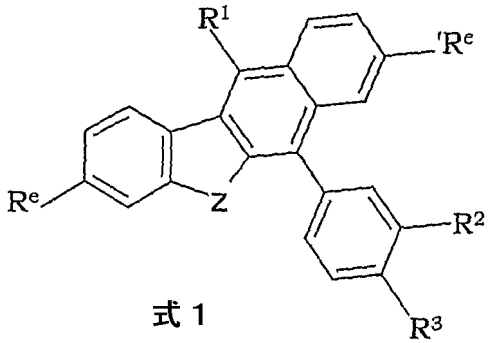
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年3月23日(2006.3.23)

【公表番号】特表2005-517731(P2005-517731A)
【公表日】平成17年6月16日(2005.6.16)
【年通号数】公開・登録公報2005-023
【出願番号】特願2003-569585(P2003-569585)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ　39/42　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/05　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/085　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/095　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/138　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/36　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/40　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/428　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/44　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4453　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/506　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/5375　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　5/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　13/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　15/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　39/17　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　43/23　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　217/54　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　323/18　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　211/68　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　239/42　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　277/66　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　295/08　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　317/54　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ　39/42　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ　31/05
Ａ６１Ｋ　31/085
Ａ６１Ｋ　31/095
Ａ６１Ｋ　31/138
Ａ６１Ｋ　31/36
Ａ６１Ｋ　31/40
Ａ６１Ｋ　31/428
Ａ６１Ｋ　31/44

Ａ６１Ｋ	31/4453	
Ａ６１Ｋ	31/506	
Ａ６１Ｋ	31/5375	
Ａ６１Ｐ	5/24	
Ａ６１Ｐ	9/00	
Ａ６１Ｐ	13/08	
Ａ６１Ｐ	15/00	
Ａ６１Ｐ	19/10	
Ａ６１Ｐ	25/00	
Ａ６１Ｐ	25/24	
Ａ６１Ｐ	25/28	
Ａ６１Ｐ	35/00	
Ａ６１Ｐ	43/00	１１１
Ｃ０７Ｃ	39/17	
Ｃ０７Ｃ	43/23	Ｄ
Ｃ０７Ｃ	43/23	Ｅ
Ｃ０７Ｃ	217/54	
Ｃ０７Ｃ	323/18	
Ｃ０７Ｄ	211/68	
Ｃ０７Ｄ	239/42	Ｚ
Ｃ０７Ｄ	277/66	
Ｃ０７Ｄ	295/08	Ｚ
Ｃ０７Ｄ	317/54	

【手続補正書】
【提出日】平成18年2月6日(2006.2.6)
【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】
式１：
【化１】



式１

[式中、
R^e及び'R^eはＯＨであり、ここで該ＯＨは場合により独立してエーテル化されているか又はエステル化されており；
Ｚは、-Ｃ(R^4,R^5)-であり、ここで、R^4及びR^5は独立して(１Ｃ-２Ｃ)アルキル

であるか、又は、R^4 及びR^5 は一緒にスピロ(３Ｃ-５Ｃ)シクロアルキルを形成しており；

R^1 は、Ｈ、ハロゲン、CF_3 又は(１Ｃ-４Ｃ)アルキルであり；

R^2 及びR^3 は独立して、Ｈ、ハロゲン、-CF_3、-OCF_3、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、ヒドロキシ、(１Ｃ-８Ｃ)アルキルオキシ、アリールオキシ、アリール(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、ハロ(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、-$O(CH_2)_m$Ｘ(ここで、Ｘは、ハロゲン又はフェニルであり、ｍは２～４である)；-$O(CH_2)_m NR_a R_b$、-$S(CH_2)_m NR_a R_b$、又は-$(CH_2)_m NR_a R_b$(ここで、ｍは２～４であり、R_a 及びR_b は独立して、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、(２Ｃ-８Ｃ)アルケニル、(２Ｃ-８Ｃ)アルキニルもしくはアリールであり、前記アルキル、アルケニル及びアリールは、場合により、ハロゲン、-CF_3、-OCF_3、-ＣＮ、-NO_2、-ＯＨ、(１Ｃ-８Ｃ)アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、(１Ｃ-８Ｃ)アルキルチオ、カルボキシレート、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、アリール、アリール(１Ｃ-８Ｃ)アルキルもしくはハロ(１Ｃ-８Ｃ)アルキルで置換されていてもよく；又は、R_a 及びR_b は３～８員の環構造を形成しており、前記環構造は、場合により、ハロゲン、-CF_3、-OCF_3、-ＣＮ、-NO_2、ヒドロキシ、ヒドロキシ(１Ｃ-４Ｃ)アルキル、(１Ｃ-８Ｃ)アルコキシ、アリールオキシ、(１Ｃ-８Ｃ)アルキルチオ、カルボキシル、カルボキシレート、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、アリール、アリール(１Ｃ-８Ｃ)アルキルもしくはハロ(１Ｃ-８Ｃ)アルキルで置換されている)である]

で表される化合物又はその可能な塩。

【請求項２】

R^3 がＨであり、

及び、

R^2 が、-$O(CH_2)_m NR_a R_b$、-$S(CH_2)_m NR_a R_b$ 又は-$(CH_2)_m NR_a R_b$(ここで、ｍは２～４であり、R_a 及びR_b は独立して、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、(２Ｃ-８Ｃ)アルケニル、(２Ｃ-８Ｃ)アルキニルもしくはアリールであり、前記アルキル、アルケニル及びアリールは、場合により、ハロゲン、-CF_3、-OCF_3、-ＣＮ、-NO_2、-ＯＨ、(１Ｃ-８Ｃ)アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、(１Ｃ-８Ｃ)アルキルチオ、カルボキシレート、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、アリール、アリール(１Ｃ-８Ｃ)アルキル又はハロ(１Ｃ-８Ｃ)アルキルで置換されていてもよく；又は、R_a 及びR_b は３～８員の環構造を形成しており、前記環構造は、場合により、ハロゲン、-CF_3、-OCF_3、-ＣＮ、-NO_2、ヒドロキシ、ヒドロキシ(１Ｃ-４Ｃ)アルキル、(１Ｃ-８Ｃ)アルコキシ、アリールオキシ、(１Ｃ-８Ｃ)アルキルチオ、カルボキシル、カルボキシレート、(１Ｃ-８Ｃ)アルキル、アリール、アリール(１Ｃ-８Ｃ)アルキルもしくはハロ(１Ｃ-８Ｃ)アルキルで置換されている)である

ことを特徴とする、請求項１に記載の化合物又はその可能な塩。

【請求項３】

R^1 がＨ、ハロゲン及びCF_3 から選択される、請求項１又は２に記載の化合物。

【請求項４】

R^2 が、-$O(CH_2)_m NR_a R_b$(ここで、ｍは２～３であり、R_a 及びR_b は独立して、(１Ｃ-５Ｃ)アルキル、(３Ｃ-５Ｃ)アルケニルもしくはアリールであり、前記アルキル、アルケニル及びアリールは、場合により、ＯＨ又はメトキシで置換されていてもよく；又は、R_a 及びR_b は、アゼチジン、ピロリジン、３-ピロリン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピリジン、モルホリン、チオモルホリン、チアゾリジン、ホモピペリジン、テトラヒドロキノリン及び６-アザビシクロ[３．２．１]オクタンから選択される４～７員の環構造を形成しており、前記４～７員の環構造は、場合により、ＯＨ、メトキシ、アセチル、カルボキシレート、(１Ｃ-３Ｃ)アルキル、フェニル、ベンジル及びフェニルエチルで置換されていてもよい)であることを特徴とする、請求項３に記載の化合物。

【請求項５】

請求項１～４のいずれか１項に記載の化合物を製薬上許容される助剤とともに含む医薬組成物。

【請求項６】
エストロゲン受容体が関連する治療のための薬物を製造するための請求項１～４のいずれか１項に記載の化合物の使用において、前記治療がＥＲβに対して選択的に拮抗するものであることを特徴とする使用。