

(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
13. Juli 2006 (13.07.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/072467 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07J 53/00 (2006.01) A61P 5/34 (2006.01)
A61K 31/585 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/014205

(22) Internationales Anmeldedatum:
30. Dezember 2005 (30.12.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 063 864.0
30. Dezember 2004 (30.12.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT**
[DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **BOHLMANN, Rolf**
[DE/DE]; Kühler Weg 6a, 14055 Berlin (DE). **BIT-
TLER, Dieter** [DE/DE]; Bölkauer Pfad 11, 13503 Berlin
(DE). **KUENZER, Hermann** [DE/DE]; Turiner Strasse
4, 13347 Berlin (DE). **ESPERLING, Peter** [DE/DE];
Furkastrasse 15c, 12107 Berlin (DE). **MUHN, Hans-Pe-
ter** [DE/DE]; Markgrafenstrasse 61, 13465 Berlin (DE).

FRITZEMEIER, Karl-Heinrich [DE/DE]; Rabenstrasse
5a, 13503 Berlin (DE). **FUHRMANN, Ulrike** [DE/DE];
Charlottenburger Ufer 4, 10587 Berlin (DE). **PRELLE,
Katja** [DE/DE]; Laurinsteig 31, 13465 Berlin (DE). **BOR-
DEN (FRÜHER KURZ), Steffen** [DE/DE]; Ackerstrasse
80, 13355 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, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,
LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

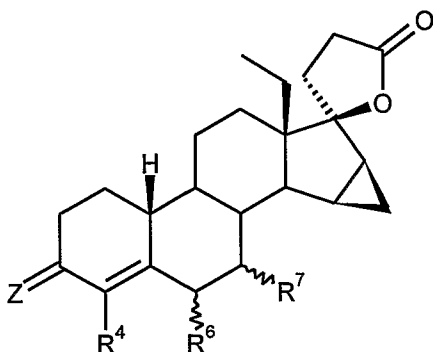
(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 18-METHYL-19-NOR-17-PREGN-4-EN-21,17-CARBOLACTONES AND PHARMACEUTICAL PREPARATIONS
COMPRISING THE SAME

(54) Bezeichnung: 18-METHYL-19-NOR-17-PREGN-4-EN-21,17-CARBOLACTONE, SOWIE DIESE ENTHALTENDE
PHARMAZEUTISCHE PRÄPARATE

(I)



(57) Abstract: The invention relates to novel 18-methyl-19-nor-17-
pregn-4-en-21,17-carbolactones of general formula (I), where Z = O,
H₂, =NOR or =NNHSO₂R, where R = H, a straight- or branched-chain
1-4 or 3-4 C alkyl group, R⁴ = H, halogen, methyl or trifluoromethyl,
R⁶ and/or R⁷ can be α- or β-positioned and independently = branched-
or straight-chain 1-4 or 3-4 alkyl, or R⁶ = H and R⁷ = α- or β-positioned,
straight- or branched-chain 1-4 or 3-4 C alkyl, or R⁶ and R⁷ = H, or R⁶
and R⁷ together = α- or β-positioned methylene or an additional bond.
The novel compounds have gestagenic and antimineralocorticoid activ-
ity and are suitable for the production of pharmaceutical preparations,
for example, for oral contraception and the treatment of pre-, peri- and
post-menopausal pain.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung beschreibt
die neuen 18-Methyl-19-nor-17-pregn-4-en-21,17-carbolactone
der allgemeinen Formel (I) worin Z ein Sauerstoffatom, zwei

Wasserstoffatome, eine Gruppierung =NOR oder =NNHSO₂R, wobei R ein Wasserstoffatom oder eine gerad- oder verzweigt-kettige
Alkylgruppe mit 1 bis 4 bzw. 3 bis 4 Kohlenstoffatomen ist, R⁴ ein Wasserstoffatom, ein Halogenatom, eine Methyl- oder eine
Trifluormethylgruppe, R⁶ und/oder R⁷ α- oder β-ständig sein kann und unabhängig voneinander eine gerad- oder verzweigt-kettige
Alkylgruppe mit 1 bis 4 bzw. 3 bis 4 Kohlenstoffatomen oder R⁶ ein Wasserstoffatom und R⁷ eine α- oder β-ständige, gerad- oder
verzweigt-kettige Alkylgruppe mit 1 bis 4 bzw. 3 bis 4 Kohlenstoffatomen oder R⁶ und R⁷ je ein Wasserstoffatom oder R⁶ und R⁷
gemeinsam eine α- oder β-ständige Methylengruppe oder eine zusätzliche Bindung bedeuten. Die neuen Verbindungen verfügen
über gestagene und antimineralecorticoide Wirkung und sind zur Herstellung von pharmazeutischen Präparaten, beispielsweise für die
orale Kontrazeption und die Behandlung prä-, peri- und postmenopausaler Beschwerden geeignet.

WO 2006/072467 A1



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

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.