

【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21年9月17日 (2009.9.17)

【公表番号】特表2009-512633(P2009-512633A)

【公表日】平成21年3月26日 (2009.3.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-012

【出願番号】特願2008-532784(P2008-532784)

【国際特許分類】

C 07 J 7/00 (2006.01)

A 61 K 31/57 (2006.01)

A 61 K 31/565 (2006.01)

A 61 K 9/06 (2006.01)

A 61 K 9/70 (2006.01)

A 61 P 5/34 (2006.01)

A 61 P 5/30 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 15/08 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 15/18 (2006.01)

C 12 Q 1/02 (2006.01)

【F I】

C 07 J 7/00 C S P

A 61 K 31/57

A 61 K 31/565

A 61 K 9/06

A 61 K 9/70 4 0 1

A 61 P 5/34

A 61 P 5/30

A 61 P 15/00

A 61 P 15/08

A 61 P 19/10

A 61 P 25/00

A 61 P 25/28

A 61 P 25/24

A 61 P 35/00

A 61 P 15/18

C 12 Q 1/02

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月30日 (2009.7.30)

【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

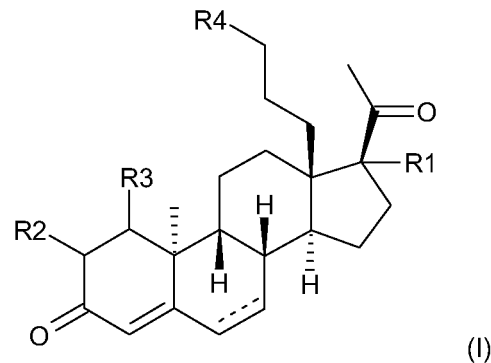
【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

一般式 (I)

## 【化 1】



[ 式中、

R 1 は、水素、-OH、-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、-O-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、および-O-CO-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルからなる群から選択され；

R 2 および R 3 は、両方ともに水素であるか、または共にメチレン基を形成し；

R 4 は、-O-R<sup>6</sup>、ヘテロアリール、およびアリールからなる群から選択され；

ここで、任意のヘテロアリールまたは任意のアリールが、-CHO；-CO-O-R<sup>9</sup>、-CO-NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 3</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-CO-R<sup>1 1</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-CH=N-O-R<sup>1 4</sup>、-CH=N-O-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-CH=N-O-CO-R<sup>1 1</sup>、-CH=N-O-CO-O-R<sup>1 4</sup>、-CN；-CH<sub>2</sub>-NH-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-R<sup>1 1</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-O-R<sup>1 4</sup>、-ハロゲン、-O-R<sup>9</sup>、-O-CO-R<sup>1 1</sup>；-O-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 3</sup>、-NR<sup>1 0</sup>-CO-R<sup>1 1</sup>、-NR<sup>1 0</sup>-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-NR<sup>1 0</sup>-CO-O-R<sup>1 4</sup>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、およびハロゲン化-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルからなる群から独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で任意に置換される、または、

ここで、任意のアリールが、隣接する炭素原子に結合し、かつ飽和環または部分不飽和環の 5、6、7、もしくは 8 - 員環系に組み合わされ、N 原子の数が 0、1、2、もしくは 3 個であり、O および S 原子の数が各々 0、1、もしくは 2 個である N、O、および S からなる群から選択される 1、2、または 3 個のヘテロ原子を任意に含む 2 つの基によって任意に置換され；

R<sup>6</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>1 0</sup>、R<sup>1 1</sup>、R<sup>1 2</sup>、R<sup>1 3</sup>、および R<sup>1 4</sup> は、水素、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、およびハロゲン化-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルからなる群から独立して選択され；または

R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> が結合される窒素原子と共に R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> は、複素環の 4 -、5 -、6 -、7 - または 8 - 員環系を形成し、この複素環は飽和、部分不飽和、または芳香族であり；付加的な N 原子の数が 0、1、2、もしくは 3 個であり、O および S 原子の数が各々 0、1、もしくは 2 個である N、O、および S からなる群から選択される 1、2、または 3 個の付加的なヘテロ原子を任意に含み；およびこの環は複数の縮合環系の任意の部分である] で示される化合物、ならびにそのすべての互変異性体、立体異性体、プロドラッグ、およびその塩。

## 【請求項 2】

R 4 は、-O-R<sup>6</sup>、ヘテロアリール、およびアリールからなる群から選択され、

ここで、任意のアリールが、-CHO；-CO-O-R<sup>9</sup>、-CO-NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 3</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-R<sup>9</sup>；-CH=N-O-R<sup>1 4</sup>、-CH=N-O-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-CH=N-O-CO-R<sup>1 1</sup>、-CH=N-O-CO-O-R<sup>1 4</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-NHR<sup>1 2</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-R<sup>1 1</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-O-R<sup>1 4</sup>、-

ハロゲンおよび - O - R<sup>9</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で任意に置換され、または

ここで、任意のアリールが、隣接する炭素原子に結合し、かつ飽和環または部分不飽和環の 5、6、もしくは 7 - 員環系に組み合わされ、N 原子の数が 0、1、もしくは 2 個であり、O 原子の数が 0、1、もしくは 2 個である N および O からなる群から選択される 1 または 2 個のヘテロ原子を任意に含む 2 つの基によって任意に置換され；

R<sup>6</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、および R<sup>14</sup> は、水素、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、およびハロゲン化 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から独立して選択され；または

R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> が結合される窒素原子と共に R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は、複素環の 5 -、6 -、または 7 - 員環系を形成し、この複素環は飽和または部分不飽和であり；および付加的な N 原子の数が 0、1、もしくは 2 個であり、O 原子の数が 0 もしくは 1 個である N および O からなる群から選択される 1 または 2 個の付加的なヘテロ原子を任意に含む、請求項 1 に記載の一般式 (I) の化合物。

【請求項 3】

R<sup>1</sup> は、水素および - O - CO - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、両方ともに水素であり；

R<sup>4</sup> は、- OH、フェニル、フリル、およびピリジルからなる群から選択され、ここで、任意のフェニルが、メタ位またはパラ位またはメタ位およびパラ位の両位で、- CHO；- CO - O - R<sup>9</sup>、- CO - NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、- CH<sub>2</sub> - O - R<sup>9</sup>；- CH = N - O - R<sup>14</sup>、- CH = N - O - CO - NHR<sup>12</sup>、- ハロゲンおよび - O - R<sup>9</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で任意に置換され；またはここで、任意のフェニルが、隣接する炭素原子に結合し、および飽和環状の 5 -、6 -、または 7 - 員環系に組み合わされ、任意に 1 または 2 個の O 原子を含む 2 つの基によって任意に置換され、；および

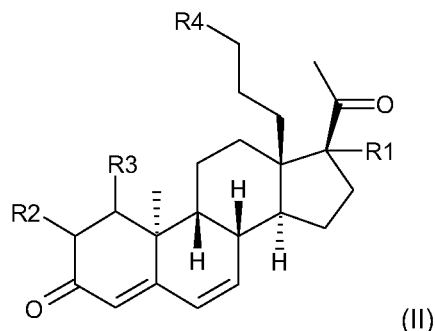
R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、および R<sup>14</sup> は、水素、- (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、およびハロゲン化 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から独立して選択され；または

R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> が結合される窒素原子と共に R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は、飽和複素環の 5 -、6 -、または 7 - 員環系を形成し、それが N および O からなる群から選択される 1 つの付加的なヘテロ原子を任意に含む、請求項 1 または 2 に記載の一般式 (I) の化合物。

【請求項 4】

一般式 (II)

【化 2】

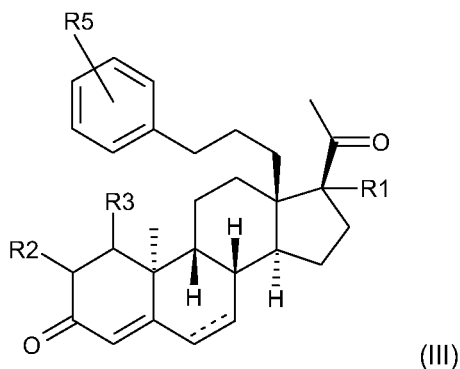


の化合物である、請求項 1 から 3 までのいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

一般式 (III)

## 【化 3】



[ 式中、R<sup>1</sup> は、-OH、-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、-O-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、および -O-CO-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、両方ともに水素であるか、または共にメチレン基を形成し；

R<sup>5</sup> は、-CHO；-CO-O-R<sup>9</sup>、-CO-NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-CO-R<sup>11</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-CO-NHR<sup>12</sup>；-CH=N-O-R<sup>14</sup>、-CH=N-O-CO-NHR<sup>12</sup>、-CH=N-O-CO-R<sup>11</sup>、-CH=N-O-CO-O-R<sup>14</sup>、-CN；-CH<sub>2</sub>-NH-CO-NHR<sup>12</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-R<sup>11</sup>、-CH<sub>2</sub>-NH-CO-O-R<sup>14</sup>、-ハロゲン、-O-R<sup>9</sup>、-O-CO-R<sup>11</sup>、-O-CO-NHR<sup>12</sup>、-NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、-NR<sup>10</sup>-CO-R<sup>11</sup>、-NR<sup>10</sup>-CO-NHR<sup>12</sup>、-NR<sup>10</sup>-CO-O-R<sup>14</sup>、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、およびハロゲン化-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から選択され；

R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、および R<sup>14</sup> は、水素、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、およびハロゲン化-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から独立して選択され；または

R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> が結合される窒素原子と共に R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は、複素環の 4 -、5 -、6 -、7 - または 8 - 員環系を形成し、それは飽和、部分不飽和、または芳香族であり；および付加的な N 原子の数が 0、1、2、もしくは 3 個であり、O および S 原子の数が各々 0、1、もしくは 2 個である N、O および S からなる群から選択される 1、2、または 3 個の付加的なヘテロ原子を任意に含み；およびこの環は複数の縮合環系の任意の部分である ] で示される化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

R<sup>1</sup> は、水素および -O-CO-O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から選択され；

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、両方ともに水素であり；

R<sup>5</sup> は、-CHO；-CO-O-R<sup>9</sup>、-CO-NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>、-CH<sub>2</sub>-O-R<sup>9</sup>；-CH=N-O-R<sup>14</sup>、-CH=N-O-CO-NHR<sup>12</sup>、-ハロゲン、および -O-R<sup>9</sup> からなる群から選択され；ならびに

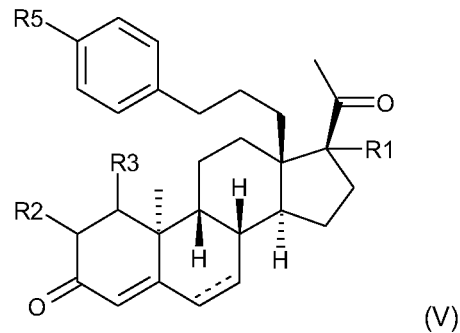
R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、および R<sup>14</sup> は、水素、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキル、およびハロゲン化-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) アルキルからなる群から独立して選択され；または

R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> が結合される窒素原子と共に R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は、複素環の 5 -、6 -、または 7 - 員環系を形成し、これは飽和または部分不飽和であり；付加的な N 原子の数が 0、1、もしくは 2 個であり、O 原子の数が 0 もしくは 1 個である N および O からなる群から選択される 1 または 2 個の付加的なヘテロ原子を任意に含む、請求項 5 に記載の一般式 (III) の化合物。

## 【請求項 7】

化合物が一般式 (V)

## 【化 4】



である、請求項 5 および 6 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 8】

- 18 - [ 2 - ( 4 - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 1 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 2 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - 3 , 20 - ジオキソ - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 17 - イル - 炭酸エチルエステル ( 第 3 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - N - エチルカルバモイル - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 4 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - N - エチルカルバモイル - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 5 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - N - エチルカルバモイル - オキシミノ - ホルミルフェニル ) - エチル ] - 3 , 20 - ジオキソ - ( ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 17 - イル - 炭酸エチルエステル ( 第 6 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ヒドロキシメチル - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 7 ) )、
- 18 - ( 2 - [ 4 - ヒドロキシメチル - フェニル ] - エチル ) - 3 , 20 - ジオキソ - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 17 - イル - 炭酸エチルエステル ( 第 8 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ホルミル - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 9 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ホルミル - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 10 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ホルミル - フェニル ) - エチル ] - 3 , 20 - ジオキソ - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 17 - イル - 炭酸エチルエステル ( 第 11 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ホルミル - フェニル ) - エチル ] - 3 , 20 - ジオキソ - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 17 - イル - 炭酸エチルエステル ( 第 12 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ホルムアミド - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 13 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ギ酸 - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 14 ) )、
- 18 - [ 2 - ( 4 - ギ酸 - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 15 ) )、
- 18 - [ 2 - フェニル ] - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 16 ) )、
- 18 - [ 2 - フェニル ] - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 17 ) )、
- 18 - [ 2 - ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル - エチル ] - ( 9 , 10 ) -

プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 18 ) 、  
 18 - [ 2 - ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル - エチル ] - ( 9 , 10 ) -  
 プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 19 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグ  
 ナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 20 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグ  
 ナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 21 ) 、  
 18 - [ 2 - ピリジン - 3 - イル - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 - エン -  
 3 , 20 - ジオン ( 第 22 ) 、  
 18 - [ 2 - ピリジン - 3 - イル - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジ  
 エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 23 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4  
 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 24 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4  
 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 25 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4  
 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 26 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグナ - 4  
 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 27 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジメトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグ  
 ナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 28 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジメトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 ) - プレグ  
 ナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 29 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 - トリフルオロ - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 )  
 - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 30 ) 、  
 18 - [ 2 - ( 3 - トリフルオロ - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ( 9 , 10 )  
 - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 31 ) 、  
 18 - { 2 - [ 4 - ( モルホリン - 4 - カルボニル ) - フェニル ] - エチル } - ( 9 ,  
 10 ) - プレグナ - 4 - エン - 3 , 20 - ジオン ( 第 32 ) 、および  
 18 - { 2 - [ 4 - ( モルホリン - 4 - カルボニル ) - フェニル ] - エチル } - ( 9 ,  
 10 ) - プレグナ - 4 , 6 - ジエン - 3 , 20 - ジオン ( 第 33 ) の典型的な化合物か  
 らなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 9】

活性成分として、請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの化合物  
 、またはその薬学的に許容される塩またはプロドラッグの薬理的有効量および少なくとも  
 1 つの薬学的に許容される担体および / または少なくとも 1 つの薬学的に許容される補助  
 物質を含む医薬組成物。

#### 【請求項 10】

さらに、少なくとも 1 つの低容量の天然または合成のエストロゲンまたはそのプロドラ  
 ッグを含む、請求項 9 に記載の医薬組成物。

#### 【請求項 11】

使用される前記エストロゲンが、天然エストロゲンである、請求項 10 に記載の医薬組  
 成物。

#### 【請求項 12】

前記医薬組成物が、子宮内器具、経皮パッチまたはゲルの形態である、請求項 9 から 1  
 1 までのいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

#### 【請求項 13】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩ま  
 たはプロドラッグを含有することを特徴とする、プロゲステロン受容体によって媒介され  
 る、または前記プロゲステロン受容体の操作によって治療されることが可能な疾患もしく

は状態の治療もしくは予防のための薬剤。

【請求項 1 4】

プロゲステロン受容体によって媒介される、または前記プロゲステロン受容体の調節によって治療されることが可能な前記疾患または前記状態が、子宮内膜症、子宮筋腫、子宮平滑筋腫、子宮内膜増殖症、月経困難症、機能不全性子宮出血、月経過多、不正子宮出血、過多月経、顔面紅潮、気分障害、髄膜腫、ホルモン依存性癌、女性の骨粗鬆症、クッシング症候群、大うつ病、神経変性疾患、アルツハイマー病、および脱髄疾患から選択される、請求項 1 3 に記載の薬剤。

【請求項 1 5】

前記ホルモン依存性癌が、女性の性ステロイド依存性癌、卵巢癌、乳癌、子宮内膜癌、および前立腺癌からなる群から選択される、請求項 1 4 に記載の薬剤。

【請求項 1 6】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩またはプロドラッグを含有することを特徴とする、女性の避妊用、受胎能の調節用、または女性のホルモン補充療法用の薬剤。

【請求項 1 7】

前記状態が、女性のホルモン補充療法で軽減される、請求項 1 3 に記載の薬剤。

【請求項 1 8】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物を含有することを特徴とする、避妊を提供するための薬剤。

【請求項 1 9】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物を含有することを特徴とする、プロゲステロン受容体を調節するための薬剤。

【請求項 2 0】

前記調節が活性化である、請求項 1 9 に記載の薬剤。

【請求項 2 1】

( a ) 請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物を標識すること ;  
( b ) 細胞または細胞抽出物を標識した前記化合物と接触させること ;  
( c ) プロゲステロン受容体の存在を決定するために、接触させた前記細胞または前記細胞抽出物を試験すること、  
とを含む細胞または細胞抽出物でのプロゲステロン受容体の存在を決定する方法。