

【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 0 7 J 1/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5685 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 J 1/00 C S P

A 6 1 K 31/5685

A 6 1 P 35/00

A 6 1 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

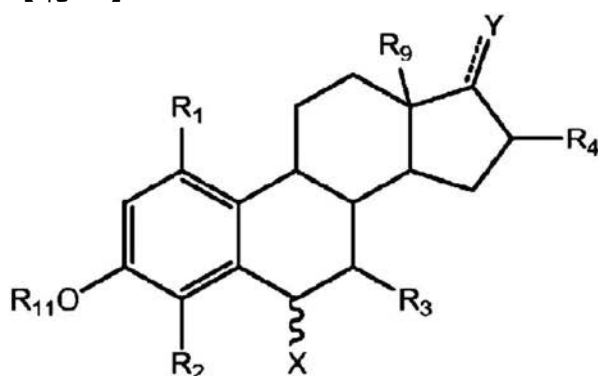
【補正の内容】

【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、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$  および  $R_4$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$  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、 $-N(CH_2)_n$ 、ホスフェート基、およびホスフィン酸塩基から選択され；

$R_9$  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；

$R_{11}$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル、ハロゲン、硫酸塩、グルクロニド、 $-SO_2NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-NHCH_2$ 、 $-CHO$ 、 $=CHOCH_3$ 、 $-COO$  塩、 $-OSO_2$  アルキル、 $-NH_2$ 、および  $-NHCO(CH_2)_n$  からなる群から選択され；

$R_{12}$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  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、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル、ハロゲン、グルクロニド、 $-NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-NHCN$ 、 $-CHO$ 、 $-COO$ 塩、 $-OSO_2$ アルキル、 $-SH$ 、 $-SCH_3$ 、 $-CH[(CH_2)_nCH_3]COOCH_3$ 、 $-(CH_2)_mCOOCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-NH-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルケニル- $O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルケニル-S- $(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルケニル-N- $(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルキニル- $O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルキニル-S- $(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$ アルキニル-N- $(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-OH$ 、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-NHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-SCN$ 、 $-SO_2$ アルキル、 $-B(OH)_2$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、 $-(CH_2)_m-NH-SO_2-NH_2$ 、 $-NHC(=S)CH_3$ 、および $-NHNH_2$ からなる群から選択され；

Yは、水素原子、 $=O$ 、 $-OCO(R_6)$ 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】



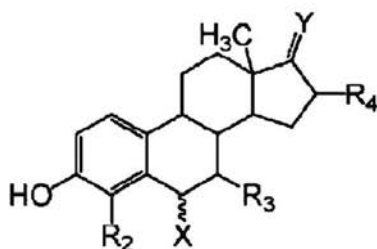
は、立体化学に関わらず任意の種類の結合を表す；

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うる塩。

【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；

$R_4$ 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、 $-OH$ およびハロからなる群から選択され；

$R_3$ 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、 $-(CH_2)_mCOOC$

$H_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-OH$ 、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、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；

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 - OH であり；

R<sub>4</sub> は、水素原子およびアルキルから選択され；

R<sub>2</sub> および R<sub>3</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、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、および  $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$  からなる群から選択され；

m は、1 ～ 6 の整数であり；

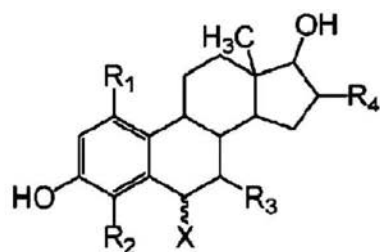
n は 0 ～ 3 の整数であり；および

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<sub>1</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>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、水素原子およびハロから選択され；

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、 $-(CH_2)_mCOOC$   $H_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-OH$ 、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、および  $-(CH_2)_m-NH-SO_2-NH_2$  からなる群から選択され；

$m$  - OH、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、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、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、および  $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$  から選択され；

$m$  は 1 ~ 12 の整数であり；および

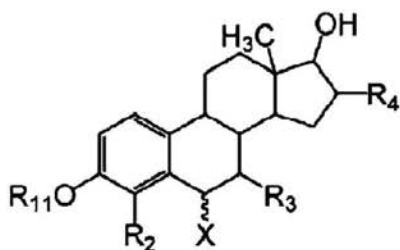
$n$  は 0 ~ 4 の整数であり、

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、 $-(CH_2)_mCOOCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル -  $O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル -  $S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル -  $N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル -  $O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル -  $S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル -  $N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-OH$ 、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、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、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、および  $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$  からなる群から選択され；

$m$  は 1 ～ 12 の整数であり；および

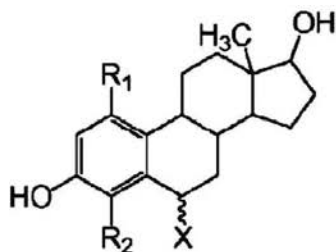
$n$  は 0 ～ 4 の整数であり；

$C-13$  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、 $-(CH_2)_mCOOCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルケニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-S-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-C_2 \sim C_8$  アルキニル  $-N-(CH_2)_nCH_3$ 、 $-(CH_2)_m-OH$ 、 $-(CH_2)_m-O-NH_2$ 、 $-(CH_2)_m-S-NH_2$ 、 $-NH(CH_2)_mCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mOCH_3$ 、 $-NH(CH_2)_mCHOH-COOH$ 、 $-(CH_2)_m(NH)CH_2OH$ 、 $-(CH_2)_mNHCOOH$ 、 $-(CH_2)_mN(CH_3)-SO_2-NH_3$ 、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、 $-(CH_2)_m-O-CH_3$ 、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_nCH_3$ 、 $(CH_2)_m-S-CH_3$ 、および  $-(CH_2)_m-S-(CH_2)_nCH_3$  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<sub>1</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>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<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；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<sub>1</sub> ~ R<sub>4</sub>は、水素原子であり；および

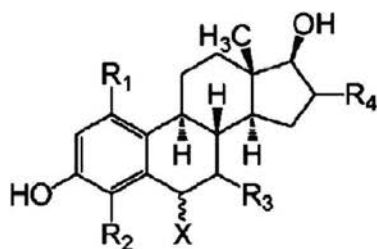
Zは、- O - であり、

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 10】



## 【請求項 18】

R<sub>1</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>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、水素原子およびハロから選択され；

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 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(CH<sub>3</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

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-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>、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<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 - シクロペンタ[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 - シクロペンタ[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 - 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、
- n) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - ( ( (メトキシメチル) アミノ) 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、
- o) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - ( ( (メトキシメチル) アミノ) 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、
- p) 1 - ( ( ( (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 3, 17 - ジヒドロキシ - 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 - 6 - yl) メチル) アミノ) プロパン - 2 - オン、
- q) 1 - ( ( ( (6S, 8R, 9S, 13S, 14S) - 3, 17 - ジヒドロキシ - 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 - 6 - yl) メチル) アミノ) プロパン - 2 - オン、
- r) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - メトキシ - 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、
- s) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - (2 - メトキシエチル) - 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、
- t) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - (4 - メトキシブチル) - 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、
- u) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - (6 - メトキシヘキシル) - 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、
- v) (6R, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - (6 - メトキシオクチル) - 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、
- w) (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, 14, 15, 16, 17 - デカヒドロ - 6H - シクロペンタ [a] フェナントレン - 17 - yl ステアレート、
- x) (6R, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S) - 6 - (メトキシメチル) - 10, 13 - ジメチル - 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16 - デカヒドロ - 3H - シクロペンタ [a] フェナントレン - 3, 17 (6H) - ジオン、
- y) (6S, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S) - 6 - (メトキシメチル) - 10, 13 - ジメチル - 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16 - デカヒドロ - 3H - シクロペンタ [a] フェナントレン - 3, 17 (6H) - ジオン、
- z) (6R, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S) - 6 - (メトキシメチル) - 10, 13 - ジメチル - 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17 - テトラデカヒドロ - 3H - シクロペンタ [a] フェナントレン - 3, 17 - ジオール、
- aa) (6S, 8R, 9S, 10R, 13S, 14S) - 6 - (メトキシメチル) - 10, 13 - ジメチル - 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17 - テトラデカヒドロ - 3H - シクロペンタ [a] フェナントレン - 3, 17 - ジオール、
- bb) (6S, 8R, 9S, 13S, 14S) - 6 - (メトキシメチル) - 13 - メチル - 17 - オキソ - 7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17 - 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、  
 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 - プロボキシブチル ) - 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 - エトキシペンチル ) - 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。