



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2735562 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 231/56 (2006.01)
A61K 31/416 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 249/18 (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 409/06 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)
C07D 417/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2015.07.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.03.11
(86)	European Application Nr.	14155086.3
(86)	European Filing Date	2011.09.15
(87)	The European Application's Publication Date	2014.05.28
(30)	Priority	2011.03.15, GB, 201104288 2010.09.16, US, 383659 P 2010.11.05, US, 410727 P 2011.02.25, US, 201161446967 P
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	Seragon Pharmaceuticals, Inc., 12780 El Camino Real, Suite No. 301, San Diego, CA 92130, US-USA
(72)	Inventor	Smith, Nicholas, D., 1204 Beryl Street, San Diego, CA California 92109, US-USA Kahraman, Mehmet, 8617 Via Mallorca Unit E, La Jolla, CA California 92037, US- USA Govek, Steven, P., 13216 Via Santillana, San Diego, CA California 92129, US-USA Nagasawa, Johnny, Y., 8525 Park Run Road, San Diego, CA California 92129, US- USA Lai, Andiliy, G., 7360 Calle Cristobal Unit 112, San Diego, CA California 92126, US- USA Julien, Jackaline, D., 517 1/2 Stratford Ct., Del Mar, CA California 92014, US-USA Herbert, Mark R., 4180 Amoroso St., San Diego, CA California 92111, US-USA Bonnefous, Celine, 4425 Via Sepulveda Unit 3, San Diego, CA California 92122, US-USA Douglas, Karen L., 4050 Rosenda Court Unit 244, San Diego, CA California 92122, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54) Title **Estrogen receptor modulators and uses thereof**

(56) References

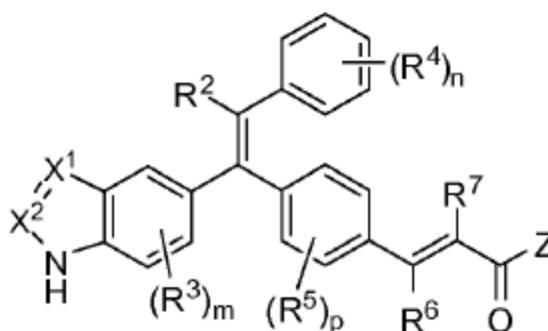
Cited: EP-A1- 0 002 097
WO-A2-03/016270

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Østrogenreseptormodulatorer og anvendelser derav

Patentkrav

1. Forbindelse som har strukturen av formel (XII):



Formel (XII)

der

X¹ er CH, CR³ eller N;

X² er N, CH eller CR³;

Z er -OH eller -OR¹⁰;

R² er C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-fluoralkyl, C₁-C₄-deuteroalkyl, C₃-C₆-sykloalkyl eller -C₁-C₄-alkylen-W;

W er hydroksy, halogen, CN, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoksy, C₁-C₄-halogenalkoksy og C₃-C₆-sykloalkyl;

hver R³ er uavhengig halogen, C₁-C₄-alkyl eller C₁-C₄-fluoralkyl;

hver R⁴ er uavhengig halogen, -CN, -OR⁹, -S(=O)₂R¹⁰, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-fluoralkyl eller C₁₋₄-heteroalkyl;

hver R⁵ er uavhengig halogen, -CN, -OR⁹, -S(=O)₂R¹⁰, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-fluoralkyl eller C₁-C₄-heteroalkyl;

R⁶ er H, C₁-C₄-alkyl eller halogen;

R⁷ er H, C₁-C₄-alkyl eller halogen;

R⁹ er H, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-fluoralkyl eller C₃-C₆-sykloalkyl;

R¹⁰ er C₁-C₆-alkyl;

m er 0, 1 eller 2;

n er 0, 1, 2, 3 eller 4; og

p er 0, 1 eller 2;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der:

Z er -OH;

hver R³ er uavhengig halogen, C₁-C₄-alkyl eller C₁-C₄-fluoralkyl;

hver R⁴ er uavhengig halogen, -CN, -OR⁹, -S(=O)₂R¹⁰, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-fluoralkyl eller C₁-C₄-heteroalkyl;

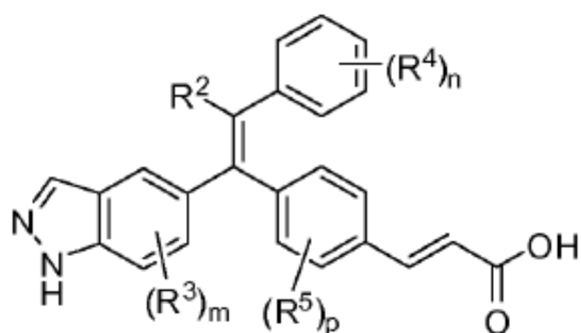
hver R⁵ er uavhengig halogen, C₁-C₄-alkyl eller C₁-C₄-fluoralkyl;

R^6 er H, $-CH_3$, F eller Cl;
 R^7 er H, $-CH_3$, F eller Cl;
 m er 0 eller 1;
 n er 0, 1 eller 2; og
 p er 0 eller 1.

3. Forbindelsen ifølge krav 2, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der:

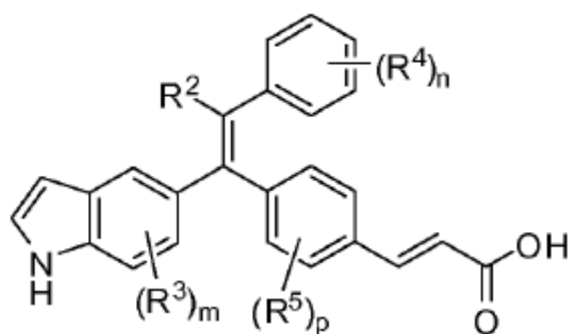
Z er $-OH$;
 R^2 er C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -fluoralkyl, C_1 - C_4 -deuteroalkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl eller $-C_1$ - C_4 -alkylen- W ;
 W er hydroksy, halogen, CN, C_1 - C_4 -alkoksy eller C_3 - C_6 -sykloalkyl;
 R_6 er H;
 R^7 er H;
 m er 0 eller 1;
 n er 0, 1 eller 2; og
 p er 0.

4. Forbindelsen ifølge krav 3, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der forbindelsen av formel (XII) har strukturen av formel (XIII):

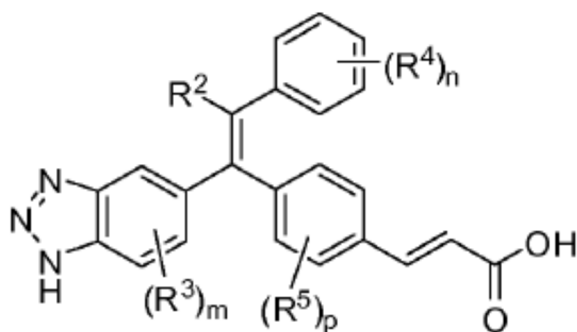


Formel (XIII)

5. Forbindelsen ifølge krav 3, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der forbindelsen av formel (XII) har strukturen av formel (XIV) av formel (XV):



Formel (XIV)



Formel (XV)

6. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der:

hver R^3 er uavhengig halogen, F, Cl eller $-\text{CH}_3$;
 hver R^4 er uavhengig halogen, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_3$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCH}_3$ eller $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$;
 hver R^5 er uavhengig halogen, F, Cl eller $-\text{CH}_3$;
 m er 0 eller 1;
 n er 0, 1 eller 2; og
 p er 0 eller 1.

7. Forbindelsen ifølge krav 6, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der:

R^2 er $-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CD}_3$, $-\text{CH}_2\text{CD}_3$, $-\text{CD}_2\text{CD}_3$, syklopropyl, syklobutyl,
 syklopentyl, sykloheksyl, $-\text{CH}_2\text{-W}$ eller $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-W}$;
 W er hydroksy, F, Cl, $-\text{CN}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$,
 syklopropyl, syklobutyl, syklopentyl eller sykloheksyl.

8. Forbindelsen ifølge krav 7, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav, der:

R^2 er $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ eller syklobutyl;
 hver R^4 er uavhengig F, Cl, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{OCF}_3$,
 $-\text{OCH}_3$, eller $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$;
 m er 0 eller 1;
 n er 0, 1 eller 2; og
 p er 0.

9. Forbindelsen ifølge krav 1, der forbindelsen er:

(E)-etyl 3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylat;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-benzo[d][1,2,3]triazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)
 akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-metoksyfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;

(E)-3-(4-((E)-2-(3-(hydroksymetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-(hydroksymetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-(hydroksymetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(o-tolyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(m-tolyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(p-tolyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(2-metoksyfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-metoksyfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 ((E)-3-(4-((E)-2-(2-klorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-klorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-etyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(2-(trifluormetyl)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-klor-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-4-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-cyanofenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-difluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-3-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklopropyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-fluor-2-metyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,6-difluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,6-diklorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4,4,4-Trideutero-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-fluor-3-metyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(5-fluor-2-metyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,3-difluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,5-difluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-5-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-6-metyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(7-klor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(4-metyl-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(7-metyl-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(6-metyl-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(3-metyl-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(3-klor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-metyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;

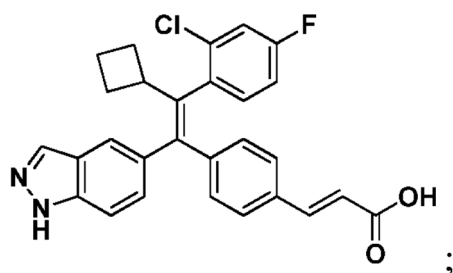
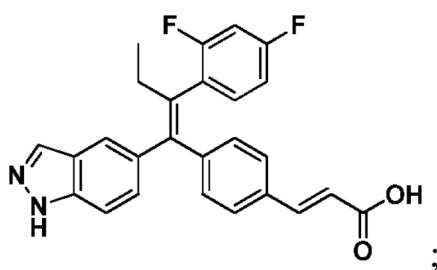
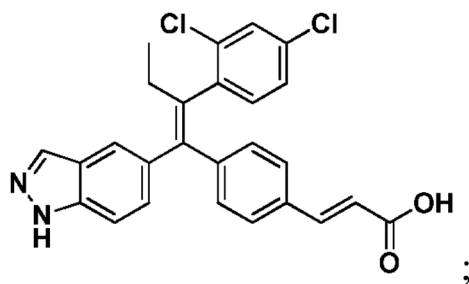
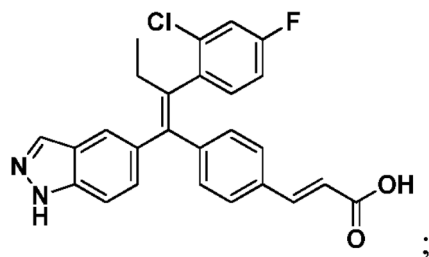
(E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylpent-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-cyanofenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-cyanofenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-hydroksy-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-4-metoksy-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-3-metoksy-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-Indol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(6-klor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-4-metyl-2-fenylpent-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-benzo[d][1,2,3]triazol-5-yl)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(4-klor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklopentyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-sykloheksyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-3-metyl-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-3-syklopropyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klorfenyl)-2-syklopropyl-1-(1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(6-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-benzo[d]imidazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylheks-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-3-syklopentyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(7-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(7-fluor-1H-indol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)-4-metylpent-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-3,3-difluor-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(7-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-fluor-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-klor-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-3,3,3-trifluor-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylprop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-(4-fluor-2-metylfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-metylfenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklopropyl-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-(4-fluor-2-metylfenyl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-metylfenyl)-2-syklopropyl-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(4-klor-1H-indazol-5-yl)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-3,3-difluor-1-(1H-indazol-5-yl)prop-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;

(E)-3-(4-((E)-2-syklopropyl-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-klor-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-klor-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-fluor-2-(4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-4-fluor-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-5-metoksy-2-fenylpent-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-6-metoksy-2-fenylheks-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)-3-metylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-(trifluormetoksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklobutyl-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-2-syklobutyl-1-(1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(3-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklobutyl-1-(3-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(3-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-2-syklobutyl-1-(3-fluor-1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-etyl 3-(4-((E)-2-(4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylat;
 (E)-etyl 3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(2-metoksyfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylat;
 (E)-etyl 3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-metoksyfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylat;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)-2-metylakrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-3-metylfenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-2-metylfenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-2-klorfenyl)akrylsyre;
 (Z)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)-2-fluorakrylsyre;
 (Z)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)-2-klorakrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-3-fluorfenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-2-fluorfenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-2-(trifluormetyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-3-metoksyfenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((Z)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)-2-metoksyfenyl)akrylsyre;
 (E)-etyl 3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylathydroklorid;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-etyl 3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylat;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-(trifluormetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-2-syklopropyl-1-(1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;

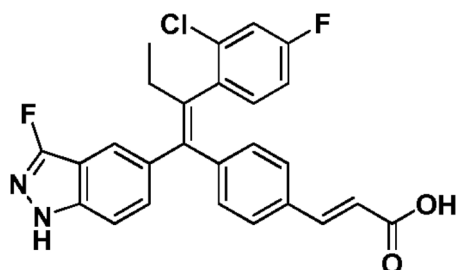
(E)-3-(4-((E)-2-(4-fluor-2-(trifluormetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-(1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)-2-(4-fluor-2-(trifluormetyl)fenyl)butyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-(trifluormetyl)fenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-fluor-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-metoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-4-fluor-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklopropyl-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-2-syklopropyl-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklopropyl-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-metylfenyl)-2-syklopropyl-1-(1H-indazol-5-yl)vinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(2-metyl-5-(metylsulfonyl)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-metoksy-2-metylfenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-fluor-4-metoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-5-metoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-fluor-4-(metylsulfonyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-3,3,4,4,4-pentadeutero-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-(metylsulfonyl)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(7-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-3-metoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2,4-diklorfenyl)-1-(7-fluor-1H-indol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(7-fluor-1H-indol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-3,3,4,4,4-pentadeutero-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-klor-2-cyanofenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;

(E)-3-(4-((E)-2-(2-cyano-4-fluorfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-cyano-4-(trifluormetyl)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-cyanofenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-cyano-2-metylphenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-cyano-2-metylphenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(5-cyano-2-metylphenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-cyano-4-metoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-hydroksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-hydroksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-hydroksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-(1-(1H-indazol-5-yl)-2-fenylbut-1-en-1-yl)fenyl)propansyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-(2-metoksyethoksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-(3-metoksypropoksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-(2-metoksyethoksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-(3-metoksypropoksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-(sykloheksyloksy)fenyl)-1-(4-fluor-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-butoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(3-(pentyloksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(3-(heksyloksy)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-butoksyfenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(4-(pentyloksy)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-(heksyloksy)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(4-(2-hydroksyetoksy)fenyl)-1-(1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-1-(1H-indazol-5-yl)-2-(2-(metylsulfonyl)fenyl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klorfenyl)-1-(1-metyl-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-syklobutyl-1-(1-metyl-1H-indazol-5-yl)-2-fenylvinyl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1-metyl-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 (E)-3-(4-((E)-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-1-(1-(difluormetyl)-1H-indazol-5-yl)but-1-en-1-yl)fenyl)akrylsyre;
 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav.

10. Forbindelse ifølge krav 1, der forbindelsen representeres av én av de følgende formlene:



eller



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksid derav.

11. Farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 10.

12. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksiderav, og minst én farmasøytisk akseptabel inaktiv bestanddel.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, der den farmasøytiske sammensetningen formuleres for intravenøs injeksjon, subkutan injeksjon, oral administrering eller lokal administrering.

14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 15, der den farmasøytiske sammensetningen er en tablett, en pille, en kapsel, en væske, en suspensjon, en gel, en dispersjon, en løsning, en emulsjon, en salve eller en lotion.

15. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksiderav, for anvendelse i medisin.

16. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksiderav, for anvendelse i behandlingen av kreft i et pattedyr.

17. Forbindelsen ifølge krav 16, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksiderav, for anvendelse i behandlingen av brystkreft, eggstokk-kreft, livmorkreft, prostatakreft eller livmorkreft hos et pattedyr.

18. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller N-oksiderav, for anvendelse i behandling av beinkreft, brystkreft, kolorektal kreft, livmorkreft, prostatakreft, kreft i eggstokkene, livmorkreft, livmorhalskreft, lungekreft, leiomyom, livmorleiomyom, alkoholisme, migrene, aortaaneurisme, mottakelighet for hjerteinfarkt, aortaklaffsklerose, hjerte- og karsykdommer, koronarsykdom, høyt blodtrykk, dyp venetrombose, Graves sykdom, artritt, multippel sklerose, skrumplever, hepatitt B, kronisk leversykdom, bentetthet, kolestase, hypospadi, fedme, osteoartritt, osteopeni, osteoporose, Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, migrene, svimmelhet, spisevegring, oppmerksomhetssvikt og hyperaktivitetsforstyrrelse (ADHD), demens, dyp depresjon, psykose, menarkealder, endometriose, eller ufruktbarhet hos et pattedyr.