



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2010100334/04, 04.06.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
12.06.2007 DE 102007027636.4

(43) Дата публикации заявки: 20.07.2011 Бюл. № 20

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 12.01.2010(86) Заявка РСТ:  
EP 2008/004428 (04.06.2008)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2008/151745 (18.12.2008)Адрес для переписки:  
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,  
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.  
И.А.Веселицкой, рег.№ 0011

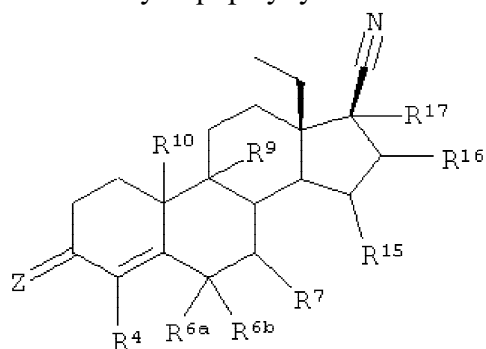
(71) Заявитель(и):

**БАЙЕР ШЕРИНГ ФАРМА  
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)**

(72) Автор(ы):

**КУНКЕ Йоахим (DE),  
ХЮБНЕР Ян (DE),  
БОЛЬМАНН Рольф (DE),  
ФРЕНЦЕЛЬ Томас (DE),  
КЛАР Ульрих (DE),  
МЕНГЕС Фредерик (DE),  
РИНГ Свен (DE),  
БОРДЕН Штеффен (DE),  
МУН Ханс-Петер (DE),  
ПРЕЛЛЕ Катя (DE)**(54) **ПРОИЗВОДНОЕ 17 $\beta$ -ЦИАНО-18А-ГОМО-19-НОР-АНДРОСТ-4-ЕНА, ЕГО ПРИМЕНЕНИЕ  
И ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, СОДЕРЖАЩИЕ ПРОИЗВОДНОЕ**

(57) Формула изобретения

1. Производное 17 $\beta$ -циано-18а-гомо-19-нор-андрост-4-ена, имеющее общую  
химическую формулу 1

(1)

где Z выбран из группы, включающей O, два атома водорода, NOR и NNHSO<sub>2</sub>R, в  
котором R представляет собой водород или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил,

R<sup>4</sup> представляет собой водород или галоген,

кроме того каждый:

$R^{6a}$ ,  $R^{6b}$  вместе образуют метилен или 1,2-этандиил или  $R^{6a}$  представляет собой водород и  $R^{6b}$  выбран из группы, включающей водород, метил и гидроксиметилен и  $R^7$  выбран из группы, включающей водород,  $C_1$ - $C_4$ -алкил,  $C_2$ - $C_3$ -алкенил и циклопропил,

или:

$R^{6a}$  представляет собой водород и  $R^{6b}$  и  $R^7$  также образуют метилен или упускаются с образованием двойной связи между  $C^6$  и  $C^7$ ,

$R^9$ ,  $R^{10}$  представляют собой водород или упускаются с образованием двойной связи между  $C^9$  и  $C^{10}$ ,

$R^{15}$ ,  $R^{16}$  представляют собой водород или вместе образуют метилен,

$R^{17}$  выбран из группы, включающей водород,  $C_1$ - $C_4$ -алкил и аллил,

по крайней мере один из заместителей  $R^4$ ,  $R^{6a}$ ,  $R^{6b}$ ,  $R^7$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  не являются водородом или  $R^{6b}$  и  $R^7$  упускаются с образованием двойной связи между  $C^6$  и  $C^7$  или упускаются с образованием двойной связи между  $C^1$  и  $C^2$ ,

и его сольваты, гидраты, стереоизомеры, диастереомеры, энантиомеры и соли.

2. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^{15}$  и  $R^{16}$  вместе образуют метилен.

3. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что Z выбран из группы, включающей O, NOH и NNHSO<sub>2</sub>H.

4. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что Z представляет собой O.

5. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^4$  представляет собой водород или хлор.

6. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^{6a}$ ,  $R^{6b}$  вместе образуют 1,2-этандиил или в каждом конкретном случае водород.

7. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^7$  выбран из группы, включающей водород и метил.

8. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^{6b}$  и  $R^7$  вместе образуют метилен.

9. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, отличающееся тем, что  $R^{17}$  выбран из группы, включающей водород и метил.

10. Производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по п.1, выбранное из группы, включающей

17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-6 $\beta$ -гидроксиметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-6,6-этандиил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-6 $\beta$ ,7 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-6 $\alpha$ ,7 $\alpha$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -метил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -этил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -этил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

17 $\beta$ -циано-6 $\beta$ ,7 $\beta$ ;15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,

- 17 $\beta$ -циано-6 $\alpha$ ,7 $\alpha$ ;15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -циклопропил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -циклопропил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4,6-диен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андроста-4,6-диен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андроста-4,6-диен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ ,17 $\alpha$ -бисметил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -этил-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -этил-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-7 $\alpha$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-7 $\beta$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -циклопропил-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -циклопропил-17 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-6 $\beta$ ,7 $\beta$ -15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -метил-6 $\alpha$ ,7 $\alpha$ -15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андроста-4,6-диен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-7 $\alpha$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-7 $\beta$ -метил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -,17 $\alpha$ -бисэтил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ ,17 $\alpha$ -бисэтил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-7 $\alpha$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-7 $\beta$ -винил-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\alpha$ -циклопропил-17 $\alpha$ -этил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-7 $\beta$ -циклопропил-17 $\alpha$ -этил-15 $\beta$ ,16 $\beta$ -метилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он,  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-6 $\beta$ ,7 $\beta$ -15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он и  
17 $\beta$ -циано-17 $\alpha$ -этил-6 $\alpha$ ,7 $\alpha$ -15 $\beta$ ,16 $\beta$ -бисметилен-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен-3-он.
11. Применение производного 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ена по пп.1-10 для производства лекарственных средств для оральных контрацептивов и лечения пред-, пери- и постклимактерических симптомов.
12. Применение по п.11, отличающееся тем, что лекарственное средство имеет гестагенное и антиминералокортикоидное действие.
13. Лекарственное средство, содержащее по крайней мере одно производное 17 $\beta$ -циано-18 $\alpha$ -гомо-19-нор-андрост-4-ен по пп.1-10 и по меньшей мере одну подходящую фармацевтически безвредную добавку.
14. Лекарственное средство по п.13, более того содержащее по крайней мере один эстроген.
15. Лекарственное средство по п.14, отличающееся тем, что эстроген представляет собой этинилэстрадиол.
16. Лекарственное средство по п.14, отличающееся тем, что эстроген представляет собой природный эстроген.
17. Лекарственное средство по п.16, отличающееся тем, что природный эстроген представляет собой эстрадиол.
18. Лекарственное средство по п.16, отличающееся тем, что природный эстроген представляет собой эстрадиол валерат.

19. Лекарственное средство по п.16, отличающееся тем, что природный эстроген представляет собой сопряженный эстроген.

RU 2010100334 A

RU 2010100334 A