

(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
7. Juni 2007 (07.06.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/062876 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07J 41/00 (2006.01) **A61P 5/30** (2006.01)
A61K 31/565 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2006/011728

(22) Internationales Anmeldedatum:
27. November 2006 (27.11.2006)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2005 057 225.1
29. November 2005 (29.11.2005) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT**
[DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13342 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **PETERS, Olaf**
[DE/DE]; Langenhainer Str. 8, 99891 Tabarz (DE). **RED-
DERSEN, Gudrun** [DE/DE]; Friedrich-Engels-Str. 10,
07749 Jena (DE). **WYRWA, Ralf** [DE/DE]; Burgstrasse
47, 07751 Rothenstein (DE). **HILLISCH, Alexander**
[AT/DE]; Zum Teller Hof 44, 42553 Velbert (DE). **EL-
GER, Walter** [DE/DE]; Schorlemerallee 12B, 14195
Berlin (DE). **PRELLE, Katja** [DE/DE]; Laurinsteig 31,
13465 Berlin (DE). **DROESCHER, Peter** [DE/DE];
Lessingstrasse 7, 99425 Weimar (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, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN,
IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR,
LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO,
RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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,
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).

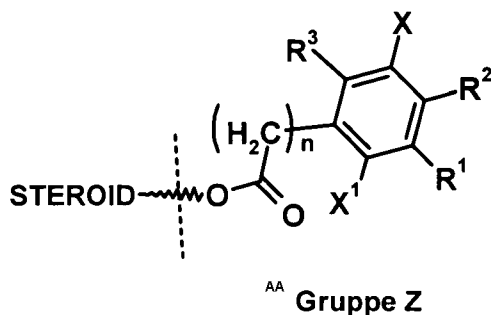
Veröffentlicht:

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

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: PRODRUGS OF ER-BETA-SELECTIVE SUBSTANCES METHOD FOR PRODUCTION THEREOF AND PHAR-
MACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING THE SAME

(54) Bezeichnung: PRODRUGS ER-BETA-SELEKTIVER SUBSTANZEN, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND
DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE ZUSAMMENSETZUNGEN



AA ... GROUP Z

(I)

(57) Abstract: The invention relates to prodrugs of
8-β-substituted estratrienes of general formula (I) in which
the Z group is bonded to the steroid, method for production
thereof, pharmaceutical compositions comprising said
compounds and use thereof. Said compounds of general
formula (I) do not bind to α- and/or β- estrogen receptors,
but to carboanhydrases and inhibit said enzymes.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung
stellt Prodrugs von 8β-substituierten Estratrienen der
allgemeinen Formel (I) bereit, in denen die Gruppe
Z an das Steroid gebunden ist, Verfahren zu deren
Herstellung, pharmazeutische Zusammensetzungen, die

diese Verbindungen enthalten sowie Verwendung derselben. Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I)
binden nicht an den Estrogenrezeptor α und/ oder β. Sie binden an Carboanhydrasen und hemmen diese Enzyme.

WO 2007/062876 A1