(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

PCT

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
7. Juni 2007 (07.06.2007)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/062877 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07J 41/00 (2006.01) *A61P 5/32* (2006.01)
A61K 31/565 (2006.01) *A61P 15/00* (2006.01)
A61P 5/28 (2006.01) *A61P 19/10* (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2006/011729

(22) Internationales Anmeldedatum:
27. November 2006 (27.11.2006)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2005 057 224.3
29. November 2005 (29.11.2005) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13342 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **MÜLLER, Gerd** [DE/DE]; Magdelstieg 132, 07745 Jena (DE). **KOSEMUND, Dirk** [DE/DE]; Ulan-Bator-Str. 51, 99091 Erfurt (DE). **WYRWA, Ralf** [DE/DE]; Burgstrasse 47, 07751 Rothenstein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*

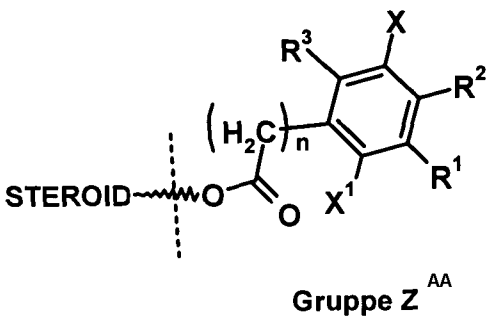
(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 8. November 2007

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** PRODRUG ERβ-SELECTIVE SUBSTANCES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) **Bezeichnung:** PRODRUGS ERβ-SELEKTIVER SUBSTANZEN, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE ZUSAMMENSETZUNGEN

(I)



Gruppe Z AA

AA ... GROUP Z

(57) **Abstract:** The invention relates to a prodrugs of 9α-substituted estratrienes of general formula (I), wherein the Z group is linked to a steroid, (I). The invention also relates to a methods for the production thereof, pharmaceutical compositions which contain said compounds, and to the use thereof. Said inventive compounds of general formula (I) do not bond with the oestrogen receptor alpha and/ or beta but they bond with carboanhydrases and inhibitors of said enzymes.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung stellt Prodrugs von 9α-substituierten Estratrienen der allgemeinen Formel (I) bereit, in denen die Gruppe Z an das Steroid gebunden ist, (I) Verfahren zu deren Herstellung, pharmazeutische Zusammensetzungen, die diese Verbindungen enthalten sowie Verwendung derselben. Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I binden nicht an den Estrogenrezeptor alpha und/ oder beta. Sie binden an Carboanhydrasen und hemmen diese Enzyme.

WO 2007/062877 A3