

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-531562(P2004-531562A)

【公表日】平成16年10月14日(2004.10.14)

【年通号数】公開・登録公報2004-040

【出願番号】特願2002-591461(P2002-591461)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 215/20

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/57

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

// C 0 7 M 7:00

【F I】

C 0 7 D 215/20

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/57

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月9日(2005.5.9)

【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

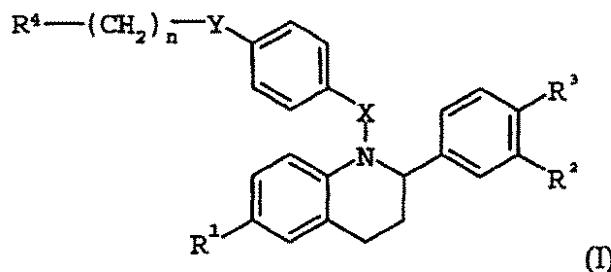
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

## 【化1】



[式中、

R1は、-H、-OH、-O(C1-C4アルキル)、-OCOC6H5、-OCO(C1-C6アルキル)または-OSO2(C2-C6アルキル)；

R2およびR<sup>3</sup>はそれぞれ独立して、-H、-OH、-O(C1-C4アルキル)、-OCOC6H5、-OCO(C1-C6アルキル)、-OSO2(C2-C6アルキル)またはハロ；

R4は、1-ピペリジニル、1-ピロリジニル、メチル-1-ピロリジニル、ジメチル-1-ピロリジニル、4-モルホリノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジイソプロピルアミノまたは1-ヘキサメチレンイミノ；

nは、1、2または3；

Xは、-C(0)-または-CH<sub>2</sub>-；および

Yは、-O-、-S-、-NH-、-NMe-または-CH<sub>2</sub>-である]

の化合物またはそのエナンチオマーもしくは医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項2】

Xが-CH<sub>2</sub>-、Yが-O-およびnが2である請求項1に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項3】

R<sup>1</sup>が-OHおよびR<sup>4</sup>が1-ピペリジニルである請求項2に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項4】

R<sup>2</sup>またはR<sup>3</sup>が-OHあるいはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の1つが-Hである請求項3に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項5】

Xが-C(0)-である請求項1に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項6】

Yが-O-およびnが2である請求項5に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項7】

R<sup>1</sup>が-OHおよびR<sup>4</sup>が1-ピペリジニルである請求項6に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項8】

R<sup>2</sup>またはR<sup>3</sup>が-OHあるいはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の1つが-Hである請求項7に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

## 【請求項9】

[6-メトキシ-2-(4-メトキシフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル]-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)フェニル]メタノン；

(6-メトキシ-2-フェニル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[4-2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)フェニル]メタノン；

[6-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル]-[4-2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)フェニル]メタノン；

(6-ヒドロキシ-2-フェニル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)フェニル]メタノン；

6 - メトキシ - 2 - フェニル - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン ;

6 - メトキシ - 2 - フェニル - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン ;

2 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オール ;

2 - フェニル - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オール ;

6 - メトキシ - 2 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン ;

2 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ)ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロキノリン - 6 - オール ;

6 - メトキシ - 2 - (3 - メトキシフェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - キノリン ; および

2 - (3 - ヒドロキシフェニル) - 1 - [4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - ベンジル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - オールから選ばれる請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容しうる塩。

**【請求項 10】**

骨粗鬆症および心臓血管疾患から選ばれる、エストロゲン欠乏に関連する閉経後の女性における疾患の抑制のための請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。

**【請求項 11】**

エストロゲン依存性ガン、子宮内膜症および子宮線維症から選ばれる、内因性エストロゲンに対する異常な生理反応に関連する閉経後の女性における疾患の抑制のための請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。

**【請求項 12】**

疾患が、乳ガンである請求項 11 に記載の使用。