

PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
 Internationales Büro
 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
 INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

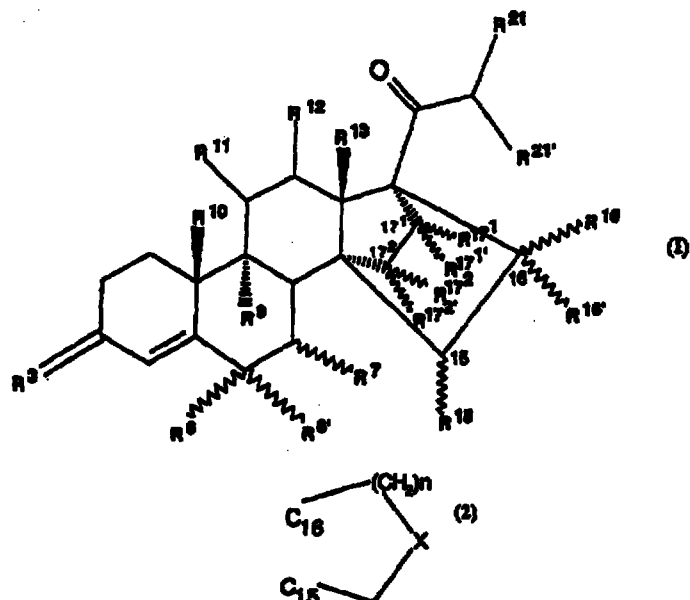
(51) Internationale Patentklassifikation 6 : C07J 53/00, 71/00, A61K 31/56, 31/58	A2	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 96/20209 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 4. Juli 1996 (04.07.96)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/05107 (22) Internationales Anmeldedatum: 23. December 1995 (23.12.95) (30) Prioritätsdaten: P 44 47 401.6 23. December 1994 (23.12.94) DE (71) Anmelder: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstrasse 178, D-13353 Berlin (DE). (72) Erfinder: SCHÖLLKOPF, Klaus; Kurstrasse 6, D-14129 Berlin (DE). HALFBRODT, Wolfgang; Scharfenberger Strasse 42, D-13505 Berlin (DE). KUHNKE, Joachim; Zingerieweg 27d, D-14089 Berlin (DE). SCHWEDE, Wolfgang; Klosterheider Weg 35, D-13467 Berlin (DE). FRITZEMBIER, Karl-Heinrich; Rohrweihstrasse 32, D-13505 Berlin (DE). KRATTENMACHER, Rolf; Am Seeschloß 3, D-13467 Berlin (DE). MUHN, Hans-Peter; Markgrafenstrasse 61, D-13465 Berlin (DE).	(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, FI, HU, JP, KR, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, UA, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.</i>	

(54) Title: 14 α ,17 α -C₂-BRIDGED 19-NOR-PROGESTERONE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: 14 α ,17 α -C₂-ÜBERBRÜCKTE 19-NOR-PROGESTERONDERIVATE

(57) Abstract

The invention concerns 14,17-C₂-bridged steroids of general formula (I), wherein: R³ represents an oxygen atom, the hydroxy amino group or two hydrogen atoms; R⁶ represents either a hydrogen, fluorine, chlorine or bromine atom or a C₁-C₄ alkyl group at the α or β position, R^{6'} and R⁷ then representing hydrogen atoms; or alternatively, R⁶ represents a hydrogen, fluorine, chlorine or bromine atom or a C₁-C₄ alkyl group, R^{6'} and R⁷ then representing a common additional bond; R⁷ represents a C₁-C₄ alkyl group at the α or β position, R⁶ and R^{6'} then representing hydrogen atoms; or alternatively R⁶ and R⁷ together represent a methylene group at the α or β position and R^{6'} represents a hydrogen atom; or R⁶ and R^{6'} together represent an ethylene or methylene group and R⁷ represents a hydrogen atom; R⁹ and R¹⁰ each represent a hydrogen atom or a common bond; R¹¹ and R¹² each represent a hydrogen atom or a common bond; R¹³ represents a methyl or ethyl group; R¹⁵ represents a hydrogen atom or a C₁-C₃ alkyl group; R¹⁶ and R^{16'} independently of one another represent a hydrogen atom, a C₁-C₃ alkyl group, or a C₂-C₄ alkenyl group, or together represent a C₁-C₃ alkylidene group; R¹⁵ and R¹⁶ represent a common bond and R^{16'} represents a hydrogen atom or a C₁-C₃ alkyl group, or alternatively R¹⁵ and R¹⁶ together represent a ring of the partial formula (I) shown, in which n = 1 and 2 and X represents a methylene group or an oxygen atom; and R^{16'} represents a hydrogen atom; R¹⁷ represents a hydrogen atom or a C₁-C₃ alkyl group; R¹⁷ represents a hydrogen atom, a C₁-C₃ alkyl group or a C₂-C₄ alkenyl group; R¹⁷ and R¹⁷ each represent a hydrogen atom or a common bond; R²¹ represents a hydrogen atom or a C₁-C₃ alkyl group; and R²¹ represents a hydrogen atom, C₁-C₃ alkyl group or hydroxy group. The claimed compounds do not include 14,17-ethano-19-norpregn-4-en-3,20-dione. The novel compounds, unlike the one disclaimed, show a high level of gestagenic activity even after peroral administration and are suitable for use in the production of medicaments.



(57) Zusammenfassung

Die Erfindung beschreibt 14,17-C₂-überbrückte Steroide der allgemeinen Formel (I), worin R³ für ein Sauerstoffatom, die Hydroxyiminogruppe oder zwei Wasserstoffatome, R⁶ für ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder für einen α - oder β -ständigen C₁-C₄-Alkylrest, wobei dann R⁶ und R⁷ Wasserstoffatome darstellen, oder aber R⁶ für ein Wasserstoff-, Fluor-, Chlor- oder Bromatom oder für einen C₁-C₄-Alkylrest, wobei dann R⁶ und R⁷ eine gemeinsame zusätzliche Bindung darstellen, R⁷ für einen α - oder β -ständigen C₁-C₄-Alkylrest, wobei dann R⁶ und R⁶ Wasserstoffatome darstellen, oder aber R⁶ und R⁷ gemeinsam für eine α - oder β -ständige Methylengruppe und R⁶ für ein Wasserstoffatom oder R⁶ und R⁶ gemeinsam für eine Ethylen- oder Methylengruppe und R⁷ für ein Wasserstoffatom, R⁹ und R¹⁰ jeweils für ein Wasserstoffatom oder eine gemeinsame Bindung, R¹¹ und R¹² jeweils für ein Wasserstoffatom oder eine gemeinsame Bindung, R¹³ für eine Methyl- oder Ethylgruppe, R¹⁵ für ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₃-Alkylrest, R¹⁶ und R¹⁶ unabhängig voneinander für ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₃-Alkylrest oder einen C₂-C₄-Alkenylrest oder gemeinsam für eine C₁-C₃-Alkylidengruppe, R¹⁵ und R¹⁶ für eine gemeinsame Bindung sowie R¹⁶ für ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₃-Alkylrest oder R¹⁵ und R¹⁶ gemeinsam für einen Ring der Teilformel (i), worin n = 1 und 2 und X eine Methylengruppe oder ein Sauerstoffatom bedeuten sowie R¹⁶ für ein Wasserstoffatom, R¹⁷¹ für ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₃-Alkylrest, R¹⁷² für ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₃-Alkylrest oder einen C₂-C₄-Alkenylrest, R¹⁷¹ und R¹⁷² jeweils für ein Wasserstoffatom oder für eine gemeinsame Bindung, R²¹ für ein Wasserstoffatom oder einen C₁-C₃-Alkylrest, R²¹ für ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₃-Alkylrest oder eine Hydroxygruppe stehen, ausgenommen der Verbindung 14,17-Ethano-19-norpregn-4-en-3,20-dion. Die neuen Verbindungen verfügen im Gegensatz zu der disclainnten Verbindung auch nach peroraler Applikation über hohe gestagene Wirksamkeit und sind zur Herstellung von Arzneimitteln geeignet.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirghistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauritanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		