

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成26年1月23日(2014.1.23)

【公表番号】特表2013-512260(P2013-512260A)

【公表日】平成25年4月11日(2013.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2013-017

【出願番号】特願2012-541227(P2012-541227)

【国際特許分類】

C 07 J 1/00 (2006.01)

A 61 K 31/5685 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 J 1/00 C S P

A 61 K 31/5685

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成25年11月28日(2013.11.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

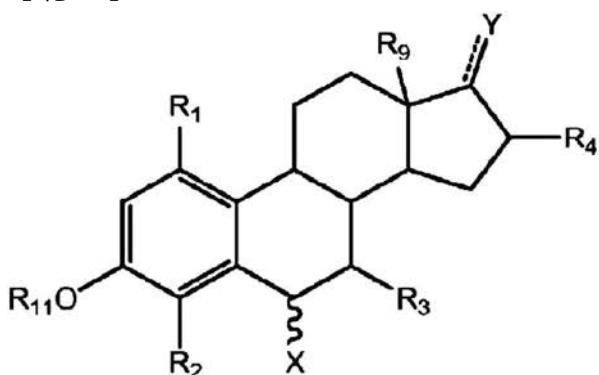
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記化学式を有する化合物：

【化1】



式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル、ハロゲン、硫酸塩、グルクロニド、-OH、嵩高い基(bulky group)、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、ホスフェート基、およびホスフィン酸塩基から選択され；

R<sub>9</sub>は、水素原子、ハロゲンおよびアルキルからなる群から選択され；

R<sub>1</sub>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル、ハロゲン、硫酸塩、グルクロニド、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-COOH、-CN、-CH<sub>2</sub>CN-、-NH-CN-、-CHO、=CHOCH<sub>3</sub>、-COO塩、-OSO<sub>2</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、および-NHCO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>からなる群から選択され；

R<sub>1</sub>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル、硫酸塩、グルクロニド、嵩高い基(bulky

group)、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；

Xは、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルキニル、ハロゲン、グルクロニド、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-COOH、-CN、-CH<sub>2</sub>CN、-NHCN、-CHO、-COO塩、-OSO<sub>2</sub>アルキル、-SH、-SCH<sub>3</sub>、-CH[CH<sub>2</sub>]<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>]COOCH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COOCH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-NH-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニル-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-NH<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-NH<sub>2</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH<sub>3</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OCH<sub>3</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CHOH-COOH、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(NH)CH<sub>2</sub>OH、-NHCOOH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NHCOOH、-NO<sub>2</sub>、-SCN、-SO<sub>2</sub>アルキル、-B(OH)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-NH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-NH-SO<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>C(=S)CH<sub>3</sub>、および-NHNH<sub>2</sub>からなる群から選択され；

Yは、水素原子、=O、-OCO(R<sub>6</sub>)および-OHから選択され；

mは0～20の整数であり；

nは0～8の整数であり；

記号

【化2】

---



---

は、3位または17位にケト基を形成しうる単結合または二重結合のいずれかを表し；および

記号

【化3】



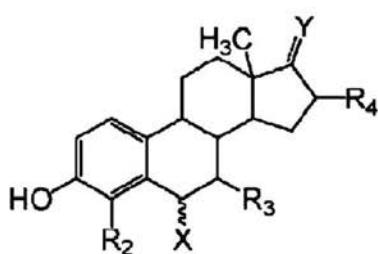
は、立体化学に関わらず任意の種類の結合を表す；

ならびに、前記化合物の各エナンチオマー、立体化学の異性体、水和物、溶媒和物、互変異性体および製薬上許容される塩。

【請求項2】

下記化学式を有する、請求項1に記載の化合物：

【化4】



【請求項3】

Yは=Oおよび-OHからなる群から選択され；

R<sub>4</sub>は、水素原子、ハロおよびC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキルからなる群から選択され；

R<sub>2</sub>は、水素原子、-OHおよびハロからなる群から選択され；

R<sub>3</sub>は、水素原子、ハロおよび-OHからなる群から選択され；

Xは、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COOC

$\text{H}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_m-\text{S}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{N}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル- $\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル- $\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{N}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{OH}$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{S}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_2)_m\text{CH}_3$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_2)_m\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_2)_m\text{CHOH-COOH}$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m(\text{NH})\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m\text{NHCOOH}$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2-\text{NH}_3$ 、および $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{NH}-\text{SO}_2-\text{NH}_2$ からなる群から選択され；

$m$ は1～20の整数であり；

$n$ は0～8の整数であり；および

記号

【化5】

---

は、単結合または二重結合のいずれかを表す、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

$Y$ は、(S)配置- $\text{OH}$ であり；

$R_4$ は、水素原子およびアルキルから選択され；

$R_2$ および $R_3$ は水素原子であり；

$X$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{12}$ のアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{12}$ のアルケニル、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_m-\text{S}-\text{CH}_3$ 、および $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ からなる群から選択され；

$m$ は、1～6の整数であり；

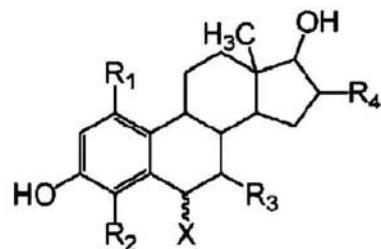
$n$ は0～3の整数であり；および

$C-13$ メチル基は、(S)配置に存在する、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

下記化学式を有する、請求項1に記載の化合物：

【化6】



【請求項6】

$R_1$ は、水素原子、 $-\text{OH}$ およびハロからなる群から選択され；

$R_4$ は、水素原子、ハロおよび $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ のアルキルからなる群から選択され；

$R_2$ は、水素原子およびハロから選択され；

$R_3$ は、水素原子、ハロおよび $-\text{OH}$ からなる群から選択され；

$X$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{12}$ のアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{12}$ のアルケニル、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m\text{COOCCH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_m-\text{S}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_m-\text{N}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル- $\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルケニル- $\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{N}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{O}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{S}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_2\sim\text{C}_8$ アルキニル- $\text{N}-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_n\text{CH}_3$

$m - OH$ 、 $- (CH_2)_m - O - NH_2$ 、 $- (CH_2)_m - S - NH_2$ 、 $- NH(CH_2)_m CH_3$ 、 $- NH(CH_2)_m OCH_3$ 、 $- NH(CH_2)_m CHOH - COOH$ 、 $- (CH_2)_m (NH)CH_2OH$ 、 $- (CH_2)_m NHCOOH$ 、 $- (CH_2)_m N(CH_3) - SO_2 - NH_3$ 、および $- (CH_2)_m - NH - SO_2 - NH_2$ からなる群から選択され；

$m$ は、1～20の整数であり；および

$n$ は、0～8の整数である、請求項5に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$R_1$ は、水素原子であり；

$R_4$ は、水素原子またはアルキルから選択され；

$R_2$ および $R_3$ は、水素原子であり；

$X$ は、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル、 $- (CH_2)_m - O - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $(CH_2)_m - S - CH_3$ 、および $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n CH_3$ から選択され；

$m$ は1～12の整数であり；および

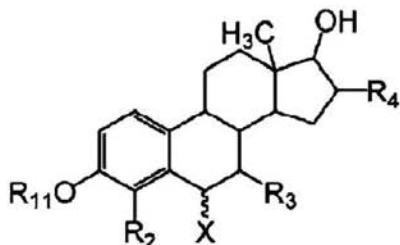
$n$ は0～4の整数であり、

$C-13$ メチルおよび $C-17$ ヒドロキシルは(S)配置に存在する、請求項6に記載の化合物。

#### 【請求項8】

下記化学式を有する、請求項1に記載の化合物：

#### 【化7】



#### 【請求項9】

$R_{11}$ は、水素原子または $C_1 \sim C_6$ のアルキルであり；

$R_4$ は、水素原子、ハロおよび $C_1 \sim C_6$ のアルキルからなる群から選択され；

$R_2$ は、水素原子およびハロから選択され；

$R_3$ は、水素原子、ハロおよび $-OH$ からなる群から選択され；

$X$ は、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル、 $- (CH_2)_m COOC$   
 $H_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $(CH_2)_m - S - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - S - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - N - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_2 \sim C_8$ アルケニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、 $- C_2 \sim C_8$ アルケニル-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、 $- C_2 \sim C_8$ アルキニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、 $- C_2 - C_8$ アルキニル-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、 $- C_2 - C_8$ アルキニル-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、 $- (CH_2)_m - OH$ 、 $- (CH_2)_m - O - NH_2$ 、 $- (CH_2)_m - S - NH_2$ 、 $- NH(CH_2)_m CH_3$ 、 $- NH(CH_2)_m OCH_3$ 、 $- NH(CH_2)_m CHOH - COOH$ 、 $- (CH_2)_m (NH)CH_2OH$ 、 $- (CH_2)_m NHCOOH$ 、 $- (CH_2)_m N(CH_3) - SO_2 - NH_3$ 、および $- (CH_2)_m - NH - SO_2 - NH_2$ からなる群から選択され；

$m$ は1～20の整数であり；および

$n$ は0～8の整数である、請求項8に記載の化合物。

#### 【請求項10】

$R_{11}$ は、水素原子であり；

$R_4$ は、水素原子またはアルキルから選択され；

$R_2$  および  $R_3$  は、水素原子であり；

$X$  は、 $C_{1\sim C_{12}}$  のアルキル、 $C_{2\sim C_{12}}$  のアルケニル、 $- (CH_2)_m - O - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $(CH_2)_m - S - CH_3$ 、および $- (CH_2)_m - S - (CH_2)_n CH_3$  からなる群から選択され；

$m$  は 1 ~ 12 の整数であり；および

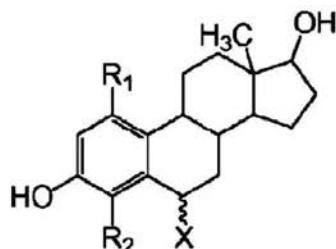
$n$  は 0 ~ 4 の整数であり；

$C-13$  メチルおよび  $C-17$  ヒドロキシルは ( $S$ ) 配置に存在する、請求項 9 に記載の化合物。

#### 【請求項 11】

下記化学式を有する、請求項 1 に記載の化合物：

#### 【化 8】



#### 【請求項 12】

$R_1$  は、水素原子、 $- OH$  およびハロからなる群から選択され；

$R_2$  は、水素原子およびハロから選択され；

$X$  は、 $C_{1\sim C_{12}}$  のアルキル、 $C_{2\sim C_{12}}$  のアルケニル、 $- (CH_2)_m COOC$   $H_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $(CH_2)_m - S - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - S - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - N - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_{2\sim C_8}$  アルケニル $- O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_{2\sim C_8}$  アルケニル $- N - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_{2\sim C_8}$  アルキニル $- O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_{2\sim C_8}$  アルキニル $- S - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- C_{2\sim C_8}$  アルキニル $- N - (CH_2)_n CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - OH$ 、 $- (CH_2)_m - O - NH_2$ 、 $- (CH_2)_m - S - NH_2$ 、 $- NH (CH_2)_m CH_3$ 、 $- NH (CH_2)_m OCH_3$ 、 $- NH (CH_2)_m CHO$   $H - COOH$ 、 $- (CH_2)_m (NH) CH_2 OH$ 、 $- (CH_2)_m NHCOOH$ 、 $- (CH_2)_m N (CH_3) - SO_2 - NH_3$ 、および $- (CH_2)_m - NH - SO_2 - NH_2$  からなる群から選択され；

$m$  は 1 ~ 20 の整数であり；および

$n$  は 0 ~ 8 の整数である、請求項 11 に記載の化合物。

#### 【請求項 13】

$R_1$  および  $R_2$  は、水素原子であり；

$X$  は、 $C_{1\sim C_{12}}$  のアルキル、 $C_{2\sim C_{12}}$  のアルケニル、 $- (CH_2)_m - O - CH_3$ 、 $- (CH_2)_m - O - (CH_2)_n CH_3$ 、 $(CH_2)_m - S - CH_3$ 、および $- (CH_2)_m - S - (CH_2)_n CH_3$  からなる群から選択され；

$m$  は 1 ~ 12 の整数であり；および

$n$  は 0 ~ 4 の整数であり、

$C-13$  メチルおよび  $C-17$  ヒドロキシルは ( $S$ ) 配置に存在する、請求項 12 に記載の化合物。

#### 【請求項 14】

下記化学式を有する、請求項 1 に記載の化合物：

【化 9】



式中、Zは、-O-、-S-および-NH-からなる群から選択される。

【請求項 15】

$m$  は、1 ~ 12 であり；

$n$  は、0 ~ 4 であり；

$R_1$  は、水素原子、-OH およびハロからなる群から選択され；

R<sub>4</sub>は、水素原子、ハロおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルからなる群から選択され；

R<sub>2</sub> は、水素原子およびハロから選択され；

$R_3$  は、水素原子、ハロおよび - OH からなる群から選択され；および

Zは、-O-および-S-から選択される、請求項14に記載の化合物。

## 【請求項16】

$m$  は、2～8であり；

$n$  は、0 ~ 3 であり；

$R_1 \sim R_4$  は、水素原子であり；および

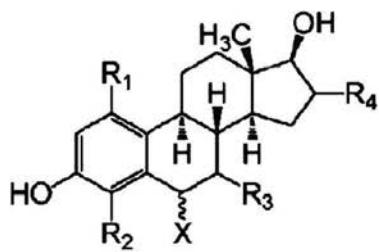
Zは、-O-であり、

C-13メチルおよびC-17ヒドロキシルは(S)配置に存在する、請求項15に記載の化合物。

## 【請求項 17】

下記化学式を有する、請求項 1 に記載の化合物：

【化 1 0】



## 【請求項18】

$R_1$  は、水素原子、-OH およびハロからなる群から選択され；

R<sub>4</sub> は、水素原子、ハロおよびC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキルからなる群から選択され；

$R_2$  は、水素原子およびハロから選択され；

$R_3$  は、水素原子、ハロおよび $-OH$ からなる群から選択され；

Xは、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COOC  
H<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニル-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニル-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル-N-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-NH<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-NH<sub>2</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH<sub>3</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OCH<sub>3</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CHOH-COOH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(NH)CH<sub>2</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NHCOOH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(C<sub>H<sub>3</sub></sub>)<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-NH<sub>3</sub>、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-NH-SO<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>からなる群からなる。

選択され；

mは、1～20の整数であり；および

nは、0～8の整数である、請求項17に記載の化合物。

**【請求項19】**

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、水素原子であり；

Xは、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C<sub>H</sub><sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C<sub>H</sub><sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-CH<sub>3</sub>、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C<sub>H</sub><sub>3</sub>からなる群から選択され；

mは、1～12の整数であり；および

nは0～4の整数である、請求項18に記載の化合物。

**【請求項20】**

a) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S)-3-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 15, 16-オクタヒドロ-6H-シクロ펜タ[a]フェナントレン-17(14H)-オン、

b) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S)-3-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 15, 16-オクタヒドロ-6H-シクロ펜タ[a]フェナントレン-17(14H)-オン、

c) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-(メトキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

d) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-(メトキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

e) (6S, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S)-17-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)-10, 13-ジメチル-6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-ドデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3-オン；

f) (6R, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S)-17-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)-10, 13-ジメチル-6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-ドデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3-オン、

g) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-(ヒドロキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

h) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-(ヒドロキシメチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

i) (6R, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S)-6-(メトキシメチル)-10, 13-ジメチルヘキサデカヒドロ-1H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

j) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-((アミノオキシ)メチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

k) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-((アミノオキシ)メチル)-13-メチル-7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-デカヒドロ-6H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3, 17-ジオール、

l) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-((アミノオキシ)メチル)-17-ヒドロキシ-13-メチル-6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17-ドデカヒドロ-3H-シクロペンタ[a]フェナントレン-3-オン、

m) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S)-6-((アミノオキシ)メチル)-17-

- ヒドロキシ - 1 3 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - ドデカヒドロ - 3 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 - オン、  
 n ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( ( ( メトキシメチル ) アミノ ) メチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 o ) ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( ( ( メトキシメチル ) アミノ ) メチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 p ) 1 - ( ( ( ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 3 , 1 7 - ジヒドロキシ - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 6 - y 1 ) メチル ) アミノ ) プロパン - 2 - オン、  
 q ) 1 - ( ( ( ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 3 , 1 7 - ジヒドロキシ - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 6 - y 1 ) メチル ) アミノ ) プロパン - 2 - オン、  
 r ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - メトキシ - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 s ) ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( 2 - メトキシエチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 t ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( 4 - メトキシブチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 u ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( 6 - メトキシヘキシル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 v ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( 6 - メトキシオクチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール；  
 w ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 3 - ヒドロキシ - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 1 7 - y 1 ステアレート、  
 x ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 0 R , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 0 , 1 3 - ジメチル - 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 - デカヒドロ - 3 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 ( 6 H ) - ジオン、  
 y ) ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 0 R , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 0 , 1 3 - ジメチル - 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 - デカヒドロ - 3 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 ( 6 H ) - ジオン、  
 z ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 0 R , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 0 , 1 3 - ジメチル - 4 , 5 , 6 , 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - テトラデカヒドロ - 3 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 a a ) ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 0 R , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 0 , 1 3 - ジメチル - 4 , 5 , 6 , 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - テトラデカヒドロ - 3 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
 b b ) ( 6 S , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 3 - メチル - 1 7 - オキソ - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒド

口 - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 - イル 硫酸水素塩、  
c c ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 1 3 - メチル - 1 7 - オキソ - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 - イル 硫酸水素塩、  
d d ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 1 3 - メチル - 6 - ( 4 - プロポキシブチル ) - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
e e ) ( 6 R , 8 R , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 1 3 - メチル - 6 - ( 5 - エトキシベンチル ) - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
f f ) ( 6 R , 8 S , 9 S , 1 4 S ) - 6 - ( メトキシメチル ) - 2 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、  
g g ) ( 6 R , 8 S , 9 S , 1 4 S ) - 6 - ( 6 - メトキシヘキシル ) - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオール、および  
h h ) ( 6 S , 8 S , 9 S , 1 3 S , 1 4 S ) - 6 - ( 6 - メトキシヘキシル ) - 1 3 - メチル - 7 , 8 , 9 , 1 1 , 1 2 , 1 3 , 1 4 , 1 5 , 1 6 , 1 7 - デカヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ a ] フェナントレン - 3 , 1 7 - ジオールからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物および製薬上許容されうる担体を含む、医薬組成物。

【請求項 2 2】

哺乳類ホストにおける固形癌の増殖を阻害するために使用される、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記哺乳類ホストがヒトである、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記固形癌の増殖が、乳房、膵臓、肺、結腸、前立腺、卵巣、脳、肝臓、脾臓、腎臓、リンパ節、小腸、血液細胞、骨、胃、子宮内膜、精巣、卵巣、中枢神経系、肌、頭および首、食道、ならびに骨髄の癌からなる群から選択される癌と関連する固形癌を表す、請求項 2 2 または 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記化合物を選択的にエストロゲン受容体に結合させることにより、染色体複製に関与する、またはそれらの産物が染色体複製に不可欠である、一つ以上の遺伝子の転写を減少させるために使用される、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記化合物が選択的に E R - 受容体に結合する、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。