

【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23年7月21日 (2011.7.21)

【公表番号】特表2010-529152(P2010-529152A)

【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2010-511525(P2010-511525)

【国際特許分類】

C 0 7 J 41/00 (2006.01)

C 0 7 J 53/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 5/34 (2006.01)

A 6 1 P 5/42 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/30 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 J 41/00

C 0 7 J 53/00 C S P

A 6 1 K 31/56

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 5/34

A 6 1 P 5/42

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月3日 (2011.6.3)

【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

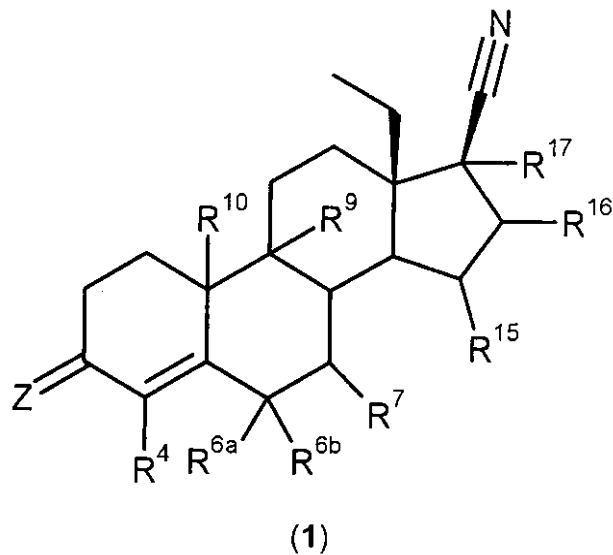
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般化学式 1 :

【化 1】



[式中、

Z は、O、2つの水素原子、NOR 及び NNHSO_2R を含む群より選ばれ、

R は、水素又は $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルキルであり；

R^4 は、水素又はハロゲンであり；

更に、

R^{6a} 、 R^{6b} は一緒になってメチレン又は 1, 2 - エタンジイルを形成するか、又は R^{6a} は水素であり、かつ R^{6b} は水素、メチル及びヒドロキシメチレンを含む群より選ばれ、そして

R^7 は、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_3$ - アルケニル及びシクロプロピルを含む群より選ばれ、あるいは

R^{6a} は水素であり、 R^{6b} 及び R^7 は一緒になってメチレンを形成するか又は C^6 と C^7 との間の二重結合の形成がなく；

R^9 、 R^{10} は、水素であるか、又は C^9 と C^{10} との間の二重結合の形成がなく；

R^{15} 、 R^{16} は、水素であるか、又は一緒になってメチレンを形成し；

R^{17} は、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルキル及びアリルであり；

置換基 R^4 、 R^{6a} 、 R^{6b} 、 R^7 、 R^{15} 、 R^{16} 及び R^{17} のいずれか 1 つは、水素でないか、又は R^{6a} 及び R^7 は C^6 と C^7 との間の二重結合の形成がないか、又は C^1 と C^2 との間の二重結合の形成がない。]

で表される 17 - シアノ - 18a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体、並びにその溶媒和物、水和物、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー及び塩。

【請求項 2】

R^{15} 及び R^{16} が一緒になってメチレンを形成する、請求項 1 記載の 17 - シアノ - 18a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 3】

Z が、O、NOR 及び NNHSO_2R を含む群より選ばれる、請求項 1 又は 2 記載の 17 - シアノ - 18a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 4】

Z が O を示す、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 5】

R⁴ が水素又は塩素である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 6】

R^{6a}、R^{6b} が一緒になって 1, 2 - エタンジイルを形成するか、又は各場合において水素である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 7】

R⁷ が、水素及びメチルを含む群より選ばれる、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 8】

R^{6b} 及び R⁷ が一緒になってメチレンを形成する、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 9】

R¹⁷ が水素及びメチルを含む群より選ばれる、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 10】

以下：

17 - シアノ - 17 - メチル - 15, 16 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 15, 16 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6 - ヒドロキシメチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6, 6 - エタンジイル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6, 7 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6, 7 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 17 - メチル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 17 - エチル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 7 - メチル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 7 - エチル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 7 - エチル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6, 7 ; 15, 16 - ビスメチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 6, 7 ; 15, 16 - ビスメチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、

17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - ジエン - 3 - オン、

17 - シアノ - 15, 16 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスタ - 4, 6 - ジエン - 3 - オン、

17 - シアノ - 7 - ビニル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン
 - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - ビニル - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン
 - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 -
 ノル - アンドロスタ - 4 , 6 - ジエン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 , 17 - ビスメチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a - ホ
 モ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - エチル - 17 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - エチル - 17 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 7 - ビニル - 18 a -
 ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 7 - ビニル - 18 a -
 ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 17 - メチル - 15 , 16 - メチレン
 - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 17 - メチル - 15 , 16 - メチレン
 - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - メチル - 6 , 7 - 15 , 16 - ビスメチレン - 18
 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - メチル - 6 , 7 - 15 , 16 - ビスメチレン - 18
 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - エチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a - ホモ - 19 -
 ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - エチル - 7 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - エチル - 7 - メチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 , 17 - ビスエチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a - ホ
 モ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 , 17 - ビスエチル - 15 , 16 - メチレン - 18 a - ホ
 モ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - エチル - 15 , 16 - メチレン - 7 - ビニル - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 17 - エチル - 15 , 16 - メチレン - 7 - ビニル - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 17 - エチル - 15 , 16 - メチレン
 - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - シクロプロピル - 17 - エチル - 15 , 16 - メチレン
 - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7 - エチル - 6 , 7 - 15 , 16 - ビスメチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、及び
 17 - シアノ - 7 - エチル - 6 , 7 - 15 , 16 - ビスメチレン - 18 a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン
 を含む群より選ばれる、請求項 1 記載の 17 - シアノ - 18 a - ホモ - 19 - ノル - ア
 ンドロスト - 4 - エン誘導体。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項記載の少なくとも 1 つの 17 - シアノ - 18 a - ホモ

- 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン誘導体及び少なくとも１つの好適な薬学的に無害な添加物を含む、医薬。

【請求項 12】

少なくとも１つのエストロゲンを更に含む、請求項 11 記載の医薬。

【請求項 13】

前記エストロゲンが、エチニルエストラジオールである、請求項 12 記載の医薬。

【請求項 14】

前記エストロゲンが、天然エストロゲンである、請求項 12 記載の医薬。

【請求項 15】

前記天然エストロゲンが、エストラジオールである、請求項 14 記載の医薬。

【請求項 16】

前記天然エストロゲンが、エストラジオール吉草酸塩である、請求項 14 記載の医薬。

【請求項 17】

前記天然エストロゲンが、複合化エストロゲンである、請求項 14 記載の医薬。