

【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25年8月15日(2013.8.15)

【公表番号】特表2010-529153(P2010-529153A)

【公表日】平成22年8月26日(2010.8.26)

【年通号数】公開・登録公報2010-034

【出願番号】特願2010-511526(P2010-511526)

【国際特許分類】

C 07 J	3/00	(2006.01)
A 61 K	31/56	(2006.01)
A 61 K	31/565	(2006.01)
A 61 P	5/30	(2006.01)
A 61 P	5/42	(2006.01)
A 61 P	5/34	(2006.01)
A 61 P	15/12	(2006.01)
A 61 P	15/18	(2006.01)
C 07 J	53/00	(2006.01)

【F I】

C 07 J	3/00	C S P
A 61 K	31/56	
A 61 K	31/565	
A 61 P	5/30	
A 61 P	5/42	
A 61 P	5/34	
A 61 P	15/12	
A 61 P	15/18	
C 07 J	53/00	

【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年6月26日(2013.6.26)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0087

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0087】

96穴を有する白色不透明組織培養プレートにおいて、穴あたり 4×10^4 細胞の密度で受容体細胞株を増殖させ(PerkinElmer, #P12-106-017)、そして6%DCC-FCS(血清中に含まれる干渉成分を除去するために活性炭処理された血清)中に維持した。試験化合物を8日後に加え、そして細胞を16時間化合物とインキュベートした。実験を3回行った。インキュベートの終わりに、エフェクター含有培地を取り除き、そして溶解緩衝液に置換した。ルシフェラーゼアッセイ基質(Promega, #E1501)を加えた後に、96穴プレートをマイクロプレートルミノメーター(Pherastar、BMG Labtech)に入れ、そして発光を計測した。用量活性関係を計算するためのソフトウェアを用いてIC50値を評価した。実験結果を表1に示す。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0088

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0088】

【表1】

表1

化合物	MR 拮抗作用 IC50 [nM]	MR 拮抗作用活性 [最大効果に対する 割合 (%)]	PR <i>in vivo</i> ED50 [mg/kg/d s. c.]
17 β -シアノ-15 α , 16 α -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	16.0	93.01	0.8
17 β -シアノ-17 α -メチル-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	29.0	96.00	0.8
7 α , 17 α -ビスマチル-17 β -シアノ-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	31.0	96.20	1.0
17 β -シアノ-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	4.5	95.57	0.84
17 β -シアノ-17 α -エチル-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	440	106.4	1.9
17 β -シアノ-7 α -メチル-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	8.2	108.02	0.33
17 β -シアノ-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4, 6-ジエン-3-オン	15	108.51	3.3
17 β -シアノ-17 α -メチル-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4, 6-ジエン-3-オン	190	114	2.1
17 β -シアノ-7 α -メチル-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	8.3	108.4	0.11
17 β -シアノ-7 α -メチル-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	10.3	110	2.9
17 β -シアノ-17 α -エチル-6 α , 7 α -メチレン-15 β , 16 β -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン	90.17	160	0.22

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の：

1 7 -シアノ- 6 -ヒドロキシメチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -エチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 6 , 6 -エタンジイル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 6 , 7 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 6 , 7 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 6 -ヒドロキシメチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 5 , 1 6 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 6 , 6 -エタンジイル- 1 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -エチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 6 , 7 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 6 , 7 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -エチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 , 6 -ジエン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 , 6 -ジエン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 1 5 , 1 6 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -エチル- 1 5 , 1 6 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
7 , 1 7 -ビスマチル- 1 7 -シアノ- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -ビニル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -ビニル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -シクロプロピル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -シクロプロピル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -シクロプロピル- 1 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 7 -シクロプロピル- 1 7 -メチル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 7 -ビニル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 7 -メチル- 7 -ビニル- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 -エン- 3 -オン、
1 7 -シアノ- 1 5 , 1 6 -メチレン- 1 9 -ノル-アンドロスター- 4 , 6 -ジエン-

3 - オン、

17 -シアノ-15 , 16 -メチレン-6 -ヒドロキシメチレン-19 -ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17-エチル-17-シアノ-15,16-メチレン-6-ヒドロキシメチル-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17 - シアノ- 6 , 7 - 15 , 16 - ビスマチレン- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、

17 - シアノ- 6 , 7 - 15 , 16 - ビスマチレン- 19 - ノル- アンドロスター-
4 - エン- 3 - オン、

17 - シアノ-7 - シクロプロピル-15 , 16 - メチレン-19 - ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17 -シアノ-7 -シクロプロピル-15 , 16 -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17 - シアノ-7 - エチル-15 , 16 - メチレン-19 - ノル-アンドロスター-4
-エン-3-オン、

17 - シアノ-7 - エチル-15 , 16 - メチレン-19 - ノル-アンドロスター-4
-エン-3-オン、

17 -シアノ-7 -メチル-15 , 16 -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17 -シアノ-7 -メチル-15 , 16 -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オン、

17 - シアノ- 17 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター-
4, 6 - ジエン- 3 - オン、

17 - シアノ- 17 - エチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター-
4, 6 - ジエン- 3 - オン、

17 -シアノ- 15 , 16 -メチレン- 7 -ビニル- 19 -ノル-アンドロスター- 4
-エン- 3 -オン、

-エン- 3 -オン、

17 - シアノ- 6 , 6 - エタンシイル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロ
スタ - 4 - エン - 3 - オン、

1 / -シアノ-15 , 16 -メチレン-19-ノル-アンドロスター-4-エン-3-オ
ン、

1 / -シアノ-1 / , / -シメチル-1 5 , 1 6 -メチレン-1 9 -ノル-アンド
ロスター-4-エン-3-オン、

1 / - シアノ- 1 / , / - シメチル- 1 5 , 1 6 - メナレソ- 1 9 - ノル- アンド
ロスター- 4 - エン- 3 - オン、

1 / - シアノ- 1 / , / - シメチル- 1 5 , 1 6 - メナレン- 1 9 - ノル- アントロスタ- 4 - エン- 3 - オン、

アンドロスター-4-エン-3-オン、
17-シアノ-17-メチル-17-エチル-15,16-メチレン-19-ノル-

17 - シアソ - 17 - ステル / - エテル - 15 , 16 - ステレノ - 19 - ノル - ア
ンドロスタ - 4 - エン - 3 - オン、

アンドロスター-4-エン-3-オン、
1,7-シアノ-1,7-ステル-7-ヒニル-1,5,16-ステレン-1,9-ノル-

アンドロスター-4-エン-3-オン、
1,3-シクロヘキサメチル-3-シクロプロパノール、1,5-,1,6-,1,7-,1,8-,1,9-,1,10-

9 - ノル - アンドロスター - 4 - エン - 3 - オン、
13 - シアノ - 13 - ステル - 13 - シクロプロビル - 13 , 16 - ステレン - 1

「アーティスト」「スチル」「ショットヒル」、「ステレン」

9 - ノル- アンドロスタ- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - メチル- 6 - ヒドロキシメチル- 15 , 16 - メチレン-
 19 - ノル- アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - メチル- 6 , 6 - エチレン- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノ
 ル- アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - メチル- 6 , 7 - メチレン- 15 , 16 - メチレン- 19
 - ノル- アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - メチル- 6 , 7 - メチレン- 15 , 16 - メチレン- 19
 - ノル- アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル-
 アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル-
 アンドロ스타- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 , 7 - ジエチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンド
 ロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 , 7 - ジエチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンド
 ロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - ビニル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル-
 アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - ビニル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル-
 アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - シクロプロピル- 15 , 16 - メチレン- 1
 9 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 7 - シクロプロピル- 15 , 16 - メチレン- 1
 9 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 6 , 6 - エチレン- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノ
 ル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 6 , 7 - メチレン- 15 , 16 - メチレン- 19
 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
 17 - シアノ- 17 - エチル- 6 , 7 - メチレン- 15 , 16 - メチレン- 19
 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
からなる群から選ばれる、 17 - シアノ- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン誘導体。

【請求項 2】前記誘導体が、以下の：

17 - シアノ- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オ
ン、
17 - シアノ- 17 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター-
4 - エン- 3 - オン、
7 , 17 - ビスマチル- 17 - シアノ- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オ
ン、
17 - シアノ- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オ
ン、
17 - シアノ- 17 - エチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター-
4 - エン- 3 - オン
、
17 - シアノ- 7 - メチル- 19 - ノル- アンドロスター- 4 - エン- 3 - オン、
17 - シアノ- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター- 4 , 6 - ジエン-
3 - オン、
17 - シアノ- 7 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター- 4
- エン- 3 - オン、
17 - シアノ- 17 - メチル- 15 , 16 - メチレン- 19 - ノル- アンドロスター-

4 , 6 - ジエン - 3 - オン、
1 7 - シアノ - 1 7 - エチル - 6 , 7 - メチレン - 1 5 , 1 6 - メチレン - 1 9
- ノル - アンドロスター - 4 - エン - 3 - オン、

である、請求項 1 に記載の誘導体。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の 1 7 - シアノ - 1 9 - ノル - アンドロスター - 4 - エン 誘導体を含む
、ミネラルコルチコイド受容体アンタゴニスト。

【請求項 4】

経口避妊薬、並びに閉経前、閉経期、及び閉経後の症状の治療用の医薬の製造のための
請求項 1 又は 2 に記載の 1 7 - シアノ - 1 9 - ノル - アンドロスター - 4 - エン 誘導体、又は請求
項 3 に記載のアンタゴニストの使用。

【請求項 5】

前記医薬が、黄体ホルモン及び抗ミネラルコルチコイド作用を有することを特徴とする
、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 6】

請求項 1 又は 2 に記載の少なくとも 1 の 1 7 - シアノ - 1 9 - ノル - アンドロスター - 4 - エン 誘導体、及び少なくとも 1 の適切な医薬として無害の添加物を含む医薬。

【請求項 7】

少なくとも 1 のエストロゲンをさらに含む、請求項 6 に記載の医薬。

【請求項 8】

前記エストロゲンがエチニルエストラジオールであることを特徴とする、請求項 7 に記載の医薬。

【請求項 9】

前記エストロゲンが、天然エストロゲンであることを特徴とする、請求項 8 に記載の医薬。

【請求項 10】

前記天然エストロゲンが、エストラジオールであることを特徴とする、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 11】

前記天然エストロゲンが、吉草酸エストラジオールであることを特徴とする、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 12】

前記天然エストロゲンが、抱合型エストロゲンであることを特徴とする、請求項 9 に記載の医薬。

【請求項 13】

経口避妊薬、並びに閉経前、閉経期、及び閉経後の症状の治療用である、請求項 6 ~ 12 のいずれか一項に記載の医薬。