

【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

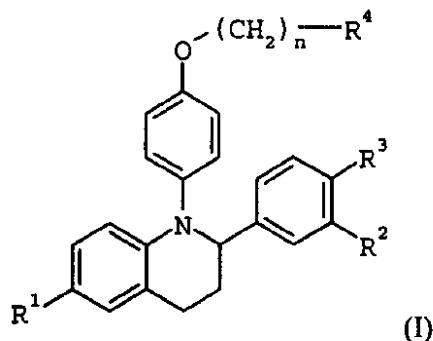
【補正の内容】

【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1】

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2】

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3】

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4】

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。

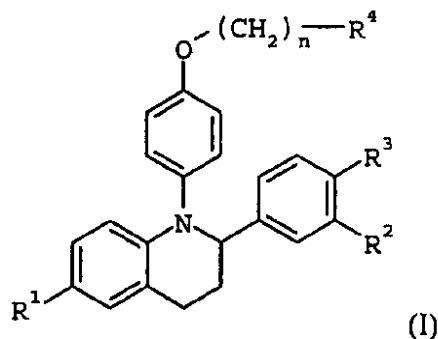
【請求項5】

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6】

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。