

【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22年6月17日(2010.6.17)

【公表番号】特表2009-536623(P2009-536623A)

【公表日】平成21年10月15日(2009.10.15)

【年通号数】公開・登録公報2009-041

【出願番号】特願2009-507924(P2009-507924)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/05	(2006.01)
C 0 7 C	39/23	(2006.01)
A 6 1 K	31/085	(2006.01)
A 6 1 K	31/4418	(2006.01)
A 6 1 K	31/50	(2006.01)
C 0 7 D	211/86	(2006.01)
C 0 7 D	237/16	(2006.01)
C 0 7 D	211/70	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
C 0 7 C	39/42	(2006.01)
C 0 7 C	43/215	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/05	
C 0 7 C	39/23	C S P
A 6 1 K	31/085	
A 6 1 K	31/4418	
A 6 1 K	31/50	
C 0 7 D	211/86	
C 0 7 D	237/16	
C 0 7 D	211/70	
A 6 1 P	27/06	
C 0 7 C	39/42	
C 0 7 C	43/215	
A 6 1 P	27/02	

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月22日(2010.4.22)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

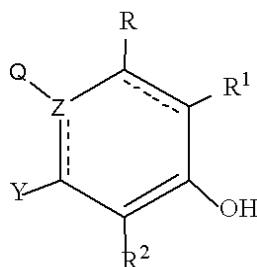
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式1で示される化合物から成る緑内障または高眼圧の処置に有用な新規化合物：

## 【化1】



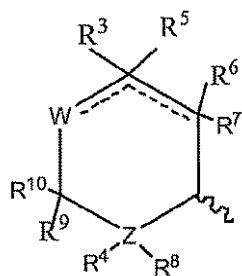
[式中、

Yは、OおよびOHから成る群から選択され；

Zは、NまたはCであり；

Qは、

## 【化2】



(ここで、Wは、直接結合またはC( $R^{11}$ )( $R^{12}$ )である)であり；

点線は、二重結合の存在または不存在を表し；

波線は、直接結合を表し；

Rは、H、ハロゲン、および $C_{1\sim 5}$ アルキルから成る群から選択され；

$R^1$ は、H、およびハロゲンから成る群から選択され；

$R^2$ は、独立に、H、 $C_{1\sim 5}$ アルキル、ハロゲン、 $XC_{1\sim 5}$ アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルキルOR $^{13}$ 、 $C_{1\sim 5}$ アルキルN( $R^{13}$ ) $_2$ 、N( $R^{13}$ ) $_2$ 、 $XC_{1\sim 5}$ アルキルN( $R^{13}$ ) $_2$ および $XC_{1\sim 5}$ アルキルOR $^{13}$ から成る群から選択され；

Xは、OまたはS(O) $_n$ であり；

nは、0または1~2の整数であり；

$R^3$ は、H、ヒドロキシル、C<sub>1~5</sub>アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルキルOR $^{13}$ および $C_{1\sim 5}$ アルキルN( $R^{13}$ ) $_2$ から成る群から選択され；

$R^4$ は、H、 $C_{2\sim 5}$ アルケニル、 $C_{1\sim 5}$ アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルキルOR $^{13}$ および $C_{1\sim 5}$ アルキルN( $R^{13}$ ) $_2$ から成る群から選択され；

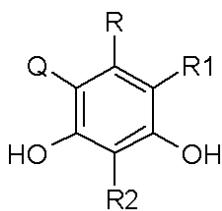
$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ は、独立に、H、 $C_{1\sim 5}$ アルキル、 $C_{1\sim 5}$ アルキルOR $^{13}$ およびOR $^{13}$ から成る群から選択され；

$R^{13}$ は、H、 $C_{1\sim 5}$ アルキルおよび $C_{3\sim 8}$ 環式アルキルから成る群から選択されるか、または2個のR $^{13}$ 基が、NまたはOと一緒にになって、ピベリジンまたはモルホリン環のような環を形成し；但し、前記アルキル基はいずれも、ヘテロ原子含有基で置換されてもよく(ここで、ヘテロ原子は、ハロゲン、酸素、窒素および硫黄から成る群から選択される)、 $R^8$ および $R^{12}$ が一緒にになって環を形成してもよく、 $R^3$ および $R^5$ が一緒にになってOを表してもよく、Qがメンタジエンである場合、 $R^1$ および $R^2$ はHであり、Yはヒドロキシルであり、RはHまたはアルキルでないものとする]。

## 【請求項2】

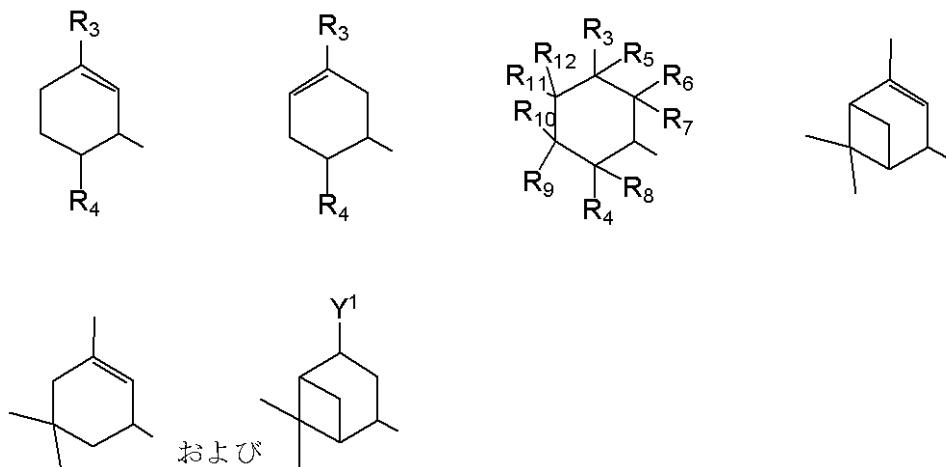
化合物が下記の式IIで示される化合物である請求項1に記載の化合物：

## 【化3】



[式中、Qは、

## 【化4】



から成る群から選択され、ここで、 $Y^1$ は、 $R^3$ および $R^5$ 、または0もしくはOHである]。

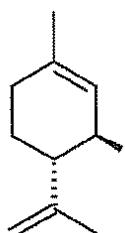
## 【請求項3】

$R$ が、水素、メチル、ブロモおよびエチルから成る群から選択され、 $R^2$ が、水素、メチルおよびクロロから成る群から選択される請求項2に記載の化合物。

## 【請求項4】

$Q$ が

## 【化5】

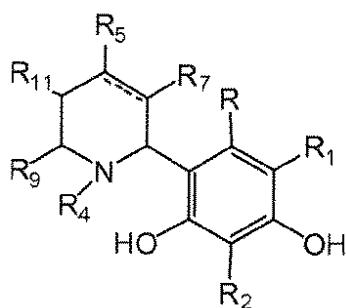


である請求項3に記載の化合物。

## 【請求項5】

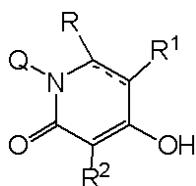
化合物が下記の式IIIで示される化合物である請求項1に記載の化合物：

## 【化6】



**【請求項 6】**

化合物が下記の式IVで示される化合物である請求項1に記載の化合物：

**【化 7】****【請求項 7】**

Rが、水素、メチル、プロモおよびクロロから成る群から選択され、R¹が、水素、メチルおよびクロロから成る群から選択され、R²が水素であり、R³がメチルであり、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹およびR¹²が水素であり、R⁴がイソプロペニルである請求項2に記載の化合物。

**【請求項 8】**

化合物が、5-クロロ-4-(6-イソプロペニル-3-メチルシクロヘキサ-2-エニル)ベンゼン-1,3-ジオール、4-(1-イソプロピル-4-メチル-1,2,5,6-テトラヒドロピリジン-2-イル)-5-メチルベンゼン-1,3-ジオール、1-シクロヘキシル-6-メチルピペリジン-2,4-ジオン、および5-クロロ-4-シクロヘキシルベンゼン-1,3-ジオールから成る群から選択される請求項1に記載の化合物。

**【請求項 9】**

請求項1～8のいずれかに記載の化合物を処置有効量で含有する眼用液剤である医薬組成物。

**【請求項 10】**

内容物を計量形態でディスペンスするのに適当な容器；および  
その中の請求項9に記載の眼用液剤  
を含んで成る医薬生成物。

**【請求項 11】**

請求項1に記載の化合物である薬物を高眼圧または緑内障の処置に充分な量で個体の眼に適用することを含んで成る緑内障または高眼圧の処置方法。

**【請求項 12】**

請求項1に記載の化合物である第1の薬物、並びに 遮断剤、アドレナリンアゴニスト、炭酸脱水酵素阻害剤、コリンアゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤、グルタメートアンタゴニスト、プロスタミドおよびプロスタグランジンから成る群から選択される第2の薬物を含む薬物組み合わせを、高眼圧の処置に充分な量で眼に適用することを含んで成る緑内障または眼圧を処置する方法。

**【請求項 13】**

緑内障または高眼圧の処置を必要とする個体において緑内障または高眼圧を処置するための請求項1に記載の化合物である薬物の使用であって、請求項1に記載の化合物である薬物を高眼圧または緑内障の処置に充分な量で個体の眼に適用することを含んで成る使用。

**【請求項 14】**

緑内障または高眼圧の処置を必要とする個体において緑内障または高眼圧を処置するための医薬の製造における請求項1に記載の化合物である薬物の使用であって、請求項1に記載の化合物である薬物を高眼圧または緑内障の処置に充分な量で個体の眼に適用することを含んで成る使用。