

【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

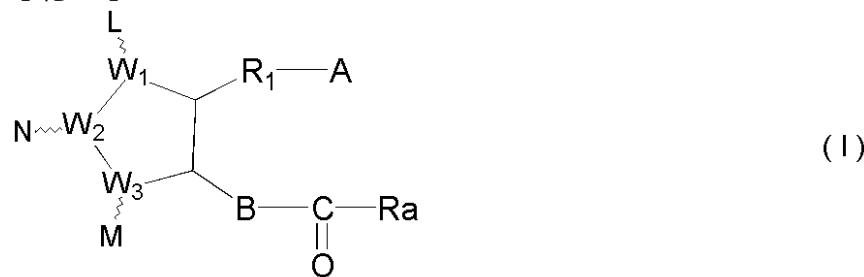
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 プロスタグラジン関連化合物を活性成分として含有し、ヒト患者に對し長期間、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】 プロスタグラジン関連化合物を活性成分として含有し、ヒト患者に對し長期間、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、該プロスタグラジン関連化合物が式(I)

【化1】



[式中、W<sub>1</sub>、W<sub>2</sub> およびW<sub>3</sub> 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<sub>2</sub>OH、-COCH<sub>2</sub>OH、-COOH またはそれらの官能性誘導体；

B は、単結合、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-、-C=C-、-C-C-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH=CH-、-C-C-CH<sub>2</sub>- または -CH<sub>2</sub>-C-C-；

R<sub>1</sub> 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<sub>a</sub> 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-CO NR' 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】 プロスタグラジン関連化合物が13, 14-ジヒドロー-15-ケト-20-エチルPGF<sub>2</sub> 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。

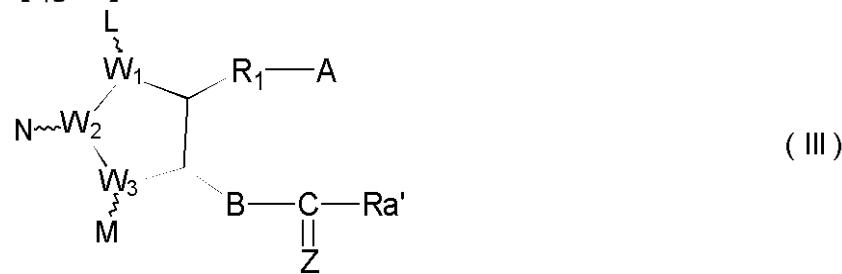
【請求項8】 1日2回、6ヶ月以上投与するのに適している、請求項7記載の組成物。

【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、プロスタグラジン関連化合物が式(III)：

【化2】



[式中、W<sub>1</sub>、W<sub>2</sub>、およびW<sub>3</sub> 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、-CH<sub>2</sub>OH、-COCH<sub>2</sub>OH、-COOHまたはそれらの官能性誘導体；

Bは、単結合、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-、-C-C-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH=CH-、-C-C-CH<sub>2</sub>-または-C-CH<sub>2</sub>-C-C-；

R<sub>1</sub>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<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> 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<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> 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<sub>a</sub> 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C5～C10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-CO NR' 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。