

【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29年6月8日 (2017.6.8)

【公表番号】特表2017-504567(P2017-504567A)

【公表日】平成29年2月9日 (2017.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-006

【出願番号】特願2016-533043(P2016-533043)

【国際特許分類】

C 0 7 C 39/17 (2006.01)

C 0 7 C 39/23 (2006.01)

C 0 7 C 59/11 (2006.01)

C 0 7 C 69/732 (2006.01)

C 0 7 C 251/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/05 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/15 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/30 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 39/17 C S P

C 0 7 C 39/23

C 0 7 C 59/11

C 0 7 C 69/732 Z

C 0 7 C 251/44

A 6 1 K 31/05

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 31/15

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 5/30

【手続補正書】

【提出日】平成29年4月19日 (2017.4.19)

【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

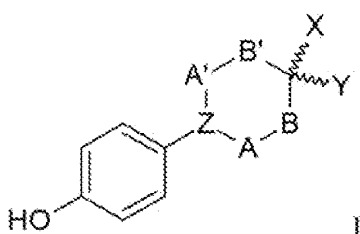
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式



を有する化合物：

式中、

A-Bは、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、または $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ であり；

A'-B'は $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、または $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり；

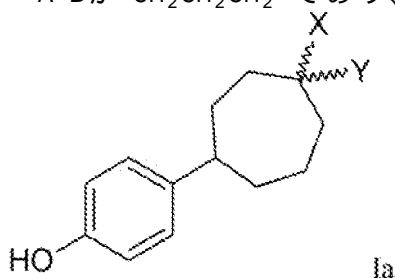
Zは炭素原子であり；

Xは、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、アミノ、またはアミノアルキルであり、ただし、A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ でありかつA'-B'が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ である場合、XはヒドロキシエチルではなくかつXはアミノメチルではないことを条件とし；

Yは水素もしくはアルキルであるか、またはXおよびYは一緒になってカルボキシアルキリデニル、エステルアルキリデニル、ヒドロキシアルキリデニル、アミノアルキリデニル、もしくはオキシムを形成するか、またはYは $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ でありかつYおよびZは架橋を形成する。

【請求項 2】

A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、A'-B'が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、かつ前記化合物が式 Ia



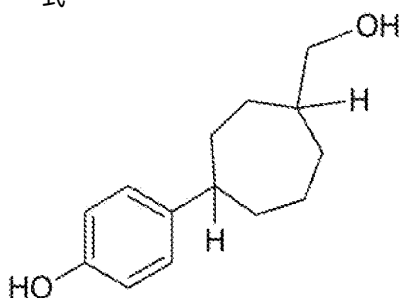
を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

Xがヒドロキシルまたはヒドロキシアルキルであり、かつYが水素である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項 4】

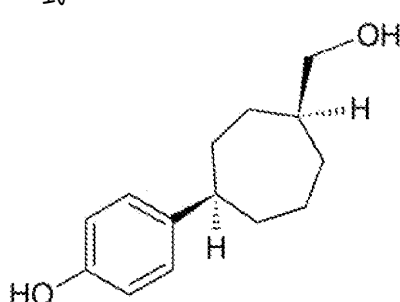
式



を有する、請求項3に記載の化合物。

【請求項 5】

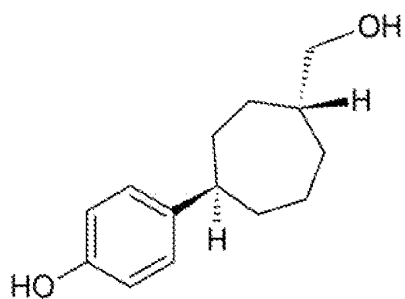
式



を有する、請求項4に記載の化合物。

【請求項 6】

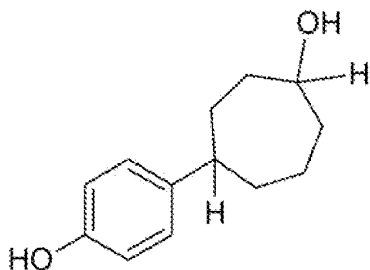
式



を有する、請求項4に記載の化合物。

【請求項 7】

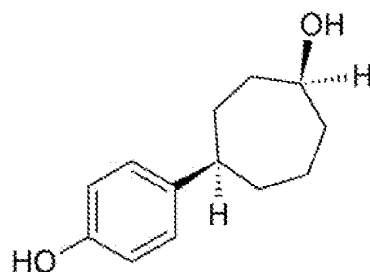
式



を有する、請求項3に記載の化合物。

【請求項 8】

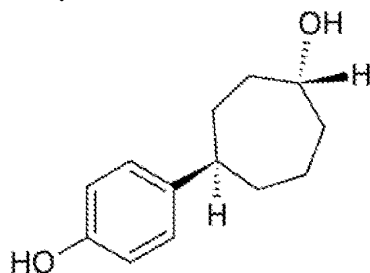
式



を有する、請求項7に記載の化合物。

【請求項 9】

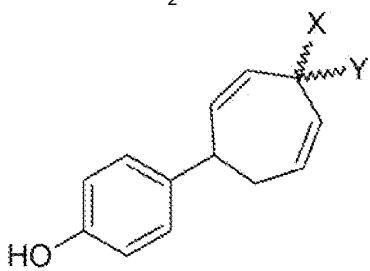
式



を有する、請求項7に記載の化合物。

【請求項 10】

A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ であり、A'-B'が $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、かつ前記化合物が式Ia

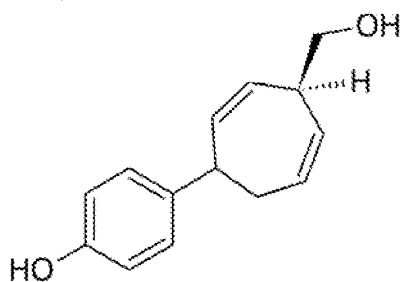


Ia(i)

を有する、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

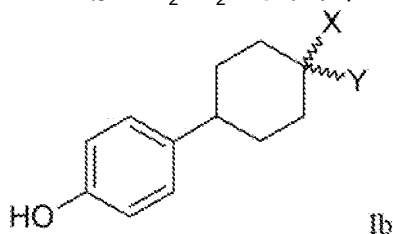
式



を有する、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、A-B'が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、かつ前記化合物が式1b



を有する、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

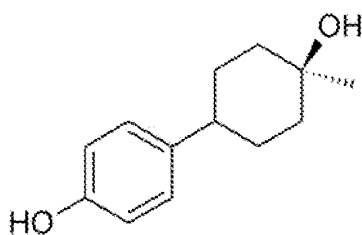
Xがヒドロキシメチルであり、かつYが水素である、請求項12に記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

Xがヒドロキシルであり、かつYがメチルである、請求項12に記載の化合物。

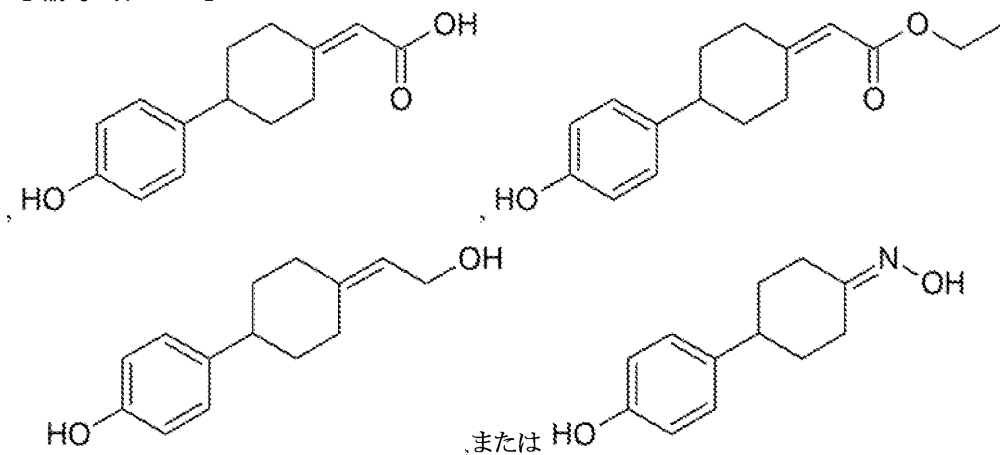
## 【請求項 1 5】

式



を有する、請求項15に記載の化合物。

## 【請求項 1 6】



より選択される式を有する、請求項12に記載の化合物。

## 【請求項 1 7】

請求項1～16のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を薬学的な賦形剤、担体、または希釈剤と共に含む、薬学的組成物。

## 【請求項 18】

エストロゲン受容体（ER）活性に関連する疾患または障害を処置するための医薬を調製するための、請求項1～16のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の使用。

## 【請求項 19】

前記疾患または前記障害が細胞増殖性疾患または細胞増殖性障害である、請求項18に記載の使用。

## 【請求項 20】

前記疾患または前記障害が精神疾患または精神障害である、請求項18に記載の使用。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

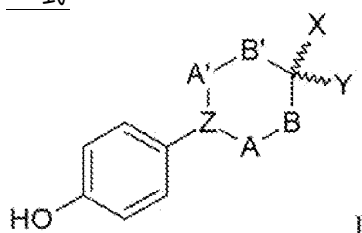
【補正の内容】

【0017】

開示する化合物を、薬学的組成物を調製および製剤化するために用いてもよい。したがって、本明細書において同様に開示するのは、本明細書において開示する化合物のいずれかまたは本明細書において開示する化合物のいずれかの薬学的に許容される塩の有効量を薬学的に許容される賦形剤、担体、または希釈剤と共に含む、薬学的組成物である。いくつかの態様において、開示する化合物を、エストロゲン受容体（ER）活性に関連する疾患または障害、特にERのアゴニストで処置しうる疾患または障害を処置するための医薬を調製するために用いてもよい。したがって、開示する化合物は、ERアゴニスト活性を示してもよく、好ましくは化合物は、ERアンタゴニストおよび/またはエストロゲン受容体（ER）アゴニストもしくはアンタゴニスト活性に比べてERアゴニストとしての特異性を示す。

[本発明1001]

式



を有する化合物：

式中、

A-Bは、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH=CH-、または-CH=CHCH<sub>2</sub>-であり；

A'-B'は-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、または-CH=CH-であり；

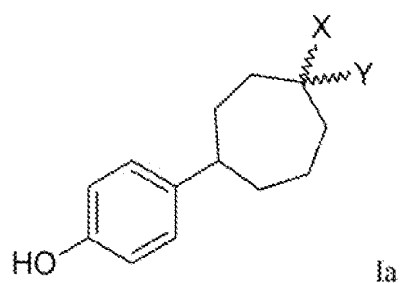
Zは炭素原子であり；

Xは、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、アミノ、またはアミノアルキルであり、ただし、A-Bが-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でありかつA'-B'が-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-である場合、XはヒドロキシエチルではなくかつXはアミノメチルではないことを条件とし；

Yは水素もしくはアルキルであるか、またはXおよびYは一緒になってカルボキシアルキリデニル、エステルアルキリデニル、ヒドロキシアルキリデニル、アミノアルキリデニル、もしくはオキシムを形成するか、またはYは-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でありかつYおよびZは架橋を形成する。

[本発明1002]

A-Bが-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-であり、A'-B'が-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-であり、かつ前記化合物が式Ia



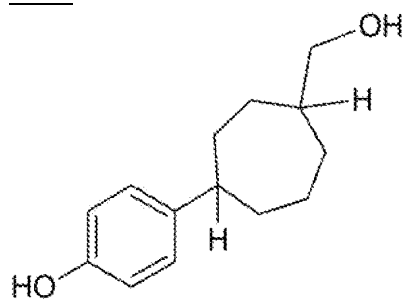
を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

Xがヒドロキシルまたはヒドロキシアルキルであり、かつYが水素である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1004]

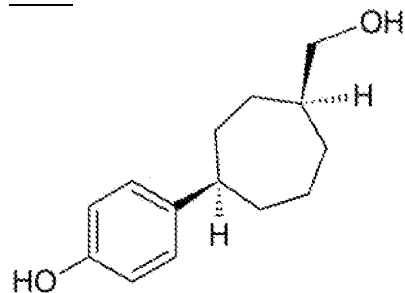
式



を有する、本発明1003の化合物。

[本発明1005]

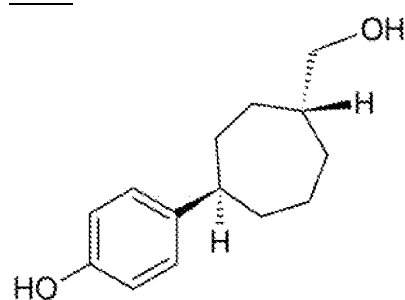
式



を有する、本発明1004の化合物。

[本発明1006]

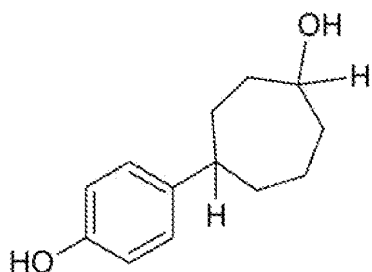
式



を有する、本発明1004の化合物。

[本発明1007]

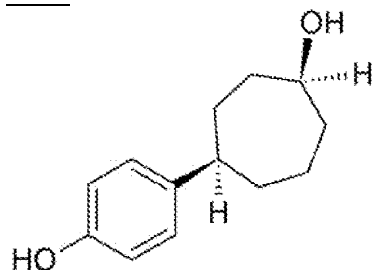
式



を有する、本発明1003の化合物。

[本発明1008]

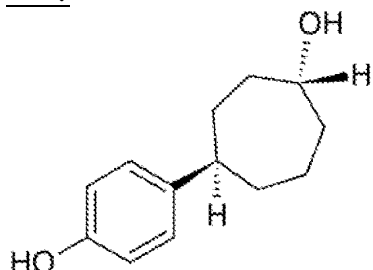
式



を有する、本発明1007の化合物。

[本発明1009]

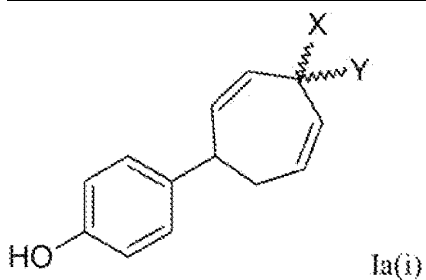
式



を有する、本発明1007の化合物。

[本発明1010]

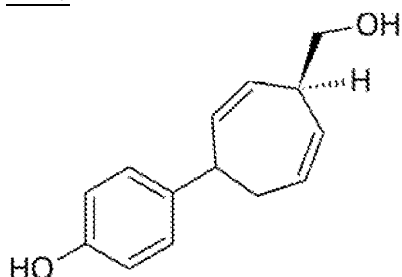
A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ であり、A'-B'が $-\text{CH}=\text{CH}-$ であり、かつ前記化合物が式Ia



を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1011]

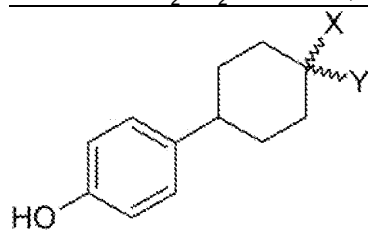
式



を有する、本発明1010の化合物。

[本発明1012]

A-Bが $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、A-B'が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり、かつ前記化合物が式1b



を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1013]

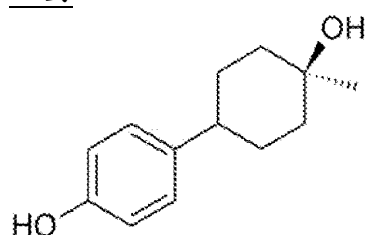
Xがヒドロキシメチルであり、かつYが水素である、本発明1012の化合物。

[本発明1014]

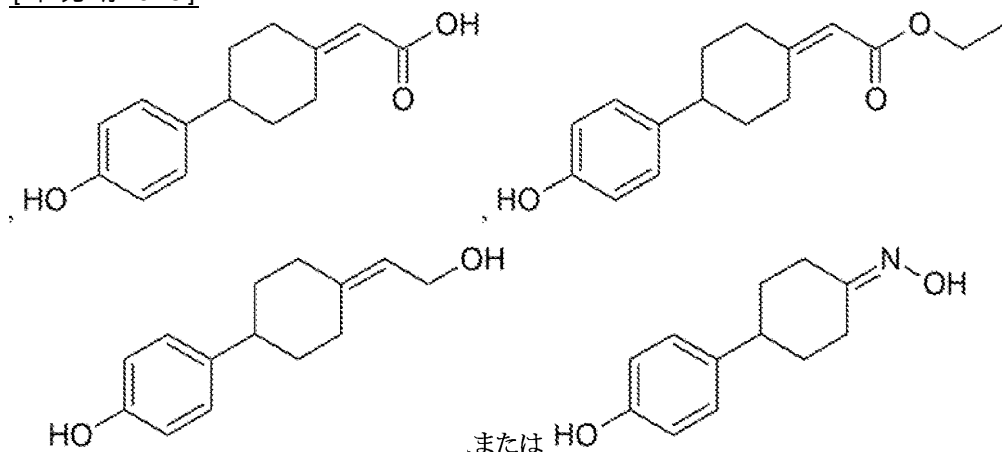
Xがヒドロキシルであり、かつYがメチルである、本発明1012の化合物。

[本発明1015]

式



を有する、本発明1015の化合物。

[本発明1016]

より選択される式を有する、本発明1012の化合物。

[本発明1017]

前記化合物のいずれかまたはその薬学的に許容される塩の有効量を薬学的な賦形剤、担体、または希釈剤と共に含む、薬学的組成物。

[本発明1018]

エストロゲン受容体 (ER) 活性に関連する疾患または障害を処置するための医薬を調製するための、前記化合物のいずれかまたはその薬学的に許容される塩の使用。

[本発明1019]

前記疾患または前記障害が細胞増殖性疾患または細胞増殖性障害である、本発明1018の使用。

[本発明1020]

前記疾患または前記障害が精神疾患または精神障害である、本発明1018の使用。