2004072971

09 DEC 2004

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

162162

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. Dezember 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2003/104253 A3

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07J 1/00, A61P 15/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/006172

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. Juni 2003 (11.06.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 26 326.4 11. Juni 2002 (11.06.2002) DE

(71) Anmelder: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Muellerstrasse 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: KOSEMUND, Dirk; Ulan-Bator-Str. 51, 99091 Erfurt (DE). MÜLLER, Gerd; Magdelstieg 132, 07745 Jena (DE). HILLISCH, Alexander; Herderstr. 28, 07743 Jena (DE). FRITZEMEIER, Karl-Heinrich; Rabenstr. 5a, 15503 Berlin (DE). MUHN, Peter; Markgrafenstr. 61, 13465 Berlin (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

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

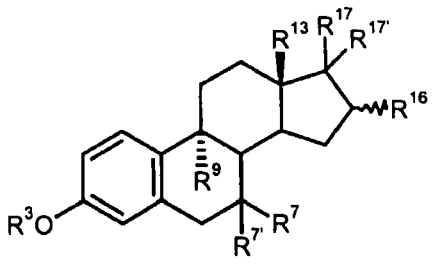
Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 16. September 2004

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: 9-ALPHA-SUBSTITUTED ESTRATRIENES AS SELECTIVELY ACTIVE ESTROGEN

(54) Bezeichnung: 9-ALPHA-SUBSTITUIERTE ESTRATRIENE ALS SELEKTIV WIRKSAME ESTROGENE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel 9α-substituted estratrienes of general formula (I) - wherein R3, R7, R7', R13, R16, R17 and R17' have the designations cited in the description, and R9 represents a linear-chain or branched-chain, optionally partially or fully halogenated alkenyl radical comprising between 2 and 6 carbon atoms, or an ethinyl radical or a prop-1-inyl radical - as pharmaceutical active ingredients which have, in vitro, a higher affinity to estrogen receptor preparations of the rat prostate than to estrogen receptor preparation of the rat uterus, and, in vivo, preferably a preferential action on the ovary compared to the uterus. The invention also relates to the production of said estratrienes, to the therapeutic application thereof and to pharmaceutical forms of administration containing the novel compounds. The invention further relates to the use of said compounds for treating illnesses and states related to estrogen deficiency.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung beschreibt die neuen 9a-substituierten Estratriene der allgemeinen Formel (I) worin R3, R7, R7', R13, R16 sowie R17 und R17' und die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben sowie R9 einen gerad- oder verzweigtkettigen, gegebenenfalls teilweise oder vollständig halogenierten Alkenylrest mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, einen Ethinyl- oder Prop-1-inylrest bedeutet, als pharmazeutische Wirkstoffe, die in vitro eine höhere Affinität an Estrogen-rezeptor-präparationen von Rattenprostata als an Estrogen-rezeptor-präparationen von Rattenuterus und in vivo vorzugsweise eine präferentielle Wirkung am Ovar im Vergleich zum Uterus aufweisen, deren Herstellung, ihre therapeutische Anwendung und pharmazeutischen Darreichungsformen, die die neuen Verbindungen enthalten. Die Erfindung beschreibt ferner die Verwendung von diesen Verbindungen zur Behandlung estrogendefizienz-bedingter Krankheiten und Zustände.

WO 2003/104253 A3

ACTION