

【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 20 年 6 月 19 日 (2008.6.19)

【公表番号】特表 2004-501931 (P2004-501931A)

【公表日】平成 16 年 1 月 22 日 (2004.1.22)

【年通号数】公開・登録公報 2004-003

【出願番号】特願 2002-505804 (P2002-505804)

【国際特許分類】

C 07 J 53/00 (2006.01)

A 61 K 31/56 (2006.01)

A 61 P 5/30 (2006.01)

A 61 P 15/12 (2006.01)

A 61 P 15/18 (2006.01)

【F I】

C 07 J 53/00

A 61 K 31/56

A 61 P 5/30

A 61 P 15/12

A 61 P 15/18

【手続補正書】

【提出日】平成 20 年 4 月 28 日 (2008.4.28)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

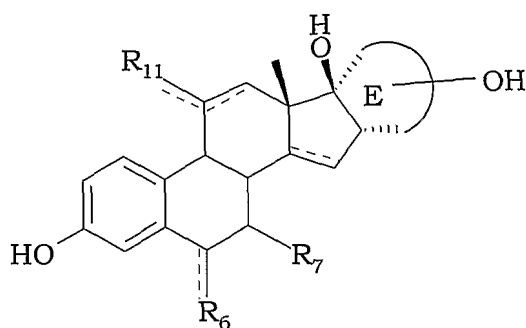
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (1) :

【化 1】



[式中、

点線の結合は、任意の二重結合を表し；

R₆ は、H、=CH₂、または -CH₃、または -CH₂-CH₃ であり；

R₇ は、H、C₁-₄-アルキル、C₂-₅アルケニルまたは C₂-₅-アルキニルであり、該アルキル、アルケニルまたはアルキニル基は、フッ素原子および塩素原子から成る群から独立に選択される 1～3 個のハロゲン原子で置換されていてもよく；

R₁₁ は H、C₁-₄-アルキル、C₂-₄-アルケニル、C₂-₄-アルキニルまたは C₁-₄-アルキリデンであり、該アルキル、アルケニル、アルキニルまたはアルキリデン基は、フッ素原子および塩素原子から成る群から独立に選択される 1～3 個のハロゲ

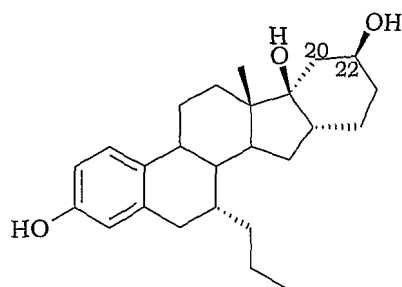
ン原子で置換されていてもよく；

E は、ステロイド骨格の炭素原子 16 および 17 と一緒になって、4 から 7 員の環を表わし、該環は、ステロイド骨格に対してシス配置における であり、1 個または 2 個の環内結合を任意に有していてもよい] で示されるステロイド化合物またはそのプロドラッグ（ここで前記プロドラッグは、ヒドロキシル基が以下の基：エーテル、エステル、アシル、ホスフェート、スルフェート、スルホネートおよび芳香族カルボキシレートの 1 つでキャップされている化合物である）。

【請求項 2】 R_6 が H であり、 R_7 が C_{1-3} -アルキルであり、E 環が、S 立体配置において 22 位にヒドロキシを有する、二重結合を有さない 5 または 6 員の環であることを特徴とする請求項 1 に記載のステロイド化合物。

【請求項 3】 前記化合物が、式 2：

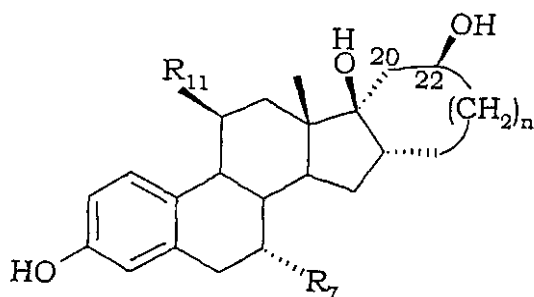
【化 2】



で示される (7, 16, 17, 22 S) - 7 - プロピル - 16, 24 - シクロ - 19, 21 - ジノルコラ - 1, 3, 5 (10) - トリエン - 3, 17, 22 - トリオールであることを特徴とする請求項 1 または 2 に記載のステロイド化合物。

【請求項 4】 下記の式 3：

【化 3】

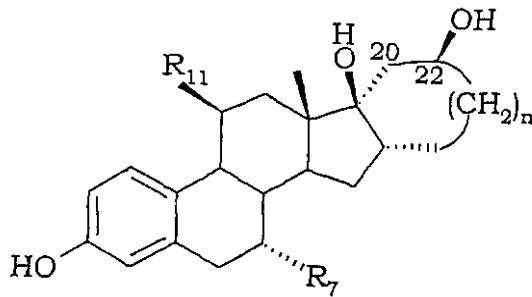


式 3

[式中、 R_7 が H であり、 R_{11} が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が CH_3 であり、 R_{11} が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が C_2H_5 であり、 R_{11} が H であり、および n が 0 である；或いは R_7 が C_2H_5 であり、 R_{11} が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が C_3H_7 であり、 R_{11} が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が H であり、 R_{11} が C_3H_7 であり、および n が 0 である] で示されるステロイド化合物。

【請求項 5】 下記の式 3：

【化 4】



式 3

[R_7 が H であり、 R_{11} が C_3H_7 であり、および n が 0 である] で示されるステロイド化合物。

【請求項 6】 治療に使用される請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載のステロイド化合物。

【請求項 7】 選択的エストロゲン受容体関連治療用の薬剤の製造における、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載のステロイド化合物の使用。

【請求項 8】 前記選択的エストロゲン受容体関連治療が、閉経期近くおよび閉経後の不定愁訴の予防または治療であることを特徴とする請求項 7 に記載の使用。

【請求項 9】 前記エストロゲン受容体関連治療が避妊治療であることを特徴とする請求項 7 に記載の使用。

【請求項 10】 請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載のステロイド化合物、および医薬適合性のある助剤を含む医薬組成物。

【請求項 11】 前記治療が、更年期不定愁訴を軽減するためのホルモン補充療法であることを特徴とする、請求項 6 に記載の使用

【請求項 12】 前記治療が、抗骨粗鬆症活性を有することを特徴とする、請求項 1 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】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

化合物 16

乾燥 THF 20 mL の中の、4.2 g の化合物 15 および 350 mg の $LiAlH_4$ の混合物を、2 時間還流した。次に、混合物を冷却し、次に、1 mL の Na_2SO_4 飽和水溶液、28 mL の酢酸エチルおよび 8 g の Na_2SO_4 で処理した。周囲温度で 30 分間攪拌した後、反応をセライトで濾過し、濾液を濃縮し、クロマトグラフィーにかけて、3.4 g の化合物 16 を得た。融点 147 ~ 148。 R_f 0.20 (トルエン / 酢酸エチル 8 / 2、化合物 15 の R_f 0.55)。

NMR ($CDCl_3$) 4.25 (ブロード s, 1, CHOH)、0.90 (s, 3, CH_3)、0.86 (t, 3, CH_3)、5.02 (s, 2, OCH_2Ar)。