

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-531559(P2004-531559A)

【公表日】平成16年10月14日(2004.10.14)

【年通号数】公開・登録公報2004-040

【出願番号】特願2002-590985(P2002-590985)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 215/20

【F I】

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 215/20

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月9日(2005.5.9)

【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

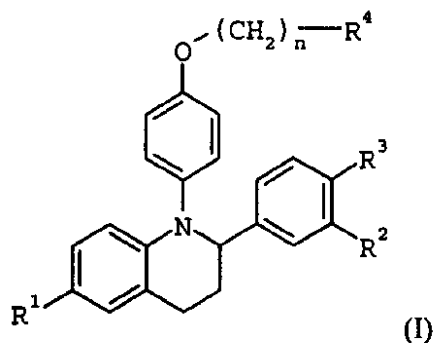
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

骨粗鬆症である、ヒトにおけるエストロゲン欠乏に関連する疾患を抑制するための医薬の製造における、式：

【化 1】



[式中、

R¹は、- H、- OH、- O(C₁ - C₄アルキル)、- OCOC₆H₅、- OCO(C₁ - C₆アルキル)または - OSO₂(C₂ - C₆アルキル)；

R²およびR³はそれぞれ独立して、- H、- OH、- O(C₁ - C₄アルキル)、- OCOC₆H₅、- OCO(C₁ - C₆アルキル)、- OSO₂(C₂ - C₆アルキル)またはハロ；

R⁴は、1 - ピペリジニル、1 - ピロリジニル、メチル - 1 - ピロリジニル、ジメチル - 1 - ピロリジニル、4 - モルホリノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジイソプロピルアミノまたは1 - ヘキサメチレンイミノ；

nは、1、2または3である]

の化合物またはその医薬的に許容しうる塩の使用。

【請求項 2】

化合物が、nが2、R¹ が - OHおよびR⁴ が1 - ピペリジニルである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

化合物が、R²またはR³の1つが - OHである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 4】

化合物が、R²およびR³の1つが - Hである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 つに記載の使用。

【請求項 5】

式 (I) の化合物が、

6 - メトキシ - 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン；

6 - メトキシ - 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン；

1 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オール；および

1 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オールまたはその医薬的に許容しうる塩から選ばれる請求項 1 に記載の使用。

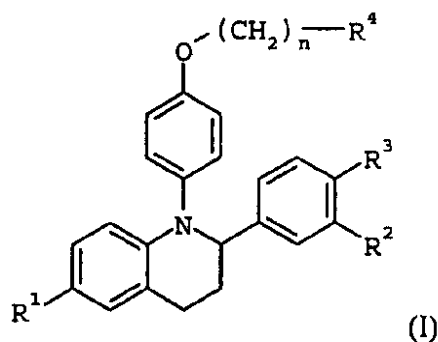
【請求項 6】

ヒトが閉経後の女性である請求項 5 に記載の使用。

【請求項 7】

エストロゲン依存性ガン、子宮内膜症および子宮線維症から選ばれる、ヒトにおける内因性エストロゲンに対する異常な生理反応に関連する疾患を抑制するための医薬の製造における、式：

【化 2】



[式中、

R¹は、- H、- OH、- O(C₁ - C₄アルキル)、- OCOC₆H₅、- OCO(C₁ - C₆アルキル)または - OSO₂(C₂ - C₆アルキル)；

R²およびR³はそれぞれ独立して、- H、- OH、- O(C₁ - C₄アルキル)、- OCOC₆H₅、- OCO(C₁ - C₆アルキル)、- OSO₂(C₂ - C₆アルキル)またはハロ；

R⁴は、1 - ピペリジニル、1 - ピロリジニル、メチル - 1 - ピロリジニル、ジメチル - 1 - ピロリジニル、4 - モルホリノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジイソプロピルアミノまたは1 - ヘキサメチレンイミノ；

nは、1、2または3である]

の化合物またはその医薬的に許容しうる塩の使用。

【請求項 8】

化合物が、nが2、R¹ が - OHおよびR⁴ が1 - ピペリジニルである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 7 に記載の使用。

【請求項 9】

化合物が、R²またはR³の1つが - OHである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 7 または 8 に記載の使用。

【請求項 10】

化合物が、R²およびR³の1つが - Hである化合物またはその医薬的に許容しうる塩である請求項 7 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の使用。

【請求項 11】

式 (I) の化合物が、

6 - メトキシ - 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン；

6 - メトキシ - 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン；

1 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オール；および

1 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オールまたはその医薬的に許容しうる塩から選ばれる請求項 7 に記載の使用。

【請求項 12】

ヒトが閉経後の女性である請求項 11 に記載の使用。