

【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

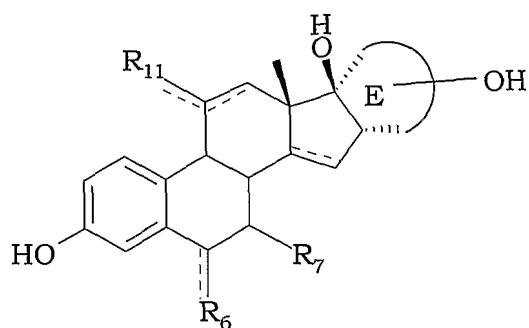
【補正方法】変更

【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

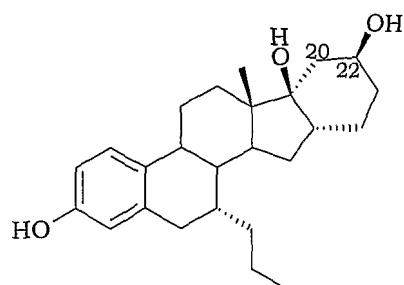
ン原子で置換されていてもよく；

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、ヒドロキシリル基が以下の基: エーテル、エステル、アシリル、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 つでキヤ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 2 2 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 :

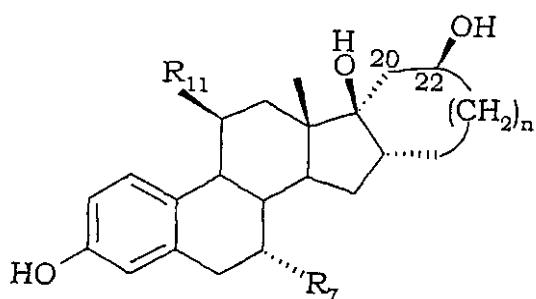
【化 2】



で示される (7 , 16 , 17 , 225) - 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】

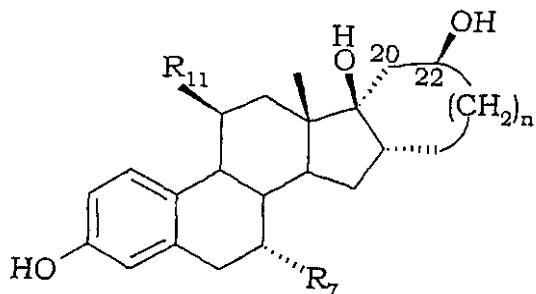


式3

[式中、 R_7 が H であり、 $R_{1,1}$ が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が C_2H_3 であり、 $R_{1,1}$ 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、 $R_{1,1}$ 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、 $R_{1,1}$ 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、 $R_{1,1}$ が H であり、および n が 1 である；或いは R_7 が H であり、 $R_{1,1}$ 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 LiAlH₄ 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 Na₂SO₄ 飽和水溶液、28 mL の酢酸エチルおよび 8 g の Na₂SO₄ 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 (CDCl₃) 4.25 (ブロード s, 1, CHOH)、0.90 (s, 3, CH₃)、0.86 (t, 3, CH₃)、5.02 (s, 2, OCH₂Ar)。