

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 19 年 12 月 27 日 (2007.12.27)

【公表番号】特表 2003-526660 (P2003-526660A)

【公表日】平成 15 年 9 月 9 日 (2003.9.9)

【出願番号】特願 2001-566636 (P2001-566636)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5575 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/06

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 10 月 25 日 (2007.10.25)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

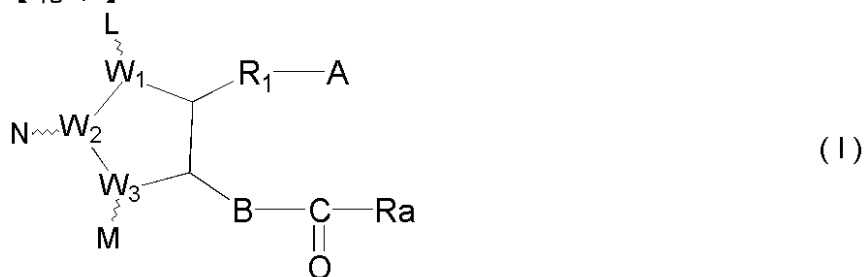
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 プロスタグランジン関連化合物を活性成分として含有し、ヒト患者に対し長期間、眼局所に投与される、高眼圧症および緑内障の長期治療もしくは予防的制御に適した医薬組成物。

【請求項 2】 プロスタグランジン関連化合物を活性成分として含有し、ヒト患者に対し長期間、眼局所に投与される、高眼圧症および緑内障の長期治療もしくは予防的制御に適した医薬組成物であって、該プロスタグランジン関連化合物が式 (I)

【化 1】



〔式中、 W_1 、 W_2 および W_3 は炭素原子あるいは酸素原子、
 L 、 M および N は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン原子、低級アルキル、低級アルコキシ、
 ヒドロキシ（低級）アルキルまたはオキソ
 （ただし、 L および M の基のうちの少なくとも 1 つは、水素以外の基であり、5 員環は少なくとも 1 つの二重結合を有していてもよい）；

A は、 $-CH_2OH$ 、 $-COCH_2OH$ 、 $-COOH$ またはそれらの官能性誘導体；

B は、単結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C(C)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-C(C)-CH_2-$ または $-CH_2-C(C)-$ ；

R_1 は、非置換またはハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、オキソ、アリールまたは複素環で置換された、二価の飽和または不飽和の低～中級の脂肪族炭化水素残基；

R a は、非置換またはハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルカノイルオキシ、シクロ（低級）アルキル、シクロ（低級）アルキルオキシ、アリール、アリールオキシ、複素環または複素環オキシで置換された、飽和または不飽和の低～中級脂肪族炭化水素残基；シクロ（低級）アルキル；シクロ（低級）アルキルオキシ；アリール；アリールオキシ；複素環；複素環オキシ]で示される化合物である組成物。

【請求項 3】 A の官能性誘導体が、塩、エーテル、エステルおよびアミドである、請求項 2 記載の組成物。

【請求項 4】 A が式 -CONR' R'' (式中、R' および R'' はそれぞれ水素、低級アルキル、アリール、アルキル - またはアリール - スルホニル、低級アルケニルおよび低級アルキニル) で示される、請求項 3 記載の組成物。

【請求項 5】 プロスタグランジン関連化合物が 13, 14 - ジヒドロ - 15 - ケト - 20 - エチル PGF₂ イソプロピルエステルである請求項 2 または 3 記載の組成物。

【請求項 6】 プロスタグランジン関連化合物が 15 - ケトラタノプロストである、請求項 2 または 3 記載の組成物。

【請求項 7】 1 日 1 回以上、6 ヶ月以上投与するのに適している、請求項 5 または 6 記載の組成物。

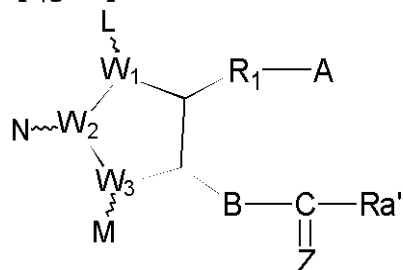
【請求項 8】 1 日 2 回、6 ヶ月以上投与するのに適している、請求項 7 記載の組成物。

【請求項 9】 ヒト患者が白人種である、請求項 8 記載の方法。

【請求項 10】 プロスタグランジン関連化合物が 15 - ケト置換基を有し、オメガ鎖にフェニル環を有するものである、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 11】 プロスタグランジン関連化合物を活性成分として含有し、ヒト患者に対し長期間、眼局所に投与される、高眼圧症および緑内障の長期治療もしくは予防的制御に適した医薬組成物であって、プロスタグランジン関連化合物が式 (III) :

【化 2】



(III)

[式中、W₁、W₂、および W₃ は炭素または酸素原子；

L、M および N は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ（低級）アルキルまたはオキソ（ただし、L および M の基のうちの少なくとも 1 つは、水素以外の基であり、5 員環は少なくとも 1 つの二重結合を有していてもよい）；

A は、-CH₂OH、-COCH₂OH、-COOH またはそれらの官能性誘導体；

B は、単結合、-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-CH=CH-、-C=C-、-CH₂-CH₂-CH₂-、-CH=CH-CH₂-、-CH₂-CH=CH-、-C=C-CH₂- または -CH₂-C=C-；

R₁ は、非置換またはハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、オキソ、アリールまたは複素環で置換された、二価の飽和または不飽和の低～中級の脂肪族炭化水素残基；

Z は

【化 3】



(式中、 R_4 および R_5 は水素、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシまたはヒドロキシ(低級)アルキルであり、 R_4 および R_5 は同時にヒドロキシ、低級アルコキシおよび/またはヒドロキシ(低級)アルキルとなることはない)；

R_a は、非置換またはハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルカノイルオキシ、シクロ(低級)アルキル、シクロ(低級)アルキルオキシ、アリール、アリールオキシ、複素環または複素環オキシで置換された、飽和または不飽和の $C_5 \sim C_{10}$ 脂肪族炭化水素残基；シクロ(低級)アルキル；シクロ(低級)アルキルオキシ；アリール；アリールオキシ；複素環；複素環オキシ]で示される化合物である組成物。

【請求項 12】 A の官能性誘導体が、塩、エーテル、エステルまたはアミドである、請求項 11 記載の組成物。

【請求項 13】 A が式 $-CONR'R''$ (式中、 R' および R'' はそれぞれ水素、低級アルキル、アリール、アルキル - またはアリール - スルホニル、低級アルケニルおよび低級アルキニル) で示される、請求項 12 記載の組成物。

【請求項 14】 プロスタグランジン関連化合物が 15 位の炭素原子の後に、炭素数 6 個以上の直鎖基を有する、請求項 11 記載の組成物。

【請求項 15】 プロスタグランジン関連化合物が、ドコサノイドである請求項 14 記載の組成物。

【請求項 16】 プロスタグランジン関連化合物が、15 位の炭素原子の後に炭素数 3 以上の直鎖基を有し、オメガ鎖末端に環状基を有している、請求項 11 記載の組成物。

【請求項 17】 環状基がフェニル環である、請求項 16 記載の組成物。

【請求項 18】 1 日 1 回以上、6 ヶ月以上投与するのに適したものである、請求項 15 記載の組成物。

【請求項 19】 1 日 2 回、6 ヶ月以上投与するのに適したものである、請求項 18 記載の組成物。

【請求項 20】 ヒト患者が白人種である、請求項 2 または 11 記載の組成物。