

【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 07 J 41/00 (2006.01)

C 07 J 53/00 (2006.01)

A 61 K 31/56 (2006.01)

A 61 P 15/18 (2006.01)

A 61 P 5/34 (2006.01)

A 61 P 5/42 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 5/30 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 J 41/00

C 07 J 53/00 C S P

A 61 K 31/56

A 61 P 15/18

A 61 P 5/34

A 61 P 5/42

A 61 K 45/00

A 61 P 5/30

A 61 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

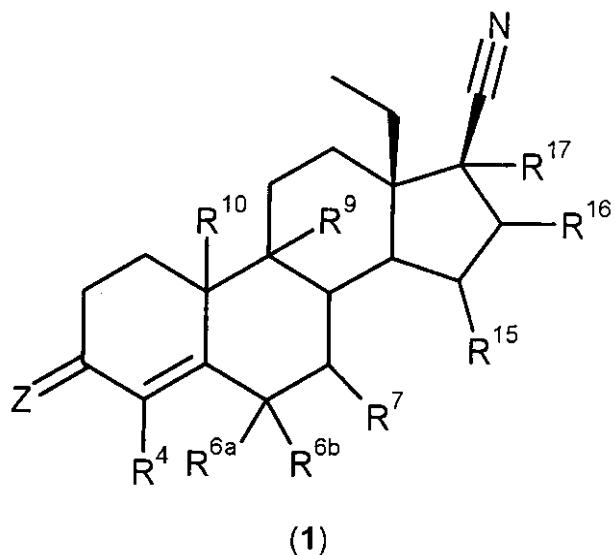
【補正の内容】

【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NNHSO₂Rを含む群より選ばれ、

Rは、水素又はC₁ - C₄ - アルキルであり；

R⁴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

R⁷は、水素、C₁ - C₄ アルキル、C₂ - C₃ - 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R⁷は一緒になってメチレンを形成するか又はC⁶とC⁷との間の二重結合の形成がなく；

R⁹、R¹⁰は、水素であるか、又はC⁹とC¹⁰との間の二重結合の形成がなく；

R¹⁵、R¹⁶は、水素であるか、又は一緒になってメチレンを形成し；

R¹⁷は、水素、C₁ - C₄ - アルキル及びアリルであり；

置換基R⁴、R^{6a}、R^{6b}、R⁷、R¹⁵、R¹⁶及びR¹⁷のいずれか1つは、水素でないか、又はR^{6a}及びR⁷はC⁶とC⁷との間の二重結合の形成がないか、又はC¹とC²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】

R¹⁵及びR¹⁶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NNHSO₂R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】

R⁶ a、R⁶ b 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】

R⁶ b 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 - ピスマチレン - 18 a - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン、
 17 - シアノ - 6 , 7 ; 15 , 16 - ピスマチレン - 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 - アンドロスト - 4 , 6 - ジエン - 3 - オン、

17 - シアノ - 7 - ビニル - 18a - 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 - 18a - 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 - 18a - ホモ - 19 -
 ノル - アンドロスター - 4, 6 - ジエン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7, 17 - ビスマチル - 15, 16 - メチレン - 18a - 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 - 18a
 - 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 - 18a
 - 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 - 18a -
 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 - 18a -
 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
 - 18a - 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
 - 18a - 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 - ビスマチレン - 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 - ビスマチレン - 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 - 18a - 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 - 18a
 - 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 - 18a
 - ホモ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7, 17 - ビスマチル - 15, 16 - メチレン - 18a - ホ
 モ - 19 - ノル - アンドロスト - 4 - エン - 3 - オン、
 17 - シアノ - 7, 17 - ビスマチル - 15, 16 - メチレン - 18a - 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 - 18a
 - 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 - 18a
 - 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
 - 18a - 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
 - 18a - 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 - ビスマチレン - 18a
 - 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 - ビスマチレン - 18a
 - 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 - 18a - 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 - 18a - ホモ

- 1 9 - 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 1 2】

少なくとも 1 つのエストロゲンを更に含む、請求項 1 1 記載の医薬。

【請求項 1 3】

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 1 2 記載の医薬。

【請求項 1 4】

前記エストロゲンが、天然エストロゲンである、請求項 1 2 記載の医薬。

【請求項 1 5】

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 1 4 記載の医薬。

【請求項 1 6】

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 1 4 記載の医薬。

【請求項 1 7】

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 1 4 記載の医薬。