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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
4. November 2004 (04.11.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/094451 A3

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/004086

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. April 2004 (16.04.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10318896.7 22. April 2003 (22.04.2003) DE

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

(72) Erfinder: **BRÄUER, Nico**; Schroeterstr. 13, 07745 Jena (DE). **PETERS, Olaf**; Am Birnstiel 22, 07745 Jena (DE). **HILLISCH, Alexander**; Herderstr. 28, 07743 Jena (DE). **BOHLMANN, Rolf**; Kühler Weg 6a, 14055 Berlin (DE). **RICHTER, Margit**; Magdelstieg 117b, 07745 Jena (DE). **MUHN, Hans, Peter**; Markgrafenstr. 61, 13465 Berlin (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, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, 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, IT, LU, 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).

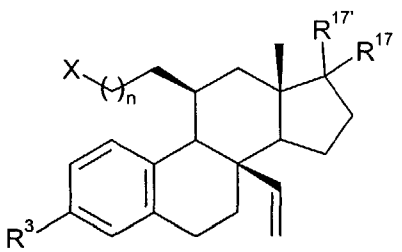
Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 23. Dezember 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: 8$G(B)-VINYL-11$G(B)-($G(V)-SUBSTITUTED)ALKYL-ESTRA-1,3,5(10)-TRIENES

(54) Bezeichnung: 8BETA-VINYL-11BETA-(OMEGA-SUBSTITUIERTE)ALKYL-ESTRA-1,3,5(10)-TRIENE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to 8β-vinyl-11β-(ω-substituted)alkyl-estra-1,3,5(10)-trienes of general formula (I), which have ERβ-antagonistic activity, methods for the production thereof, the intermediate products thereof, pharmaceutical preparations containing the inventive compounds, and the use thereof for producing medicaments. The novel compounds can be used for contraceptive purposes in men and women without influencing other estrogen-sensitive organs such as the uterus or the liver and while also being suitable for the treatment of benign or malignant proliferous ovarian diseases, such as ovarian carcinoma and granulosa cell tumors.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft 8β-Vinyl-11β-(w-substituierte)alkyl-estra-1,3,5(10)-triene der allgemeinen Formel (I) mit ERβ-antagonistischer Aktivität, Verfahren zu deren Herstellung, deren Zwischenprodukte, pharmazeutische Präparate enthaltend die erfindungsgemäßen Verbindungen, sowie deren Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln. Die neuen Verbindungen sind zur Kontrazeption beim Mann und der Frau einsetzbar, ohne daß sie andere Östrogen-sensitive Organe wie den Uterus oder die Leber beeinflußen. Sie sind auch zur Behandlung von gutartigen oder bösartigen proliferativen Erkrankungen des Ovars, wie Ovarialcarcinomen und Granulosazelltumoren geeignet.

WO 2004/094451 A3