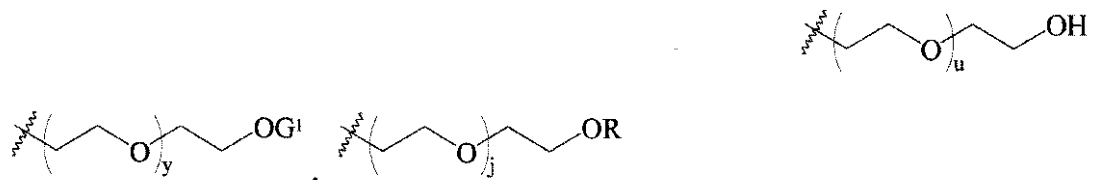
(項目 35)

A² が、O である、項目 34 に記載の使用。

(項目 36)

D² が、H、R、

【化 8 4 9】



または表 1 から選択される部分であり； u 、 y および j の各々が、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、項目 3 4 または 3 5 に記載の使用。

10

(項目 3 7)

D^2 が、H である、項目 3 4 または 3 5 に記載の使用。

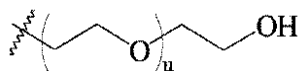
(項目 3 8)

D^2 が、R である、項目 3 4 または 3 5 に記載の使用。

(項目 3 9)

D^2 が、

【化 8 5 0】



20

であり、 u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、項目 3 4 または 3 5 に記載の使用。

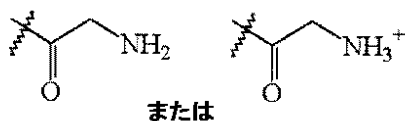
(項目 4 0)

D^2 が、表 1 から選択される部分である、項目 3 4 または 3 5 に記載の使用。

(項目 4 1)

表 1 から選択される前記部分が、

【化 8 5 1】



30

である、項目 4 0 に記載の使用。

(項目 4 2)

m が、0 である、項目 1 から 4 1 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 4 3)

m が、1、2、3、4 または 5 である、項目 1 から 4 1 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 4 4)

40

m が、1 である、項目 1 から 4 1 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 4 5)

M が、C-CH であり； M^2 が、CH₂Cl であり； L が、H である、項目 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 4 6)

L^2 が、H である、項目 4 5 に記載の使用。

(項目 4 7)

L^2 が、A²-D² であり；A² が、O であり；D² が、H である、項目 4 5 に記載の使用。

(項目 4 8)

50

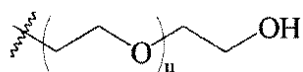
n が、0 である、項目 4 5 から 4 7 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 4 9)

M が、 CH_2Cl であり；L が、H であり； M^2 が、H、 CH_2OH 、 CH_2OG^1 または CH_2Cl である、項目 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 0)

L^2 が、 $A^2 - D^2$ であり； A^2 が、O であり； D^2 が、H または
【化 8 5 2】



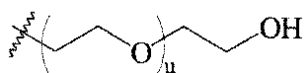
10

であり、u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、項目 4 9 に記載の使用。

(項目 5 1)

M が、 CH_2Cl であり；L が、A - D であり；A が、O であり；D が、H であり； M^2 が、H であり； L^2 が、 $A^2 - D^2$ であり； A^2 が、O であり； D^2 が、

【化 8 5 3】



20

であり、u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 である、項目 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 2)

n が、1、2、3、4 または 5 である、項目 4 9 から 5 1 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 3)

m が、1、2、3、4 または 5 である、項目 4 5 から 5 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

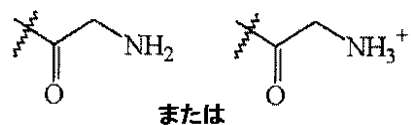
(項目 5 4)

J が、O であり、 J^2 が、O である、項目 4 5 から 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 5)

J'' および J'' の各々が、存在するとき、独立して、

【化 8 5 4】



30

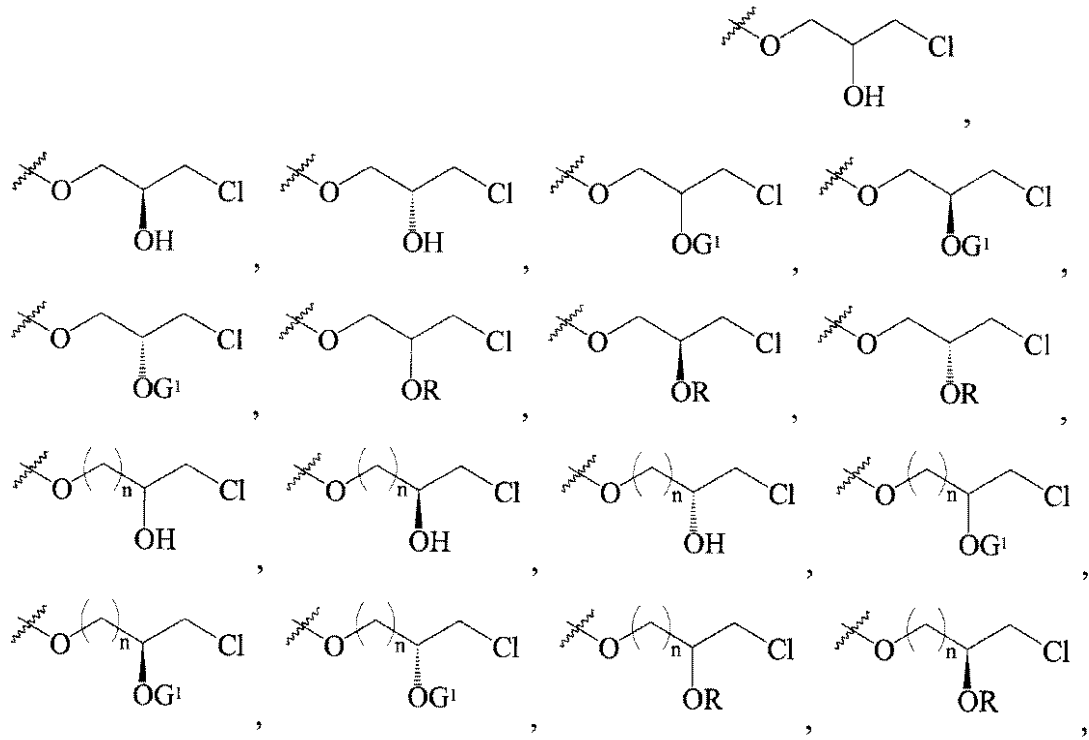
である、項目 1 から 5 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 5 6)

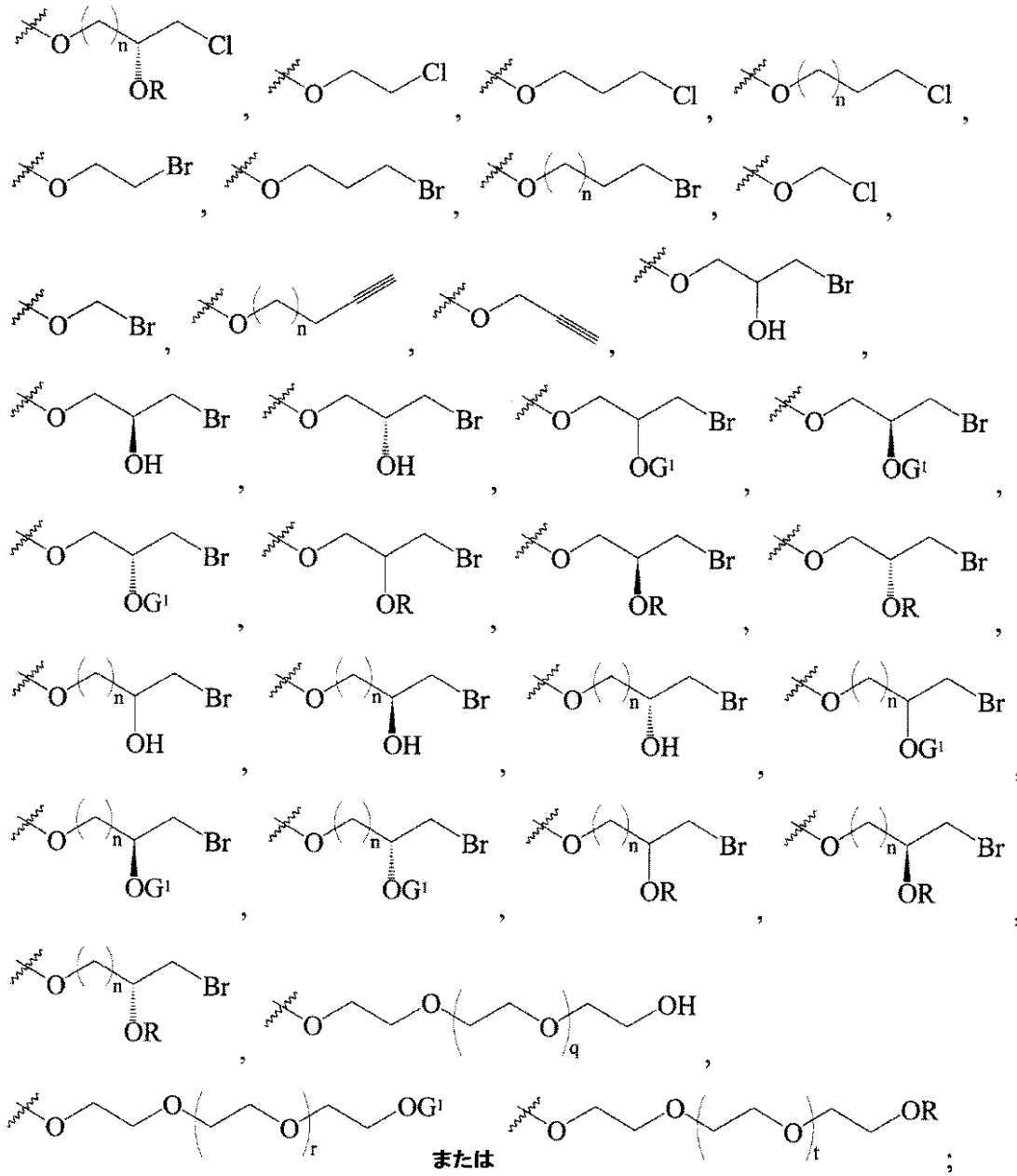
Q が、

40

【化 8 5 5】

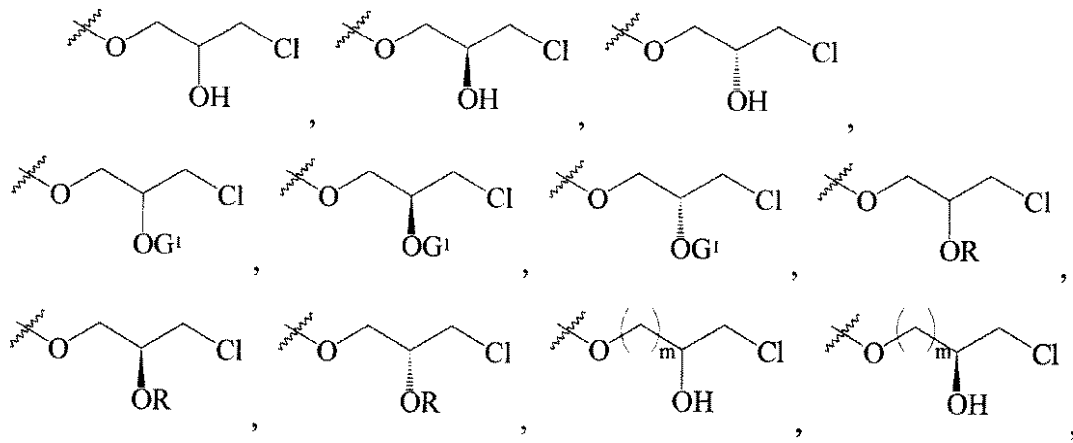


【化 8 5 6】

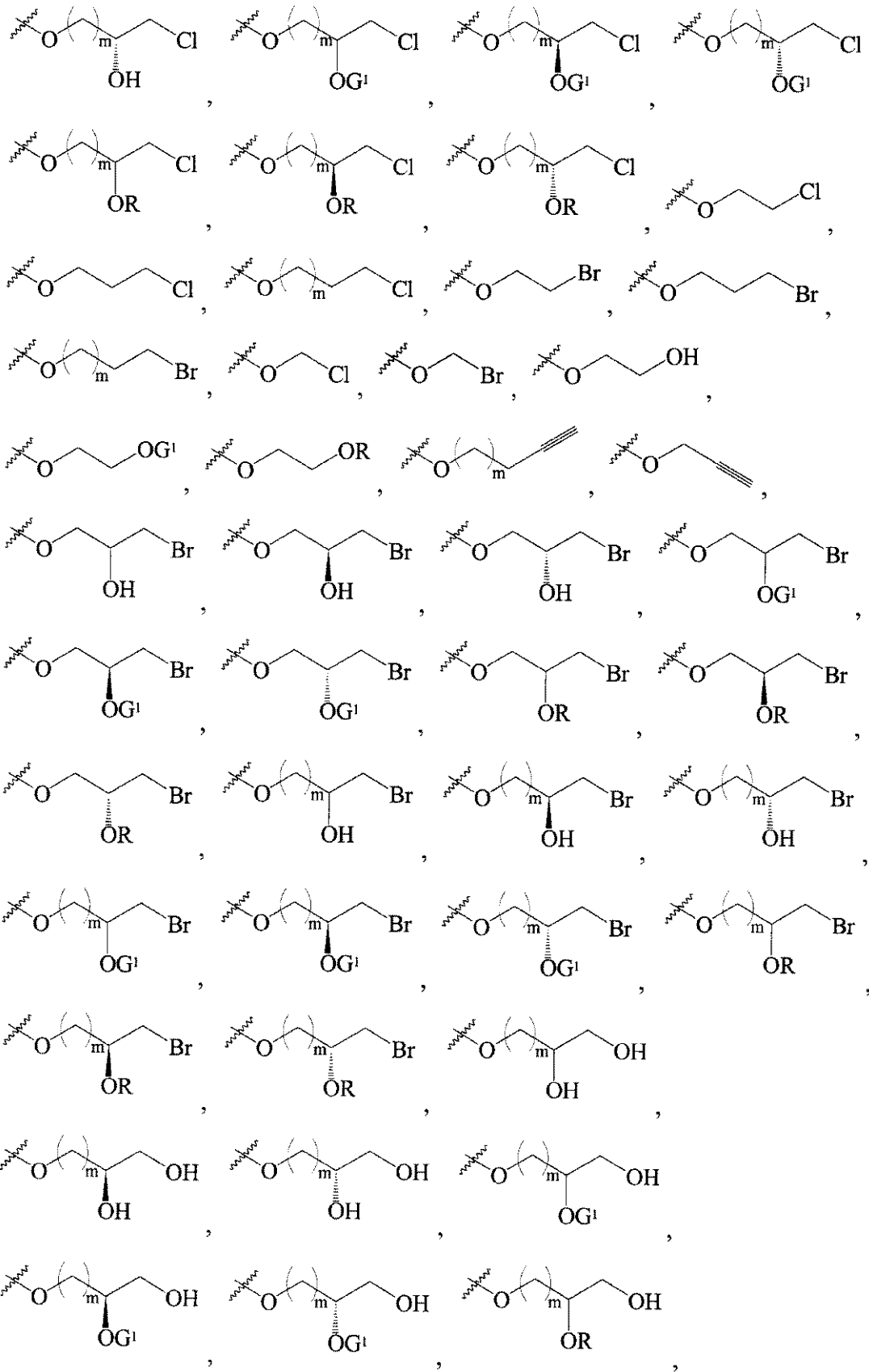


であり；
 Tが、

【化 8 5 7】



【化 8 5 8】



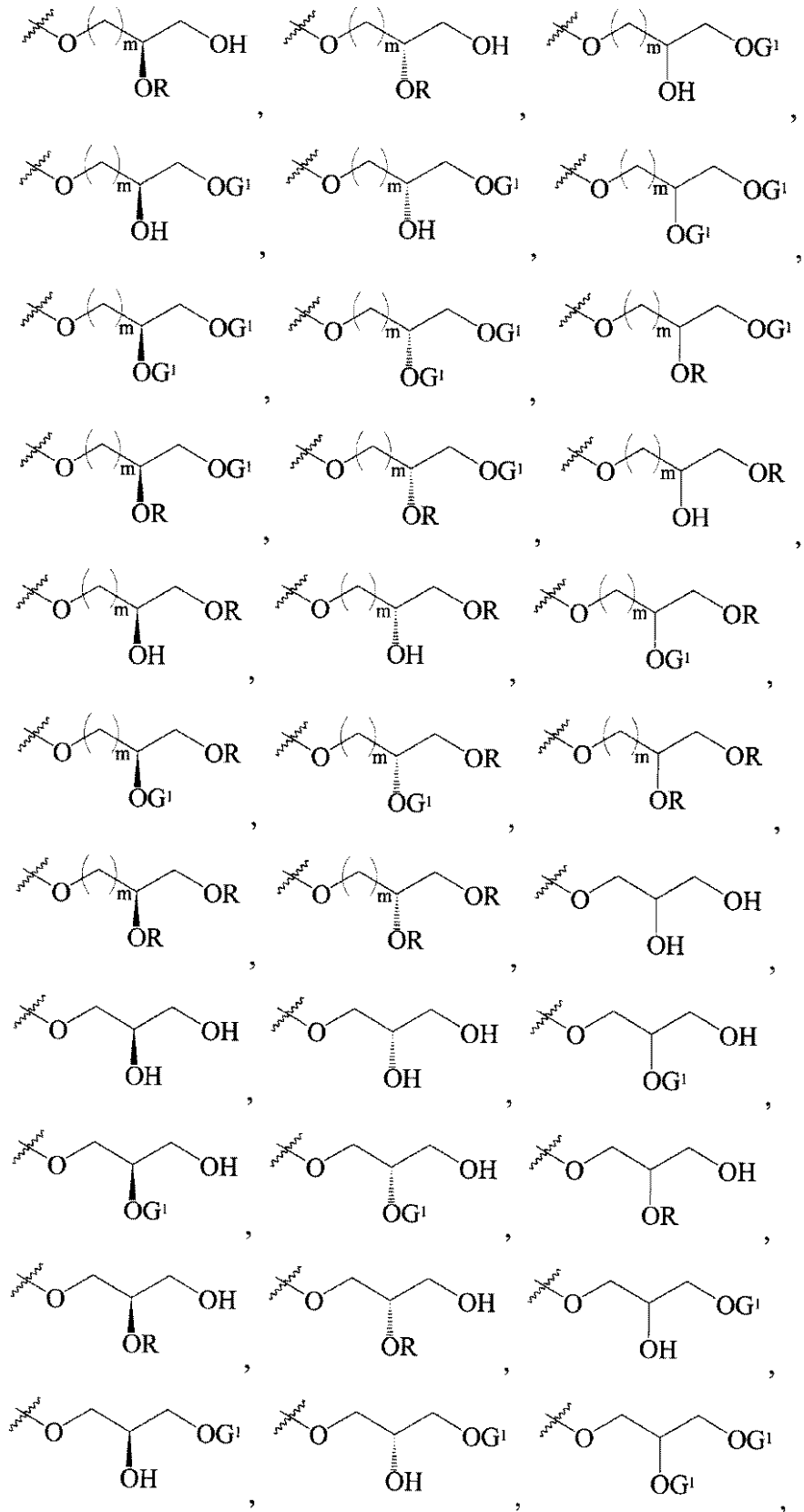
10

20

30

40

【化 8 5 9】



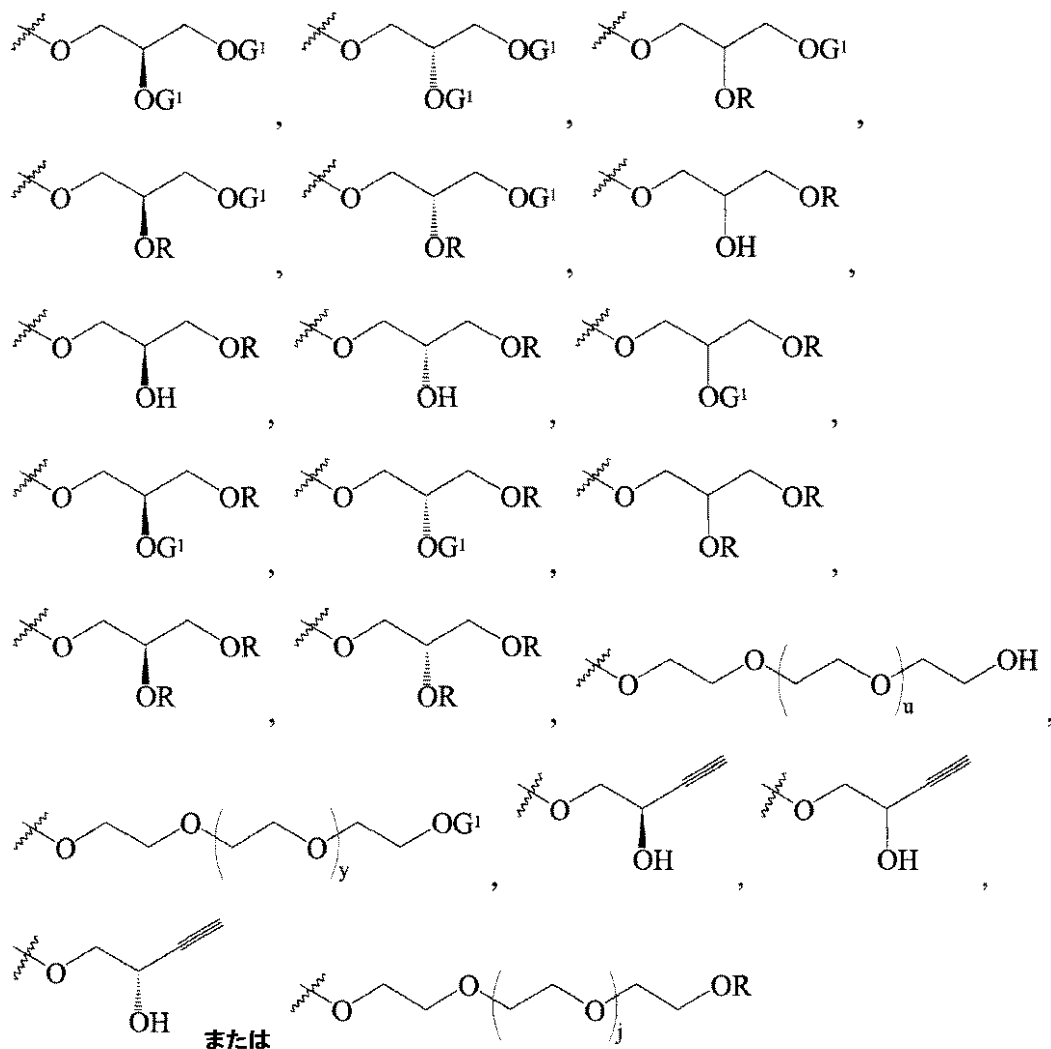
10

20

30

40

【化 8 6 0】



10

20

30

であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

q 、 r および t の各々が、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

m が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

u 、 j および y の各々が、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

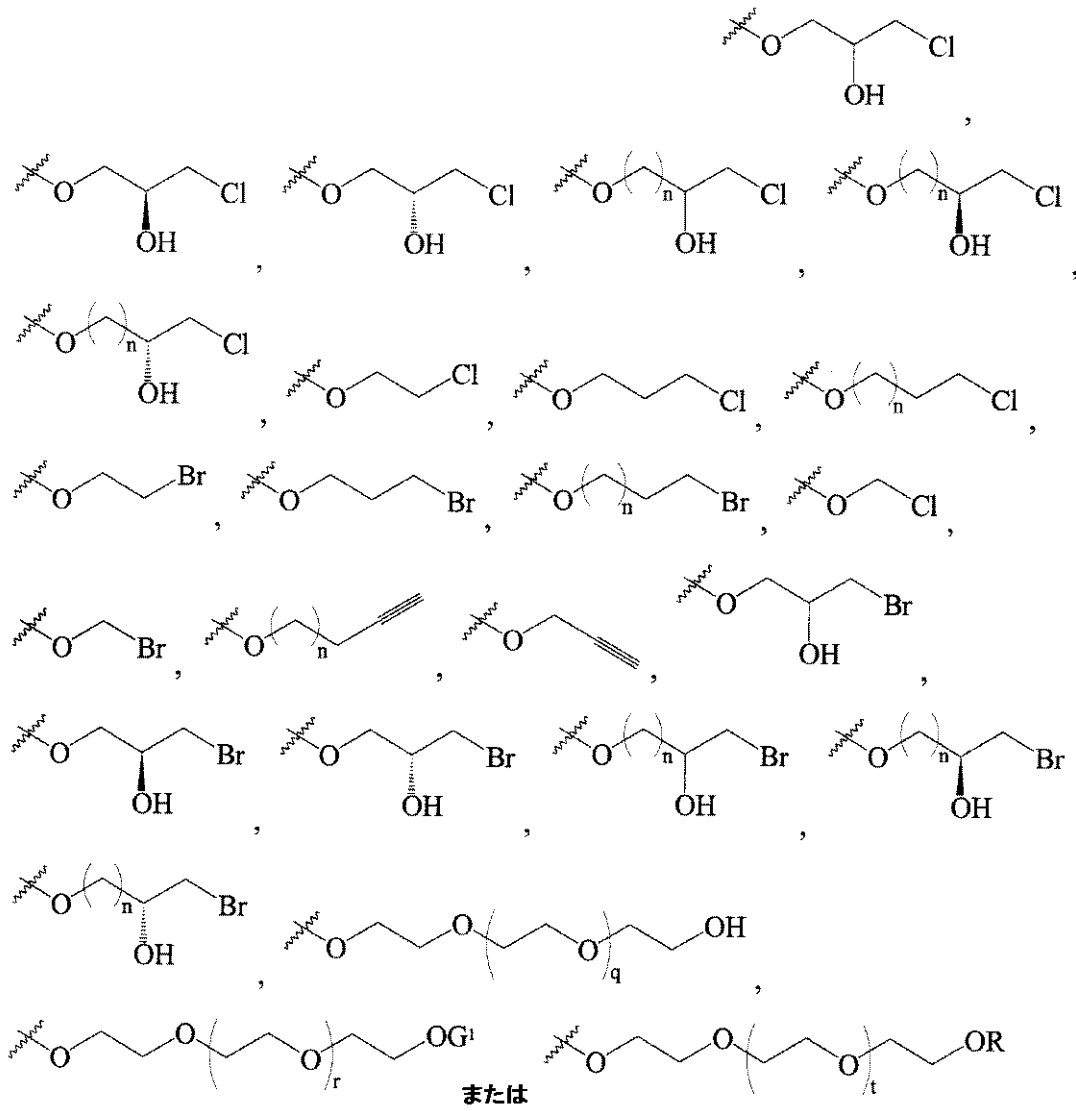
各 G^1 が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_1 - C_{10} アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択される、項目2、3または4に記載の使用。

(項目57)

Q が、

40

【化 8 6 1】



10

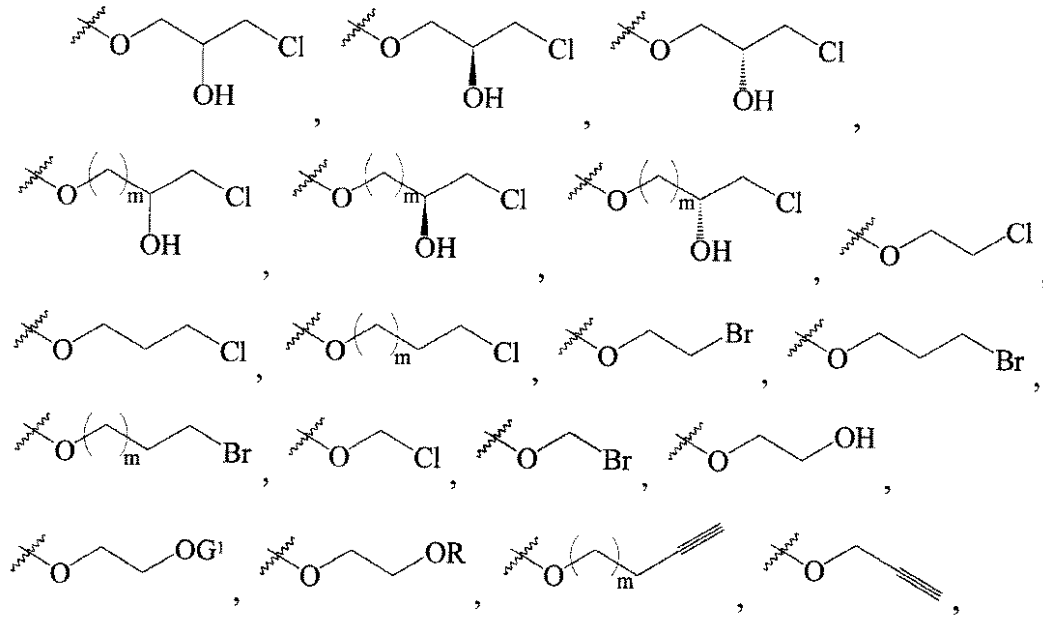
20

30

または

であり；
Tが、

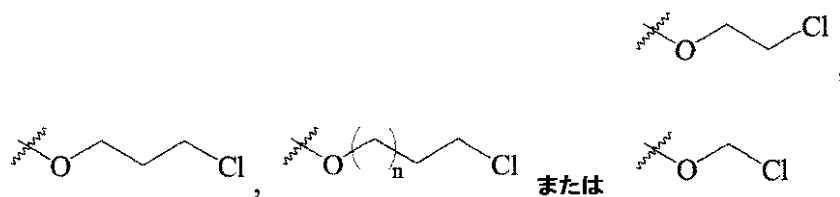
【化 8 6 2】



(項目58)

Qが、

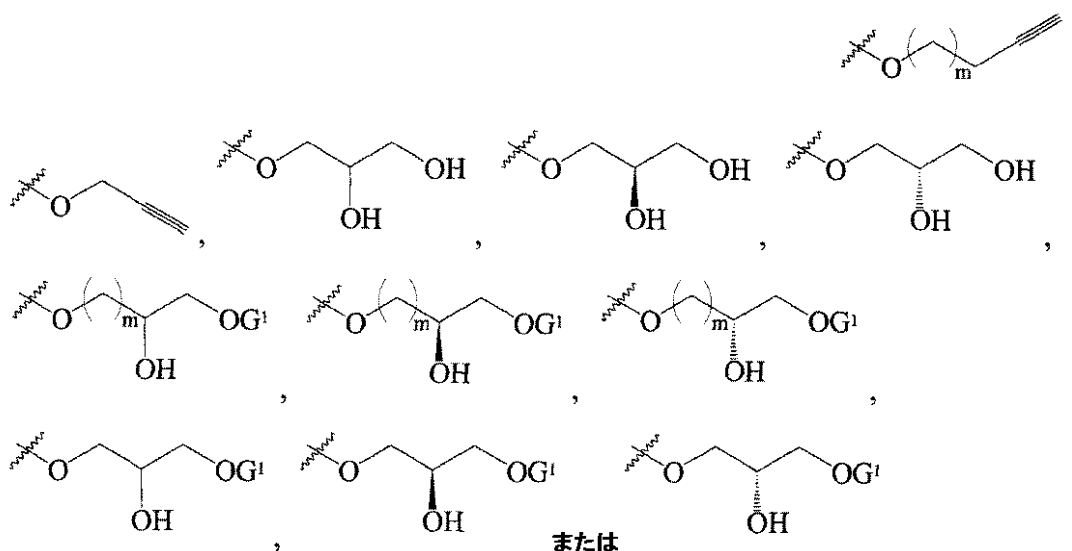
【化864】



10

であり；Tが、

【化865】



20

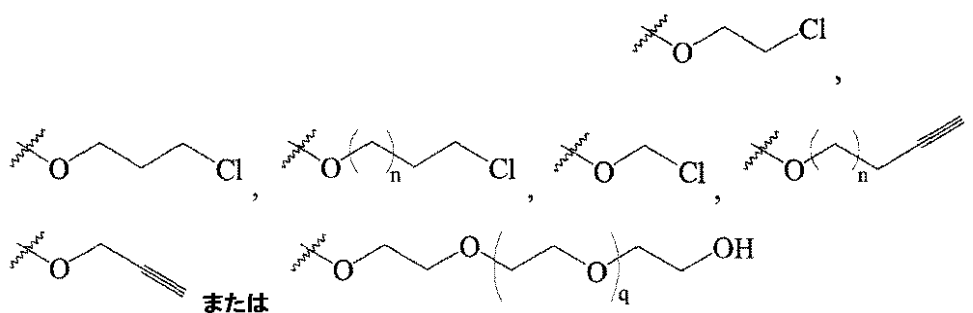
であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各G¹が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択される、項目2に記載の使用。

30

(項目59)

Qが、

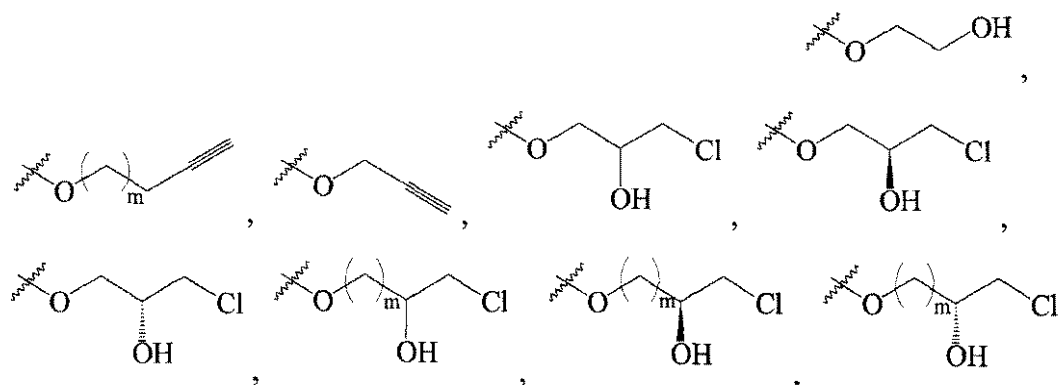
【化866】



40

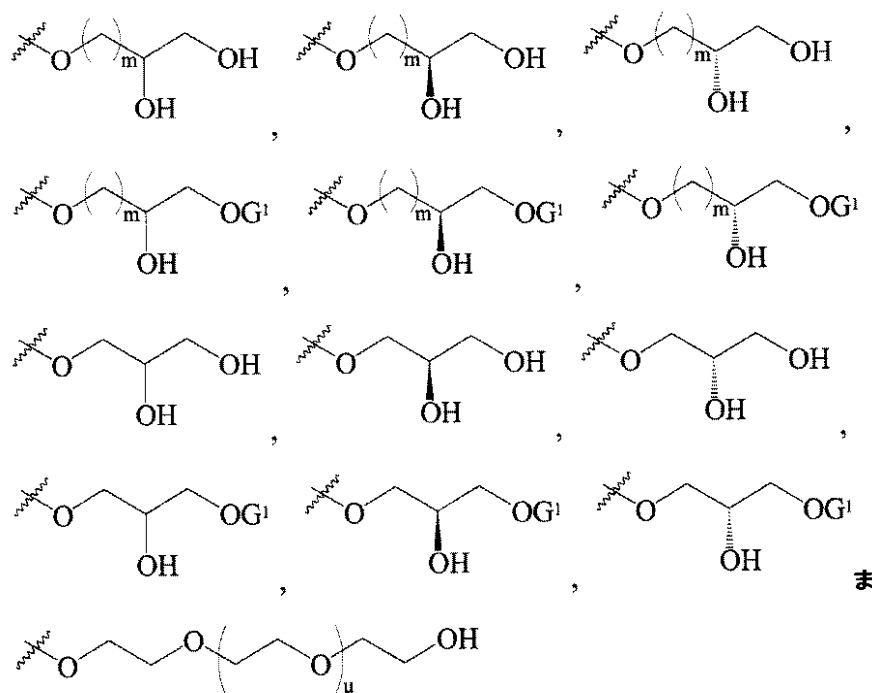
であり；Tが、

【化 8 6 7】



10

【化 8 6 8】



20

30

または

であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；q が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；m が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

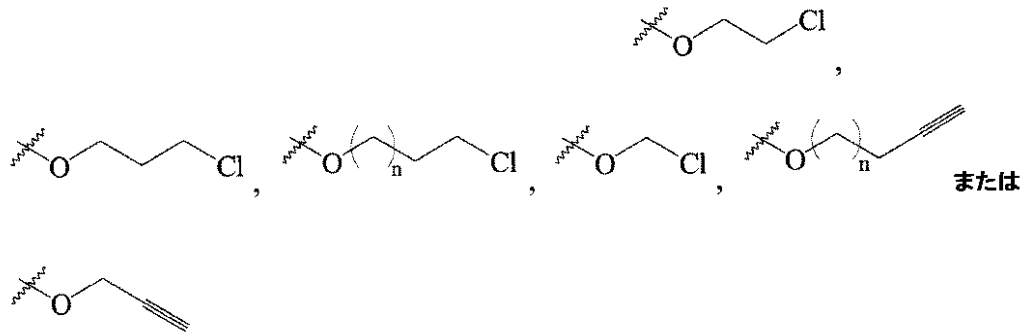
各 G¹ が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C₁-C₁₀ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ および NO₂ からなる群から選択される、項目 3 に記載の使用。

(項目 60)

Q が、

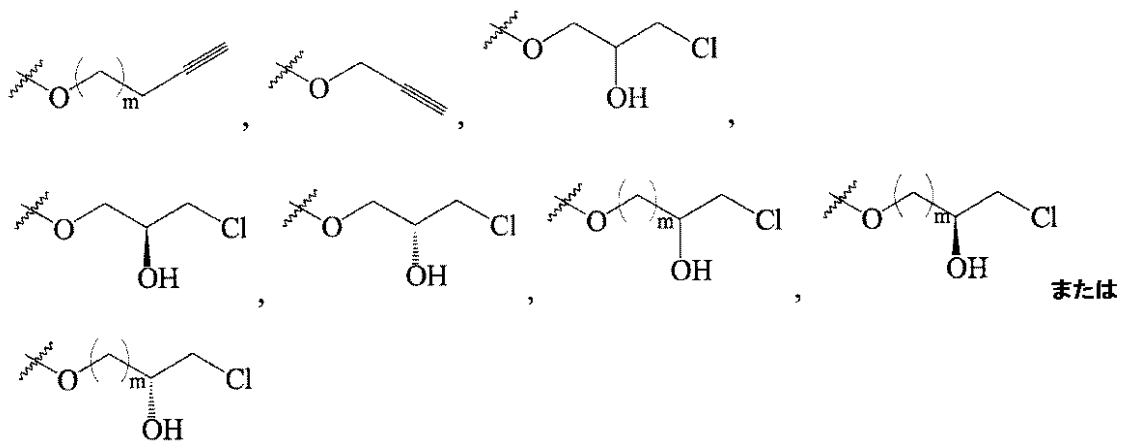
40

【化 8 6 9】



10

であり；Tが、
【化 8 7 0】



20

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目3に記載の使用。

30

(項目61)

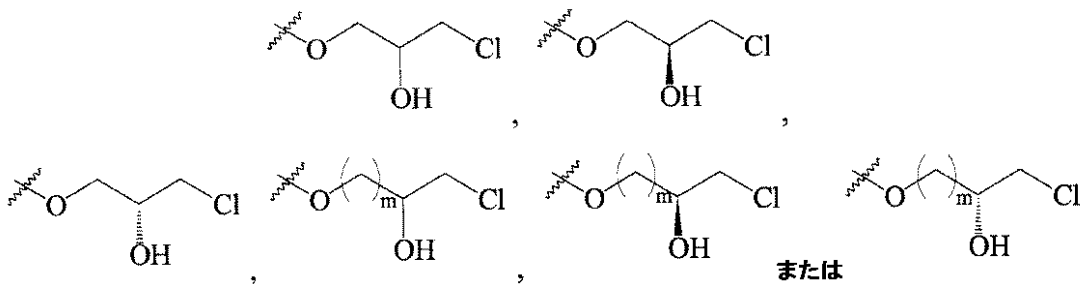
Qが、
【化 8 7 1】



40

であり；Tが、

【化 8 7 2】

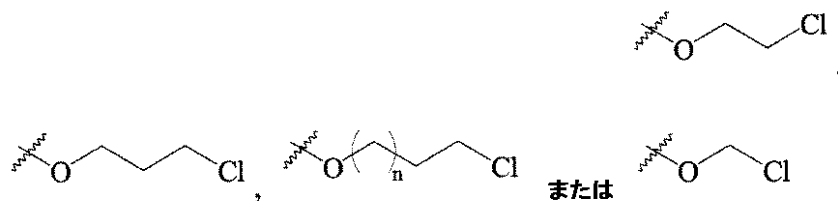


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目3に記載の使用。

(項目62)

Qが、

【化 8 7 3】



であり；Tが、

【化 8 7 4】

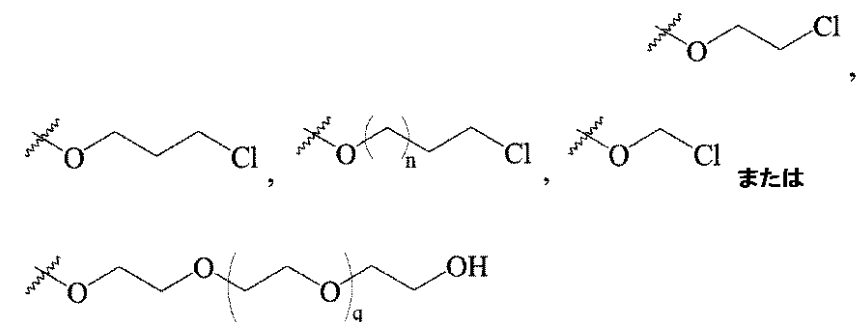


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目3に記載の使用。

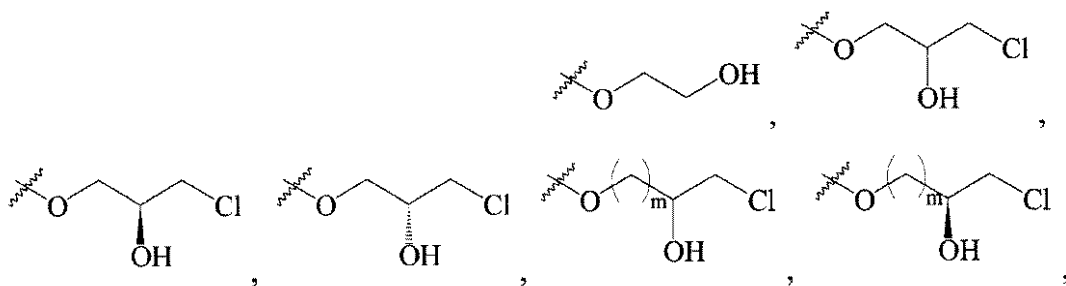
(項目63)

Qが、

【化 8 7 5】

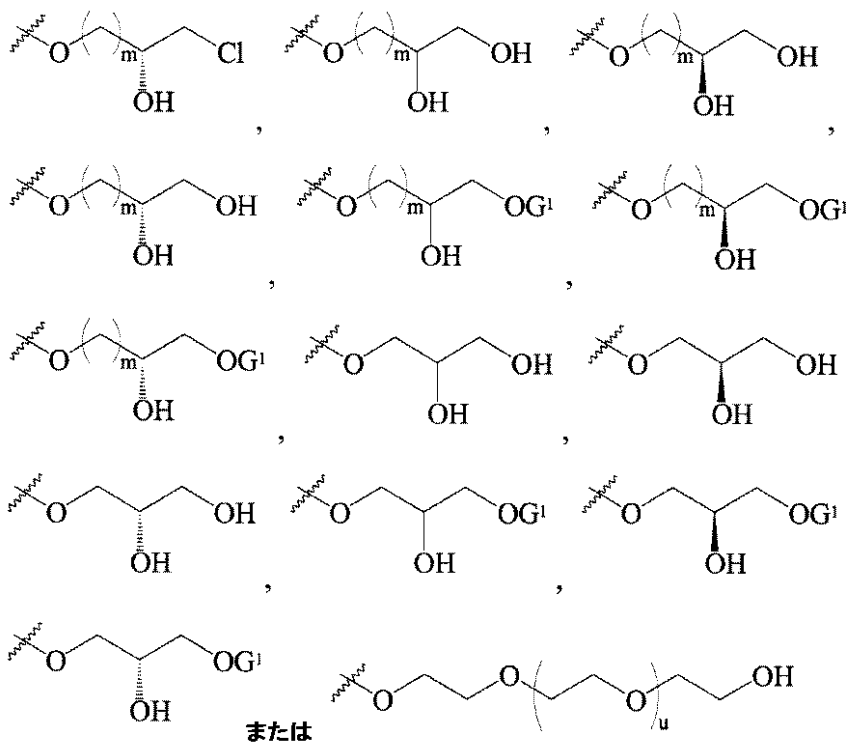


であり；Tが、
【化876】



10

【化877】



20

30

であり；

nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

qが、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

uが、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

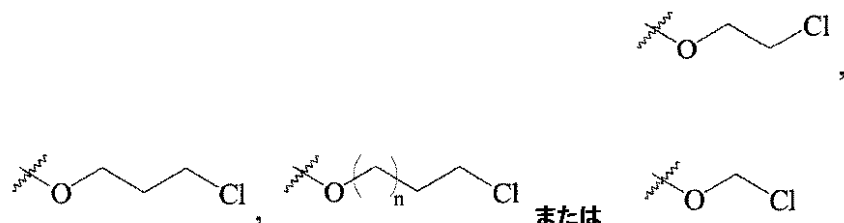
各 G¹ が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C₁ - C₁₀ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ および NO₂ からなる群から選択される、項目3に記載の使用。

40

(項目64)

Qが、

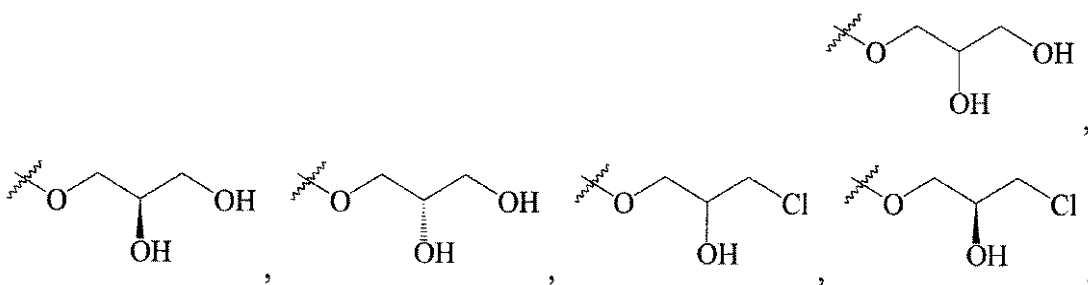
【化 8 7 8】



10

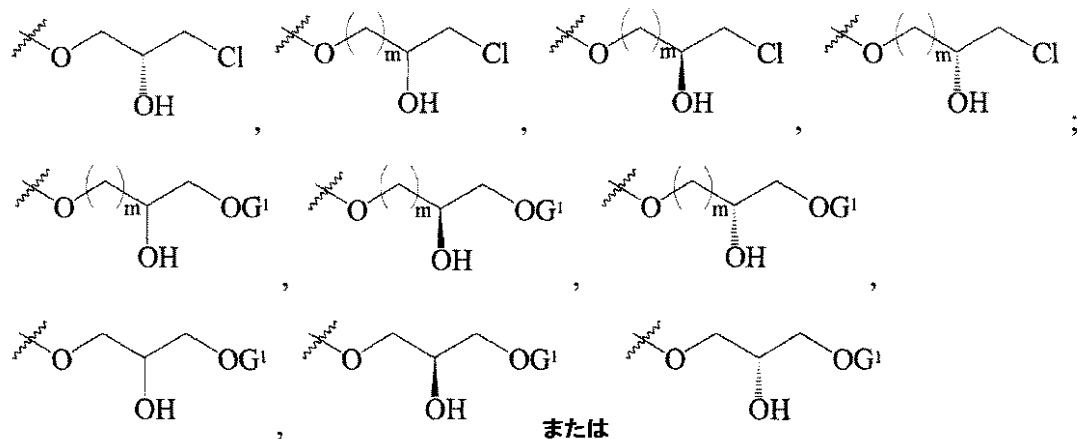
であり；Tが、

【化 8 7 9】



20

【化 8 8 0】



30

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各G¹が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ¹、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択される、項目3に記載の使用。

40

(項目65)

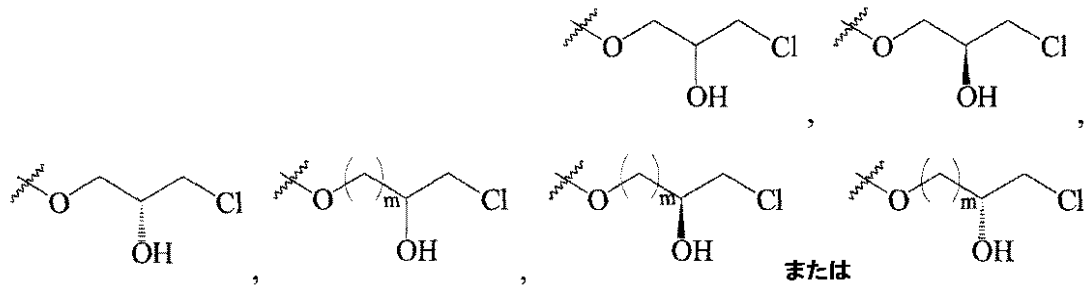
Qが、

【化 8 8 1】



50

であり、Tが、
【化882】



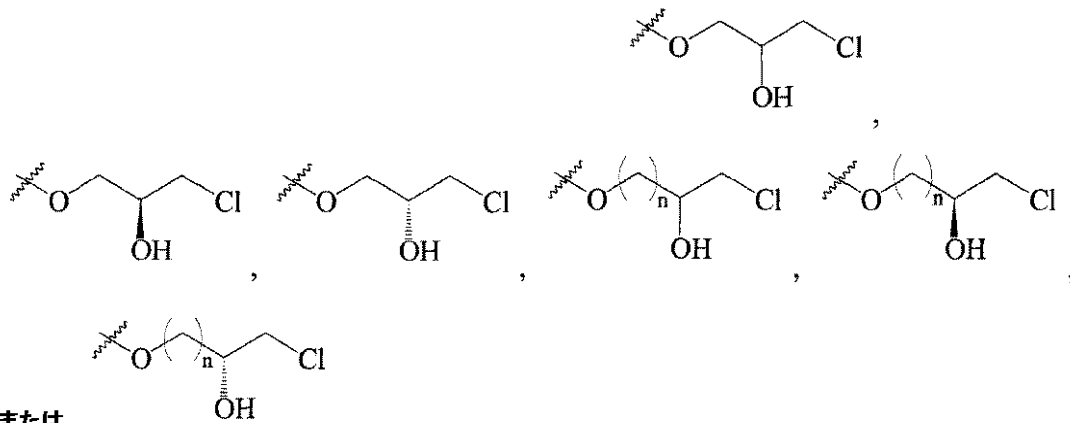
10

であり、qが、0、1、2、3、4、5、6または7であり、mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目3に記載の使用。

(項目66)

Qが、

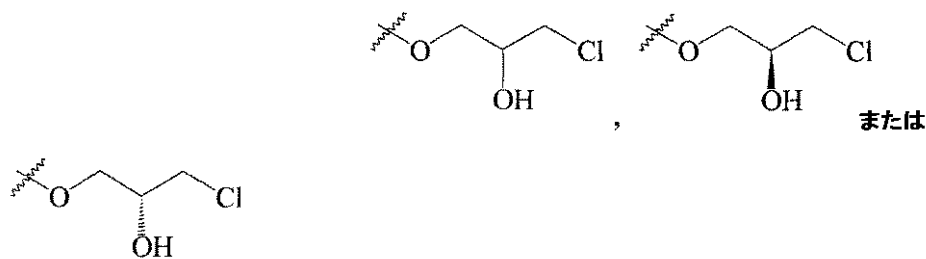
【化883】



20

30

であり、Tが、
【化884】

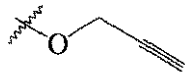
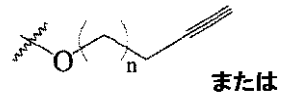


40

であり、nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目4に記載の使用。
(項目67)

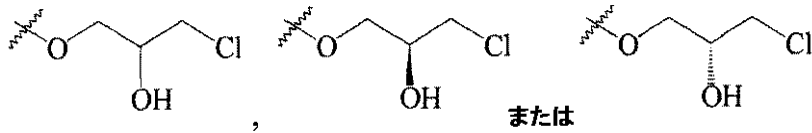
Qが、

【化 8 8 5】



であり；Tが、
【化 8 8 6】

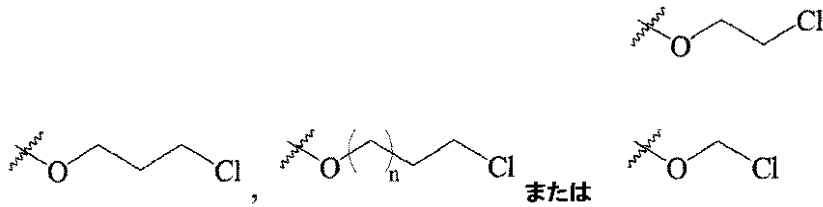
10



であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7である、項目4に記載の使用。
(項目68)

Qが、
【化 8 8 7】

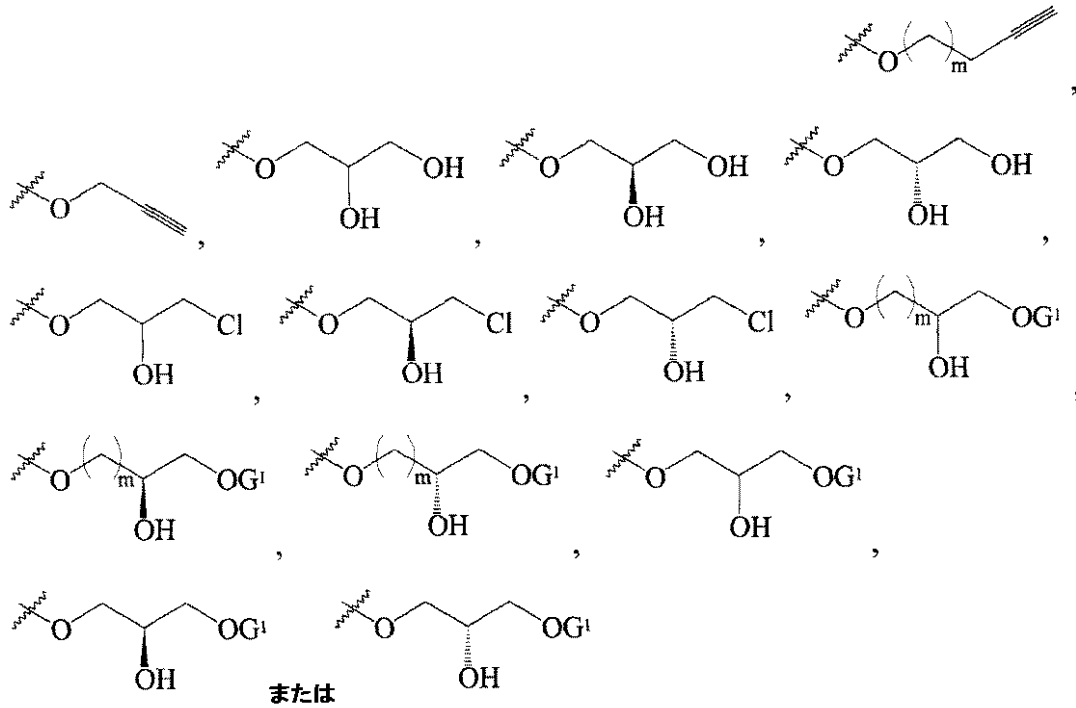
20



であり；Tが、

30

【化 8 8 8】

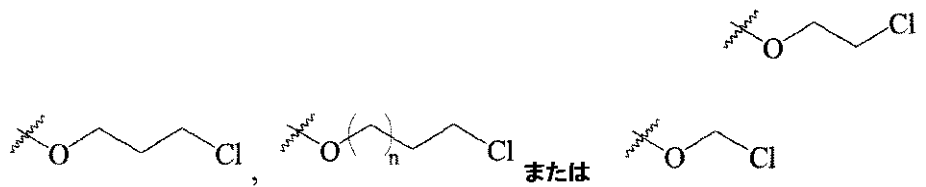


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各G¹が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択される、項目4に記載の使用。

(項目69)

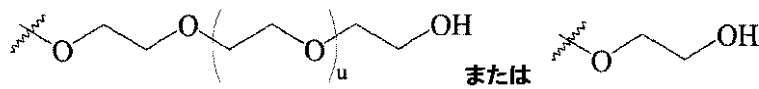
Qが、

【化 8 8 9】



であり；Tが、

【化 8 9 0】



であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；uが、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目2、3または4に記載の使用。

(項目70)

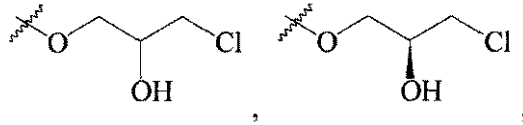
Qが、

【化 8 9 1】

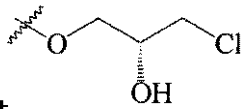


であり；Tが、

【化 8 9 2】



10



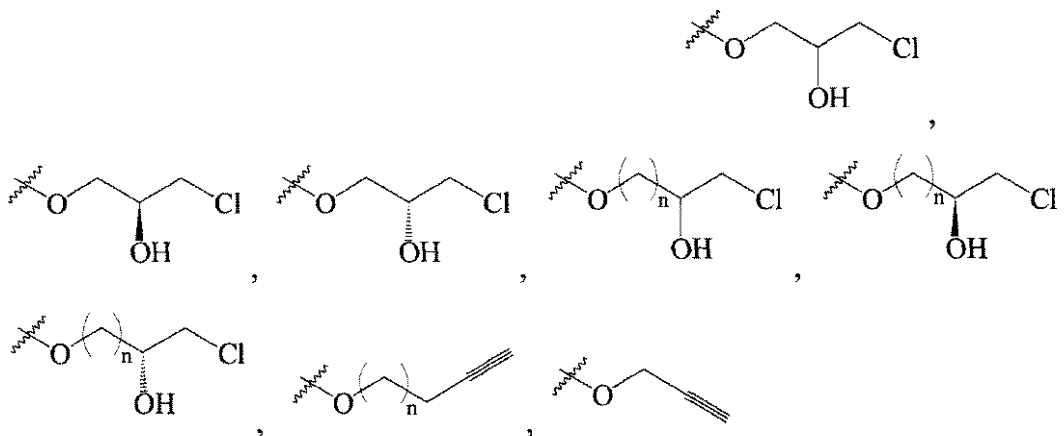
または

であり、qが、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目4に記載の使用。

(項目71)

Qが、

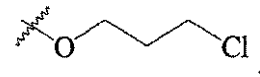
【化 8 9 3】



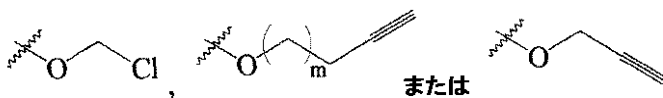
30

であり；Tが、

【化 8 9 4】



40



または

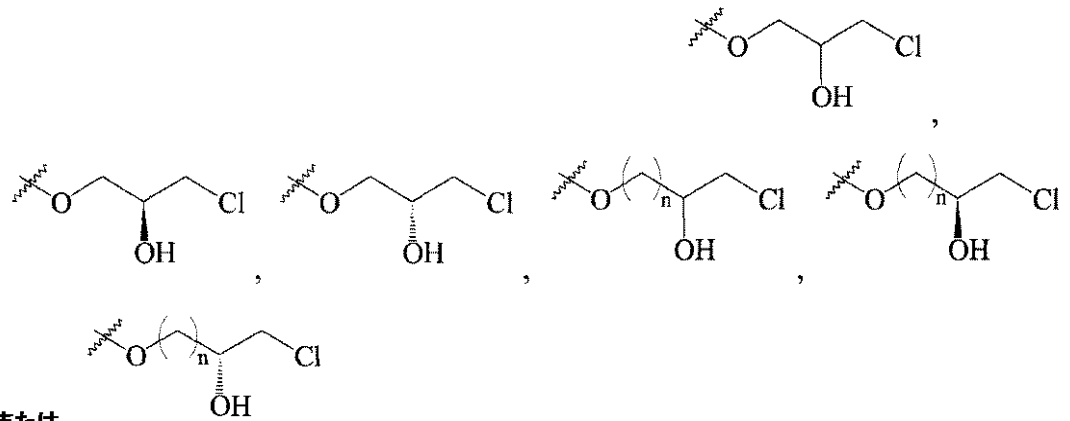
であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目2または4に記載の使用。

(項目72)

Qが、

50

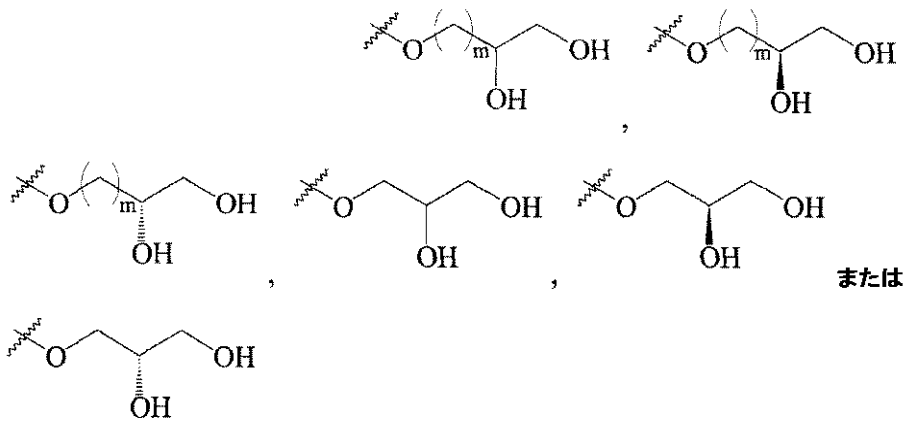
【化 8 9 5】



10

であり；Tが、

【化 8 9 6】



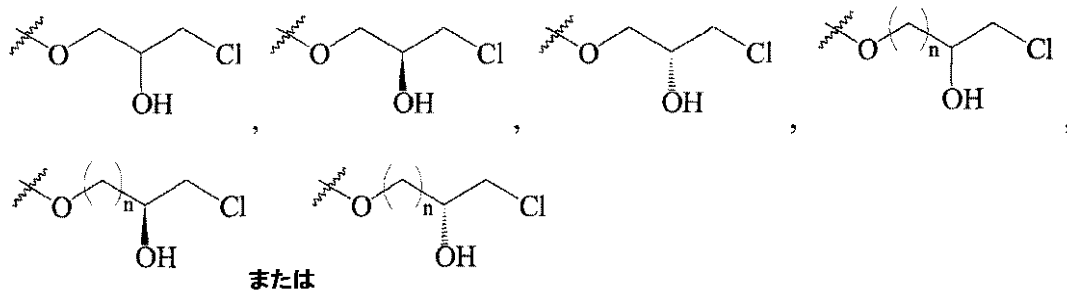
20

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目2または4に記載の使用。

(項目73)

Qが、

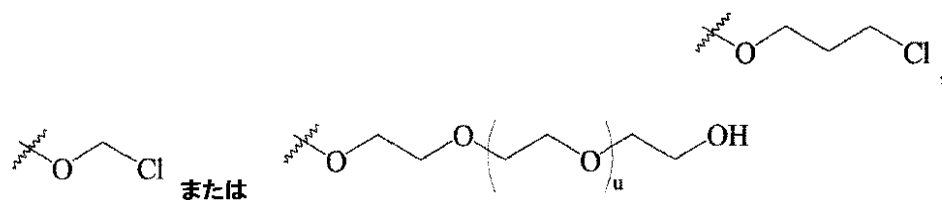
【化 8 9 7】



40

であり；Tが、

【化 8 9 8】



であり； u が、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目2または4に記載の使用。

10

(項目74)

G^1 が、存在するとき、 $CH_2C(CH_3)_2$ または $CH(CH_3)_2$ である、項目1から73のいずれか1項に記載の使用。

(項目75)

前記残りの各 Z が、独立して、 CCH_3 ； CH ；および CBr から選択される、項目1から74のいずれか1項に記載の使用。

(項目76)

前記残りの各 Z が、 CH である、項目1から74のいずれか1項に記載の使用。

(項目77)

20

X が、 CH_2 である、項目1から76のいずれか1項に記載の使用。

(項目78)

X が、 CHR^1 であり、 R^1 が、 CH_3 である、項目1から76のいずれか1項に記載の使用。

(項目79)

X が、 CR^1R^2 であり、 R^1 および R^2 の各々が、 CH_3 である、項目1から76のいずれか1項に記載の使用。

(項目80)

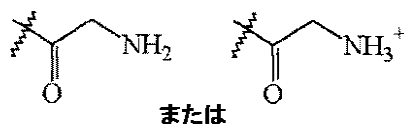
前記化合物の OH 基の1つ以上が、該 H を表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、項目1から79のいずれか1項に記載の使用。

30

(項目81)

表1から選択される前記部分が、

【化 8 9 9】



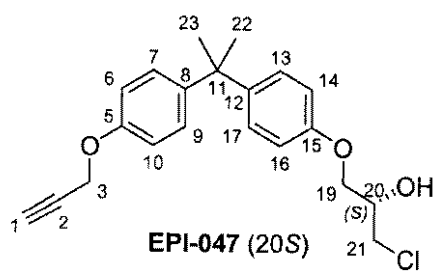
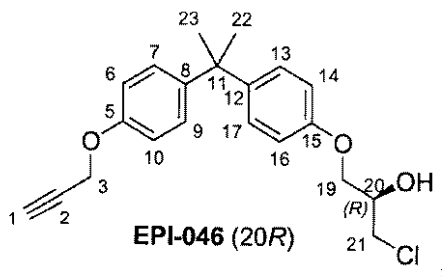
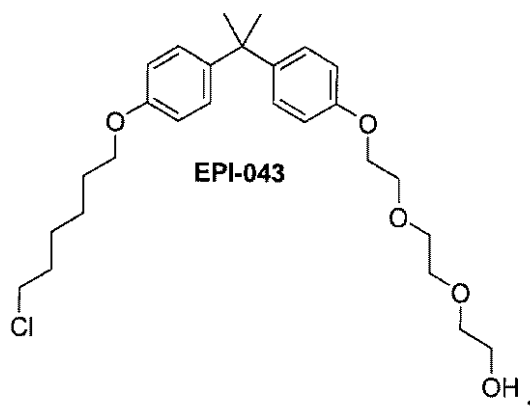
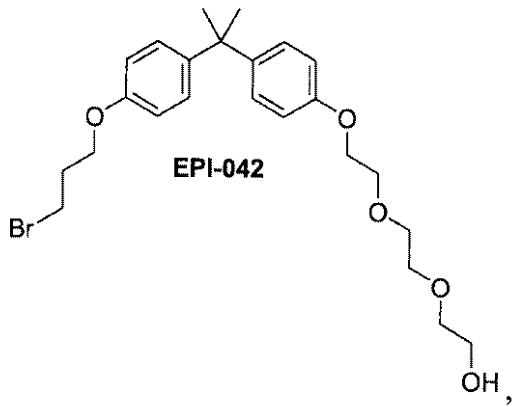
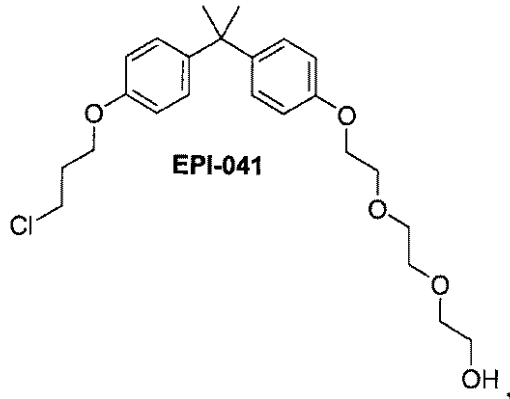
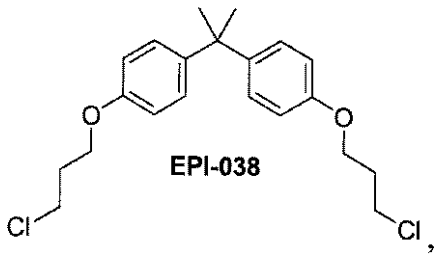
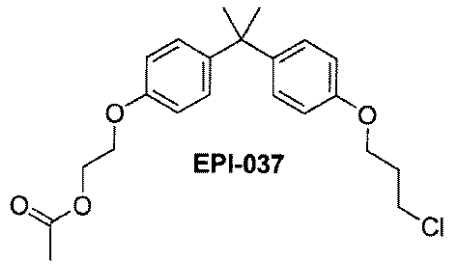
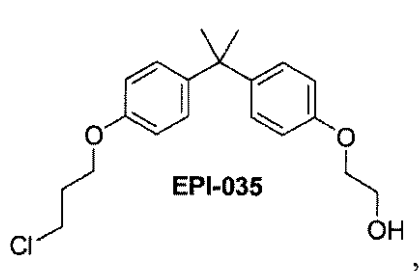
である、項目80に記載の使用。

(項目82)

40

前記化合物が、以下：

【化 9 0 0】

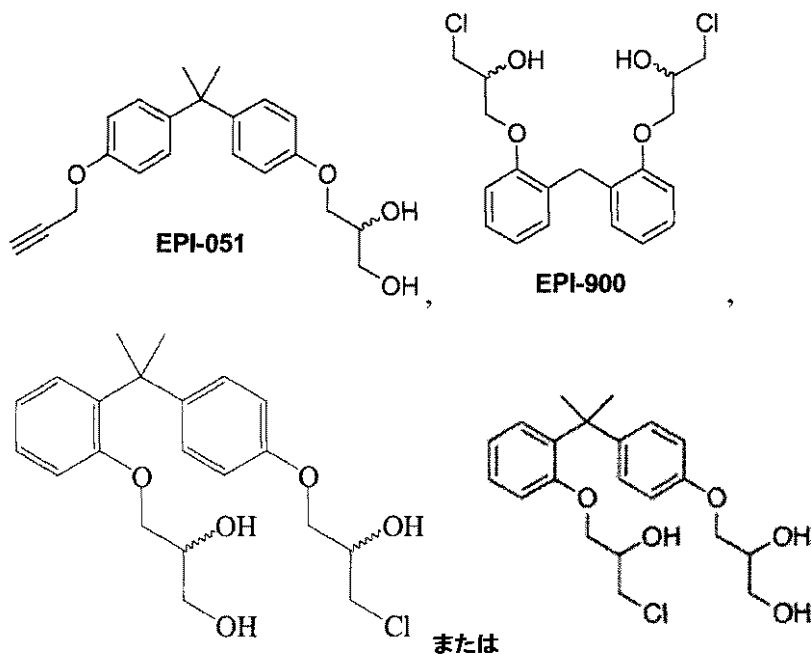


10

20

30

【化 9 0 1】



10

20

のうちの1つ以上から選択される、項目1に記載の使用。

(項目83)

前記アンドロゲンレセプター(A R)活性の調節が、哺乳動物細胞におけるものである、
項目1から82のいずれか1項に記載の使用。

(項目84)

前記A R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
巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される
少なくとも1つの適応症を処置するためのものである、項目1から83のいずれか1項に
記載の使用。

(項目85)

前記適応症が、前立腺癌である、項目1から84のいずれか1項に記載の使用。

(項目86)

前記前立腺癌が、アンドロゲン非依存性前立腺癌である、項目85に記載の使用。

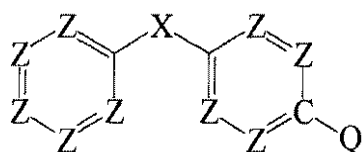
(項目87)

前記前立腺癌が、アンドロゲン依存性前立腺癌である、項目85に記載の使用。

(項目88)

式I I Iの構造を有する化合物

【化 9 0 2】



III

40

またはその薬学的に許容され得る塩であって、

ここで：

Xは、 CH_2 、 CHR^1 または CR^1R^2 であり；

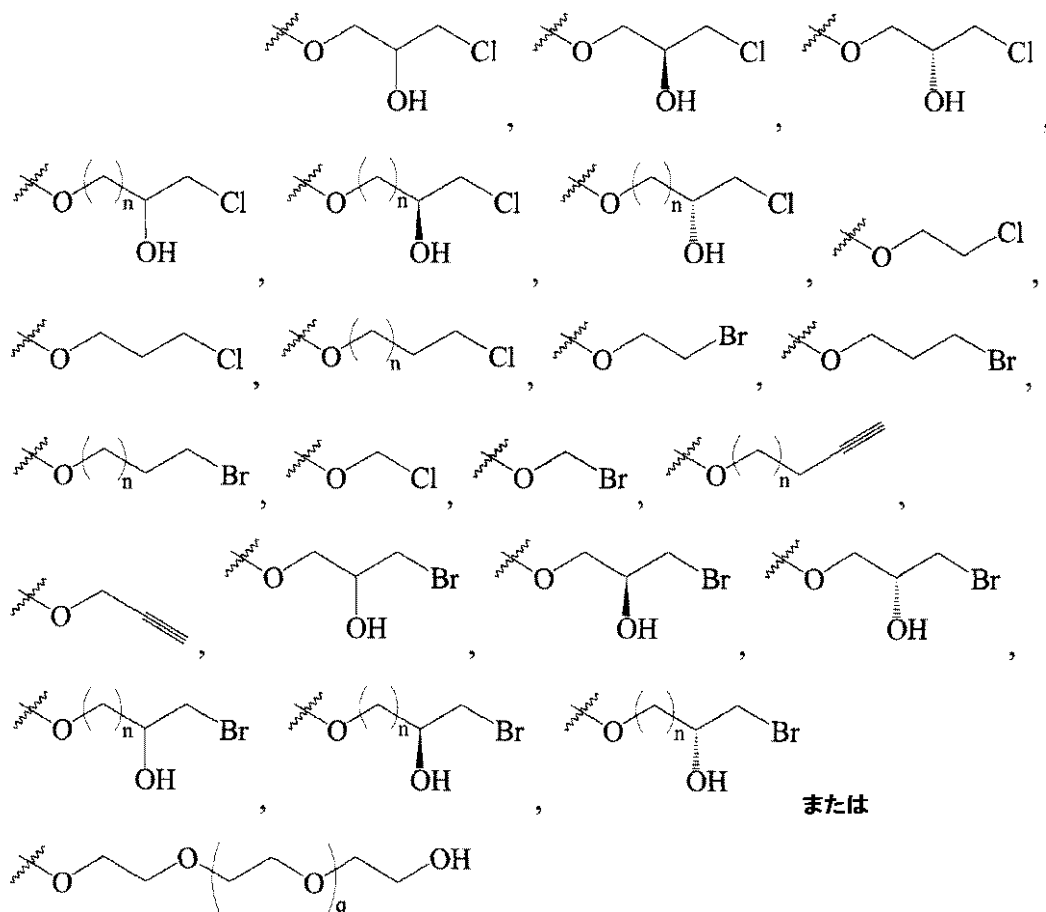
R^1 および R^2 の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、 O 、 J 、 F

50

、Cl、Br、IまたはNH₂からなる群から選択され；

ここで、Qは、

【化903】



10

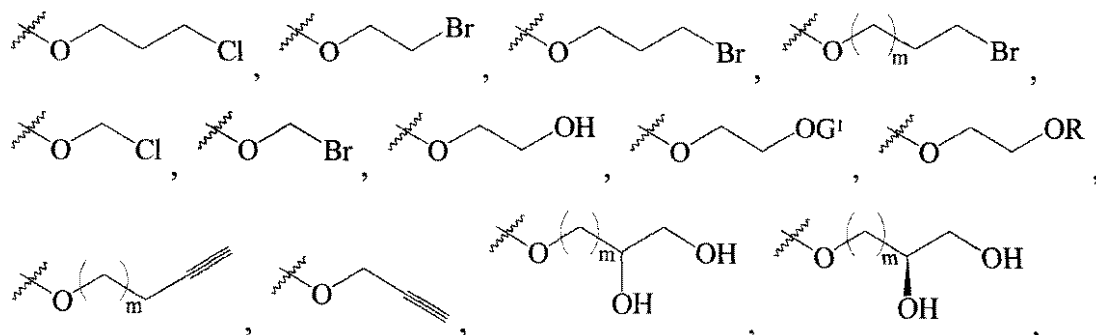
20

または

であり；

他方の芳香族環の少なくとも1つのZは、独立して、C - Tであり得、ここで、Tは、

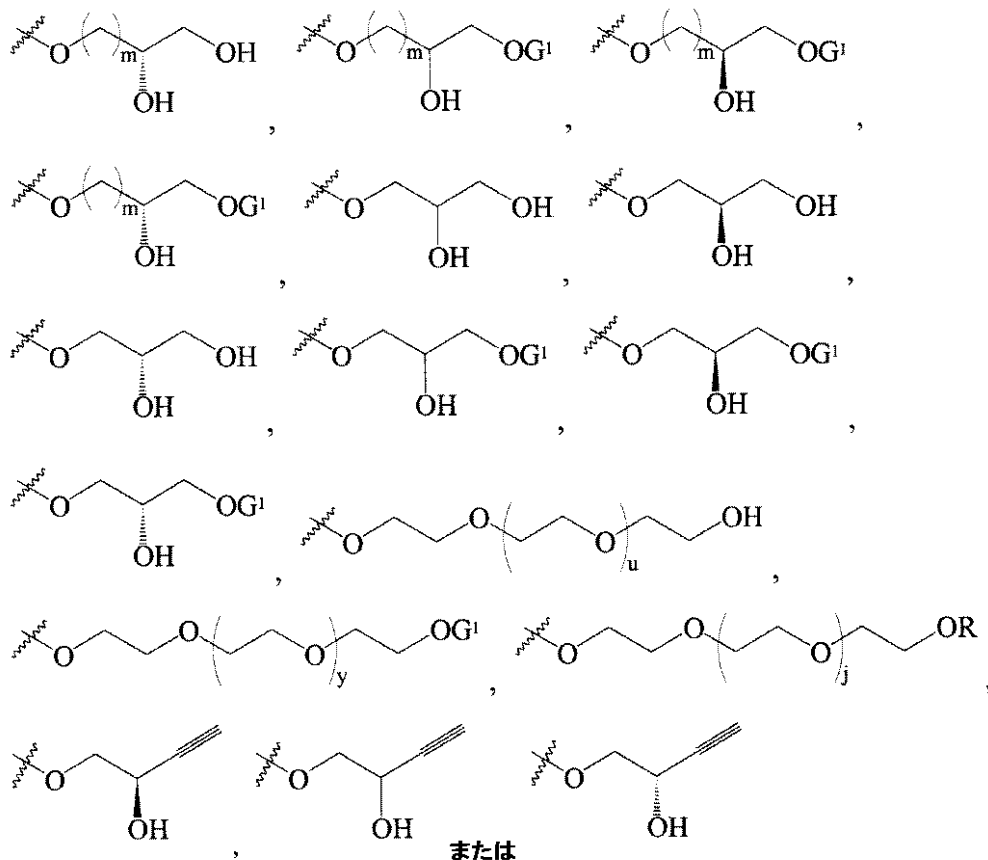
【化904】



30

40

【化 9 0 5】



10

20

であり；

残りの各 Z は、独立して、 CG^1 、 N 、 CH 、 CF 、 CCl 、 CBr 、 CI または COH であり；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

q は、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

u 、 j および y の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_1 - C_{10} アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 COOH 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 CONH_2 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され；

J'' および J' の各々は、独立して、表 1 から選択される部分であり；

ここで、 OH 基の 1 つ以上は、該 H を表 1 から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、

化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

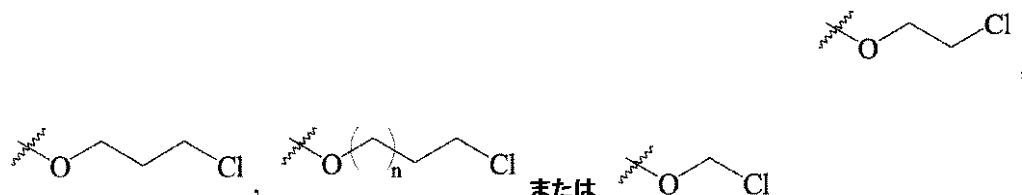
(項目 89)

Q が、

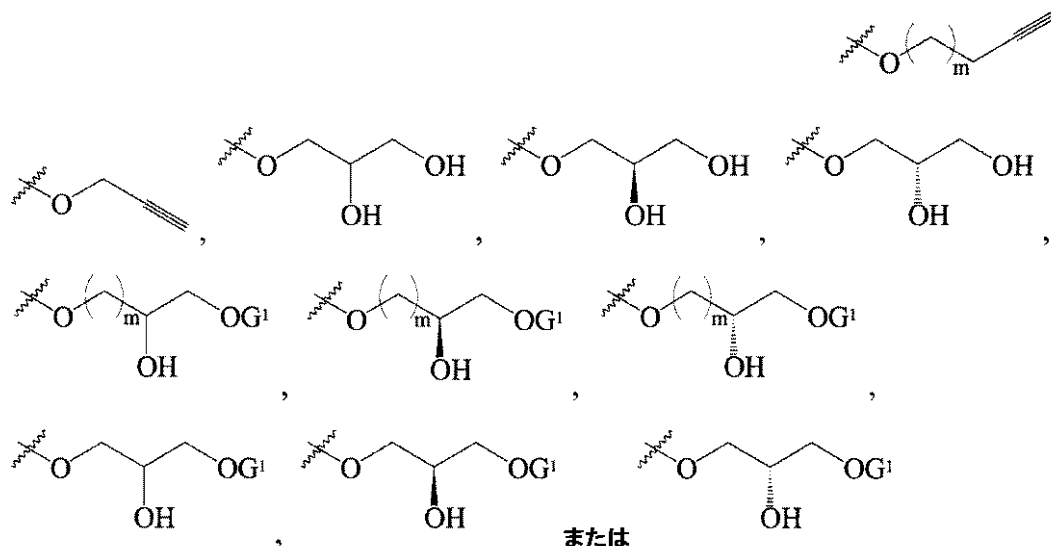
30

40

【化906】



であり；Tが、
【化907】

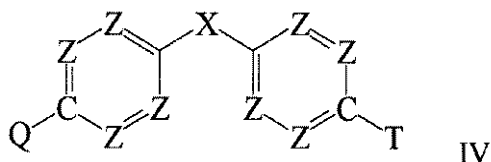


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各G¹が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃およびNO₂からなる群から選択される、項目88に記載の化合物または塩。

(項目90)

式IVの構造を有する化合物

【化908】



またはその薬学的に許容され得る塩であって、
ここで：

Xは、CH₂、CHR¹またはCR¹R²であり；

R¹およびR²の各々は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和のC₁-C₁₀アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、OJ'、F、Cl、Br、IまたはNH₂からなる群から選択され；

各Zは、独立して、CG¹、N、CH、CF、CCl、CBr、CIまたはCOHであり

10

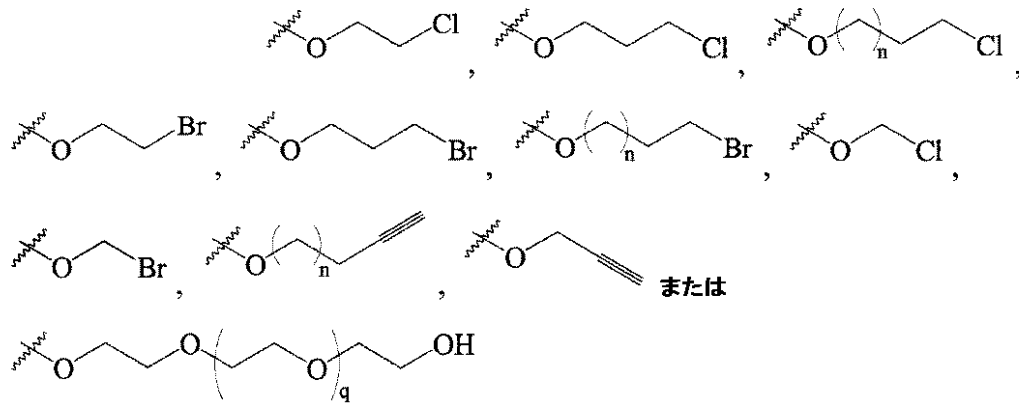
20

30

40

50

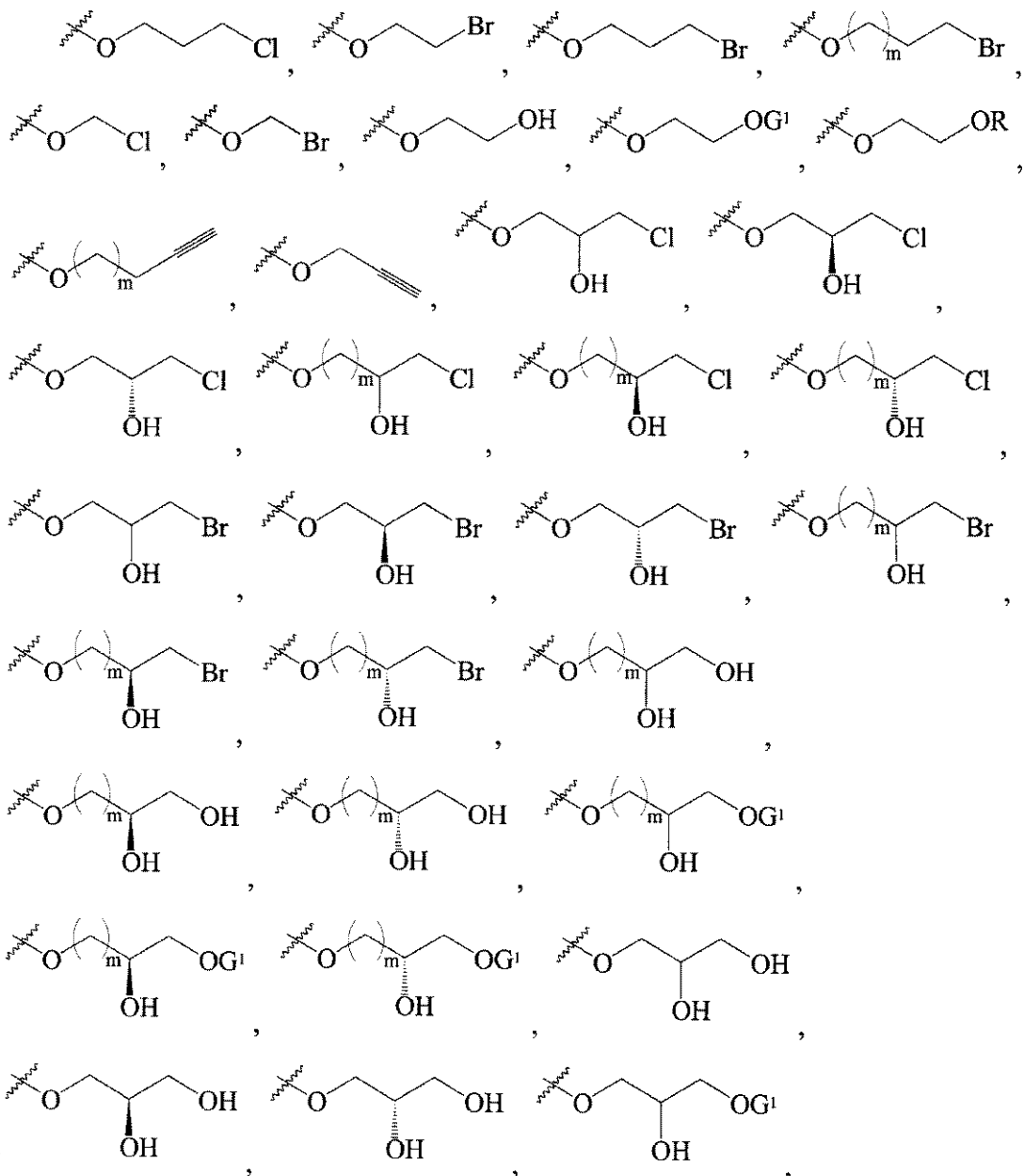
i
 ここで、Qは、
 【化909】



10

であり；Tは、

【化910】

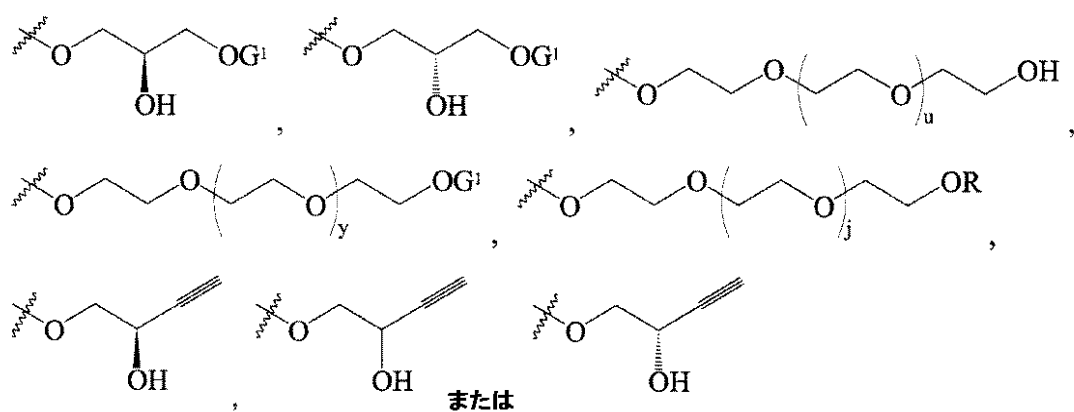


10

20

30

【化911】



40

であり；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

50

q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり；
 m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；
 u 、 j および y の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；
 各 G^1 は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C_{1-10} アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ'' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択され；
 J'' および J''' の各々は、独立して、表1から選択される部分であり；
 ここで、 OH 基の1つ以上は、該 H を表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、

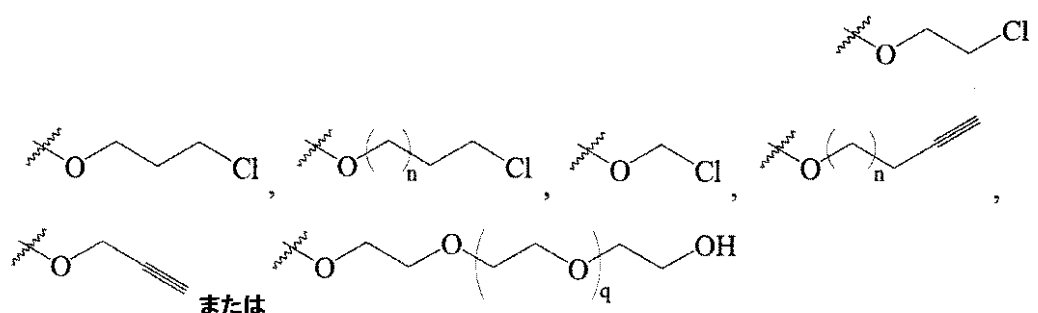
10

化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目91)

Q が、

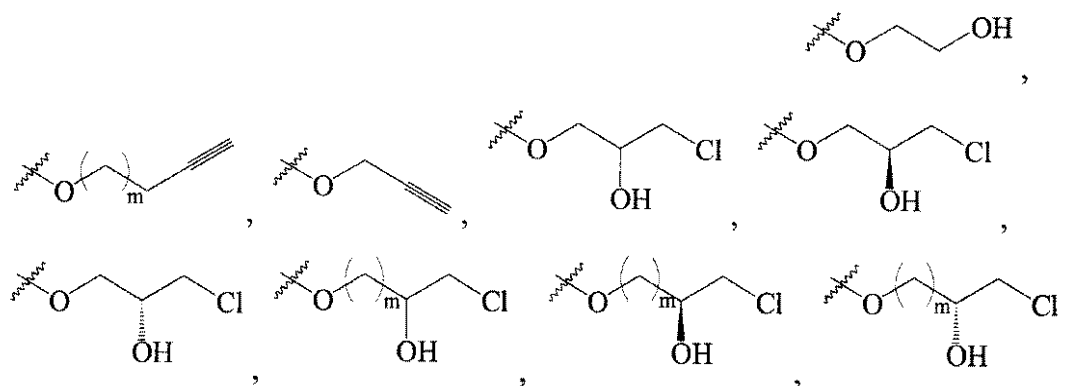
【化912】



20

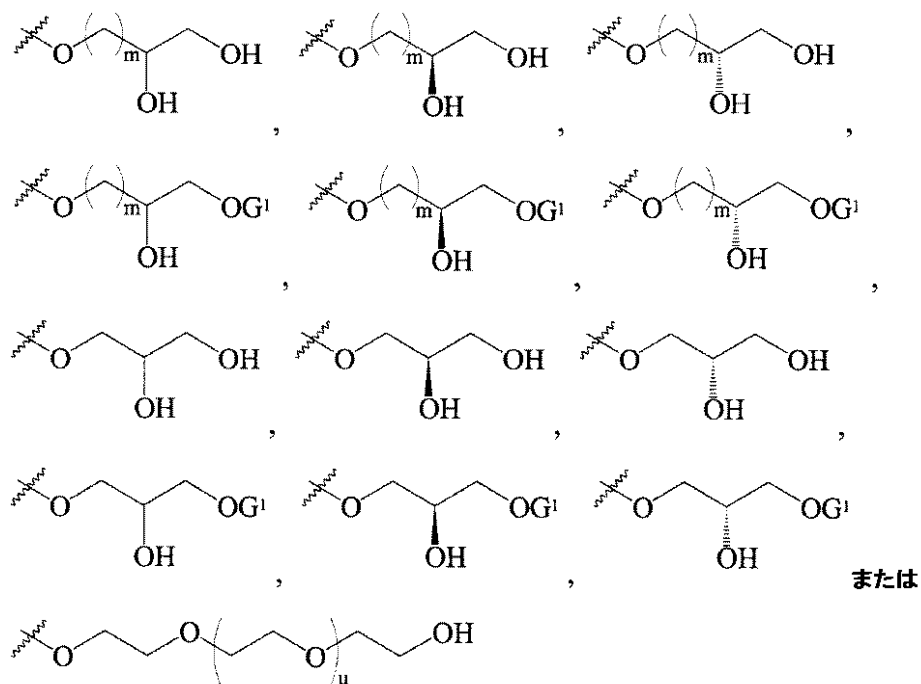
であり； T が、

【化913】



30

【化 9 1 4】



であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

q が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

m が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

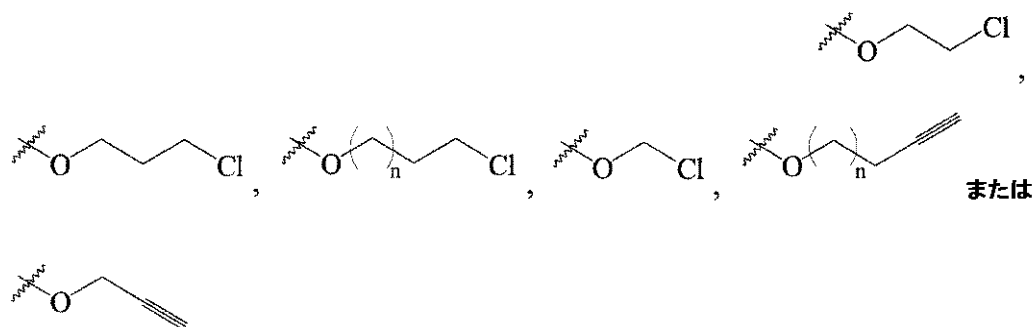
各 G¹ が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C₁ - C₁₀ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ および NO₂ からなる群から選択される、項目 90 に記載の化合物または塩。

30

(項目 9 2)

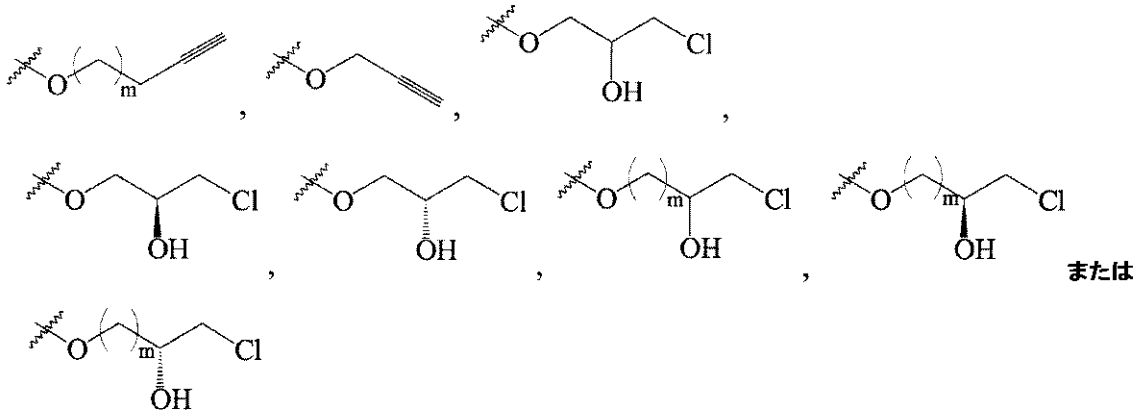
Q が、

【化 9 1 5】



であり； T が、

【化 9 1 6】



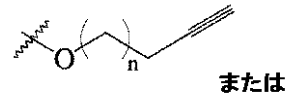
10

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目90に記載の化合物または塩。

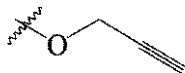
(項目93)

Qが、

【化 9 1 7】

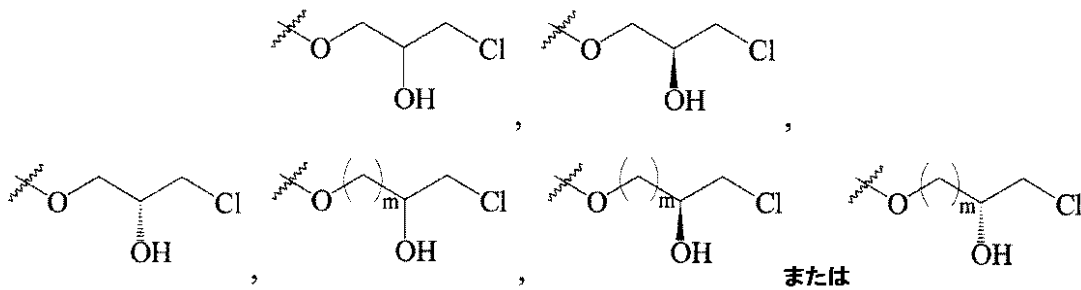


20



であり；Tが、

【化 9 1 8】



30

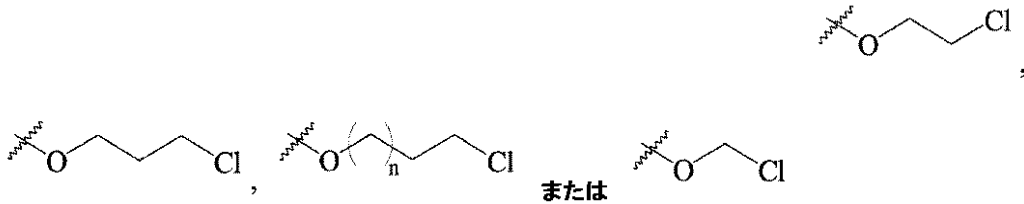
40

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目90に記載の化合物または塩。

(項目94)

Qが、

【化 9 1 9】



であり ; T が、
【化 9 2 0】

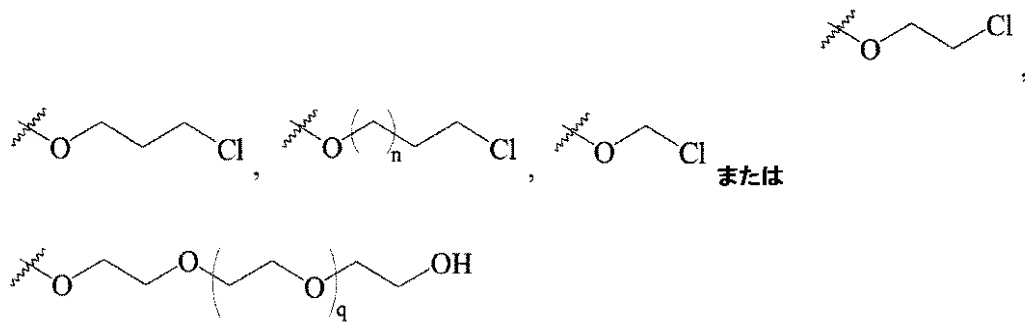
10



であり ; n が、 0、 1、 2、 3、 4、 5、 6、 7 または 8 であり ; m が、 0、 1、 2、 3、 4、 5、 6、 7 または 8 である、 項目 9 0 に記載の化合物または塩。

20

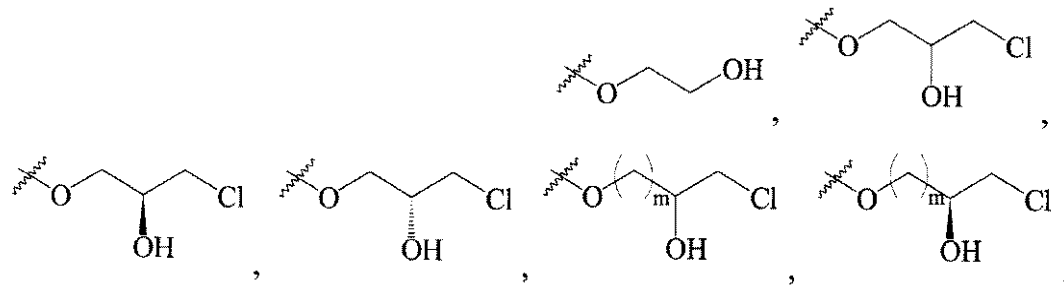
(項目 9 5)
Q が、
【化 9 2 1】



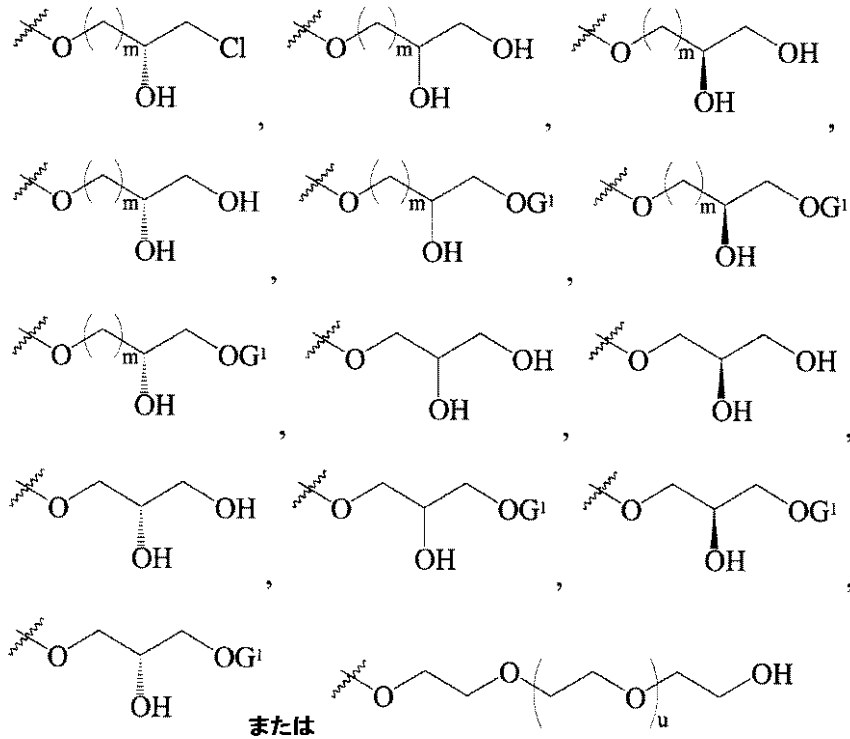
30

であり ; T が、
【化 9 2 2】

40



【化 9 2 3】



であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

q が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

m が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 であり；

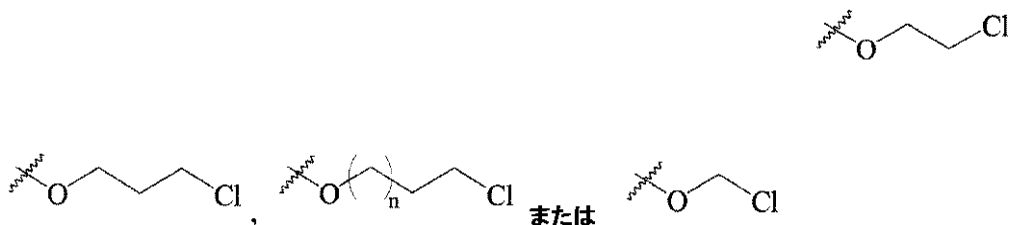
u が、0、1、2、3、4、5、6 または 7 であり；

各 G¹ が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の C₁-C₁₀ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、OJ'、COOH、OH、F、Cl、Br、I、NH₂、CN、SH、SO₃H、CONH₂、OPO₃H₃ および NO₂ からなる群から選択される、項目 90 に記載の化合物または塩。

(項目 96)

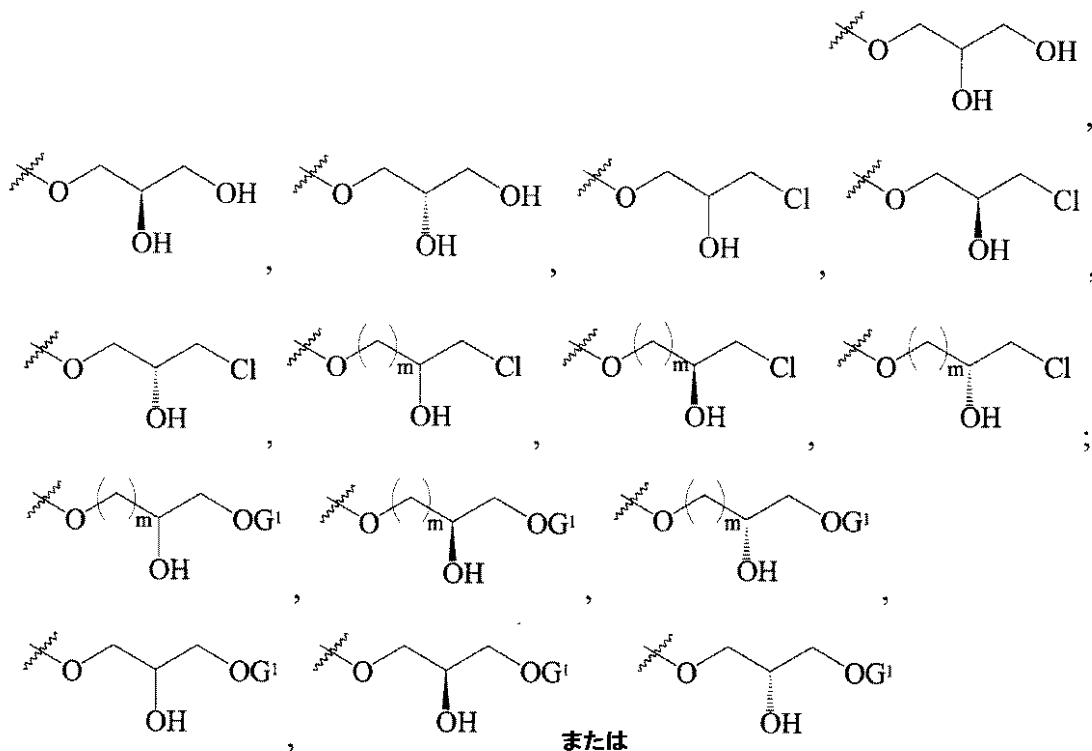
Q が、

【化 9 2 4】



であり； T が、

【化 9 2 5】

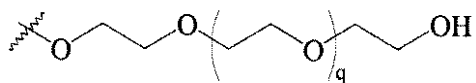


であり； n が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり； m が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各 G^1 が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ^1 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択される、項目 9 0 に記載の化合物または塩。

(項目 9 7)

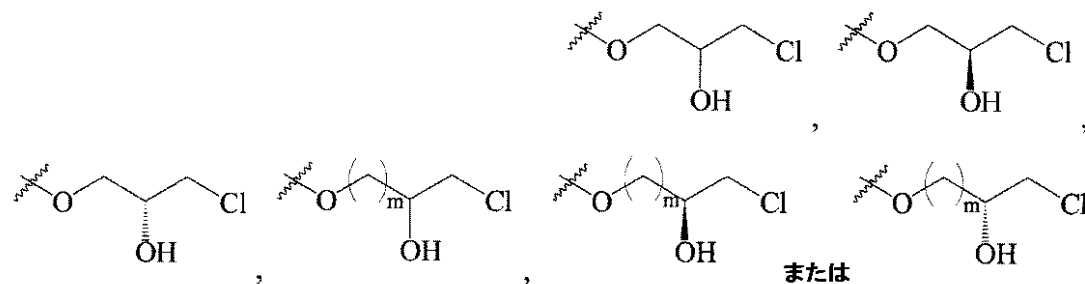
Q が、

【化 9 2 6】



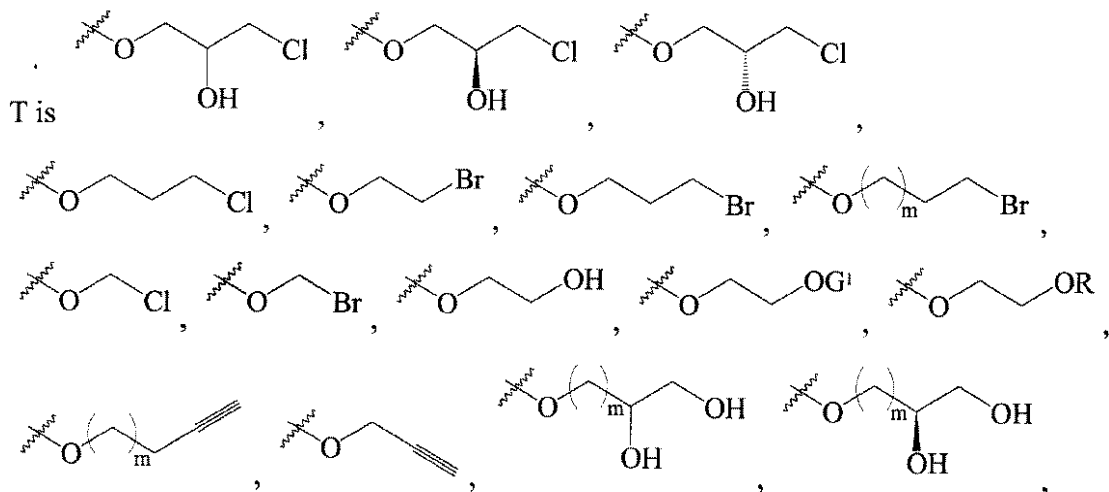
であり； T が、

【化 9 2 7】

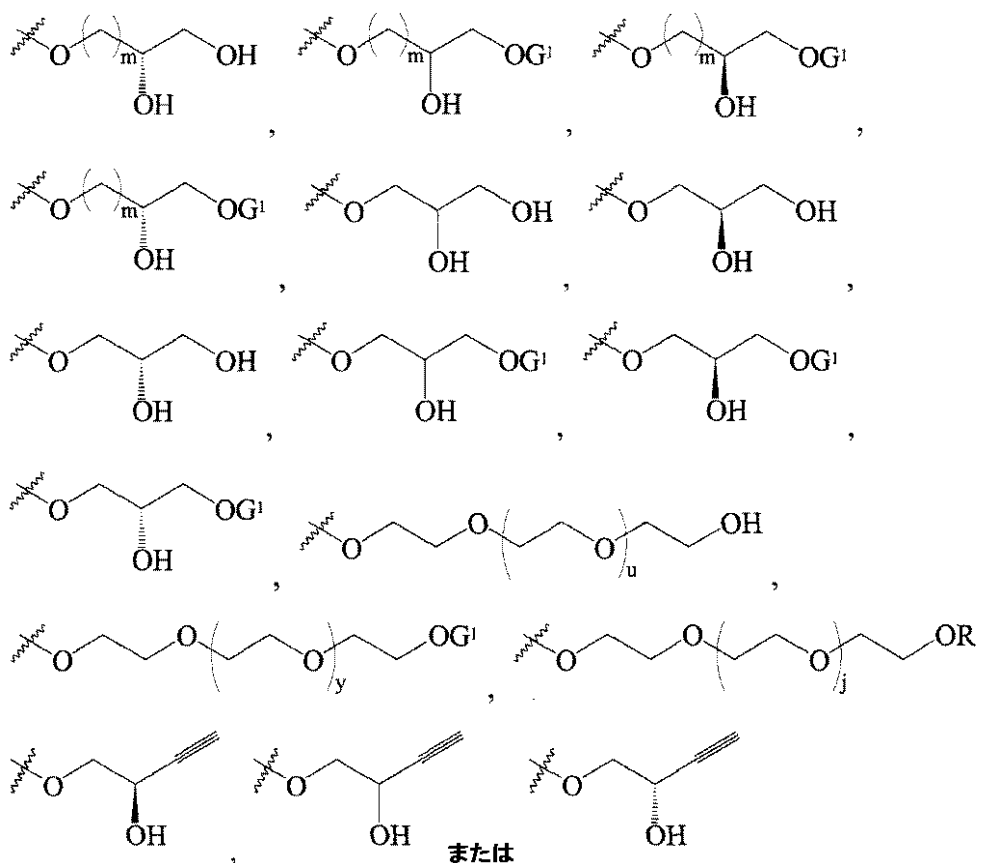


であり； q が、0、1、2、3、4、5、6または7であり； m が、0、1、2、3、4

【化930】



【化931】



であり；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

q は、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；

u 、 j および y の各々は、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

各 G' は、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H

10

20

30

40

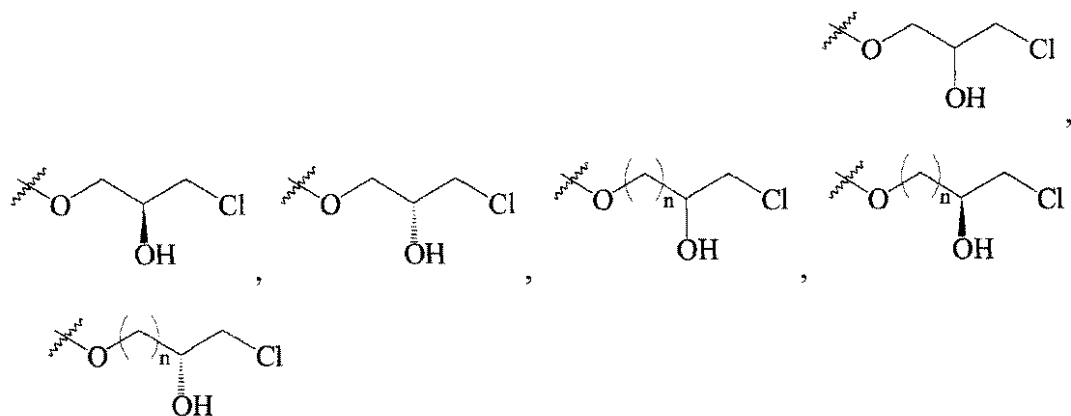
50

3 および NO₂ からなる群から選択され；
” J ” および ” J ’ ” の各々は、独立して、表 1 から選択される部分であり；
ここで、OH 基の 1 つ以上は、該 H を表 1 から選択される部分で置き換えるように必要に
応じて置換される、
化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 9 9)

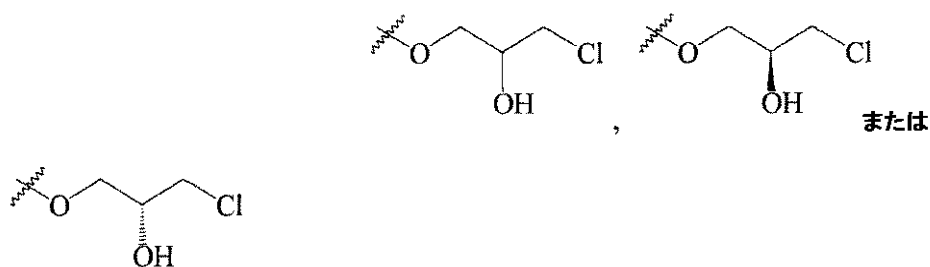
Q が、

【化 9 3 2】



であり、T が、

【化 9 3 3】



であり；

n が、0、1、2、3、4、5、6、7 または 8 である、項目 9 8 に記載の化合物または
塩。

(項目 1 0 0)

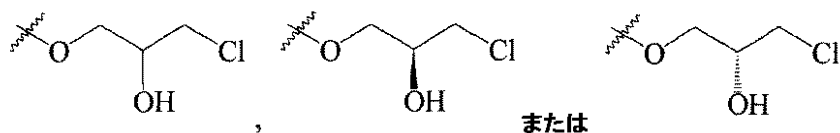
Q が、

【化 9 3 4】



であり；T が、

【化 9 3 5】

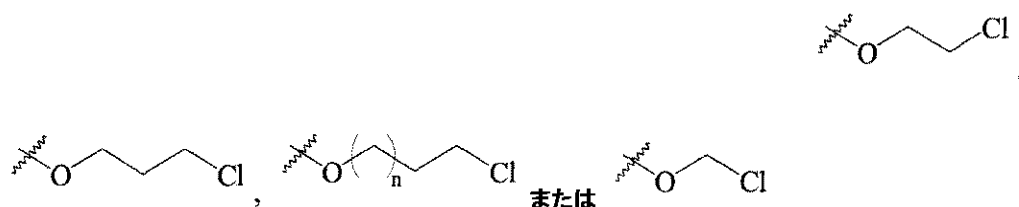


であり； n が、0、1、2、3、4、5、6、7である、項目 9 8 に記載の化合物または塩。

(項目 1 0 1)

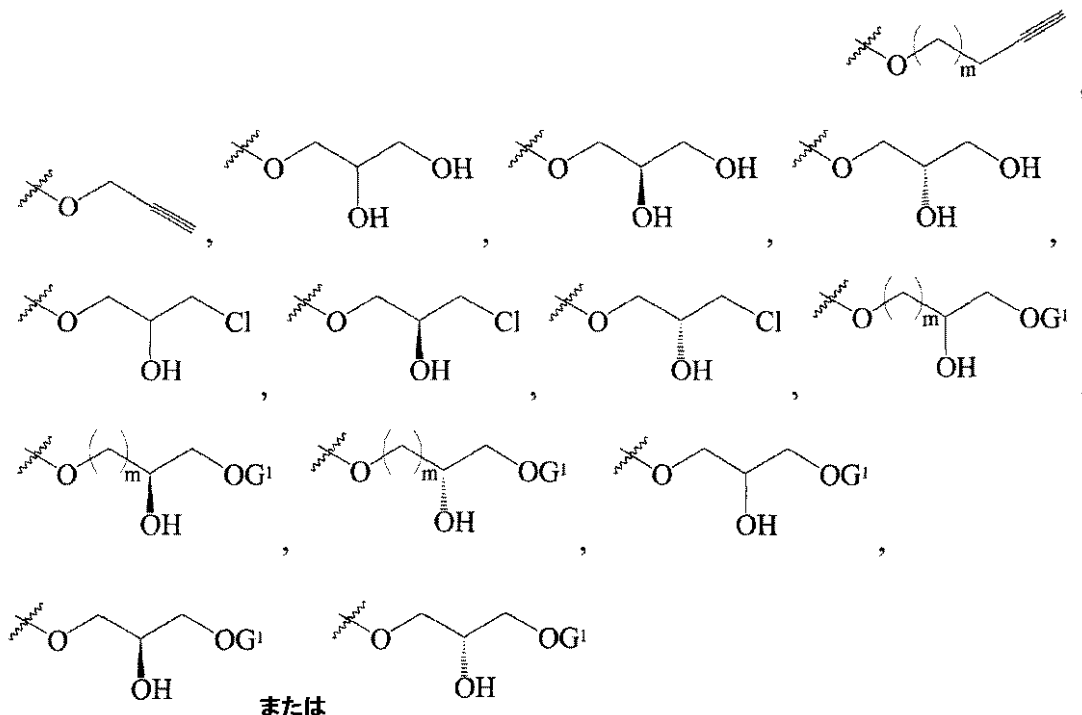
Qが、

【化 9 3 6】



であり；Tが、

【化 9 3 7】



であり； n が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり； m が、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；各 G^1 が、独立して、直鎖状または分枝状の置換または非置換の飽和または不飽和の $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、ここで、必要に応じた置換基は、オキソ、 OJ' 、 $COOH$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 NH_2 、 CN 、 SH 、 SO_3H 、 $CONH_2$ 、 OPO_3H_3 および NO_2 からなる群から選択される、項目 9 8 に記載の化合物または塩。

(項目 1 0 2)

10

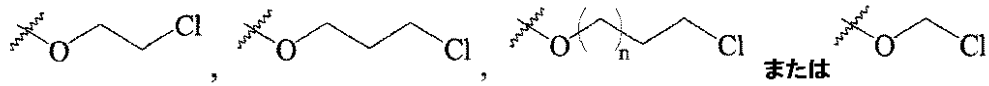
20

30

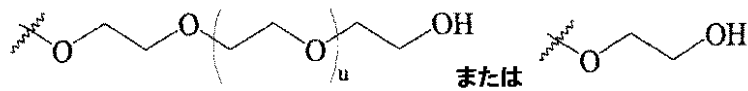
40

50

Qが、
【化938】



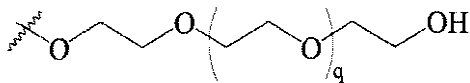
であり；Tが、
【化939】



10

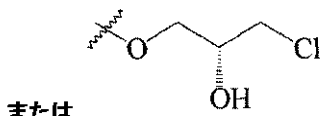
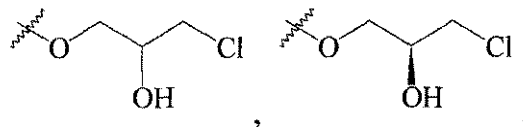
であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；uが、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目88、90または98に記載の化合物または塩。
(項目103)

Qが、
【化940】



20

であり；Tが、
【化941】



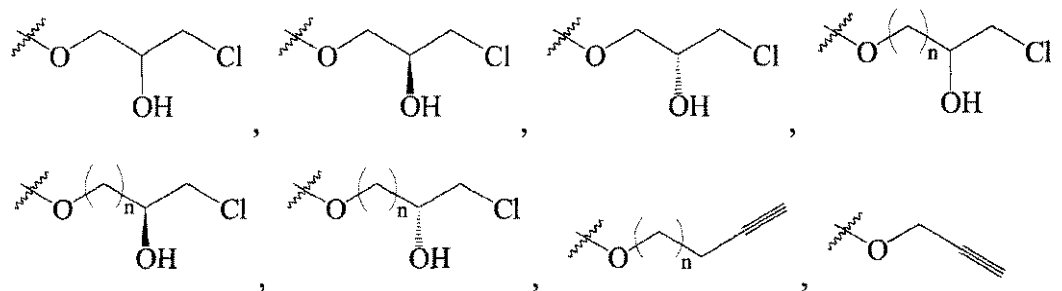
または

30

であり、qが、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目98に記載の化合物または塩。

(項目104)

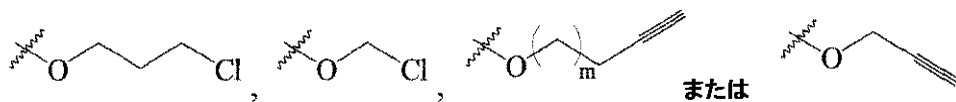
Qが、
【化942】



40

であり；Tが、

【化 9 4 3】

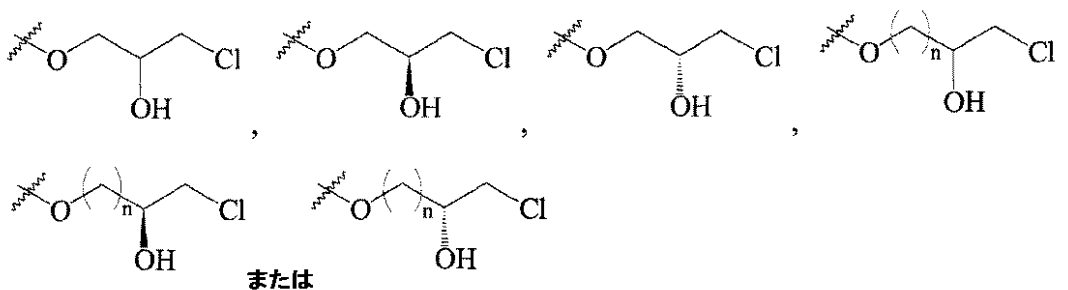


であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目88または98に記載の化合物または塩。

(項目105)

Qが、

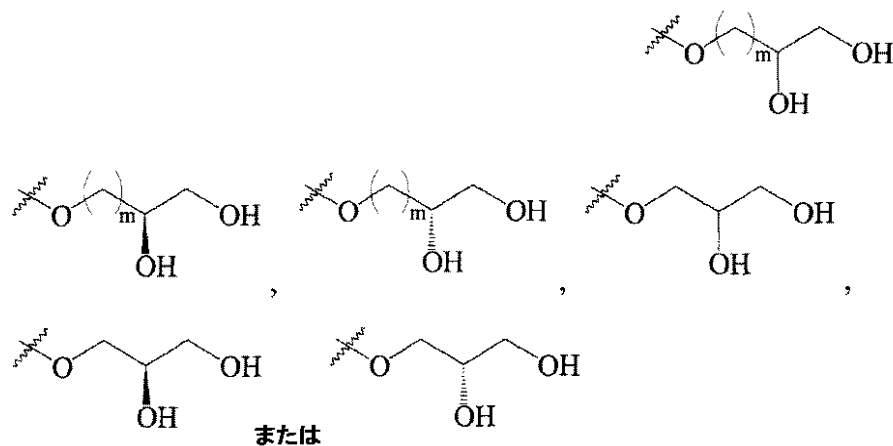
【化 9 4 4】



10

であり；Tが、

【化 9 4 5】



20

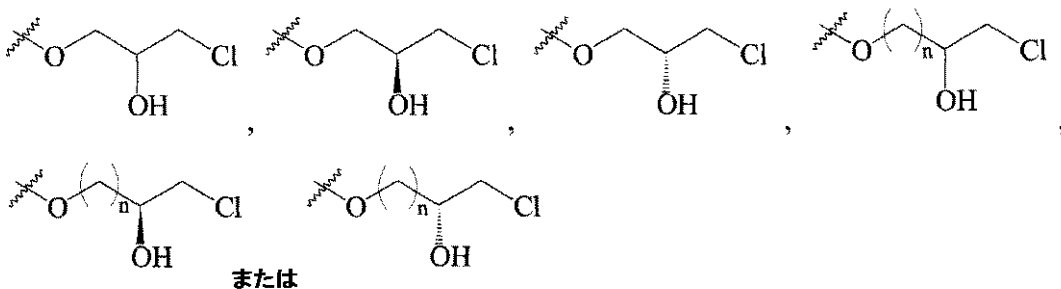
30

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；mが、0、1、2、3、4、5、6、7または8である、項目88または98に記載の化合物または塩。

(項目106)

Qが、

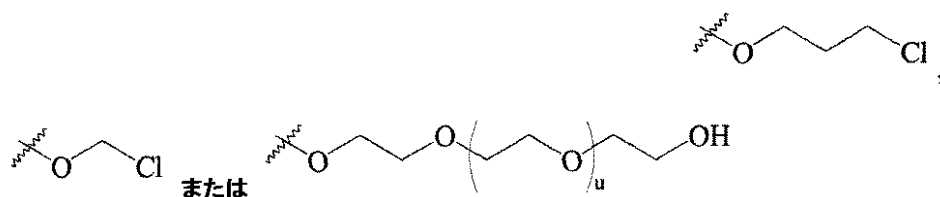
【化 9 4 6】



40

50

であり；Tが、
【化947】



10

であり；nが、0、1、2、3、4、5、6、7または8であり；uが、0、1、2、3、4、5、6または7である、項目88または98に記載の化合物または塩。

(項目107)

G¹が、存在するとき、CH₂C(CH₃)₂またはCH(CH₃)₂である、項目88から106のいずれか1項に記載の化合物または塩。

(項目108)

前記残りの各Zが、独立して、C(CH₃)₃；CH；およびCB_rから選択される、項目88から107のいずれか1項に記載の化合物または塩。

20

(項目109)

前記残りの各Zが、CHである、項目88から107のいずれか1項に記載の化合物または塩。

(項目110)

Xが、CH₂である、項目88から109のいずれか1項に記載の化合物または塩。

(項目111)

Xが、CHR¹であり、R¹が、CH₃である、項目88から109のいずれか1項に記載の化合物または塩。

(項目112)

Xが、CR¹R²であり、R¹およびR²の各々が、CH₃である、項目88から109のいずれか1項に記載の化合物または塩。

30

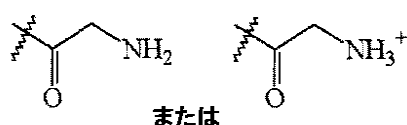
(項目113)

前記化合物または塩のOH基の1つ以上が、該Hを表1から選択される部分で置き換えるように必要に応じて置換される、項目88から112のいずれか1項に記載の化合物または塩。

(項目114)

表1から選択される前記部分が、

【化948】



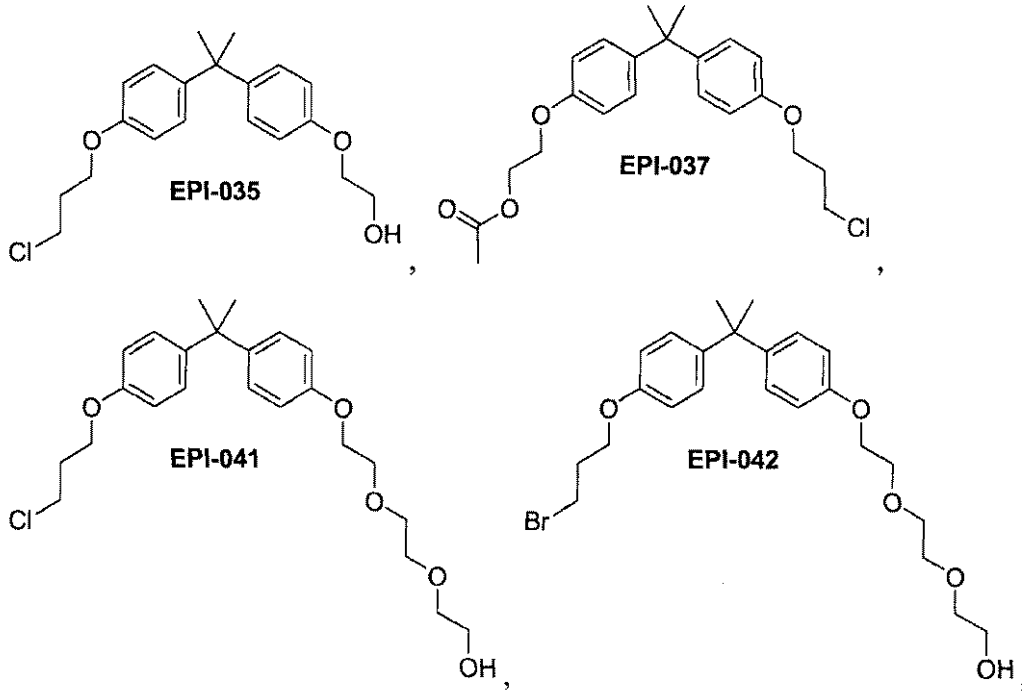
40

である、項目113に記載の化合物または塩。

(項目115)

以下：

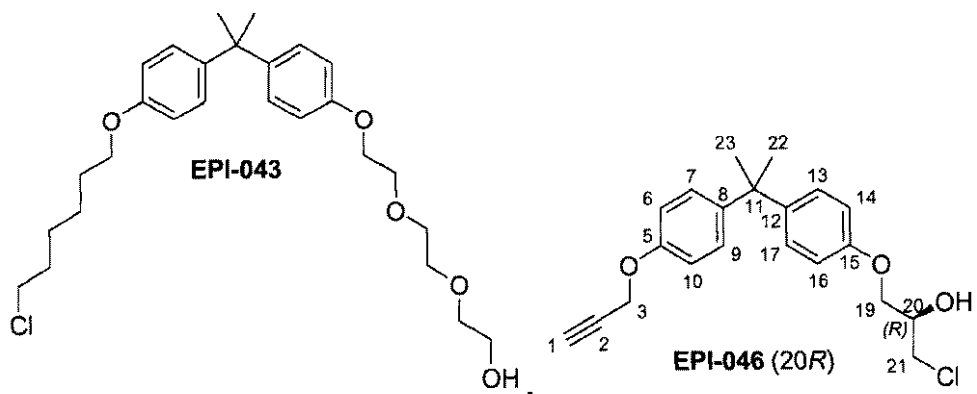
【化 9 4 9】



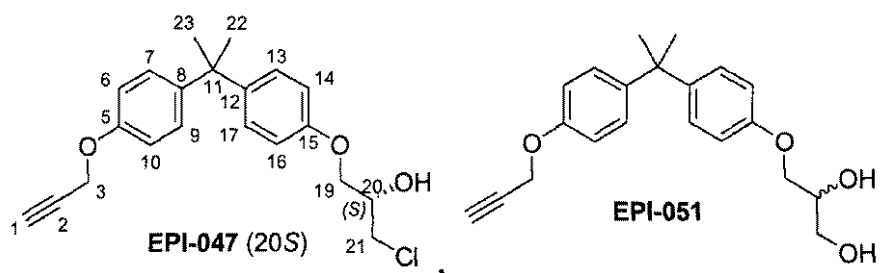
10

20

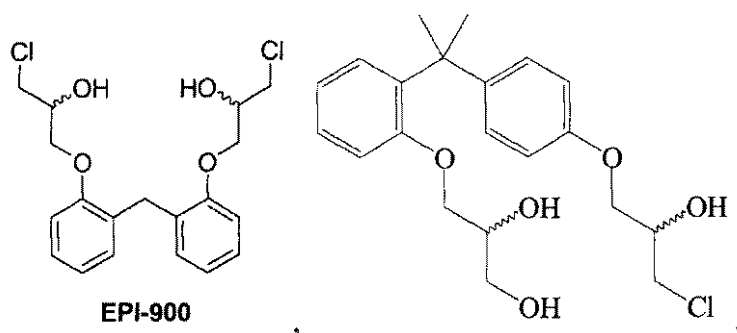
【化 9 5 0】



10



20



30

または

のうちの1つ以上から選択される化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 1 1 6)

アンドロゲンレセプター (AR) 活性を調節する方法であって、該方法は、それを必要とする被験体に項目 1 から 1 1 5 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得る塩を投与する工程を包含する、方法。

(項目 1 1 7)

前記アンドロゲンレセプター (AR) 活性の調節が、以下：前立腺癌；乳癌；卵巣癌；子宮内膜癌；脱毛；ざ瘡；多毛症；卵巣嚢胞；多嚢胞性卵巣疾患；性的早熟症；および加齢黄斑変性症のうちの1つ以上を処置するためのものである、項目 1 1 6 に記載の方法。

(項目 1 1 8)

項目 1 から 1 1 5 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得る塩および薬学的に許容され得るキャリアを含む、薬学的組成物。

50

【図面の簡単な説明】

【0913】

【図1】図1は、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-035についての用量反応をEPI-001およびEPI-026と比較して示している。

【図2A】図2Aは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-041およびEPI-037についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図2B】図2Bは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-038についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図3A】図3Aは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-040についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図3B】図3Bは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-051についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図4A】図4Aは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、5 μ M ~ 35 μ Mの投薬量範囲にわたるEPI-043についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図4B】図4Bは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、0.25 μ M ~ 25 μ Mの投薬量範囲にわたるEPI-043についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図5】図5は、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-051についての用量反応をEPI-001およびEPI-026と比較して示している。

【図6】図6は、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-046およびEPI-047についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【図7A】図7Aは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-900についての用量反応を示している。

【図7B】図7Bは、LNCaP PSA(6.1kb) - ルシフェラーゼアッセイにおける、EPI-6000、EPI-6001、EPI-6002およびEPI-6003についての用量反応をEPI-001と比較して示している。

【発明を実施するための形態】

【0914】

詳細な説明

本明細書中で使用されるとき、句「C_x-C_yアルキル」は、当業者に通常理解されているように使用され、xからyまでの数(整数xおよびyを含み、この範囲内のすべての個別の整数が含まれる)の炭素原子を含む炭素骨格または炭素主鎖を有する化学物質のことを指すことが多い。例えば、「C₁-C₁₀アルキル」は、その炭素骨格または主鎖に1、2、3、4、5、6、7、8、9または10個の炭素原子を有する化学物質である。

【0915】

本明細書中で使用されるとき、用語「環状C_x-C_yアルキル」は、当業者に通常理解されているように使用され、化学物質の炭素骨格または主鎖の少なくとも一部が、共に結合された原子の「ループ」、輪または環を形成するように結合された、化合物または化学物質のことを指すことが多い。それらの原子は、すべてが互いに直接結合しなくてもよく、その「ループ」においてわずか2つの他の原子に直接結合されることがある。環状アルキルの非限定的な例としては、ベンゼン、トルエン、シクロペンタン、ビスフェノールおよび1-クロロ-3-エチルシクロヘキサンが挙げられる。

【0916】

本明細書中で使用されるとき、用語「分枝状」は、当業者に通常理解されているように使用され、2つ以上の連続した鎖に分割している骨格または主鎖を含む化学物質のことを

10

20

30

40

50

指すことが多い。2つ以上の向きで分割している骨格または主鎖の部分は、直鎖状、環状またはそれらの任意の組み合わせであり得る。分枝状アルキルの非限定的な例は、tert-ブチルおよびイソプロピルである。

【0917】

本明細書中で使用されるとき、用語「非分枝状」は、当業者に通常理解されているように使用され、2つ以上の連続した鎖に分割していない骨格または主鎖を含む化学物質のことを指すことが多い。非分枝状アルキルの非限定的な例は、メチル、エチル、n-プロピルおよびn-ブチルである。

【0918】

本明細書中で使用されるとき、用語「置換」は、当業者に通常理解されているように使用され、1つ以上のヘテロ原子を含む異なる化学基で置き換えられた1つの化学基を有する化学物質のことを指すことが多い。別段明記されない限り、置換アルキルは、1つ以上の水素原子が、水素でない1つ以上の原子で置き換えられているアルキルである。例えば、クロロメチルは、置換アルキルの非限定的な例であり、より詳細には、置換メチルの例である。アミノエチルは、置換アルキルの別の非限定的な例であり、より詳細には、置換エチルの別の非限定的な例である。

【0919】

本明細書中で使用されるとき、用語「非置換」は、当業者に通常理解されているように使用され、炭化水素であり、かつ/またはヘテロ原子を含まない化学物質のことを指すことが多い。非置換アルキルの非限定的な例としては、メチル、エチル、tert-ブチルおよびペンチルが挙げられる。

【0920】

本明細書中で使用されるとき、用語「飽和」は、化学物質に対して言及しているとき、当業者に通常理解されているように使用され、単結合だけを含む化学物質のことを指すことが多い。飽和の化学物質の非限定的な例としては、エタン、tert-ブチルおよび N^+H_3 が挙げられる。

【0921】

本明細書中で使用されるとき、 $C_1 - C_{10}$ アルキルとしては、例えば、飽和 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニルおよび $C_2 - C_{10}$ アルキニルが挙げられ得るが、これらに限定されない。飽和 $C_1 - C_{10}$ アルキルの非限定的な例としては、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、sec-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、i-ペンチル、sec-ペンチル、t-ペンチル、n-ヘキシル、i-ヘキシル、1,2-ジメチルプロピル、2-エチルプロピル、1-メチル-2-エチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,1,2-トリエチルプロピル、1,1-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2-エチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、sec-ヘキシル、t-ヘキシル、n-ヘプチル、i-ヘプチル、sec-ヘプチル、t-ヘプチル、n-オクチル、i-オクチル、sec-オクチル、t-オクチル、n-ノニル、i-ノニル、sec-ノニル、t-ノニル、n-デシル、i-デシル、sec-デシルおよびt-デシルが挙げられ得る。 $C_2 - C_{10}$ アルケニルの非限定的な例としては、ビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペン-2-イル、1-ブテン-1-イル、1-ブテン-2-イル、1-ブテン-3-イル、2-ブテン-1-イル、2-ブテン-2-イル、オクテニルおよびデセニルが挙げられ得る。 $C_2 - C_{10}$ アルキニルの非限定的な例としては、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニルおよびデシニルが挙げられ得る。飽和 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルキニルは、以下に限定されないが、例えば、独立して窒素、硫黄または酸素である1つ以上ヘテロ原子によって中断され得る。

【0922】

本明細書中で使用されるとき、環状 $C_3 - C_{10}$ アルキルとしては、例えば、飽和 C_3

10

20

30

40

50

- C₁₀ シクロアルキル、C₃ - C₁₀ シクロアルケニル、C₃ - C₁₀ シクロアルキニル、C₆ - C₁₀ アリール、C₆ - C₉ アリール - C₁ - C₄ アルキル、C₆ - C₈ アリール - C₂ - C₄ アルケニル、C₆ - C₈ アリール - C₂ - C₄ アルキニル、独立して窒素、硫黄または酸素である1つ以上のヘテロ原子を含む4～10員の非芳香族複素環式基、および独立して窒素、硫黄または酸素である1つ以上のヘテロ原子を含む5～10員の芳香族複素環式基が挙げられ得るが、これらに限定されない。飽和C₃ - C₁₀ シクロアルキル基の非限定的な例としては、シクロプロパニル、シクロブタニル、シクロペンタニル、シクロヘキサニル、シクロヘプタニル、シクロオクタニル、シクロノナニルおよびシクロデカニルが挙げられ得る。C₃ - C₁₀ シクロアルケニル基の非限定的な例としては、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘクセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、シクロノナネニル (cyclononanenylyl) およびシクロデカネニル (cyclodecanenylyl) が挙げられ得る。C₆ - C₁₀ アリール基の非限定的な例としては、フェニル (Ph)、ペンタレニル、インデニル、ナフチルおよびアズレニルが挙げられ得る。C₆ - C₉ アリール - C₁ - C₄ アルキル基は、以下に限定されないが、例えば、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₆ - C₉ アリール基を置換基として有する、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₁ - C₄ アルキル基であり得る。C₆ - C₈ アリール - C₂ - C₄ アルケニル基は、以下に限定されないが、例えば、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₆ - C₈ アリール基を置換基として有する、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₂ - C₄ アルケニルであり得る。C₆ - C₈ アリール - C₂ - C₄ アルキニル基は、以下に限定されないが、例えば、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₆ - C₈ アリール基を置換基として有する、上記のいずれかの箇所で定義されたようなC₂ - C₄ アルキニル基であり得る。独立して窒素、硫黄または酸素である1つ以上のヘテロ原子を含む4～10員の非芳香族複素環式基の非限定的な例としては、ピロリジニル、ピロリニル、ピペリジニル、ピペラジニル、イミダゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、モルホリニル、テトラヒドロピラニル、アゼチジニル、オキセタニル、オキサチオラニル、フタルイミドおよびスクシンイミドが挙げられ得る。独立して窒素、硫黄または酸素である1つ以上のヘテロ原子を含む5～10員の芳香族複素環式基の非限定的な例としては、ピロリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル (pirazinyl)、イミダゾリル、チアゾリルおよびオキサゾリルが挙げられ得る。

【0923】

1～10個の炭素が置換されたまたは置換されていないアシルの非限定的な例としては、アセチル、プロピオニル、ブタノイルおよびペンタノイルが挙げられる。C₁ - C₁₀ アルコキシの非限定的な例としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびブトキシが挙げられる。

【0924】

本明細書中で使用される時、シンボル

【0925】

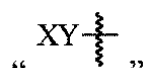
【化801】



(本明細書中以後、「付着結合点」と呼ばれることがある)は、2つの化学物質間の付着点である結合のことを表し、その2つの化学物質のうち的一方は、付着結合点に付着されているように描かれ、他方は、付着結合点に付着されているように描かれない。例えば、

【0926】

【化802】

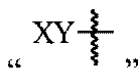


は、化学物質「XY」が、付着結合点を介して別の化学物質に結合されることを示す。さ

らに、描かれていない化学物質に対する特定の付着点は、推論によって特定され得る。例えば、化合物 $\text{CH}_3 - \text{R}^3$ (ここで、 R^3 は、Hまたは

【0927】

【化803】



である) から、 R^3 が「XY」であるとき、その付着結合点は、 R^3 が CH_3 に結合しているように描かれる結合と同じ結合であると推測される。

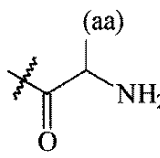
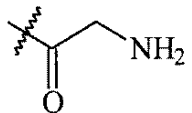
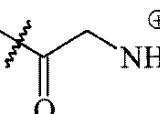
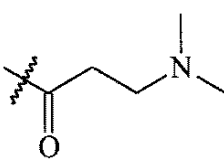
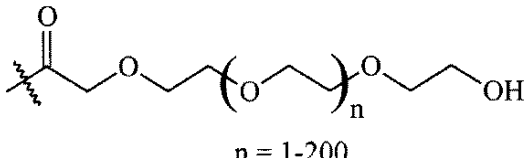
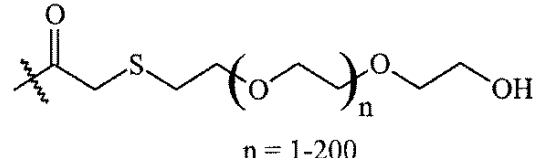
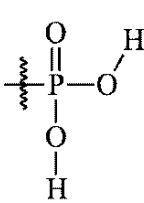
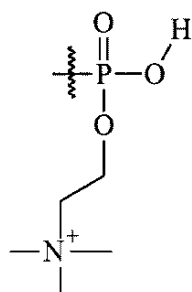
【0928】

本明細書中で使用されるとき、用語「部分」とは、下記の表1に示される部分のことを指す。

表1

【0929】

【表1-1】

部分	
アミノ酸ベースの部分	
 <p>(aa) = 任意の天然に存在するアミノ酸側鎖</p>	
	
ポリエチレングリコールベースの部分	
 <p>n = 1-200</p>	 <p>n = 1-200</p>
リン酸ベースの部分	
	

【0930】

10

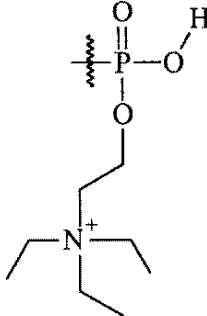
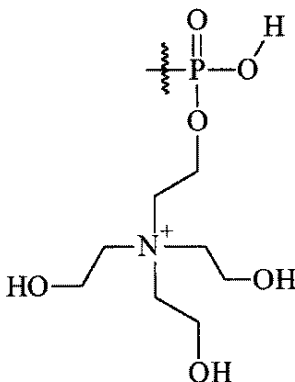
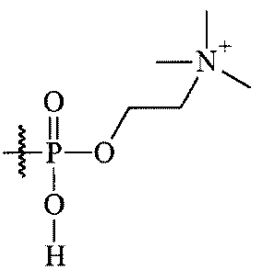
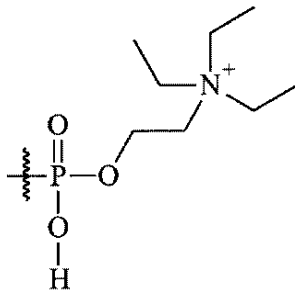
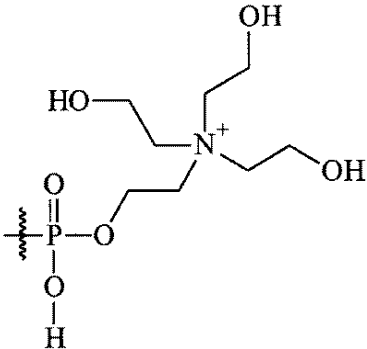
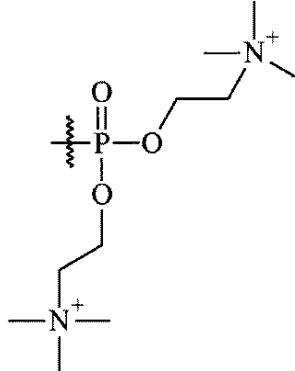
20

30

40

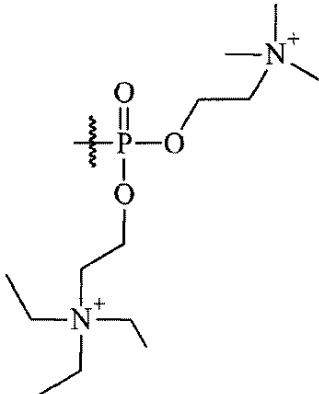
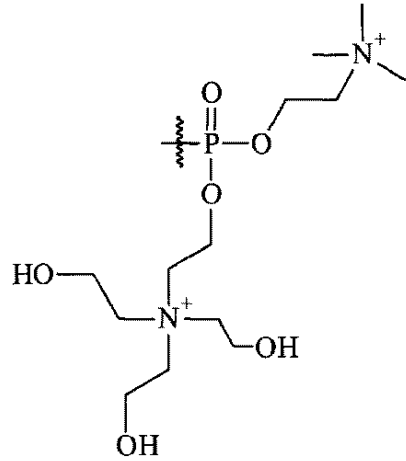
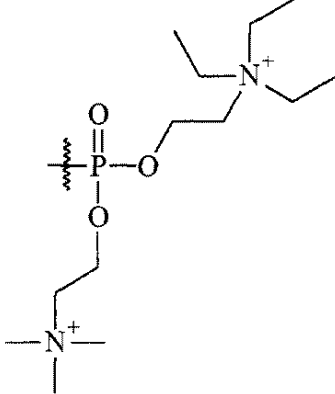
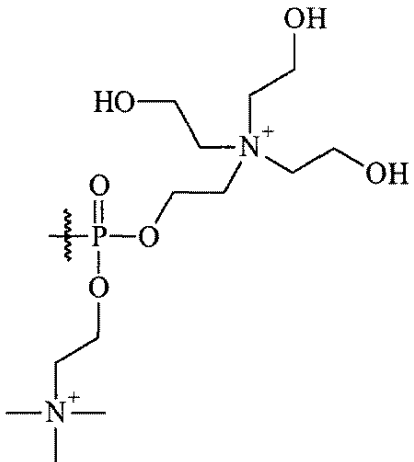
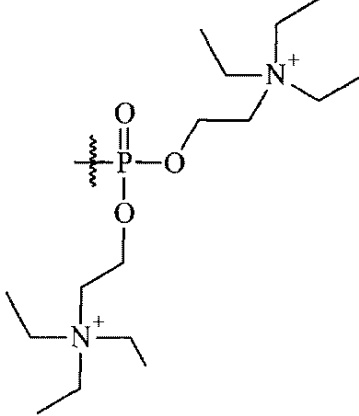
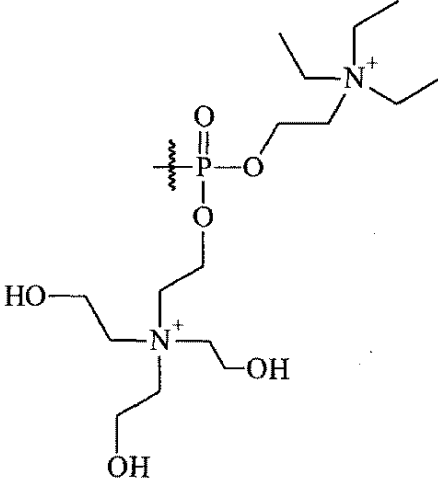
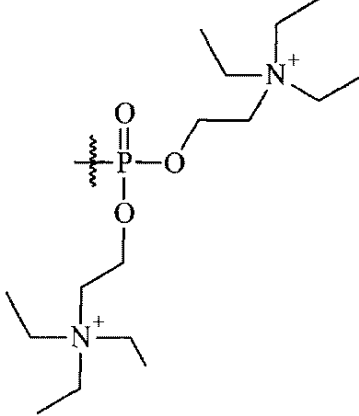
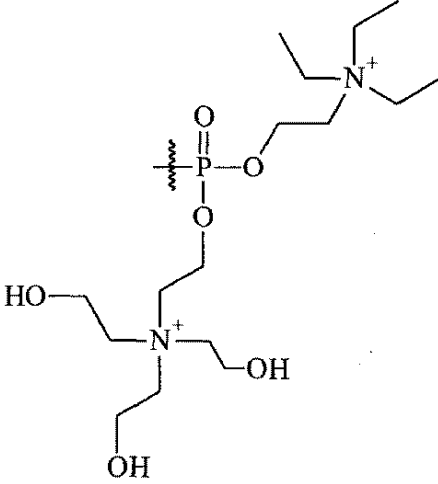
50

【表 1 - 2】

部分		
		10
		20
		30

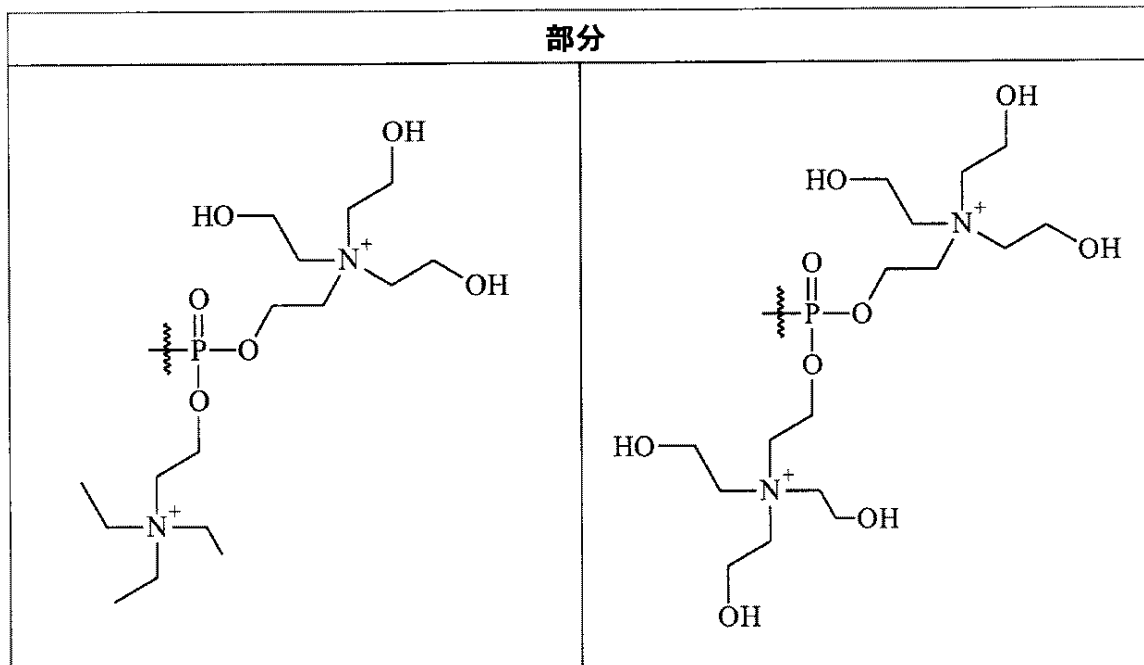
【 0 9 3 1 】

【表 1 - 3】

部分		
		10
		20
		30
		40

【 0 9 3 2 】

【表 1 - 4】



10

部分は、以下に限定されないが、例えば、3つの群：1)アミノ酸ベースの部分；2)ポリエチレングリコールベースの部分；および3)リン酸ベースの部分に細分され得る。上記の表1の部分において、最初の4つの部分が、アミノ酸ベースの部分であり、第5および第6の部分が、ポリエチレングリコールベースの部分であり、残りの部分が、リン酸ベースの部分である。

20

【0933】

天然に存在するアミノ酸のアミノ酸側鎖（本明細書中ではしばしば「(aa)」を用いて表される）は、当業者に周知であり、1995年にScientific American Booksから出版されたJames Darnellらによる“Molecular Cell Biology” Third Editionなどの種々の教科書に見られる。天然に存在するアミノ酸は、式(NH₂)C(COOH)(H)(R)によって表されることが多く、ここで、丸括弧内の化学基は各々、丸括弧内以外の炭素に結合されている。Rは、この特定の式における側鎖に相当する。

30

【0934】

当業者は、上記部分と本明細書中に記載されるような化合物との共有結合点が、以下に限定されないが、例えば、特定の条件下で切断され得ることを認識するだろう。特定の条件としては、例えば、インビボにおける酵素的または非酵素的な手段が挙げられ得るが、これらに限定されない。その部分の切断は、以下に限定されないが、例えば、自発的に生じ得るか、あるいは別の物質または物理的パラメータもしくは環境的パラメータ（例えば、酵素、光、酸、温度またはpH）の変化によって触媒され得るか、誘導され得る。その部分は、以下に限定されないが、例えば、官能基をマスクするように作用する保護基、1つ以上の能動的もしくは受動的な輸送機構に対する基質として作用する基、または化合物の特性（例えば、溶解性、バイオアベイラビリティまたは局在性）を付与するかもしくは増強するように作用する基であり得る。

40

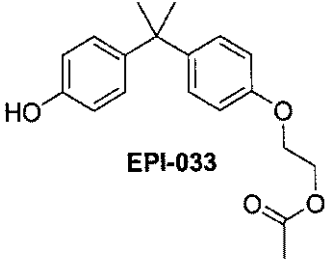
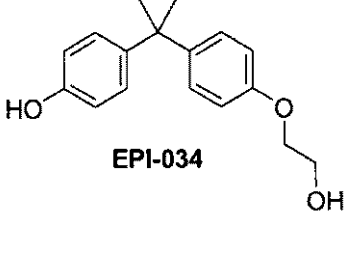
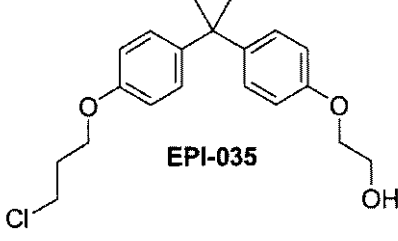
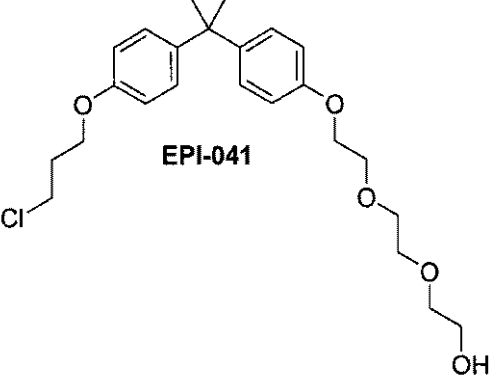
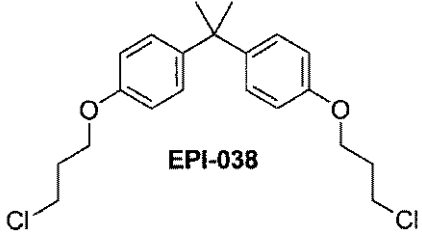
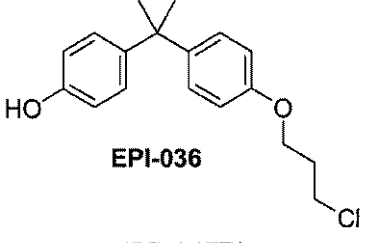
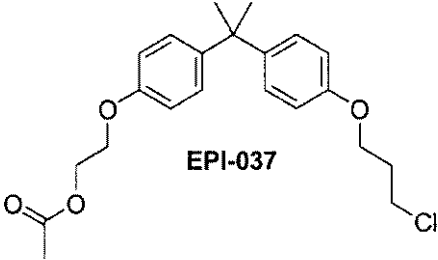
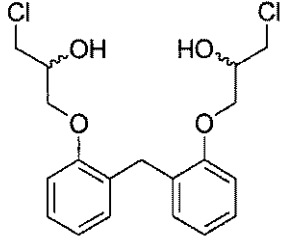
【0935】

本明細書中のいずれかの箇所に記載されるような本化合物の他の特定の実施形態では、下記の表2中の化合物が提供される。

表 2

【0936】

【表 2 - 1】

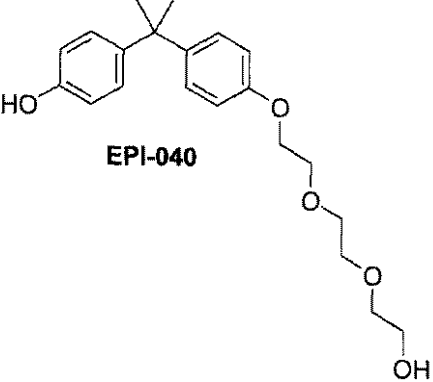
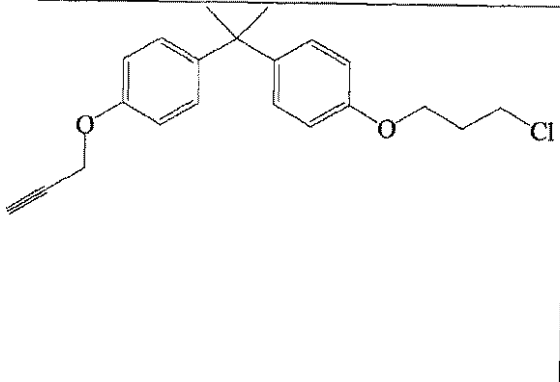
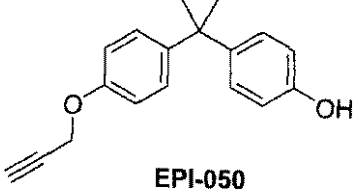
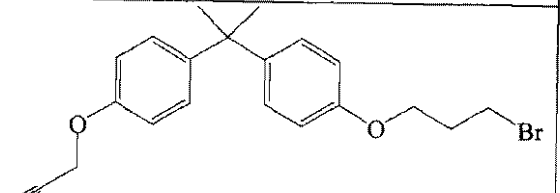
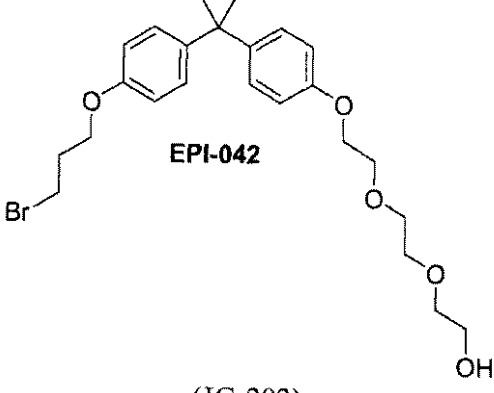
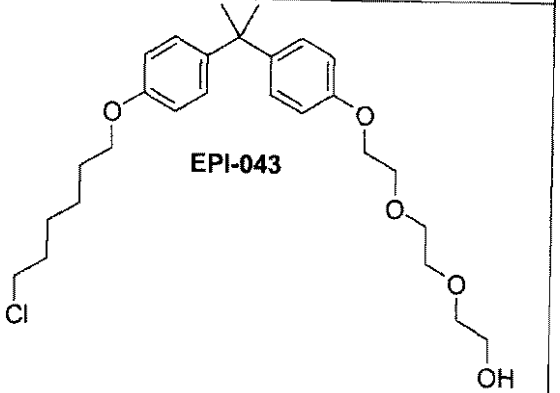
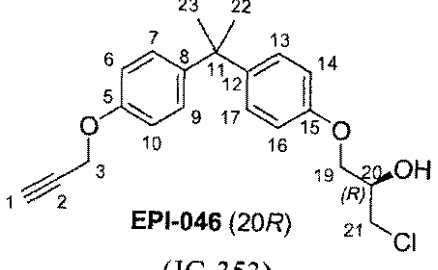
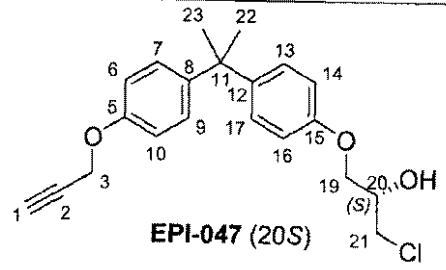
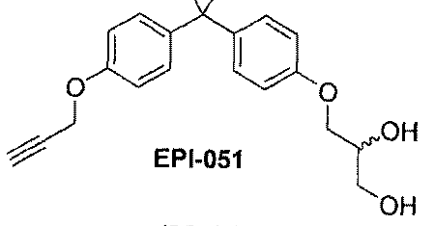
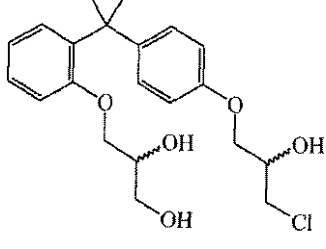
 <p>EPI-033</p>	 <p>EPI-034</p>
 <p>EPI-035 (JG-101, JG-133)</p>	 <p>EPI-041 (JG-140A)</p>
 <p>EPI-038 (JG-147A)</p>	 <p>EPI-036 (JG-147B)</p>
 <p>EPI-037 (JG-148A)</p>	 <p>EPI-900</p>

10

20

30

【表 2 - 2】

 <p>EPI-040</p> <p>(JG-122B)</p>	<p>(JG-181)</p> 	10
 <p>EPI-050</p>		20
 <p>EPI-042</p>	 <p>EPI-043</p>	30
 <p>EPI-046 (20R)</p> <p>(JG-353)</p>	 <p>EPI-047 (20S)</p> <p>(JG-349)</p>	40
 <p>EPI-051</p> <p>(JG-341)</p>	 <p>EPI-6000, EPI-6001, EPI-6002, および EPI-6003 (立体および位置異性体)</p>	50

いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物またはその上記の許容され得る塩は、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、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症の全身性処置のために使用され得る。いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物またはその上記の許容され得る塩は、本明細書中に記載される適応症の全身性処置のための医薬または組成物の調製において使用され得る。いくつかの実施形態において、本明細書中に記載される適応症のいずれかを全身的に処置する方法も提供される。本発明のいくつかの態様は、本明細書中に記載される化合物および薬学的に許容され得る賦形剤またはキャリアを含む組成物の使用をもたらす。いくつかの実施形態において、前立腺癌は、アンドロゲン非依存性前立腺癌（ホルモン不応性、去勢抵抗性、アンドロゲン遮断抵抗性、アンドロゲン除去抵抗性、アンドロゲン枯渇非依存性、去勢再発性、抗アンドロゲン - 再発性とも呼ばれる）である。いくつかの実施形態において、前立腺癌は、アンドロゲン依存性またはアンドロゲン感受性である。本明細書中に記載される適応症のいずれかを処置する方法も提供される。そのような方法は、それを必要とする被験体に本明細書中に記載されるような化合物もしくは本明細書中に記載されるような化合物の組成物、または有効量の明細書中に記載されるような化合物もしくは本明細書中に記載されるような化合物の組成物を投与する工程を包含し得る。

【0938】

本明細書中に記載されるような化合物は、遊離型またはその塩の形態であり得る。いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物は、当該分野で公知である薬学的に許容され得る塩の形態であり得る（*Berge's, J. Pharm. Sci.*, 1977, 66, 1）。本明細書中で使用される薬学的に許容され得る塩には、例えば、親化合物の所望の薬理学的活性を有する塩（親化合物の生物学的有効性および/または生物学的特性を保持し、かつ生物学的におよび/または別途望ましくなくない、塩）が含まれる。塩を形成することができる1つ以上の官能基を有する本明細書中に記載されるような化合物は、例えば、薬学的に許容され得る塩として形成され得る。1つ以上の塩基性官能基を含む化合物は、例えば、薬学的に許容され得る有機酸または無機酸を用いて薬学的に許容され得る塩を形成することができる場合がある。薬学的に許容され得る塩は、以下に限定されないが、例えば、酢酸、アジピン酸、アルギン酸、アスパラギン酸、アスコルビン酸、安息香酸、ベンゼンスルホン酸、酪酸、桂皮酸、クエン酸、ショウノウ酸、カンファースルホン酸、シクロペンタンプロピオン酸、ジエチル酢酸、ジグルコン酸、ドデシルスルホン酸、エタンスルホン酸、ギ酸、フマル酸、グルコヘプタン酸、グルコン酸、グリセロリン酸、グリコール酸、ヘミスルホン酸、ヘプタン酸、ヘキサン酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、2-ヒドロキシエタンスルホン酸、イソニコチン酸、乳酸、リンゴ酸、マレイン酸、マロン酸、マンデル酸、メタンスルホン酸、2-ナフタレンスルホン酸（*naphthalenesulfonic acid*）、ナフタレンジスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ニコチン酸、硝酸、シュウ酸、パモ酸、ペクチン酸、3-フェニルプロピオン酸、リン酸、ピクリン酸、ピメリン酸、ピバル酸、プロピオン酸、ピルビン酸、サリチル酸、コハク酸、硫酸、スルファミン酸、酒石酸、チオシアン酸またはウンデカン酸から得られる場合がある。1つ以上の酸性官能基を含む化合物は、薬学的に許容され得る塩基、以下に限定されないが、例えば、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属に基づく無機塩基または有機塩基（例えば、第一級アミン化合物、第二級アミン化合物、第三級アミン化合物、第四級アミン化合物、置換アミン、天然に存在する置換アミン、環状アミンまたは塩基性イオン交換樹脂）を用いて薬学的に許容され得る塩を形成することができる場合がある。薬学的に許容され得る塩は、以下に限定されないが、例えば、薬学的に許容され得る金属カチオン（例えば、アンモニウム、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、鉄、亜鉛、銅、マンガンまたはアルミニウム）、アンモニア、ベンザチン、メグルミン、メチルアミン、ジメチルアミン、トリメチルアミン、エチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、イソプロピルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、2-ジメチルアミノエタノール、2-ジエチルアミノエタノール、ジシクロヘキシルアミン、リジン、アルギニン、ヒスチジン、カフェイン、ヒドラバミン、コリン、ベタイン、エチレンジアミン、グル

10

20

30

40

50

コサミン、グルカミン、メチルグルカミン、テオブロミン、プリン、ピペラジン、ピペリジン、プロカイン、N-エチルピペリジン、テオブロミン、テトラメチルアンモニウム化合物、テトラエチルアンモニウム化合物、ピリジン、N,N-ジメチルアニリン、N-メチルピペリジン、モルホリン、N-メチルモルホリン、N-エチルモルホリン、ジシクロヘキシルアミン、ジベンジルアミン、N,N-ジベンジルフェネチルアミン、1-エフェンアミン(ephedamine)、N,N'-ジベンジリエチレンジアミンまたはポリアミン樹脂の水酸化物、炭酸塩または炭酸水素塩から得られる場合がある。いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物は、酸性基と塩基性基の両方を含むことがあり、分子内塩または両性イオンの形態、以下に限定されないが、例えば、ベタインであり得る。本明細書中に記載されるような塩は、当業者に公知の従来のプロセスによって(以下に限定されないが、例えば、その遊離型と、有機酸もしくは無機酸または有機塩基もしくは無機塩基とを反応させることによって、あるいは他の塩からの陰イオン交換または陽イオン交換によって)調製され得る。当業者は、塩の調製が、単離中にそのままの状態が生じ得ること、および化合物の精製または塩の調製が、単離された化合物および精製された化合物を別個に反応させることによって生じ得ることを認識するだろう。

10

【0939】

いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物およびその種々のすべての形態(例えば、遊離型、塩、多形、異性体)は、溶媒付加型(solvent addition form)、例えば、溶媒和化合物であり得る。溶媒和化合物は、化合物またはその塩の物理的会合において化学量論量または非化学量論量の溶媒を含む。その溶媒は、以下に限定されないが、例えば、薬学的に許容され得る溶媒であり得る。例えば、その溶媒が水であるとき、水和物が形成されるか、またはその溶媒がアルコールであるとき、アルコールが形成される。

20

【0940】

いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物およびその種々のすべての形態(例えば、遊離型、塩、溶媒和化合物、異性体)には、結晶形および非晶形、例えば、多形、偽多形、配座多形、非晶形またはそれらの組み合わせが含まれ得る。多形は、同じ元素組成の化合物の異なる結晶充填配列(crystal packing arrangements)を含む。多形は、通常、異なるX線回折パターン、赤外スペクトル、融点、密度、硬度、結晶形、光学的特性および電気的特性、安定性ならびに/または溶解性を有する。当業者は、再結晶溶媒、結晶化速度および貯蔵温度を含む様々な因子によって、単一の結晶形が優位を占めるようになり得ることを認識するだろう。

30

【0941】

いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物およびそのすべての種々の形態(例えば、遊離型、塩、溶媒和化合物、多形)には、異性体(例えば、幾何異性体、不斉炭素に基づく光学異性体、立体異性体、互変異性体、個別のエナンチオマー、個別のジアステレオマー、ラセミ体、ジアステレオ異性体混合物およびそれらの組み合わせ)が含まれ、それらは、便宜上例証される式の記載によって限定されない。

【0942】

いくつかの実施形態において、本発明に係る薬学的組成物は、そのような化合物の塩、好ましくは、薬学的または生理的に許容され得る塩を含み得る。医薬品は、代表的には、注射、吸入、局所的投与、洗浄、または選択された処置に適した他の様式による、その調製物の投与様式にとって許容され得る1つ以上のキャリア、賦形剤または希釈剤を含み得る。適当なキャリア、賦形剤または希釈剤は、そのような投与様式において使用するために当該分野で公知のものである。

40

【0943】

適当な薬学的組成物は、当該分野で公知の手段によって製剤化され得、それらの投与様式および用量は、当業者によって決定され得る。非経口投与の場合、化合物は、滅菌水もしくは食塩水、または非水溶性化合物の投与に使用される薬学的に許容され得るビヒクル(例えば、ビタミンKに対して使用されるもの)に溶解され得る。経腸投与の場合、本化

50

化合物は、錠剤、カプセルで投与され得るか、または液体の形態に溶解され得る。その錠剤またはカプセルは、腸溶性であり得るか、または徐放用の製剤であり得る。放出される化合物を被包しているポリマー微小粒子もしくはタンパク質微小粒子、軟膏、ペースト、ゲル、ヒドロゲルまたは溶液を含む多くの適当な製剤が知られており、それらは、局所的または局在的に使用されることにより、化合物が投与され得る。長時間にわたって放出するために徐放パッチまたは埋没物が使用され得る。当業者に公知の多くの手法が、Remington: the Science & Practice of Pharmacy Alfonso Gennaro, 20th ed., Lippencott Williams & Wilkins, (2000)に記載されている。非経口投与用の製剤は、例えば、賦形剤、ポリアルキレングリコール（例えば、ポリエチレングリコール）、植物起源の油または水素化ナフタレンを含み得る。生体適合性で生分解性のラクチドポリマー、ラクチド/グリコリド共重合体またはポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレン共重合体が、本化合物の放出を制御するために使用され得る。調節性の化合物のための他の潜在的に有用な非経口送達系としては、エチレン-酢酸ビニル共重合体粒子、浸透圧ポンプ、植め込み式注入システムおよびリポソームが挙げられる。吸入用の製剤は、賦形剤、例えば、ラクトースを含み得るか、または例えば、ポリオキシエチレン-9-ラウリルエーテル、グリココレートおよびデオキシコレートを含む水溶液であり得るか、または点鼻液の形態でもしくはゲルとして投与するための油性溶液であり得る。

10

【0944】

本発明に係るまたは本発明において使用するための化合物または薬学的組成物は、医療機器またはアプライアンス（例えば、埋没物、移植片、プロステーシス、ステントなど）を用いて投与され得る。また、そのような化合物または組成物を含み、放出するように意図された埋没物が、考案され得る。その例は、本化合物をある期間にわたって放出するように適合されたポリマー材料から作製された埋没物であり得る。

20

【0945】

本発明に係る薬学的組成物の「有効量」には、治療有効量または予防有効量が含まれる。「治療有効量」とは、所望の治療結果（例えば、腫瘍サイズの減少、寿命の延長または平均余命の延長）を達成するために必要な投薬量および時間において、有効な量のことを指す。化合物の治療有効量は、被験体の疾患状態、年齢、性別および体重、ならびにその化合物が被験体において所望の応答を誘発する能力などの因子に応じて変動し得る。投与レジメンは、最適な治療反応がもたらされるように調整され得る。治療有効量は、治療的に有益な効果が、その化合物の任意の毒性作用または有害作用にまさる量でもある。「予防有効量」とは、所望の予防結果（例えば、腫瘍の縮小、寿命の延長、平均余命の延長または前立腺癌のアンドロゲン非依存型への進行の予防）を達成するために必要な投薬量および時間における、有効な量のことを指す。代表的には、予防用量は、疾患発症前またはより早期の疾患の被験体において使用され、その結果、予防有効量は、治療有効量未満であり得る。

30

【0946】

投薬量の値は、軽減されるべき状態の重症度に応じて変動し得ることに注意されたい。任意の特定の被験体に対して、特定の投与レジメンは、その個体の要求、およびその組成物の投与を行う者または監督する者の専門的判断に従って、経時的に調整され得る。本明細書中に示される投薬量の範囲は、単なる例示であって、医療従事者によって選択され得る投薬量を限定しない。組成物中の活性な化合物の量は、被験体の疾患状態、年齢、性別および体重などの因子に応じて変動し得る。投与レジメンは、最適な治療反応がもたらされるように調整され得る。例えば、単回のボラスが投与されてもよいし、いくつかの分割量が、時間をかけて投与されてもよいし、治療状況の緊急事態が示唆されるときはそれに比例してその用量が減少されてもよいし、増加されてもよい。投与を容易にするため、および投薬量を均一にするために、投薬単位形態（dosage unit form）の非経口組成物を製剤化することが有益であり得る。

40

【0947】

50

いくつかの実施形態において、本明細書中に記載されるような化合物およびそのすべての種々の形態は、以下に限定されないが、例えば、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症に対する他の処置方法と併用して、使用され得る。例えば、本明細書中に記載されるような化合物およびそのすべての種々の形態は、手術、放射線照射（近接照射療法または外照射）または他の治療法（例えば、HIFU）とともに、ネオアジュバント療法（前）、補助的療法（中）および/またはアジュバント療法（後）として使用され得る。

【0948】

一般に、本発明の化合物は、実質的な毒性を引き起こさずに使用されるべきである。本発明の化合物の毒性は、標準的な手法を用いて、例えば、細胞培養物または実験動物において試験すること、および治療指数、すなわち、LD50（集団の50%に対する致死量）とLD100（集団の100%に対する致死量）との比を測定することによって、測定され得る。しかしながら、重篤な疾患状態などのいくつかの状況では、実質的に過剰な量の組成物を投与することが必要である場合がある。本発明のいくつかの化合物は、いくつかの濃度において毒性であり得る。毒性濃度および無毒性濃度を測定するために、漸増漸減研究が用いられ得る。毒性は、ARを発現しないネガティブコントロールとしてPC3細胞を用いてすべての細胞株にわたって特定の化合物または組成物の特異性を調べることによって評価され得る。その化合物が他の組織に対して任意の影響を有する場合、動物試験を用いることにより、適応症が提供され得る。抗アンドロゲンおよびアンドロゲン不感症候群は致死的でないので、ARを標的にする全身性治療は、他の組織に対して主だった問題を引き起こす可能性が低い。

【0949】

本明細書中に記載されるような化合物は、被験体に投与され得る。本明細書中で使用される時、「被験体」は、ヒト、非ヒト霊長類、ラット、マウス、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、イヌ、ネコなどであり得る。被験体は、癌（例えば、前立腺癌、乳癌、卵巣癌または子宮内膜癌）を有すると疑われるかもしくは有するリスクがあると疑われるか、またはざ瘡、多毛症、脱毛症、良性前立腺肥大、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症もしくは加齢黄斑変性症を有すると疑われるかもしくは有するリスクがあると疑われることがある。様々な癌（例えば、前立腺癌、乳癌、卵巣癌または子宮内膜癌）に対する診断方法およびざ瘡、多毛症、脱毛症、良性前立腺肥大、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症または加齢黄斑変性症に対する診断方法、ならびに癌（例えば、前立腺癌、乳癌、卵巣癌または子宮内膜癌）の臨床上的表現、ざ瘡、多毛症、脱毛症、良性前立腺肥大、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症または加齢黄斑変性症の診断法および臨床上的表現は、当業者に公知である。

【0950】

本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌を処置するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン非依存性前立腺癌を処置するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン依存性前立腺癌を処置するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するための医薬を調製するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌を処置するための医薬を調製するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン非依存性前立腺癌を処置するための医薬を調製するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン依存性前立腺癌を処置するための医薬を調製するために使用され得る。本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌、乳癌、卵巣癌、子宮内膜癌、脱毛、ざ瘡、多毛症、卵巣嚢胞、

10

20

30

40

50

多嚢胞性卵巣疾患、性的早熟症および加齢黄斑変性症からなる群から選択される少なくとも1つの適応症を処置するための方法において使用され得る。その方法は、それを必要とする被験体に有効量の本明細書中に記載される化合物を投与する工程を包含し得る。本明細書中に記載される化合物は、前立腺癌を処置する方法において使用され得、その方法は、それを必要とする被験体に有効量の本明細書中に記載される化合物を投与する工程を包含する。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン非依存性前立腺癌を処置する方法において使用され得、その方法は、それを必要とする被験体に有効量の本明細書中に記載される化合物を投与する工程を包含する。本明細書中に記載される化合物は、アンドロゲン依存性前立腺癌を処置する方法において使用され得、その方法は、それを必要とする被験体に有効量の本明細書中に記載される化合物を投与する工程を包含する。

10

【0951】

本明細書中に記載される化合物は、アッセイにおいておよび研究目的のためにも使用され得る。使用される定義には、アンドロゲン（例えば、ジヒドロテストステロン（DHT）または研究目的で使用される合成アンドロゲン（R1881））によるアンドロゲンレセプター（AR）のリガンド依存的活性化が含まれる。ARのリガンド非依存的活性化とは、例えば、フォルスコリン（FSK）を用いたcAMP依存性タンパク質キナーゼ（PKA）経路の刺激による、アンドロゲン（リガンド）の非存在下におけるARのトランス活性化のことを指す。本発明のいくつかの化合物および組成物は、FSKとアンドロゲン（例えば、R1881）の両方によるARE-ルシフェラーゼ（ARE-luc）の誘導を阻害し得る。そのような化合物は、ARのリガンド依存性とリガンド非依存性の両方の活性化に共通の機序を阻止し得る。これは、熱ショックタンパク質の解離、必須の翻訳後修飾（例えば、アセチル化、リン酸化）、核移行、タンパク質間相互作用、転写複合体の形成、コリプレッサーの放出、および/または分解の増加を含むARの活性化における任意の工程を含み得る。本発明のいくつかの化合物および組成物は、R1881だけを阻害し得、リガンド依存的活性化（例えば、リガンド結合ドメイン（LBD）とアンドロゲンとの接近）に特異的な機序を妨害し得る。前立腺癌に加えて数多くの障害が、アンドロゲン軸（androgen axis）に関わり（例えば、ざ瘡、多毛症、脱毛症、良性前立腺肥大）、この機序を妨害する化合物が、そのような状態を処置するために使用され得る。本発明のいくつかの化合物および組成物は、FSK誘導だけを阻害し得、ARのリガンド非依存的活性化に対して特異的なインヒビターであり得る。これらの化合物および組成物は、FSK活性および/もしくはPKA活性、またはARに対して関与し得る任意の下流の作用によって通常生じる事象のカスケードを妨害し得る（例えば、FSKは、AR活性に対して強力な作用を有するMAPK活性を増加させる）。例としては、cAMPおよびまたはPKAもしくは他のキナーゼのインヒビターが挙げられ得る。本発明のいくつかの化合物および組成物は、ARの基礎レベルの活性を誘導し得る（アンドロゲンまたはPKA経路の刺激なし）。本発明のいくつかの化合物および組成物は、R1881またはFSKによる誘導を増加させ得る。そのような化合物および組成物は、ARの転写またはトランス活性化を刺激し得る。本発明のいくつかの化合物および組成物は、アンドロゲンレセプターの活性を阻害し得る。インターロイキン-6（IL-6）もまた、LNCaP細胞においてARのリガンド非依存的活性化を引き起こし、FSKに加えて使用することができる。

20

30

40

【0952】

本発明において使用するための化合物は、医学供給源（medical source）から得てもよいし、天然に存在する化合物から公知の方法を用いて改変されてもよい。さらに、本発明の化合物を調製するかまたは合成する方法は、公知の化学合成の原理に関係する当業者によって理解されるだろう。例えば、Auzouら、1974 European Journal of Medicinal Chemistry 9(5), 548-554には、上に示されたような式I~XXIのうちのいずれか1つの化合物を調製するために考慮され得、適切に適合され得る適当な合成手順が記載されている。役立つ他の参考文献としては：Debasish Das, Jyh-Fu Lee an

50

d Soofin Cheng "Sulfonic acid functionalized mesoporous MCM-41 silica as a convenient catalyst for Bisphenol-A synthesis" Chemical Communications, (2001) 2178-2179; 米国特許第2571217号 Davis, Orris L.; Knight, Horace S.; Skinner, John R. (Shell Development Co.) "Halohydrin ethers of phenols." (1951); および Rokicki, G.; Pawlicki, J.; Kuran, W. "Reactions of 4-chloromethyl-1,3-dioxolan-2-one with phenols as a new route to polyols and cyclic carbonates." Journal fuer Praktische Chemie (Leipzig) (1985) 327, 718-722 が挙げられる。

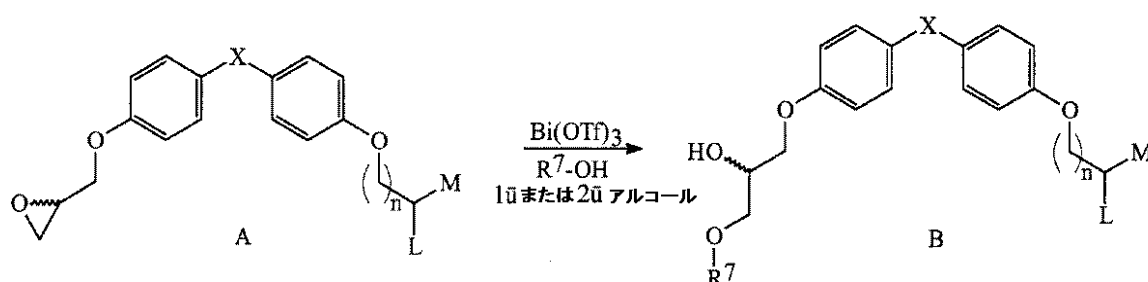
10

【0953】

例えば、エーテル部分を含む本発明の化合物は、以下の一般的な化学合成スキーム I を参照して得てもよい：

【0954】

【化804】



20

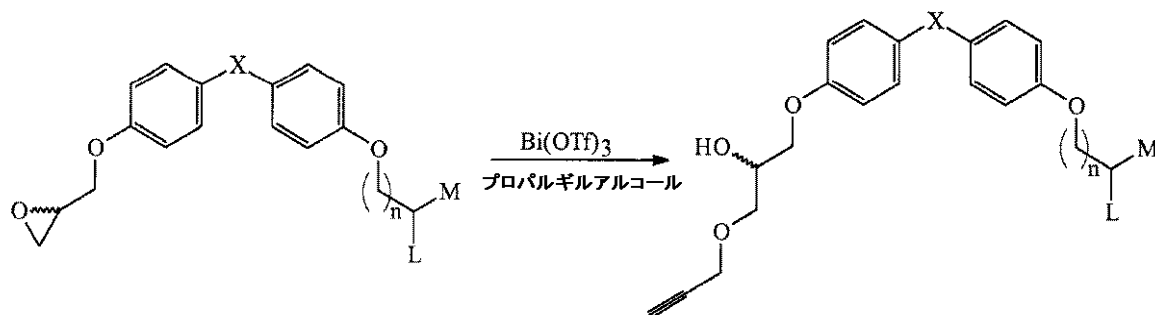
ここで、 $\text{R}^7\text{-OH}$ は、アルコールに相当し、 X 、 M 、 L および n は、本明細書中のいずれかの箇所で定義されるとおりである。ピスマストリプレートが、その反応にわたって、アルコール $\text{R}^7\text{-OH}$ 中のラセミ誘導体 A の溶液に少しずつ加えられ得る。その混合物は、適当な条件下で（例えば、rt で 24 時間）攪拌され得る。得られた懸濁液は、適当な試薬によって（例えば、炭酸水素ナトリウムを加えることによって）クエンチされ、抽出され（例えば、酢酸エチルで）、乾燥され（例えば、無水硫酸マグネシウムで）、濃縮され得る（例えば、真空下で）。得られた残渣を、適当な方法（例えば、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー - 溶離剤：酢酸エチル中の 90% ヘキサン）で精製することにより、B が得られ得る。当業者は、上記の一般スキーム I が、例えば、以下の一般的な化学合成スキーム II に基づいて、プロパルギルエーテル部分を含む本発明の化合物を調製するために適切に適合され得ることを理解するだろう：

30

【0955】

40

【化 8 0 5】

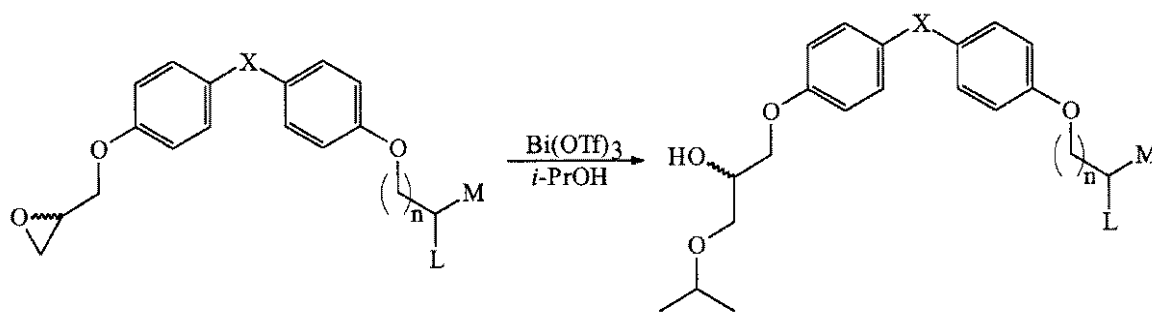


10

ここで、X、M、Lおよびnは、本明細書中のいずれかの箇所で定義されるとおりである。一般スキームIは、例えば、以下の一般的な化学合成スキームIIIに基づいて、イソプロピルエーテル部分を含む本発明の化合物を調製するために適切に適合され得る：

【 0 9 5 6】

【化 8 0 6】

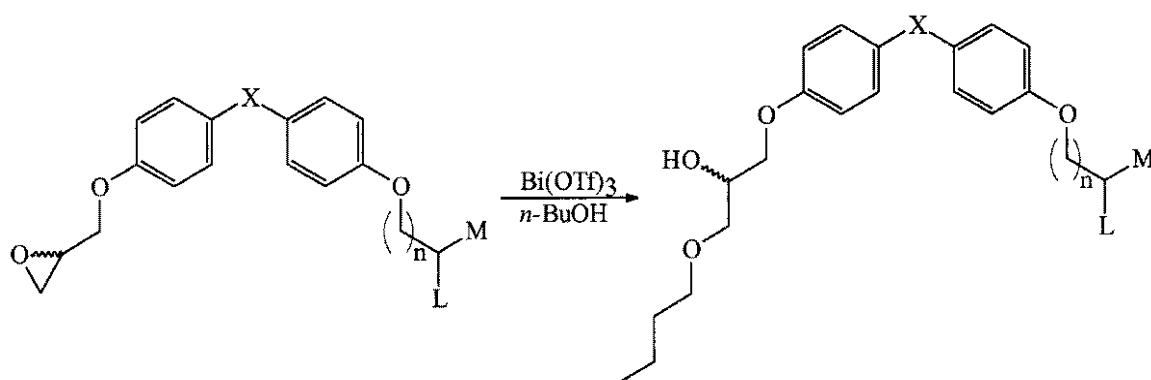


20

ここで、X、M、Lおよびnは、本明細書中のいずれかの箇所で定義されるとおりである。一般スキームIは、例えば、以下の一般的な化学合成スキームIVに基づいて、n-ブチルエーテル部分を含む本発明の化合物を調製するために適切に適合され得る：

【 0 9 5 7】

【化 8 0 7】

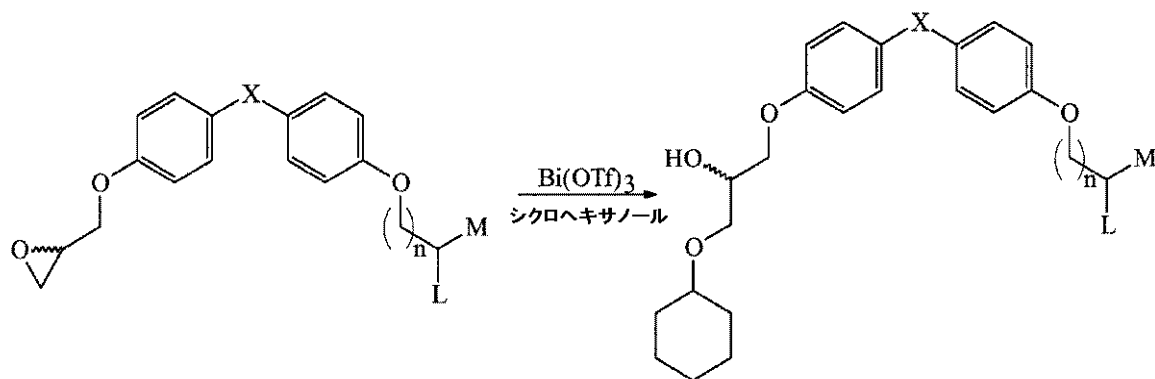


40

ここで、X、M、Lおよびnは、本明細書中のいずれかの箇所で定義されるとおりである。一般スキームIは、例えば、以下の一般的な化学合成スキームVに基づいて、シクロヘキシルエーテル部分を含む本発明の化合物を調製するために適切に適合され得る：

【 0 9 5 8】

【化 8 0 8】



10

ここで、X、M、Lおよびnは、本明細書中のいずれかの箇所で定義されるとおりである。

【0959】

式I~XXIのうちのいずれか1つの化合物を化学的に調製するための一般的な方法は、以下の非限定的な例示スキームに記載される。

【0960】

本発明の様々な代替の実施形態および例が本明細書中に記載される。これらの実施形態および例は、例示的であって、本発明の範囲を限定すると解釈されるべきでない。

20

【実施例】

【0961】

一般的な方法

化学合成

すべての反応を、火炎乾燥した丸底フラスコにおいて行った。そのフラスコには、ゴム隔膜を取り付け、別段明記されない限り、アルゴン陽圧下で反応を行った。空気および水分に感受性の液体を移すために、ステンレス鋼注射器を使用した。230~400メッシュシリカゲルを用いて、Stillらが記載するとおり(Still, W. C., Kahn, M., Mitra, A., J. Org. Chem. 1978, 43, 2923)フラッシュカラムクロマトグラフィーを行った。蛍光指示薬(254nm)に含浸された0.25mmの230~400メッシュシリカゲルで予めコーティングされたアルミニウムプレートを用いて、薄層クロマトグラフィーを行った。紫外線およびp-アニスアルデヒド溶液(1%p-アニスアルデヒド、2% H_2SO_4 、20%酢酸および77%エタノール)への曝露の後に、ヒーティングガン(約250)で加熱することによって(約1分間)、薄層クロマトグラフィープレートを可視化した。あるいは、「Seebach染色液」を使用してもよい(700mLの水、10.5gの硫酸セリウム(IV)四水和物、15.0gのモリブデートリン酸(molybdatophosphoric acid)、17.5mLの硫酸)。25~30、約25torrのBuechi R-114ロータリーエバポレーターにおいて有機溶液を濃縮した。

30

40

【0962】

市販の試薬および溶媒は、受け取ったままの状態で使用した。抽出およびクロマトグラフィーのために使用したすべての溶媒が、HPLCグレードだった。順相SiゲルSepapakTMは、Waters, Inc.から購入した。薄層クロマトグラフィープレートは、Kieselgel 60F₂₅₄だった。すべての合成試薬をSigma AldrichおよびFisher Scientific Canadaから購入した。

【0963】

プロトン核磁気共鳴(¹H NMR)スペクトルは、インバースプローブおよびBruker 400分光計とともにBruker 400を用いて25において記録され、スケールの百万分率で報告され、NMR溶媒中の残留プロチウムを基準とする(DMSO

50

- d₆ : 2.50 (DMSO-d₅)。データは、以下のとおり報告される：化学シフト [多重度 (s = シングレット、d = ダブルレット、dd = ダブルダブルレット、m = マルチレット、q = クインツレット (quintuplet)、t = トリレット)、単位 Hertz での結合定数、積分値]。炭素-13 核磁気共鳴 (¹³C NMR) スペクトルは、Bruker 400 分光計を用いて記録され、スケールの百万分率で報告され、溶媒の炭素共鳴を基準とする (DMSO-d₆ : 39.51)。データは、以下のとおり報告される：化学シフト。フッ素核磁気共鳴 (¹⁹F NMR) スペクトルは、Bruker 300 分光計を用いて 25 において記録され、スケールの百万分率で報告される。

【0964】

10

細胞株、アンドロゲンおよびレポーター

LNCaP 細胞は、FSK による AR のリガンド非依存的活性化が特徴付けられている十分に分化したヒト前立腺癌細胞であるので (Nazarethら、1996 J. Biol. Chem. 271, 19900-19907; および Sadar 1999 J. Biol. Chem. 274, 7777-7783)、すべての実験について、初めに LNCaP 細胞を使用した。LNCaP 細胞は、内在性 AR を発現し、前立腺特異的抗原 (PSA) を分泌する (Horoszewiczら、1983 Cancer Res. 43, 1809-1818)。LNCaP 細胞は、細胞培養において単層として、または去勢された宿主においてアンドロゲン非依存型に進行する十分特徴付けられた異種移植片モデルにおける腫瘍として、生育され得る (Satoら、1996 J. Steroid Biochem. Mol. Biol. 58, 139-146; Gleaveら、1991 Cancer Res. 51, 3753-3761; Satoら、1997 Cancer Res. 57, 1584-1589; および Sadarら、2002 Mol. Cancer Ther. 1(8), 629-637)。PC3 ヒト前立腺癌細胞は、機能的 AR を発現せず (Kaighnら、1978 Natl. Cancer Inst. Monogr. 49, 17-21)、AR に対する化合物の特異性を試験するために使用された。AR-NTD を特異的に標的にする小分子は、PC3 細胞に対して影響を有しないはずである。これは、それらが、AR を特異的に阻止して阻害作用を媒介する場合、PC3 細胞の増殖を変化させないはずであることを意味する。R1881 は、安定であり、かつ不安定な生理学的リガンドであるジヒドロテストステロン (DHT) に関連する問題を回避するので、R1881 を使用した。レポーター特異性は、いくつかの代替レポーター遺伝子構築物を用いて測定され得る。広く使用されている十分に特徴付けられたいくつかの ARE 駆動性レポーター遺伝子構築物は、PSA (6.1 kb) エンハンス/プロモーター (これは、いくつかの ARE を含み、アンドロゲンならびに FSK によって高度に誘導性である (Uedaら、2002 A. J. Biol. Chem. 277, 7076-7085)) および ARR3-チミジンキナーゼ (tk) -ルシフェラーゼ (これは、ルシフェラーゼレポーターの上流にラットプロバシン ARE1 および ARE2 領域の3つのタンデム反復を含む人工レポーター構築物である (Snoekら、1996 J. Steroid Biochem. Mol. Biol. 59, 243-250)) である。化合物が転写に対して全般的な阻害作用を有しないことを判定するために、CMV-luc (ARE がなく、恒常的に活性である) を使用した。

20

30

40

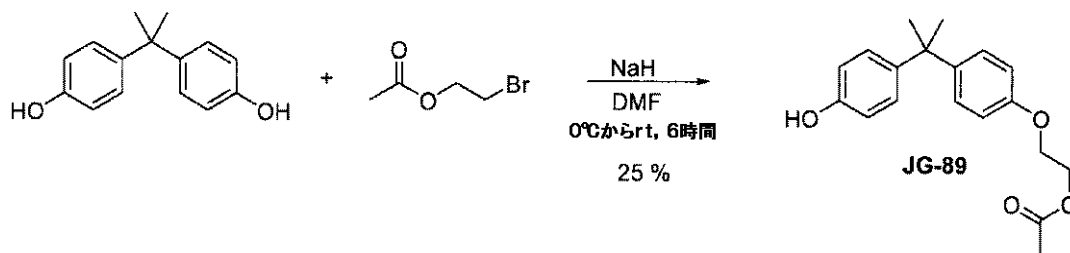
【0965】

実施例 1

EPI-035 (JG-133)

【0966】

【化809】



EPI-033 (JG-89)。鉱油中の60%分散液としてのNaH (44 mg, 1.09 mmol, 1.0当量)を、アルゴン雰囲気下で無水ジメチルホルムアミド (5 mL)に懸濁した。その混合物を0 に冷却し、ビスフェノールA (250 mg, 1.09 mmol, 1.0当量)を加えた。5分後、2-ブロモエチルアセテート (120 μL , 1.09 mmol, 1.0当量)を注射器によって加え、その混合物を室温において6時間反応させた。次いで、その溶液を脱イオン水 (約3 mL)でクエンチし、その混合物を酢酸エチルで抽出した (3 \times 3 mL)。有機層を脱イオン水 (2 mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー (溶離剤: ジクロロメタンおよびジクロロメタン中の5%酢酸エチル)で精製することによりJG-89 (74 mg, 25%)の無色泡沫状物を得た。

^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): 9.12 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 8.4$, 2H), 6.97 (d, $J = 8.8$, 2H), 6.81 (d, $J = 8.4$, 2H), 6.63 (d, $J = 8.4$, 2H), 4.30 (d, $J = 3.6$, 2H), 4.12 (d, $J = 4.4$, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.54 (s, 6H).

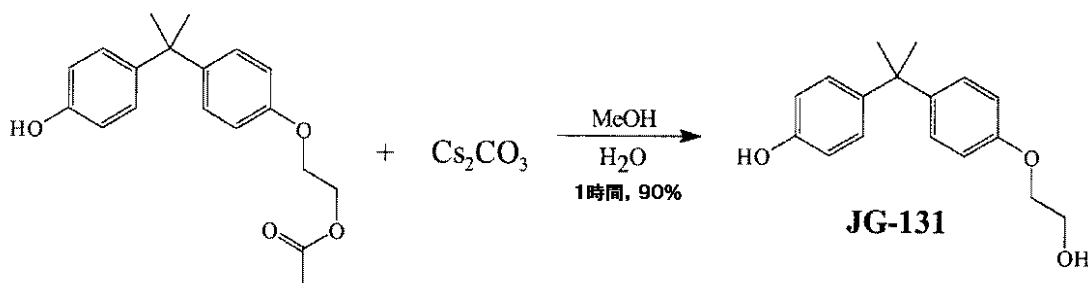
^{13}C NMR (100 MHz, DMSO-d_6): 170.9, 156.5, 155.6, 143.8, 141.3, 128.0, 127.9, 115.2, 114.4, 66.2, 63.2, 41.7, 31.4, 21.3.

HRMS (ESI) (m/z): na

TL C (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.63 (UV, *p*-アニスアルデヒド)。

【0967】

【化810】



EPI-034 (JG-131)。ビスフェノールA誘導体JG-89 (74 mg, 0.23 mmol, 1.0当量)をメタノール (1 mL)に溶解し、 H_2O (0.5 mL)中の Cs_2CO_3 (260 mg, 0.79 mmol, 3.5当量)を加えた。その混合物を室温で1.0時間反応させた。次いで、その溶液を脱イオン水 (約1 mL)でクエンチし、その混合物を酢酸エチルで抽出した (3 \times 1 mL)。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮することにより、JG-131 (58 mg, 90%)を白色固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): 9.12 (s, 1H), 7.07 (d, $J = 8.4$, 2H), 6.97 (d, $J = 8.4$, 2H), 6.80 (d, $J = 8.8$, 2H), 6.63 (d, $J = 8.4$, 2H), 4.81 (t, $J = 5.2$, 1H), 3.92 (t, $J = 4.8$, 2H), 3.68 (m,

2H), 1.54 (s, 6H).

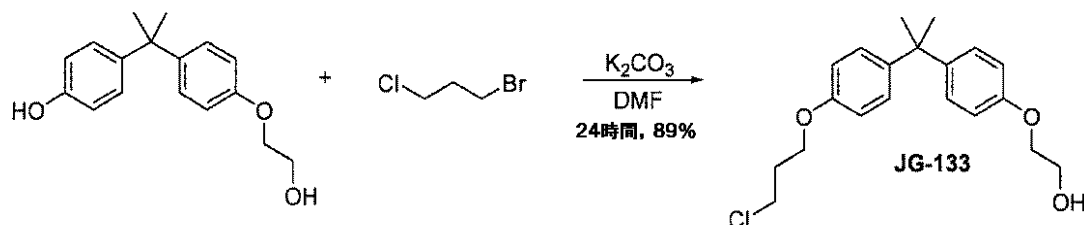
^{13}C NMR (100 MHz, DMSO-d_6): 156.9, 155.6, 143.4, 141.4, 128.0, 127.9, 115.2, 114.4, 70.0, 60.2, 41.6, 31.4.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{17}\text{H}_{20}\text{O}_3\text{Na} [\text{M} + \text{Na}]^+$ に対する計算値: 295.1310, 実測値: 295.1304.

TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.45 (UV, *p*-アニスアルデヒド).

【0968】

【化811】



10

EPI-035 (JG-133)。rtの無水ジメチルホルムアミド (0.3 mL) 中のビスフェノールA誘導体JG-131 (20 mg, 0.073 mmol, 1当量)の攪拌溶液に、 K_2CO_3 (15 mg, 0.109 mmol, 1当量)を加え、その混合物をアルゴン雰囲気下で5分間攪拌した。1-ブロモ-3-クロロプロパン (22 μL , 0.22 mmol, 3当量)を加え、その混合物をrtで18時間攪拌し、22 μL の1-ブロモ-3-クロロプロパンを加えたとき、その混合物をさらに2時間攪拌した。脱イオン水 (0.2 mL)を加え、その混合物を酢酸エチルで抽出した (3 \times 1 mL)。有機層を脱イオン水 (2 mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー (溶離剤: ジクロロメタンおよびジクロロメタン中の5%メタノール)で精製することによりJG-133 (23 mg, 89%)を無色泡沫状物として得た。

20

^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): 7.09 (m, 4H), 6.81 (m, 4H), 4.80 (t, $J = 5.2$, 1H), 4.03 (t, $J = 6.0$, 2H), 3.92 (t, $J = 5.2$, 2H), 3.76 (t, $J = 6.4$, 2H), 3.67 (m, 2H), 2.13 (m, 2H), 1.56 (s, 6H).

30

^{13}C NMR (100 MHz, DMSO-d_6): 157.0, 156.7, 143.4, 143.1, 128.0, 127.9, 114.5, 69.9, 64.7, 60.2, 42.6, 41.8, 32.4, 31.3.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{20}\text{H}_{25}\text{O}_3\text{NaCl} [\text{M} + \text{Na}]^+$ に対する計算値: 371.1390, 実測値: 371.1387.

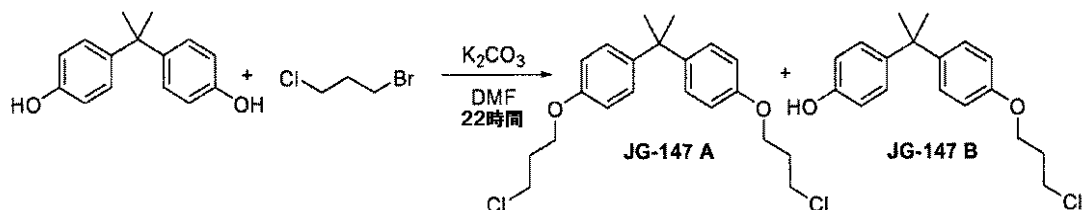
TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.68 (UV, *p*-アニスアルデヒド).

実施例 2

EPI-038 (JG-147A)、EPI-037 (JG-148A)

【0969】

【化812】



40

EPI-038 (JG-147A)、EPI-036 (JG-147B)。rtの無水ジメチルホルムアミド (2.0 mL) 中のビスフェノールA (200 mg, 0.87 mmol, 1当量)の攪拌溶液に、 K_2CO_3 (363 mg, 2.63 mmol, 3当量)を

50

加え、その混合物をアルゴン雰囲気下で20分間攪拌した。1-ブロモ-3-クロロプロパン(342 μ L, 3.48 mmol, 4当量)を加え、その混合物をrtで22時間攪拌した。脱イオン水(1.0 mL)を加え、その混合物を酢酸エチルで抽出した(3 \times 2 mL)。有機層を脱イオン水(2 mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー(溶離剤:ジクロロメタン)で精製することによりJG-147A(261 mg, 78%)を黄色油状物として、JG-147B(139 mg, 52%)を白色固体として得た。

【0970】

JG-147 A

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6): 7.09 (d, J = 8.4, 4H), 6.82 (d, J = 8.4, 4H), 4.03 (t, J = 6.0, 4H), 3.76 (t, J = 6.4, 4H), 2.13 (q, 4H), 1.56 (s, 6H).

$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO- d_6): 156.7, 143.4, 141.4, 128.0, 114.5, 64.7, 42.6, 41.8, 32.4, 31.4.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{21}\text{H}_{26}\text{O}_2\text{NaCl}_2$ [M+Na] $^+$ に対する計算値: 403.1208, 実測値: 403.1208.

TL C (ジクロロメタン中の5%メタノール), Rf: 0.87 (UV, p-アニスアルデヒド).

JG-147 B

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6): 9.12 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.8, 2H), 6.97 (d, J = 8.4, 2H), 6.81 (d, J = 8.8, 2H), 6.63 (d, J = 8.8, 2H), 4.02 (t, J = 6.0, 2H), 3.76 (t, J = 6.4, 2H), 2.13 (q, 2H), 1.54 (s, 6H).

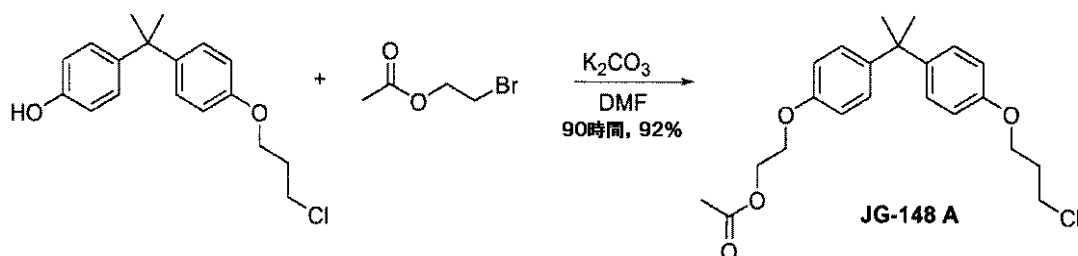
$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO- d_6): 156.7, 155.6, 143.7, 141.4, 128.0, 127.9, 115.2, 114.4, 64.7, 42.6, 41.6, 32.4, 31.4.

HRMS (ESI) (m/z): n a

TL C (ジクロロメタン中の5%メタノール), Rf: 0.65 (UV, p-アニスアルデヒド).

【0971】

【化813】



EPI-037 (JG-148A)。rtの無水ジメチルホルムアミド(10.0 mL)中のビスフェノールA誘導体JG-147B(1040 mg, 3.41 mmol, 1.0当量)の攪拌溶液に、 K_2CO_3 (1400 mg, 10.25 mmol, 3.0当量)を加え、その混合物をアルゴン雰囲気下で10分間攪拌した。2-ブロモエチルアセテート(750 μ L, 6.82 mmol, 2.0当量)を注射器によって加え、その混合物を室温で44時間反応させ、1.0当量の2-ブロモエチルアセテートを加えたとき、その混合物をさらに46時間攪拌した。次いで、その溶液を脱イオン水(約5 mL)でクエンチし、その混合物を酢酸エチルで抽出した(3 \times 5 mL)。有機層を脱イオン水(4 mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー(溶離剤:ジクロロメタン)で精製することにより、JG-148A(1.2 g, 92%)を油性生成物として得た。

10

20

30

40

50

^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): 7.08 (dd, $J = 8.8, 1.2, 4\text{H}$), 6.82 (dd, $J = 8.8, 1.6, 2\text{H}$), 4.29 (t, $J = 4.0, 2\text{H}$), 4.12 (t, $J = 4.4, 2\text{H}$), 4.03 (t, $J = 6.0, 2\text{H}$), 3.76 (t, $J = 6.8, 2\text{H}$), 2.13 (q, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.57 (s, 6H).

^{13}C NMR (100 MHz, DMSO-d_6): 170.9, 156.7, 156.5, 143.5, 143.3, 128.1, 114.5, 114.4, 66.2, 64.7, 63.2, 42.6, 41.8, 32.3, 31.3, 21.3.

HRMS (ESI) (m/z): na

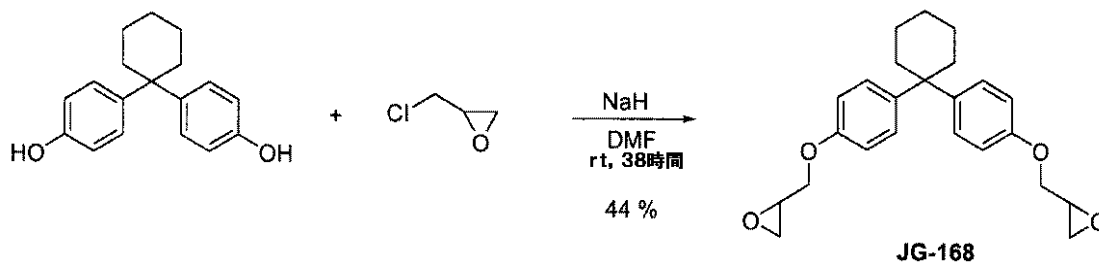
TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.87 (UV, p -アニスアルデヒド).

実施例 3

JG-177

【0972】

【化814】



(JG-168)。NaH (223 mg, 5.58 mmol, 3当量)、無水ジメチルホルムアミド (5 mL) および 4,4'-シクロヘキシリデンビスフェノール (500 mg, 1.86 mmol, 1当量) を連続的に丸底フラスコに投入し、その内容物をアルゴン雰囲気下で20分間撹拌した。ラセミエピクロロヒドリン (437 μL , 5.58 mmol, 3当量) を注射器によって加え、その混合物を室温で38時間反応させた。次いで、その溶液を脱イオン水 (約2 mL) でクエンチし、その混合物を酢酸エチルで抽出した (3 \times 4 mL)。有機層を脱イオン水 (2 mL) で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー (溶離剤: ジクロロメタン中の10%酢酸エチル) で精製することにより、JG-168 (312 mg, 44%) を白色泡沫状物として得た。

^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): 7.16 (d, $J = 8.0, 4\text{H}$), 6.83 (d, $J = 8.0, 4\text{H}$), 4.23 (d, $J = 11.2, 2\text{H}$), 3.76 (dd, $J = 10.8, 6.4, 2\text{H}$), 3.28 (m, 2H), 2.80 (t, $J = 4.0, 2\text{H}$), 2.66 (m, 2H), 2.17 (m, 4H), 1.42 (m, 6H).

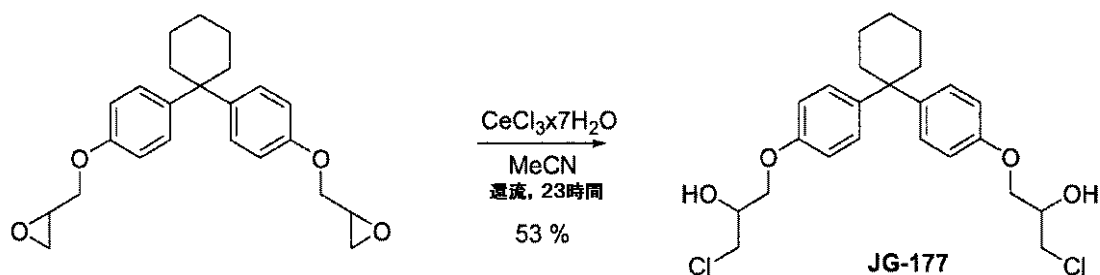
^{13}C NMR (100 MHz, DMSO-d_6): 156.3, 141.5, 128.4, 114.7, 69.4, 50.3, 44.9, 44.4, 37.0, 26.4, 23.1.

HRMS (ESI) (m/z): na

TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.80 (UV, p -アニスアルデヒド).

【0973】

【化 8 1 5】



10

(JG-177)。アセトニトリル(4.0 mL)中のラセミ4,4'-ジクロヘキシリデンビスフェノールジグリシジルエーテルJG-168(100 mg, 0.26 mmol, 1当量)の溶液に、 $\text{CeCl}_3 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ (294 mg, 0.78 mmol, 3当量)を加え、その混合物を23時間還流した。得られた白色ペースト状物を、ジクロロメタンとともに濾過し、透明の懸濁液を減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー(溶離剤:ジクロロメタンおよびジクロロメタン中の10%メタノール)で精製することにより、JG-177(63 mg, 53%)を無色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO-d_6): 7.15 (d, $J = 8.8$, 4H), 6.82 (d, $J = 8.8$, 4H), 5.49 (d, $J = 5.2$, 2H), 3.99 (m, 2H), 3.91 (d, $J = 5.2$, 4H), 3.72 (dd, $J = 11.2, 4.4$, 2H), 3.63 (dd, $J = 11.2, 5.2$, 2H), 2.17 (m, 4H), 1.42 (m, 6H).

20

$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO-d_6): 156.5, 141.4, 128.4, 114.7, 69.4, 69.3, 47.4, 45.0, 37.1, 26.4, 23.1.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{O}_4\text{NaCl}_2$ [$M + \text{Na}$] $^+$ に対する計算値: 475.1419, 実測値: 475.1424.

TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.59 (UV, *p*-アニスアルデヒド).

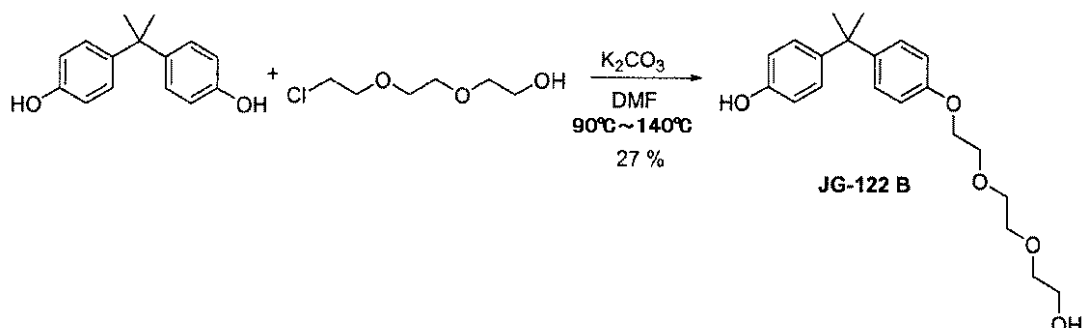
実施例 4

EPI-041 (JG-140A)

30

【0974】

【化 8 1 6】



40

EPI-040 (JG-122 B)。rtの無水ジメチルホルムアミド(5.0 mL)中のビスフェノールA(500 mg, 2.19 mmol, 1.0当量)の攪拌溶液に、 K_2CO_3 (604 mg, 4.38 mmol, 2.0当量)を加え、その混合物を90で60分間攪拌した。2-[2-(2-クロロエトキシ)エトキシ]エタノール(636 μL , 4.38 mmol, 2.0当量)を注射器によって加え、その混合物を6日間還流反応させた。次いで、その溶液を冷却し、脱イオン水(約2 mL)でクエンチし、その混合物を酢酸エチルで抽出した(3 \times 3 mL)。有機層を脱イオン水(4 mL)で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー(溶離剤:ジクロロメタン)で精製すること

50

により、JG-122B (212g, 27%) を黄色油性生成物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO-d_6): 9.12 (s, 1H), 7.08 (d, $J = 8.8$, 2H), 6.97 (d, $J = 8.4$, 2H), 6.81 (d, $J = 8.8$, 2H), 6.63 (d, $J = 8.4$, 2H), 4.55 (t, $J = 5.6$, 1H), 4.03 (t, $J = 4.0$, 2H), 3.71 (t, $J = 4.8$, 2H), 3.56 (m, 2H), 3.52 (m, 2H), 3.47 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 1.57 (s, 6H).

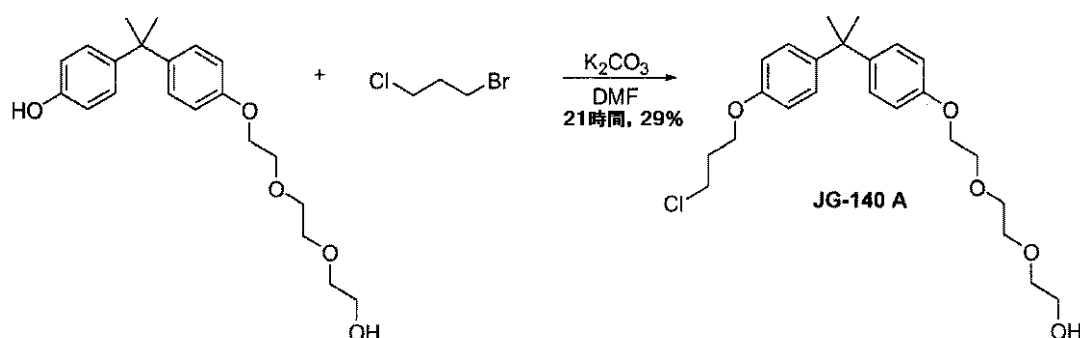
$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO-d_6): 156.7, 155.6, 143.5, 141.4, 128.0, 127.9, 115.2, 114.4, 73.0, 70.5, 70.4, 69.6, 67.6, 60.8, 41.6, 31.4.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{21}\text{H}_{28}\text{O}_5\text{Na} [\text{M} + \text{Na}]^+$ に対する計算値: 383.1834, 実測値: 383.1823.

TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.44 (UV, p-アニスアルデヒド).

【0975】

【化817】



EPI-041 (JG-140A)。rtの無水ジメチルホルムアミド (1.5 mL) 中のビスフェノールA誘導体JG-122B (100mg, 0.277mmol, 1当量) の攪拌溶液に、 K_2CO_3 (77mg, 0.55mmol, 2当量) を加え、その混合物をアルゴン雰囲気下で20分間攪拌した。1-プロモ-3-クロロプロパン (54 μL , 0.55mmol, 2当量) を加え、その混合物をrtで21時間攪拌した。脱イオン水 (0.5 mL) を加え、その混合物を酢酸エチルで抽出した (3 \times 2 mL)。有機層を脱イオン水 (2 mL) で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー (溶離剤: ジクロロメタンおよびジクロロメタン中の5%メタノール) で精製することによりJG-140A (35mg, 29%) を無色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO-d_6): 7.09 (dd, $J = 8.8, 2.4$, 4H), 6.82 (dd, $J = 8.8, 2.4$, 4H), 4.55 (t, $J = 5.6$, 1H), 4.03 (m, 4H), 3.77 (t, $J = 6.8$, 2H), 3.71 (t, $J = 4.8$, 2H), 3.56 (m, 2H), 3.52 (m, 2H), 3.47 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 2.14 (q, 2H), 1.57 (s, 6H).

$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO-d_6): 156.8, 156.7, 143.4, 143.2, 128.0, 128.0, 114.5, 73.0, 70.5, 70.4, 69.6, 67.6, 64.7, 60.8, 42.6, 41.8, 32.4, 31.3.

HRMS (ESI) (m/z): na

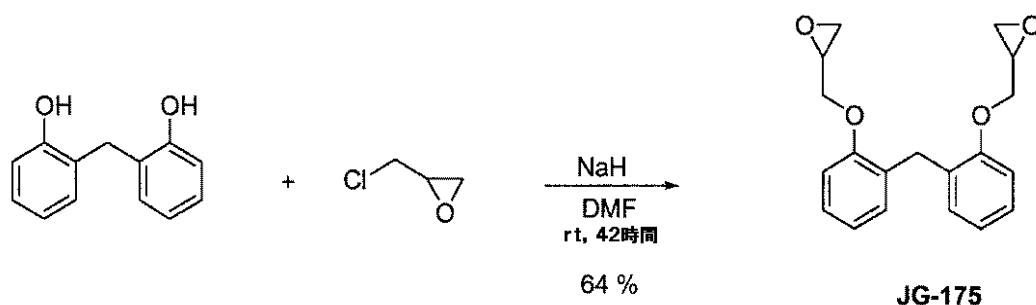
TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), R_f : 0.51 (UV, p-アニスアルデヒド).

実施例 5

EPI-900 (JG-181)

【0976】

【化 8 1 8】



10

(J G - 1 7 5) 。 N a H (1 5 0 m g , 3 . 7 4 m m o l , 3 当 量) 、 無 水 ジ メ チ ル ホ ル ム ア ミ ド (3 m L) お よ び ビ ス (2 - ヒ ド ロ キ シ フ ェ ニ ル) メ タ ン (2 5 0 m g , 1 . 2 4 m m o l , 1 当 量) を 連 続 的 に 丸 底 フ ラ ス コ に 投 入 し 、 そ の 内 容 物 を ア ル ギ ン 雰 囲 気 下 で 3 0 分 間 攪 拌 し た 。 ラ セ ミ エ ピ ク ロ ロ ヒ ド リ ン (2 9 3 μ L , 3 . 7 4 m m o l , 3 当 量) を 注 射 器 に よ っ て 加 え 、 そ の 混 合 物 を 室 温 で 4 2 時 間 反 応 さ せ た 。 次 い で 、 そ の 溶 液 を 脱 イ オ ン 水 (約 1 m L) で ク エ ン チ し 、 そ の 混 合 物 を 酢 酸 エ チ ル で 抽 出 し た (3 × 3 m L) 。 有 機 層 を 脱 イ オ ン 水 (2 m L) で 洗 浄 し 、 無 水 硫 酸 マ グ ネ シ ウ ム で 乾 燥 し 、 濾 過 し 、 減 圧 下 で 濃 縮 し た 。 得 ら れ た 残 渣 を シ リ カ ゲ ル に お け る フ ラ ッ シ ュ カ ラ ム ク ロ マ ト グ ラ フ ィ ー (溶 離 剤 : ヘ キ サ ン 中 の 4 0 % 酢 酸 エ チ ル) で 精 製 す る こ と に よ り 、 J G - 1 7 5 (2 5 0 m g , 6 4 %) を 白 色 固 体 と し て 得 た 。

20

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO-d_6) : 7.15 (m, 2H), 7.05 (m, 2H) 6.95 (m, 2H), 6.85 (m, 2H), 4.29 (m, 2H), 3.87 (m, 4H), 3.30 (m, 2H), 2.81 (t, $J = 4.8$, 2H), 2.67 (dd, $J = 4.8, 2.4$, 2H) .

$^{13}\text{C NMR}$ (100 MHz, DMSO-d_6) : 156.7, 130.8, 129.3, 127.9, 121.2, 112.5, 69.5, 50.4, 44.3, 29.9 .

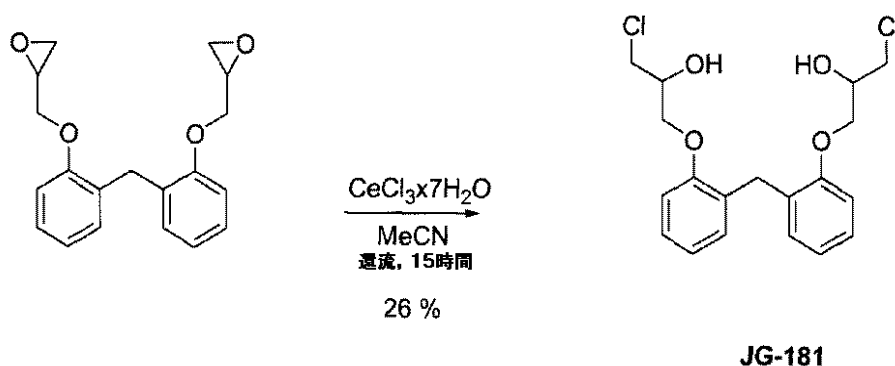
H R M S (E S I) (m / z) : n a

T L C (ジ ク ロ ロ メ タ ン 中 の 5 % メ タ ノ ール) , R f : 0 . 8 8 (U V , p - ア ニ ス ア ル デ ヒ ド) .

【 0 9 7 7】

30

【化 8 1 9】



40

E P I - 9 0 0 (J G - 1 8 1) 。 ア セ ト ニ ト リ ル (2 m L) 中 の ラ セ ミ ビ ス (2 - ヒ ド ロ キ シ フ ェ ニ ル) メ タ ン ジ グ リ シ ジ ル エ ー テ ル J G - 1 7 5 (7 4 m g , 0 . 2 4 m m o l , 1 当 量) の 溶 液 に 、 $\text{CeCl}_3 \cdot 7 \text{H}_2\text{O}$ (2 3 8 m g , 0 . 6 4 m m o l , 2 . 6 当 量) を 加 え 、 そ の 混 合 物 を 1 5 時 間 還 流 し た 。 得 ら れ た 白 色 ペ ー ス ト 状 物 を ジ ク ロ ロ メ タ ン と と も に 濾 過 し 、 透 明 の 懸 濁 液 を 減 圧 下 で 濃 縮 し た 。 得 ら れ た 残 渣 を シ リ カ ゲ ル に お け る フ ラ ッ シ ュ カ ラ ム ク ロ マ ト グ ラ フ ィ ー (溶 離 剤 : ジ ク ロ ロ メ タ ン お よ び ジ ク ロ ロ メ タ ン 中 の 1 0 % 酢 酸 エ チ ル) で 精 製 す る こ と に よ り 、 J G - 1 8 1 (2 4 m g , 2 6 %)

50

を黄色油状物として得た。

^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6): 7.15 (m, 2H), 7.05 (m, 2H) 6.95 (m, 2H), 6.83 (m, 2H), 5.49 (d, J = 5.2, 2H), 3.96 (m, 6H), 3.88 (s, 2H), 3.65 (dd, J = 10.8, 4.0, 2H), 3.55 (dd, J = 10.8, 5.2, 2H).

^{13}C NMR (100 MHz, DMSO- d_6): 156.7, 130.8, 129.3, 127.9, 121.1, 12.2, 69.5, 69.3, 47.5, 30.1.

HRMS (ESI) (m/z): $\text{C}_{19}\text{H}_{22}\text{O}_4\text{NaCl}_2$ [M + Na] $^+$ に対する計算値: 407.0793, 実測値: 407.0803.

TLC (ジクロロメタン中の5%メタノール), Rf: 0.55 (UV, p-アニスアルデヒド).

実施例 6

LNCaP細胞を、24ウェルプレートにおいてPSA(6.1kb)-ルシフェラーゼ(0.25 μg /ウェル)で24時間、一過性にコトランスフェクトした後、1時間にわたって化合物で前処理し、その後、PSAの産生を誘導する合成アンドロゲンR1881(1nM)またはビヒクルを加えた。トランスフェクトされたプラスミドDNAの総量を、空のベクターを加えることによって、0.75 μg /ウェルに正規化した。R1881とともに48時間インキュベートした後、細胞を回収し、相対的なルシフェラーゼ活性を測定した。試験化合物を様々な濃度で細胞に加え、各処理に対する活性を、予測される最大活性誘導(試験化合物の非存在下、ビヒクルのみ)に対して正規化した。S字状曲線(ボルツマン関数)のプロットおよびIC50の計算を、OriginPro8.1 Software(Northampton, MA, USA)を用いて行った。

【0978】

さらに、鏡検とタンパク質レベルの低下の両方によって、毒性を査定した。巨視的に(濁った媒質)かつ微視的に(顆粒または結晶の形成)、溶解性を査定した。

【0979】

表3は、上記のアッセイを用いたときに活性を示した化合物の化学構造を示している。

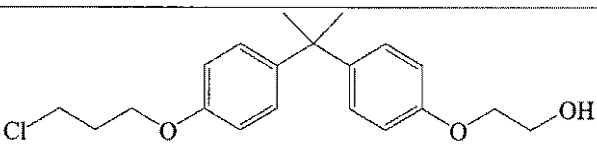
【0980】

下記の表には、活性な化合物が含まれる。

表3

【0981】

【表3-1】

化合物	実験データ
 <p>EPI-035 (JG-101)</p>	活性

【0982】

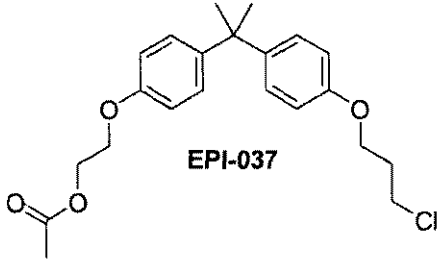
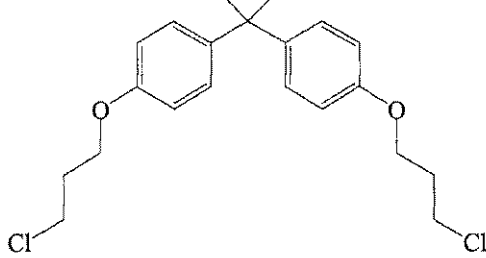
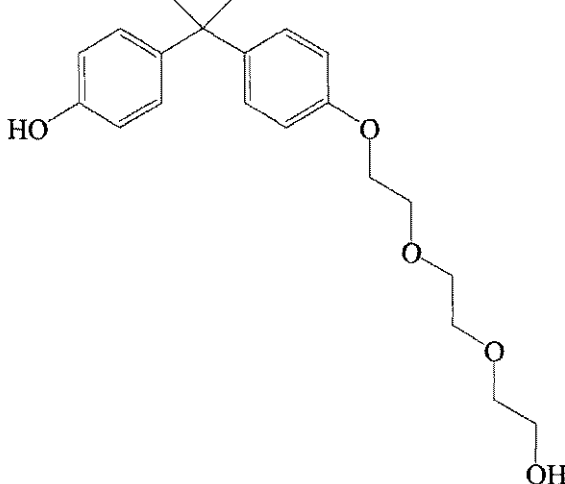
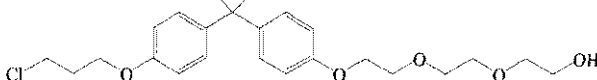
10

20

30

40

【表 3 - 2】

 <p>EPI-037 (JG-148 A)</p>	<p>活性</p>
 <p>EPI-038 (JG-147 A)</p>	<p>活性</p>
 <p>EPI-040 (JG-122B)</p>	<p>活性</p>
 <p>EPI-041 (JG-140 A)</p>	<p>活性</p>

10

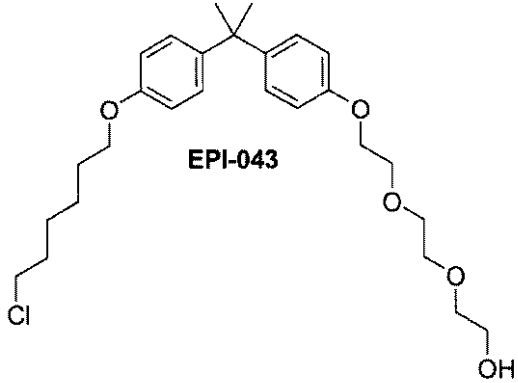
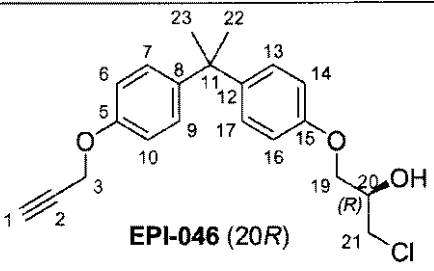
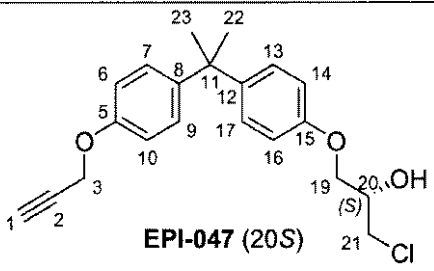
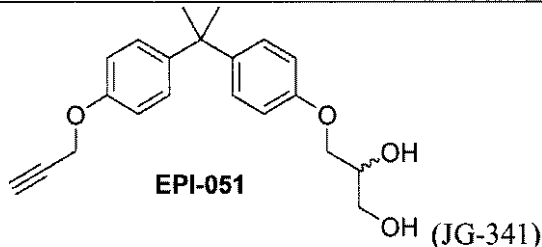
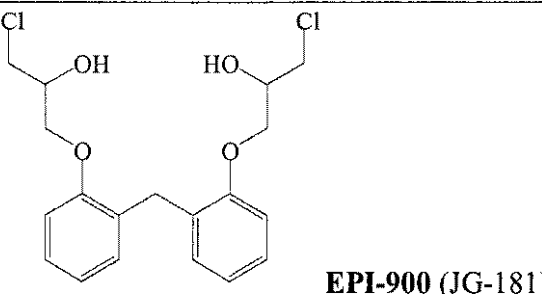
20

30

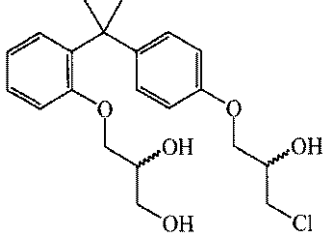
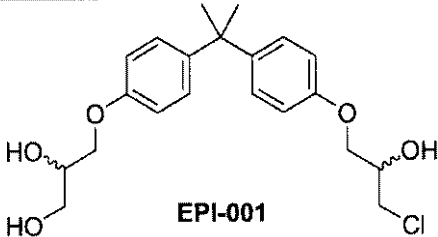
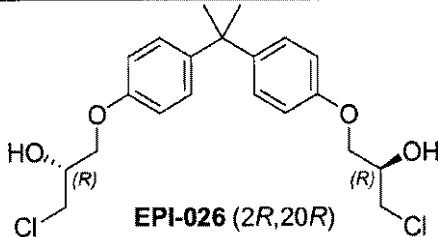
40

【 0 9 8 3 】

【表 3 - 3】

 <p style="text-align: center;">EPI-043 (JG-201)</p>	活性	10
 <p style="text-align: center;">EPI-046 (20R) (JG-353)</p>	活性	20
 <p style="text-align: center;">EPI-047 (20S) (JG-353)</p>	活性	30
 <p style="text-align: center;">EPI-051 (JG-341)</p>	活性	40
 <p style="text-align: center;">EPI-900 (JG-181)</p>	活性	40

【表 3 - 4】

 <p>EPI-6000, EPI-6001, EPI-6002, および EPI-6003 (立体および位置異性体)</p>	<p>活性</p>	10
 <p>EPI-001 EPI-001</p>	<p>コントロール</p>	20
 <p>EPI-026 (2R,20R)</p>	<p>コントロール</p>	20

実施例 7

上に記載した LNC a P P S A (6 . 1 k b) - ルシフェラーゼアッセイを用いて、本明細書中に記載される様々な化合物を、DMSO および EPI - 001 コントロールに対して試験した。図 1 では、1 μ M ~ 10 μ M の EPI - 035 と DMSO と EPI - 001 または EPI - 026 との比較を行っている。図 2 A は、0 . 01 μ M ~ 10 μ M (0 . 01 μ M 、 0 . 25 μ M 、 1 μ M および 10 μ M) における EPI - 041 および EPI - 037 を DMSO および EPI - 001 と比較して示している。図 2 B は、1 μ M 、 10 μ M および 25 μ M における EPI - 038 を DMSO および EPI - 001 と比較して示している。図 3 A および 3 B では、それぞれ EPI - 040 および EPI - 051 を 1 μ M ~ 30 μ M および 2 . 5 μ M ~ 35 μ M における DMSO および EPI - 001 と比較している。図 4 A および 4 B では、それぞれ 5 μ M ~ 35 μ M 0 . 25 μ M ~ 25 μ M における EPI - 043 を DMSO および EPI - 001 と比較している。図 5 は、2 . 5 μ M ~ 35 μ M における EPI - 051 を DMSO および EPI - 001 と比較して示している。図 6 は、0 . 25 μ M ~ 4 μ M における EPI - 046 および EPI - 047 を DMSO と比較して示している。

【 0 9 8 5 】

図 7 A は、1 μ M ~ 35 μ M (1 μ M 、 5 μ M 、 10 μ M 、 15 μ M 、 20 μ M および 35 μ M) の EPI - 900 および DMSO (コントロール) の濃度に対する用量反応プロットを示している。EPI - 900 は、DMSO コントロールと比較される用量反応を示した。同様に、図 7 B では、12 . 5 μ M および 25 μ M における EPI - 6000 、 EPI - 6001 、 EPI - 6002 および EPI - 6003 の濃度が、DMSO コントロールと比較して示されている。

【 0 9 8 6 】

30

40

50

EPI-035、EPI-037、EPI-038、EPI-040、EPI-041、EPI-043、EPI-046、EPI-047、EPI-051、EPI-900、EPI-6000、EPI-6001、EPI-6002およびEPI-6003の各々が、アンドロゲンレセプター調節活性を示した。

【0987】

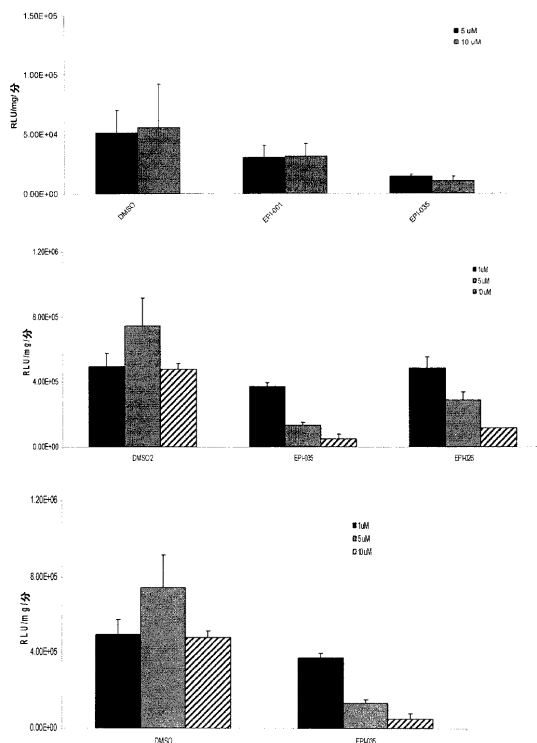
本発明の様々な実施形態が本明細書中に開示されているが、当業者の通常の一般的な知識に従って本発明の範囲内で多くの適応および改変が行われ得る。そのような改変には、実質的に同じ方法で同じ結果を得るための、本発明の任意の態様の代わりに公知の等価物を用いることが含まれる。数値の範囲は、その範囲を定義している数字を含む。単語「含む (comprising)」は、範囲を設定しない (open-ended) 用語として本明細書中で使用され、句「含むがそれに限定されない」と実質的に等価であり、単語「含む (comprises)」は、対応する意味を有する。本明細書中で使用されるとき、単数形「a」、「an」および「the」は、文脈が明らかに他のことを指示しない限り、複数の指示対象を含む。したがって、例えば、「もの (a thing)」という言葉及は、2つ以上のそのようなものを含む。本明細書中の参考文献の引用は、そのような参考文献が本発明に対する従来技術であるという承認ではない。任意の優先権書類および本明細書中に引用されたすべての刊行物 (特許および特許出願を含むがこれらに限定されない) は、各個別の刊行物が本明細書に参考として援用されると明確かつ個別に示されたかのように、および完全に本明細書中に示されたかのように、本明細書中で参考として援用される。本発明は、本明細書の前文に記載されたように、ならびに実施例および図面に照らして、すべての実施形態およびバリエーションを実質的に含む。

10

20

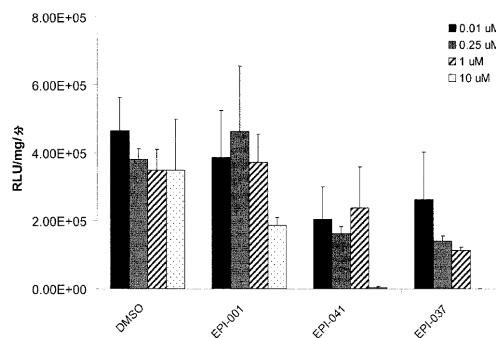
【図1】

FIGURE 1



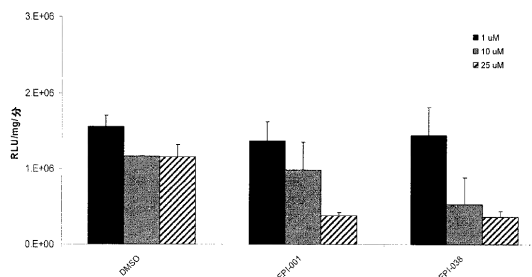
【図2A】

FIGURE 2A



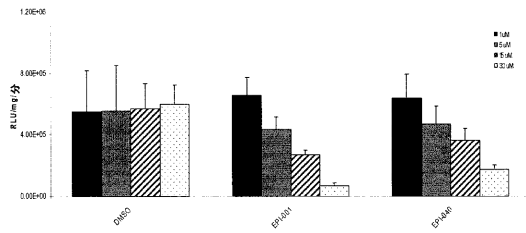
【図2B】

FIGURE 2B



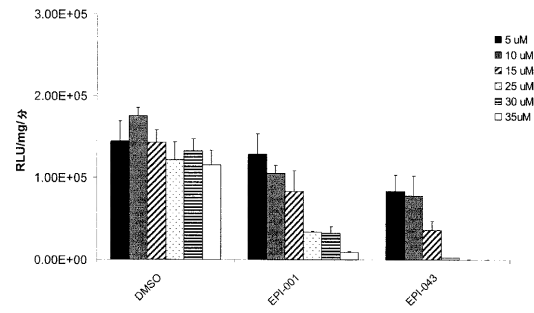
【 3 A 】

FIGURE 3A



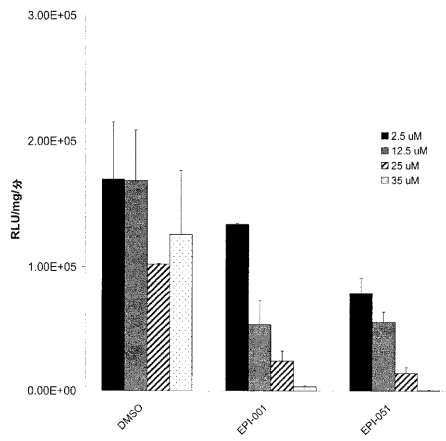
【 4 A 】

FIGURE 4A



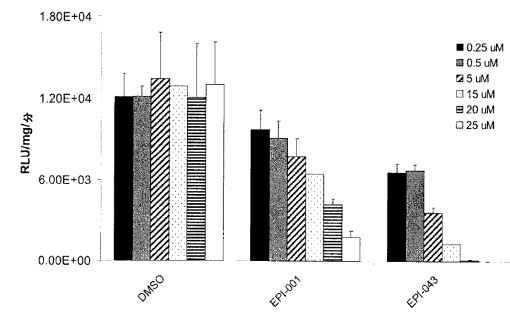
【 3 B 】

FIGURE 3B



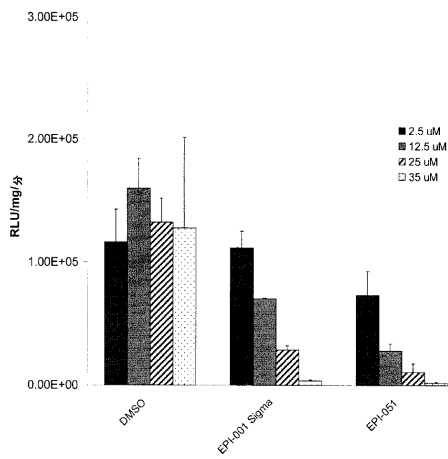
【 4 B 】

FIGURE 4B



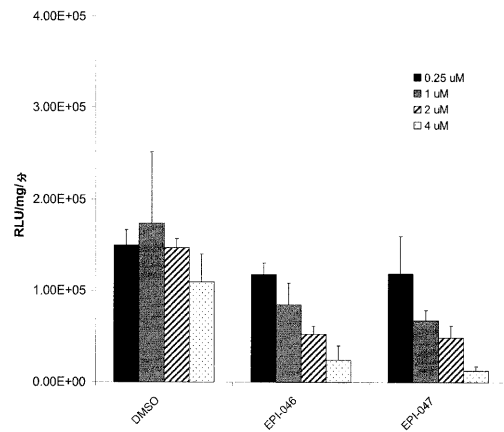
【 5 】

FIGURE 5



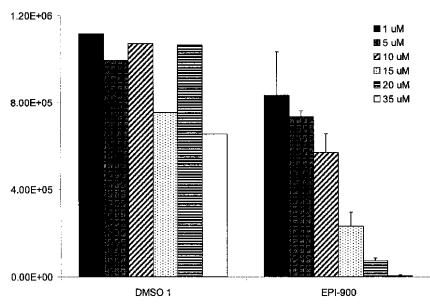
【 6 】

FIGURE 6



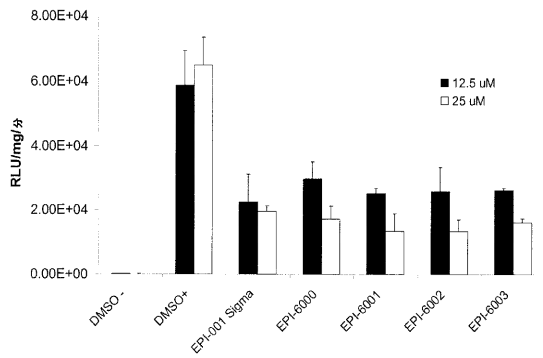
【 7 A 】

FIGURE 7A



【 7 B 】

FIGURE 7B



フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 P 35/00	(2006.01)	A 6 1 P	35/00
A 6 1 P 15/00	(2006.01)	A 6 1 P	15/00
A 6 1 P 17/14	(2006.01)	A 6 1 P	17/14
A 6 1 P 17/10	(2006.01)	A 6 1 P	17/10
A 6 1 P 17/00	(2006.01)	A 6 1 P	17/00
A 6 1 P 27/02	(2006.01)	A 6 1 P	27/02
C 0 7 C 43/23	(2006.01)	C 0 7 C	43/23 E
C 0 7 C 69/157	(2006.01)	C 0 7 C	69/157

(74)代理人 100078282

弁理士 山本 秀策

(74)代理人 100062409

弁理士 安村 高明

(74)代理人 100113413

弁理士 森下 夏樹

(72)発明者 サダー, マリアン ディー.

カナダ国 ブイ7ブイ 3ジェイ9 プリティッシュ コロンビア, ウェスト バンクーバー,
ベイリッジ アベニュー 4091

(72)発明者 マウジ, ナスリン アール.

カナダ国 ブイ5ジー 4ピー4 プリティッシュ コロンビア, バーナビー, カール アベ
ニュー 203-3421

(72)発明者 バヌエロス, カルメン アドリアーナ

カナダ国 ブイ6ティー 2ジー3 プリティッシュ コロンビア, バンクーバー, オソユー
ス クレセント 225-2875

(72)発明者 アンダーセン, レイモンド ジェイ.

カナダ国 ブイ6エス 1ゼット6 プリティッシュ コロンビア, バンクーバー, ウェスト
32エヌディー アベニュー 4048

(72)発明者 ガルシア, フェルナンデス ハビエル

スペイン国 エ-33206 ギジョン, セ/モロス 50, セブンスイセータデア

審査官 井上 明子

(56)参考文献 仏国特許出願公開第01389005(FR, A1)

米国特許第02890189(US, A)

特開昭63-196675(JP, A)

特開2005-325301(JP, A)

国際公開第2008/101806(WO, A1)

特表平01-503541(JP, A)

米国特許出願公開第2008/0255395(US, A1)

国際公開第02/005813(WO, A1)

特表2011-526250(JP, A)

Indian Journal Chemistry, 1997年, Vol.36B, p.656-661

Macromolecules, 1997年, Vol.30, No.20, p.6369-6375

Tetrahedron Letters, 1986年, Vol.27, No.46, p.5563-5566

Journal of Chromatography, 1983年, Vol.254, p.296-308

Molecular and Cellular Endocrinology, 2002年, Vol.193, p.43-49

Food Additives and Contaminants, 2001年, Vol.18, No.2, p.177-185

Food and Chemical Toxicology , 2 0 0 4 年 , Vol.42 , p.983-993

(58)調査した分野(Int.Cl. , DB名)

A 6 1 K 3 1 / 0 0 - 3 3 / 4 4

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)