

【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2009-508808(P2009-508808A)

【公表日】平成21年3月5日 (2009.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-009

【出願番号】特願2008-524214(P2008-524214)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

C 0 7 D 207/34 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 5/30 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/40

C 0 7 D 207/34 C S P

C 0 7 D 207/34

C 0 7 D 417/10

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 31/57

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/02

A 6 1 P 43/00 1 0 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 25/18

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/4025

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日(2009.8.3)

【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

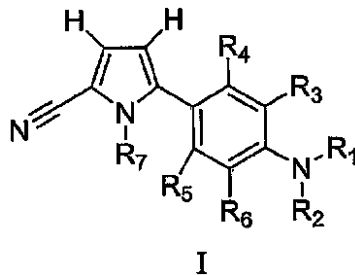
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

哺乳動物における避妊の誘導、ホルモン補充療法、ホルモン依存性の病気の治療、発情同期化、または月経周期に関連した症状の治療を必要とする哺乳動物に対して投与することによって治療するための医薬組成物であって、
前記医薬組成物は、有効量の以下の式Iの構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含み：

【化1】

ここで、 R_1 は、

H、

SO_2 - C_1 - C_6 アルキル、 SO_2 - C_3 - C_8 シクロアルキル、 SO_2 -置換 C_1 - C_6 アルキル、 SO_2 -アリー
ル、 SO_2 -置換アリール、 SO_2 -ヘテロアリール、 SO_2 -複素環、 SO_2 - C_3 - C_6 アルケニル、 SO_2 - C_3 - C_6 アルキニル、 SO_2 - C_3 - C_6 置換アルケニル、 SO_2 - C_3 - C_6 置換アルキニル、

CN、

$\text{C}(0)$ - C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)$ - C_3 - C_8 シクロアルキル、 $\text{C}(0)$ -置換 C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)$ -ア
リール、 $\text{C}(0)$ -置換アリール、 $\text{C}(0)$ -ヘテロアリール、 $\text{C}(0)$ -複素環、 $\text{C}(0)$ - C_3 - C_6 アルケ
ニル、 $\text{C}(0)$ - C_3 - C_6 アルキニル、 $\text{C}(0)$ -置換 C_3 - C_6 アルケニル、 $\text{C}(0)$ -置換 C_3 - C_6 アルキニル、

$\text{C}(0)\text{O}$ - C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)\text{O}$ - C_3 - C_8 シクロアルキル、 $\text{C}(0)\text{O}$ -置換 C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)\text{O}$ -
アリール、 $\text{C}(0)\text{O}$ -置換アリール、 $\text{C}(0)\text{O}$ -ヘテロアリール、 $\text{C}(0)\text{O}$ -複素環、 $\text{C}(0)\text{O}$ - C_3 - C_6 ア
ルケニル、 $\text{C}(0)\text{O}$ - C_3 - C_6 アルキニル、 $\text{C}(0)\text{O}$ - C_3 - C_6 置換アルケニル、 $\text{C}(0)\text{O}$ - C_3 - C_6 置換アル
キニル、

$\text{C}(0)\text{NH}$ - C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)\text{NH}$ - C_3 - C_8 シクロアルキル、 $\text{C}(0)\text{N}$ -ジ- C_3 - C_8 シクロアルキル
、 $\text{C}(0)\text{N}$ -ジ- C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)\text{N}$ -ジ-置換 C_1 - C_6 アルキル、 $\text{C}(0)\text{NH}$ -置換 C_1 - C_6 アルキル、
 $\text{C}(0)\text{NH}$ -アリール、 $\text{C}(0)\text{N}$ -(アリール)₂、 $\text{C}(0)\text{NH}$ -置換アリール、 $\text{C}(0)\text{N}$ -二置換アリール、 C
(0) NH -ヘテロアリール、 $\text{C}(0)\text{N}$ -ジヘテロアリール、 $\text{C}(0)\text{NH}$ -複素環、 $\text{C}(0)\text{N}$ -ジヘテロサイ
クル、 $\text{C}(0)\text{NH}$ - C_3 - C_6 アルケニル、 $\text{C}(0)\text{NH}$ - C_3 - C_6 アルキニル、 $\text{C}(0)\text{O}$ -置換 C_3 - C_6 アルケ
ニル、および $\text{C}(0)\text{O}$ -置換 C_3 - C_6 アルキニルからなる群から選択されるか；あるいは、

R_1 は、式Iの二量体を形成する、式Iの第2構造に対する結合基であり、前記結合基は、 $\text{C}(0)$
)-および $\text{S}(0)_2$ -からなる群から選択され、

R_2 は、H、 C_1 - C_6 アルキル、置換 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 SO_2 -アルキル、お
よび SO_2 -置換アルキルからなる群から選択されるか；あるいは、

R_1 および R_2 は、結合して $-(\text{C}(\text{R}_8)_a(\text{R}_9)_b)_c-\text{SO}_2-(\text{C}(\text{R}_8)_d(\text{R}_9)_e)_f$ -を形成し、

R_8 および R_9 は、それぞれ独立してH、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 a および b は、 $a + b = 2$ であるときに、それぞれ独立して0~2であり、
 d および e は、 $a + b = 2$ であるときに、それぞれ独立して0~2であり、
 c および f は、 c または f どちらか一方が0より大きいときに、それぞれ独立して0~5であり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、それぞれ独立してH、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、置換 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_mX_n)_zCH_pX_q$ 、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $O \sim C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O \sim C_1 \sim C_6$ 置換アルキル、 $O \sim (CH_mX_n)_zCH_pX_q$ 、アリール、ヘテロアリール、複素環、置換アリール、置換ヘテロアリール、および置換複素環からなる群から選択され、

X はハロゲンであり、

m および n は、 $m + n = 2$ であるときに、それぞれ独立して0~2であり、

p および q は、 $p + q = 3$ であるときに、それぞれ独立して0~3であり、

z は0~10であり、

R_7 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C(O)O \sim C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、および置換 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルからなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、

R_1 は、H、 $SO_2 \sim C_1 \sim C_6$ アルキル、 $SO_2 \sim C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $SO_2 \sim$ 置換 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $SO_2 \sim$ アリール、 $SO_2 \sim$ 置換アリール、 $SO_2 \sim$ ヘテロアリール、 $SO_2 \sim$ 置換アリールおよびCNからなる群から選択され、

R_2 はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、それぞれ独立してH、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $O \sim C_1 \sim C_6$ アルキル、および $O \sim C_1 \sim C_6$ 置換アルキルからなる群から選択され、そして、

R_7 はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、

R_1 は、H、 $SO_2 \sim C_1 \sim C_4$ アルキル、 $SO_2 \sim C_3 \sim C_5$ シクロアルキルおよびCNからなる群から選択され、

R_2 はHであり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、それぞれ独立してH、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $O \sim C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され、そして、

R_7 はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 4】

請求項 3 に記載の医薬組成物であって、ここで、

R_1 は $SO_2 \sim C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

R_2 はHであり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 はHであり、そして、

R_7 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、

R_1 は $SO_2 \sim C_3 \sim C_6$ アルキルであり、前記アルキルは分岐鎖であり、

R_2 はHであり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 はHであり、そして、

R_7 は C_1 アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、

R_1 は $SO_2 \sim C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、

R_2 はHであり、

R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 はHであり、そして、
 R_7 は C_1 アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、
 R_1 は、 $C(O)C_1-C_6$ アルキルまたは $C(O)C_3-C_5$ シクロアルキルであり、
 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 は、それぞれ独立してH、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキルおよびO- C_1-C_6 アルキルからなる群から選択され、そして、
 R_7 はHまたは C_1-C_6 アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 6 に記載の医薬組成物であって、ここで、
 R_1 は、 $C(O)C_1-C_4$ アルキルまたは $C(O)C_3-C_6$ シクロアルキルであり、
 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 はHであり、そして、
 R_7 は C_1 アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、
 R_1 は、 $CO(NH_2)$ 、CN、 $C(O)$ -ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールはフランである）、 $C(O)$ アリール（ここで、アリールはフェニル環である）、 SO_2 -置換アリール（ここで、置換アリールはアルキルフェニルであり、そしてここで、アルキルはイソプロピルおよびメチルから選択される）、 $C(O)O-C_1-C_3$ アルキル、 SO_2 -置換 C_2-C_6 アルキル（ここで、アルキルは1つ以上のハロゲンまたは CF_3 で置換される）、および SO_2 -アルキル（ここで、アルキルは分岐鎖である）からなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、
 R_1 は、式(1)の第2構造に対する $C(O)$ 結合基であって、その二量体を形成する、前記医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1、9 または 10 に記載の医薬組成物であって、ここで、 R_2 はHおよび $SO_2-C_1-C_4$ アルキルからなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 12】

請求項 1 および 9 ~ 11 のいずれかに記載の医薬組成物であって、ここで、 R_3 は、H、 C_1-C_3 アルキル、ハロゲン（FおよびClからなる群から選択される）、およびO- C_1-C_3 アルキルからなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 1 および 9 ~ 12 のいずれかに記載の医薬組成物であって、ここで、 R_4 は、HおよびO- C_1-C_3 アルキルからなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 14】

請求項 1 および 9 ~ 13 のいずれかに記載の医薬組成物であって、ここで、 R_5 は、H、 C_1-C_3 アルキル、ハロゲン（FおよびClからなる群から選択される）、およびO- C_1-C_3 アルキルからなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 15】

請求項 1 および 9 ~ 14 のいずれかに記載の医薬組成物であって、ここで、 R_6 はHおよびハロゲンからなる群から選択され、ここでハロゲンはフッ素である、前記医薬組成物。

【請求項 16】

請求項 1 および 9 ~ 15 のいずれかに記載の医薬組成物であって、ここで、 R_7 は C_1 アルキルである、前記医薬組成物。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の医薬組成物であって、ここで、前記化合物は：

5-(4-アミノフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；

5-(4-アミノ-3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-2-フルアミド；

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-3-メチルブタンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-2-メチルプロパンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]プロパンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]ブタンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]アセトアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]ベンズアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]シクロブタンカルボキサミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]シクロヘキサンカルボキサミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-2-メチルアクリルアミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]カルバミン酸エチル ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]カルバミン酸イソブチル ;
N,N'-ビス[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]尿素 ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]プロパン-1-スルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-N-(メチルスルホニル)メタン
スルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]ブタン-1-スルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-2,2,2-トリフルオロエタンス
スルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-4-イソプロピルベンゼンスル
ホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]ベンゼンスルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]-4-メチルベンゼンスルホンア
ミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]プロパン-2-スルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]メタンスルホンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-フルオロフェニル]メタンスルホンア
ミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-フルオロフェニル]エタンスルホンア
ミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-メチルフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-エチルフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-プロピルフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-イソプロピルフェニル]シアナミド ;
[2-クロロ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]シアナミド ;
[2-フルオロ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-メトキシフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-メトキシフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-メチルフェニル]シアナミド ;
[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]メチルシアナミド ;
5-(4-アミノ-2-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-フルオロフェニル]メタンスルホンア
ミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-フルオロフェニル]エタンスルホンア
ミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-フルオロフェニル]プロパン-1-スルホ
ンアミド ;
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-フルオロフェニル]ブタン-1-スルホン
アミド ;

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-フルオロフェニル]プロパン-2-スルホンアミド；
5-(4-アミノ-2,5-ジフルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,5-ジフルオロフェニル]-メタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,5-ジフルオロフェニル]エタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,5-ジフルオロフェニル]プロパン-1-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,5-ジフルオロフェニル]ブタン-1-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,5-ジフルオロフェニル]プロパン-2-スルホンアミド；
5-[4-アミノ-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]メタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパン-1-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]ブタン-1-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパン-2-スルホンアミド；
5-[4-(1,1-ジオキシドイソチアゾリジン-2-イル)フェニル]-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；
5-[4-アミノ-3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル]エタン-スルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル]プロパン-1-スルホンアミド；
2-シアノ-5-[4-[(エチルスルホニル)アミノ]フェニル]-1H-ピロール-1-カルボン酸tert-ブチル；
N-[4-(5-シアノ-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-エチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-プロピル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-(1-ブチル-5-シアノ-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-(1-アリル-5-シアノ-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-(5-シアノ-1-プロパ-2-イン-1-イル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；
N-[4-[5-シアノ-1-(3-フェニルプロピル)-1H-ピロール-2-イル]フェニル]エタンスルホンアミド；
5-(4-アミノ-2-シアノフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；
N-[3-シアノ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；
N-[3-シアノ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]エタンスルホンアミド

ド；

N-[3-シアノ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]プロパン-1-スルホンアミド；

N-[2-シアノ-4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

5-(4-アミノ-2,6-ジフルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル；

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3,5-ジフルオロフェニル]-メタンスルホンアミド；

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3,5-ジフルオロフェニル]エタン-スルホンアミド；

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3,5-ジフルオロフェニル]プロパン-1-スルホンアミド；および

N-[4-(5-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-3,5-ジフルオロフェニル]ブタン-1-スルホンアミド

からなる群から選択される、前記医薬組成物。

【請求項 18】

前記化合物が避妊を誘導するために投与される、請求項 1～17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記化合物がホルモン補充療法のために投与される、請求項 1～17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記化合物がホルモン依存性の病気を治療するために投与される、請求項 1～17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記ホルモン依存性の病気が、子宮筋腫、子宮内膜症、不正子宮出血、月経困難症、無月経、前立腺肥大症、平滑筋腫/類線維腫、ホルモン依存性腫瘍、卵巣、乳房、子宮内膜、結腸、前立腺および下垂体の癌腫および腺癌、並びに髄膜腫からなる群から選択される、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記ホルモン依存性の癌腫が、乳癌および卵巣癌からなる群から選択される、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記化合物が発情同期化のために投与される、請求項 1～17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記医薬組成物が、月経周期に関連した症状を治療するためのものである、請求項 1～17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記症状が心理的なものである、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記心理的な症状が、情緒の変化、興奮性、不安、集中力欠如、または性的欲求の減少を含む、請求項 25 に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記症状が肉体的なものである、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記肉体的な症状が、乳房の圧痛、腫脹、疲労または大食症を含む、請求項 27 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

前記月経周期に関連した症状が、哺乳動物における月経前症候群および月経前不快気分障

害の症状を含む、請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 30】

避妊レジメンのためのキットであって：

(a) プロゲステロン活性が約 35 ~ 100 μg のレボノルゲストレルのものに等しい、1 日投与量が 14 ~ 24 ユニットである第 1 段階のためのプロゲステロン剤；

(b) 請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の化合物の 1 日投与量が約 2 ~ 200mg であって、1 日投与量が 1 ~ 11 ユニットである第 2 段階のための請求項 1 ~ 29 のいずれかに記載の医薬組成物；ならびに

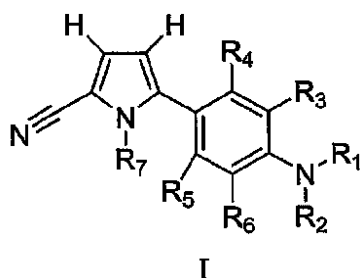
(c) アンチプロゲスチン、プロゲスチンおよびエストロゲンがいずれも投与されない連続した 28 日間のうちの残りの日において、1 日投与量ユニットを投与する、任意の第 3 段階のための経口的および薬学的に許容可能なプラセボ

を含み、ここで、第 1 段階、第 2 段階、第 3 段階の 1 日投与量ユニットの総計が 28 ユニットに等しい、前記避妊レジメンのためのキット。

【請求項 31】

哺乳動物における避妊の誘導、ホルモン補充療法、ホルモン依存性の病気の治療、発情同期化、または月経周期に関連した症状の治療のための薬剤を調製する際の、以下の式 I の構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用であって：

【化 2】



ここで、 R_1 は、

H、

$\text{SO}_2\text{-C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{SO}_2\text{-C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル、 SO_2 -置換 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 SO_2 -アリー
ル、 SO_2 -置換アリール、 SO_2 -ヘテロアリール、 SO_2 -複素環、 $\text{SO}_2\text{-C}_3\text{-C}_6$ アルケニル、 $\text{SO}_2\text{-C}_3\text{-C}_6$ アルキニル、 $\text{SO}_2\text{-C}_3\text{-C}_6$ 置換アルケニル、 $\text{SO}_2\text{-C}_3\text{-C}_6$ 置換アルキニル、

CN、

$\text{C(=O)-C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C(=O)-C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C(=O)-置換C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 C(=O)-ア
リール、 C(=O)-置換アリール 、 C(=O)-ヘテロアリール 、 C(=O)-複素環 、 $\text{C(=O)-C}_3\text{-C}_6$ アルケニ
ル、 $\text{C(=O)-C}_3\text{-C}_6$ アルキニル、 $\text{C(=O)-置換C}_3\text{-C}_6$ アルケニル、 $\text{C(=O)-置換C}_3\text{-C}_6$ アルキニル、

$\text{C(=O)O-C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C(=O)O-C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C(=O)O-置換C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 C(=O)O
-アリール、 C(=O)O-置換アリール 、 C(=O)O-ヘテロアリール 、 C(=O)O-複素環 、 $\text{C(=O)O-C}_3\text{-C}_6$ アル
ケニル、 $\text{C(=O)O-C}_3\text{-C}_6$ アルキニル、 $\text{C(=O)O-C}_3\text{-C}_6$ 置換アルケニル、 $\text{C(=O)O-C}_3\text{-C}_6$ 置換アル
キニル、

$\text{C(=O)NH-C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C(=O)NH-C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C(=O)N-ジ-C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル
、 $\text{C(=O)N-ジ-C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C(=O)N-ジ-置換C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C(=O)NH-置換C}_1\text{-C}_6$ アルキル、
 C(=O)NH-アリール 、 C(=O)N-(アリール)_2 、 C(=O)NH-置換アリール 、 C(=O)N-二置換アリール 、 C(=O)NH-ヘテロアリール 、 C(=O)N-ジヘテロアリール 、 C(=O)NH-複素環 、 C(=O)N-ジヘテロサイ
クル、 $\text{C(=O)NH-C}_3\text{-C}_6$ アルケニル、 $\text{C(=O)NH-C}_3\text{-C}_6$ アルキニル、 $\text{C(=O)O-置換C}_3\text{-C}_6$ アルケニル
、および $\text{C(=O)O-置換C}_3\text{-C}_6$ アルキニル

からなる群から選択されるか；あるいは、

R_1 は、式 I の二量体を形成する、式 I の第 2 構造に対する結合基であり、前記結合基は、 C(=O)
)-および S(O)_2 - からなる群から選択され、

R_2 は、H、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、置換 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ シクロアルキル、 SO_2 -アルキル、お

よびSO₂-置換アルキルからなる群から選択されるか；あるいは、
 R₁およびR₂は、一緒に結合して-(C(R₈)_a(R₉)_b)_c-SO₂-(C(R₈)_d(R₉)_e)_f-を形成し、
 R₈およびR₉は、それぞれ独立してH、ハロゲンまたはC₁~C₆アルキルであり、
 aおよびbは、a + b = 2であるときに、それぞれ独立して0~2であり、
 dおよびeは、a + b = 2であるときに、それぞれ独立して0~2であり、
 cおよびfは、cまたはfどちらか一方が0より大きいときに、それぞれ独立して0~5であり、

、
 R₃、R₄、R₅およびR₆は、それぞれ独立してH、ハロゲン、CN、C₁-C₆アルキル、置換C₁-C₆アルキル、-(CH_mX_n)_zCH_pX_q、C₃-C₆シクロアルキル、O-C₁-C₆アルキル、O-C₁-C₆置換アルキル、O-(CH_mX_n)_zCH_pX_q、アリール、ヘテロアリール、複素環、置換アリール、置換ヘテロアリール、および置換複素環からなる群から選択され、

Xはハロゲンであり、

mおよびnは、m + n = 2であるならば、それぞれ独立して0~2であり、

pおよびqは、p + q = 3であるならば、それぞれ独立して0~3であり、

zは0~10であり、

R₇は、H、C₁-C₆アルキル、C(O)O-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、および置換C₃-C₆シクロアルキルからなる群から選択される、前記使用。

【請求項 3 2】

前記薬剤が避妊のためのものである、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 3】

前記薬剤がホルモン補充療法のためのものである、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 4】

前記薬剤がホルモン依存性の病気を治療するためのものである、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 5】

前記ホルモン依存性の病気が、子宮筋腫、子宮内膜症、不正子宮出血、月経困難症、無月経、良性前立腺肥大症、平滑筋腫/類線維腫、ホルモン依存性腫瘍、卵巣、乳房、子宮内膜、結腸、前立腺および下垂体の癌腫および腺癌、並びに髄膜腫からなる群から選択される、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 3 6】

前記ホルモン依存性の癌腫が、乳癌および卵巣癌からなる群から選択される、請求項 3 5 に記載の使用。

【請求項 3 7】

前記薬剤が発情同期化のためのものである、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 8】

前記薬剤が月経周期に関連した症状を治療するためのものである、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 9】

前記症状が心理的なものである、請求項 3 8 に記載の使用。

【請求項 4 0】

前記心理的な症状が、情緒の変化、興奮性、不安、集中力欠如、および性的欲求の減少を含む、請求項 3 9 に記載の使用。

【請求項 4 1】

前記症状が肉体的なものである、請求項 3 8 に記載の使用。

【請求項 4 2】

前記肉体的な症状が、乳房の圧痛、腫脹、疲労および大食症を含む、請求項 4 1 に記載の使用。

【請求項 4 3】

前記月経周期に関連した症状が、月経前症候群および月経前不快気分障害の症状を含む、

請求項 3 8 に記載の使用。

【請求項 4 4】

使用される前記化合物が、請求項 3 1 ~ 4 3 のいずれかに定義される通りである、請求項 3 1 ~ 4 3 のいずれかに記載の使用。

【請求項 4 5】

5-(4-アミノフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリルおよび5-(4-アミノ-3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボニトリル、またはその薬学的に許容可能な塩からなる群から選択される化合物。

【請求項 4 6】

出産適齢期の女性に対して連続する28日間投与するための避妊用生成物であって、前記生成物は、

(a) プロゲステロン活性が約35~100 μ gのレボノルゲストレルのものに等しい、プロゲステロン剤の1日投与量が14~24ユニットである第1局面；

(b) 請求項 1 ~ 1 7 のいずれかに記載の化合物の1日投与量が約2~200mgであって、1日投与量が1~11ユニットである第2局面；および

(c) アンチプロゲスチン、プロゲスチンおよびエストロゲンがいずれも投与されない連続した28日間のうちの残りの日において、1日投与量ユニットの経口的および薬学的に許容可能なプラセボを投与する、任意の第3段階を含み、ここで、第1段階、第2段階、第3段階の1日投与量ユニットの総計が28ユニットに等しい、前記避妊用生成物。

【請求項 4 7】

前記第1局面の1日投与量ユニットがある色を有し、前記第2局面の1日投与量ユニットが異なる色を有する、請求項 4 6 に記載の避妊用生成物。