

【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4月10日(2008.4.10)

【公表番号】特表2007-532564(P2007-532564A)

【公表日】平成19年11月15日(2007.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-044

【出願番号】特願2007-507494(P2007-507494)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/536 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 413/04 C S P

A 6 1 K 31/536

A 6 1 K 31/565

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月18日(2008.2.18)

【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

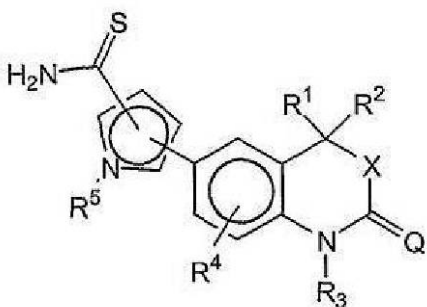
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式 I :

【化1】



I

[式中、

R^1 及び R^2 は、独立して、H、 $C_1 - C_6$ アルキル又は置換 $C_1 - C_6$ アルキルであるか；
又は R^1 及び R^2 は、 $-CH_2(CH_2)_nCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2-$ 、 $-O(CH_2)_pCH_2-$ 、 $-O(CH_2)_qO-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2NR^6CH_2CH_2-$ を含む環を形成するように縮合しており；

n は1～5であり；

p は1～4であり；

q は1～4であり；

R^3 は、H、OH、 NH_2 、CN、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換 $C_2 - C_6$ アルキニル又はCOR^Aであり；

R^A は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アミノアルキル又は置換 $C_1 - C_6$ アミノアルキルであり；

R^4 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アミノアルキル又は置換 $C_1 - C_6$ アミノアルキルであり；

R^5 は、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル又はCOR^Aであり；

R^6 は、H又は $C_1 - C_6$ アルキルであり；

Xは、O、S又は不在であり；

Qは、O又はSである。]

の化合物又はその製薬上許容し得る塩。

【請求項2】

R^1 及び R^2 が CH_3 である、請求項1記載の式Iの化合物。

【請求項3】

R^1 及び R^2 が、 $-CH_2(CH_2)_nCH_2-$ を含む環を形成するように縮合している、請求項1記載の式Iの化合物。

【請求項4】

n が3である、請求項3記載の式Iの化合物。

【請求項5】

R^3 又は R^4 がHである、請求項1～4のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項6】

R^5 が CH_3 である、請求項1～5のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項7】

前記ピロール環が2,5-置換ピロールである、請求項1～6のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項8】

(a) 5-(4,4-ジメチル-2-チオキソ-1,4-ジヒドロ-2H-3,1-ベンズオキサジン-6-イル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボチオアミド；

(b) 5-(4,4-ジメチル-2-オキソ-1,4-ジヒドロ-2H-3,1-ベンズオキサジン-6-イル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボチオアミド；及び

(c) 5-(2'-チオキソスピロ[シクロヘキサン-1,3'-[3H]-インドール]-5'-イル)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボチオアミド

からなる群より選択される、請求項1記載の式Iの化合物又はその製薬上許容し得る塩。

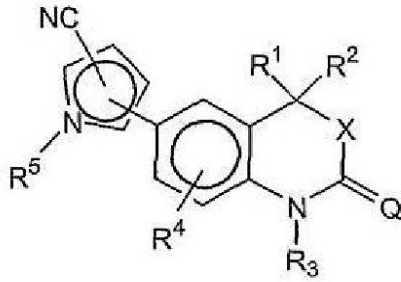
【請求項9】

請求項1～8のいずれか1項に記載の式Iの化合物又はその製薬上許容し得る塩、及び製薬上許容し得る担体又は賦形剤を含有する、医薬組成物。

【請求項10】

硫黄含有物質と、構造式II：

【化 2】



II

の化合物又はその製薬上許容し得る塩とを、塩基の存在下で反応させることを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を製造するための方法。

【請求項 1 1】

前記硫黄含有物質がジアルキルジチオホスフェート又は H_2S である、請求項 1 0 記載の方法。

【請求項 1 2】

前記ジアルキルジチオホスフェートと前記式 II の化合物との比が、約 1 : 1 ~ 約 3 : 1 である、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 3】

前記ジアルキルジチオホスフェートがジエチルジチオホスフェートである、請求項 1 1 又は 1 2 記載の方法。

【請求項 1 4】

前記塩基がアミンである、請求項 1 0 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 1 5】

前記アミンがヒューニッヒ塩基である、請求項 1 4 記載の方法。

【請求項 1 6】

- (a) 溶液を形成するために前記式 I の化合物をアセトンに溶解すること；
- (b) 前記アセトン溶液をアセトンの沸点まで加熱すること；
- (c) 前記アセトン溶液を蒸留によって濃縮すること；及び
- (d) 前記式 I の精製化合物を単離すること

を含む、前記式 I の化合物を精製する、請求項 1 0 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 1 7】

請求項 1 0 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の方法により製造される式 I の化合物。

【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、避妊；ホルモン補充療法；ホルモン依存性腫瘍性疾患の治療又は予防；機能不全性不正出血、子宮平滑筋腫、子宮内膜症又は多嚢胞性卵巣症候群の治療；発情の同期化；ざ瘡の治療；又は多毛症の治療に有用な医薬キット。

【請求項 1 9】

エストロゲン、プロゲステロン、エストロン、アンドロゲン、エストロゲン受容体アゴニスト又は選択的エストロゲン受容体調節剤をさらに含む、請求項 1 8 記載のキット。

【請求項 2 0】

その必要のある哺乳動物における避妊；ホルモン補充療法；ホルモン依存性腫瘍性疾患の治療又は予防；機能不全性不正出血、子宮平滑筋腫、子宮内膜症又は多嚢胞性卵巣症候群の治療；発情の同期化；ざ瘡の治療；又は多毛症のための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の使用。

【請求項 2 1】

前記医薬品が、エストロゲン、プロゲステロン、エストロン、アンドロゲン、エストロゲ

ン受容体アゴニスト又は選択的エストロゲン受容体調節剤をさらに含む、請求項20記載の使用。