

(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
12. Januar 2006 (12.01.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/003012 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07J 63/00**,
A61K 31/56, A61P 5/32

14195 Berlin (DE). **SCHNEIDER, Birgitt** [DE/DE];
Damaschkeweg 19, 07745 Jena (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/007314

(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, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, 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.

(22) Internationales Anmeldedatum:
4. Juli 2005 (04.07.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004032673.8 2. Juli 2004 (02.07.2004) DE

(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).

(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): **GEGE, Christian** [DE/DE]; Mochentalerweg 26, 89584 Ehingen (DE). **REGENHARDT, Wilko** [DE/DE]; Reichenaustr. 43, 81243 München (DE). **PETERS, Olaf** [DE/DE]; Langenhainer Str. 8, 99891 Tabarz (DE). **HILLISCH, Alexander** [AT/DE]; Zum Teller Hof 44, 42553 Velbert (DE). **ADAMSKI, Jerzy** [DE/DE]; Strassbergerstrasse 10, 80809 München (DE). **MÖLLER, Gabriele** [DE/DE]; Darmstädter Strasse 3, 80992 München (DE). **DELUCA, Dominga** [IT/DE]; Oberländerstrasse 6, 81371 München (DE). **ELGER, Walter** [DE/DE]; Schorlemerallee 12B,

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

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:** NOVEL 2-SUBSTITUTED D-HOMO-ESTRA-1,3,5(10)-TRIENES AS INHIBITORS OF 17 β -HYDROXYSTEROID DEHYDROGENASE TYPE 1

(54) **Bezeichnung:** NEUE 2-SUBSTITUIERTE D-HOMO ESTRA-1,3,5(10)-TRIENE ALS INHIBITOREN DER 17 β -HYDROXYSTEROIDDEHYDROGENASE TYP 1

(57) **Abstract:** The invention relates to novel 2-substituted D-homo-estra-1,3,5(10)-trienes of general formula (I) wherein R² represents a C₁-C₈ alkyl, a C₁-C₈ alkyloxy group or a halogen atom, R¹³ represents a hydrogen atom or a methyl group, and R¹⁷ represents a hydrogen atom or a fluorine atom. The invention also relates to the pharmaceutically acceptable salts of said compounds, to the production thereof, and to the use of the same as medicaments for the prophylaxis and treatment of oestrogen-dependent diseases that can be influenced by the inhibition of 17 β -hydroxysteroid dehydrogenase type 1.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft neue 2-substituierte D-Homo-Estra-1,3,5(10)-triene der allgemeinen Formel (I), worin R² eine C₁-C₈-Alkyl, eine C₁-C₈-Alkyloxygruppe oder ein Halogenatom, R¹³ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe, R¹⁷ ein Wasserstoff- oder ein Fluoratom, bedeuten, sowie ihre pharmazeutisch annehmbaren Salze, deren Herstellung und Verwendung als Arzneimittel zur Prophylaxe und Therapie estrogenabhängiger Erkrankungen, die sich durch Hemmung der 17 β -Hydroxysteroiddehydrogenase Typ 1 beeinflussen lassen.

WO 2006/003012 A1