

【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23年8月18日(2011.8.18)

【公表番号】特表2010-532379(P2010-532379A)

【公表日】平成22年10月7日(2010.10.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-040

【出願番号】特願2010-515212(P2010-515212)

【国際特許分類】

C 07 D 277/20 (2006.01)

C 07 D 277/56 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

C 07 D 409/08 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 333/40 (2006.01)

A 61 K 31/559 (2006.01)

【F I】

C 07 D 277/56

A 61 P 27/06

C 07 D 409/08 C S P

A 61 P 43/00 1 1 2

C 07 D 333/40

A 61 K 31/559

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月30日(2011.6.30)

【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

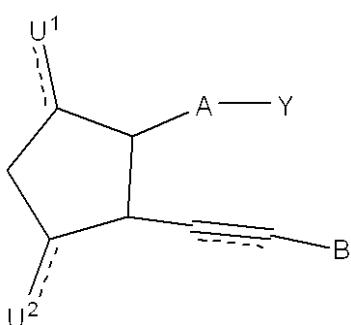
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

眼圧の降下用組成物を製造するための、下記の式を有する化合物の使用：

【化1】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Yは、有機酸官能基またはそのアミドもしくはエステルであるか；或いは、Yは、ヒドロキシメチルまたはそのエーテルであるか；或いは、Yは、テトラゾリル官能基であり；

Aは、 $(CH_2)_6$ 、シス  $CH_2CH=CH(CH_2)_3$  または  $CH_2C=C(CH_2)_3$  であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子は、SまたはOによって置換し得；或いは、Aは、

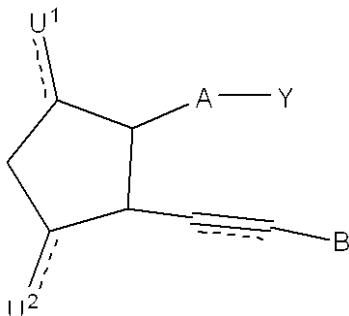
$(CH_2)_mAr(CH_2)_n$  であり、式中、Arはインターリークンまたはヘテロインターリー

リーレンであり、 $m$ と $o$ の和は1、2、3または4であり、1個の  $CH_2$  はSまたはOによって置換し得、1個の  $CH_2CH_2$  は  $CH=CH$  または  $CC$  によって置換し得；  
 $U^1$ および $U^2$ は、個々に、H、=O、OH、F、ClおよびCNから選ばれ；  
Bは、アリールまたはヘテロアリールである)。

## 【請求項2】

下記の式を有する化合物：

## 【化2】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Yは、有機酸官能基またはそのアミドもしくはエステルであるか；或いは、Yは、ヒドロキシメチルまたはそのエーテルであるか；或いは、Yは、テトラゾリル官能基であり；  
Aは、 $(CH_2)_6$ 、シス  $CH_2CH=CH(CH_2)_3$  または  $CH_2CC(CH_2)_3$  であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子は、SまたはOによって置換し得；或いは、Aは、 $(CH_2)_mAr(CH_2)$ 。であり、式中、Arはインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、 $m$ と $o$ の和は1、2、3または4であり、1個の  $CH_2$  はSまたはOによって置換し得、1個の  $CH_2CH_2$  は  $CH=CH$  または  $CC$  によって置換し得；

$U^1$ および $U^2$ は、個々に、H、=O、OH、F、ClおよびCNから選ばれ；

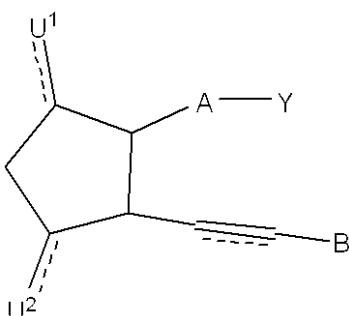
Bは、アリールまたはヘテロアリールである；

但し、 $U^1$ が=Oである場合、 $U^2$ は OHまたは Hではないことを条件とする)。

## 【請求項3】

下記の式を有する化合物：

## 【化3】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Yは、有機酸官能基またはそのアミドもしくはエステルであるか；或いは、Yは、ヒドロキシメチルまたはそのエーテルであるか；或いは、Yは、テトラゾリル官能基であり；  
Aは、 $(CH_2)_6$ 、シス  $CH_2CH=CH(CH_2)_3$  または  $CH_2CC(CH_2)_3$  であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子は、SまたはOによって置換し得；或いは、Aは、 $(CH_2)_mAr(CH_2)$ 。であり、式中、Arはインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、 $m$ と $o$ の和は1、2、3または4であり、1個の  $CH_2$  はSまたはOによって置換し得、1個の  $CH_2CH_2$  は  $CH=CH$  または  $CC$  によって置換し得；

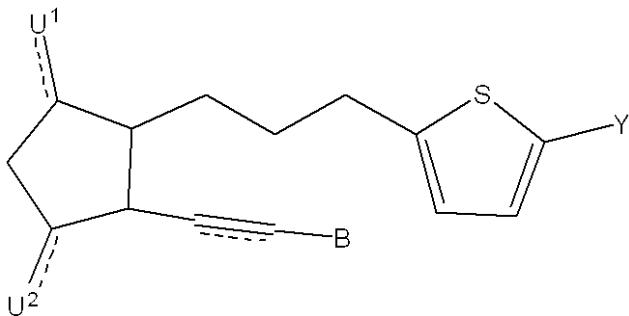
$U^1$ は、H、OH、F、ClまたはCNであり；  
 $U^2$ は、H、=O、OH、F、ClまたはCNであり；

Bは、アリールまたはヘテロアリールである)。

## 【請求項 4】

下記の式を有する化合物：

## 【化 4】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Yは、有機酸官能基またはそのアミドもしくはエステルであるか；或いは、Yは、ヒドロキシメチルまたはそのエーテルであるか；或いは、Yは、テトラゾリル官能基であり；

U<sup>1</sup>およびU<sup>2</sup>は、個々に、H、=O、OH、F、CIおよびCNから選ばれ；

Bは、アリールまたはヘテロアリールである)。

## 【請求項 5】

Bが、置換フェニルまたはピリジニルである、請求項2～4のいずれか1項記載の化合物。

## 【請求項 6】

U<sup>1</sup>が=O、H、OH、F、CIまたはCNである、請求項2～5のいずれか1項記載の化合物。

## 【請求項 7】

U<sup>2</sup>が=O、H、OH、F、CIまたはCNである、請求項2～6のいずれか1項記載の化合物。

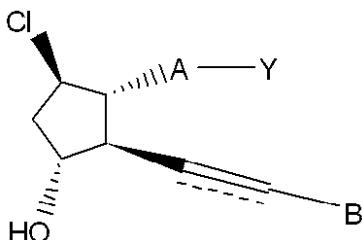
## 【請求項 8】

Bが、置換フェニルまたはピリジニルである、請求項1記載の方法。

## 【請求項 9】

下記の式を有する請求項3記載の化合物：

## 【化 5】



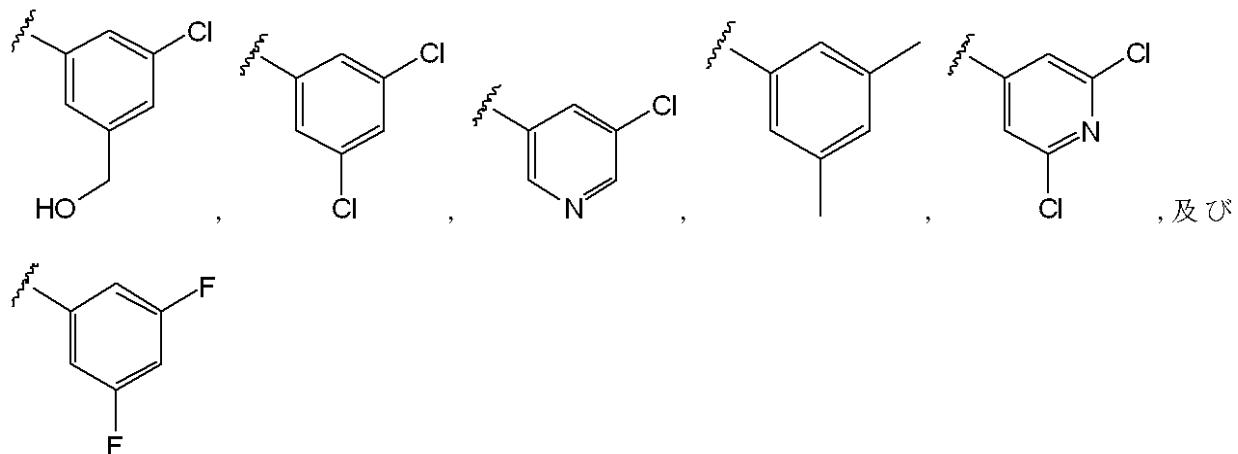
## 【請求項 10】

Bが、F、CI、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルおよび1～3個の炭素原子を有するヒドロキシアルキルから選ばれる置換基によって置換されている、請求項5～9のいずれか1項記載の化合物。

## 【請求項 11】

Bが、下記から選ばれる、請求項9記載の化合物：

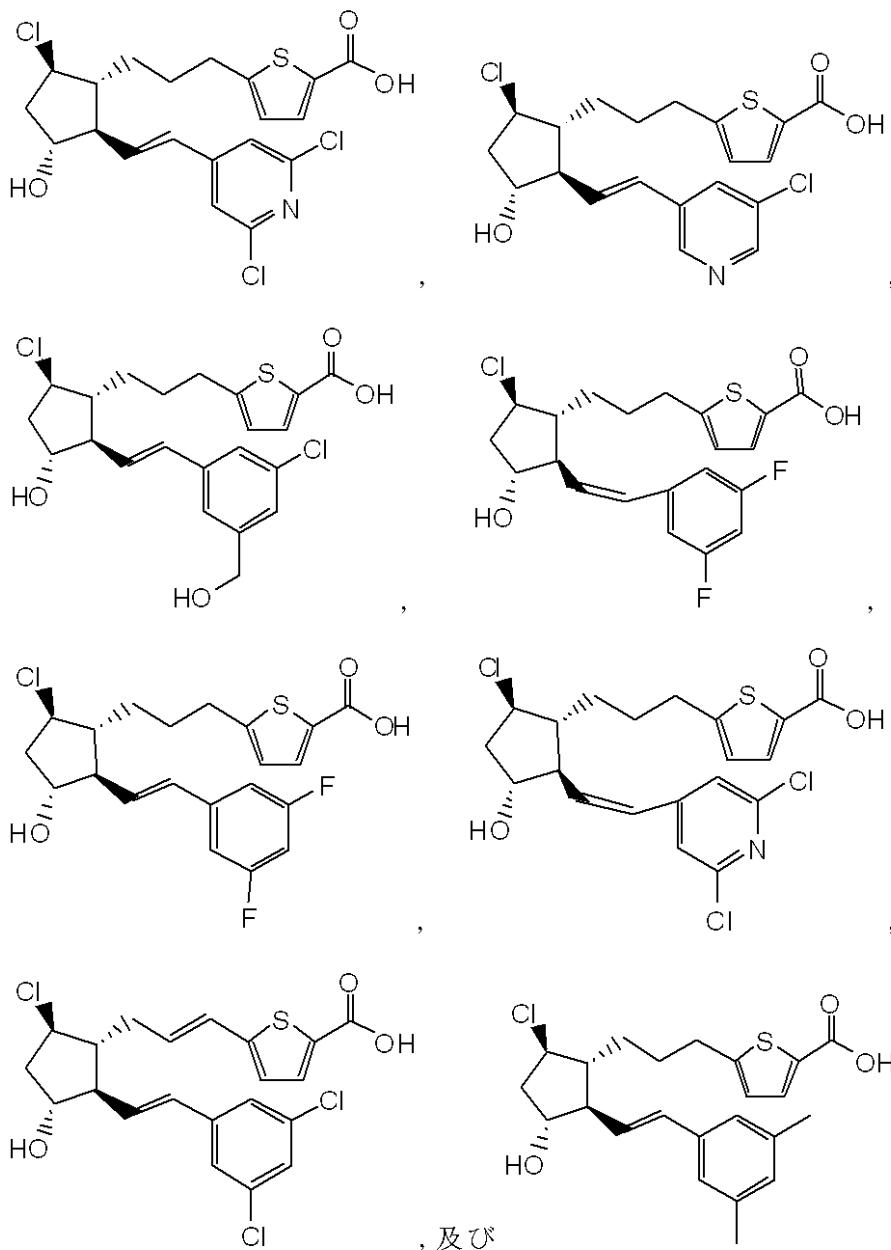
## 【化 6】



## 【請求項 1 2】

前記化合物が、下記から選ばれる、請求項9記載の化合物：

## 【化 7】



## 【請求項 13】

前記化合物が、下記からなる群から選ばれる、請求項 3 記載の化合物：

- 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 (3,5 ジクロロスチリル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロペ 1 エニル)チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 (3 クロロ 5 (ヒドロキシメチル)スチリル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル) チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((E) 2 (5 クロロピリジン 3 イル)ビニル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル) チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((E) 2 (2,6 ジクロロピリジン 4 イル)ビニル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル) チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((Z) 2 (2,6 ジクロロピリジン 4 イル)ビニル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル) チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((E) 3,5 ジフルオロスチリル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸；  
 5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((Z) 3,5 ジフルオロスチリル) 3 ヒドロ

キシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 (3,5 ジメチルスチリル) 3 ヒドロキシシ  
クロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 2 (3 (ブテ 3 エニル)スチリル) 5 クロロ 3 ヒドロ  
キシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((E) 3 クロロ 5 ((E) プロペ 1 エニ  
ル)スチリル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 ((Z) 3 クロロ 5 ((E) プロペ 1 エニ  
ル)スチリル) 3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (3 メチルスチリル)シクロ  
ペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 ((E) 2 (2 プロピルピリ  
ジン 4 イル)ビニル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
2 (2 ((1R,2R,3R,5R) 5 クロロ 2 (3,5 ジクロロスチリル) 3 ヒドロキシシ  
クロペンチル)エチルチオ)チアゾール 4 カルボン酸 ;  
2 (2 ((1R,2R,3R,5R) 2 ((E) 3 (ブテ 3 エニル) 5 クロロスチリル) 5  
クロロ 3 ヒドロキシシクロペンチル)エチルチオ)チアゾール 4 カルボン酸 ;  
2 (2 ((1R,2R,3R,5R) 2 ((Z) 3 (ブテ 3 エニル) 5 クロロスチリル) 5  
クロロ 3 ヒドロキシシクロペンチル)エチルチオ)チアゾール 4 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R) 3 ヒドロキシ 5 オキソ 2 (フェニルエチニル)シクロペ  
ンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1S,2S,3R) 3 ヒドロキシ 5 オキソ 2 (フェニルエチニル)シクロペ  
ンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 フルオロ 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル)シクロ  
ペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル)シクロペ  
ンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
イソプロピル 5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチ  
ニル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボキシレート ;  
5 (3 ((1S,2S,3R,5R) 5 シアノ 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル)シクロペ  
ンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R) 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル) 5 (トリフルオロメチ  
ル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸(先溶出性HPLCジアステレオマー  
) ;  
5 (3 ((1R,2S,3R) 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル) 5 (トリフルオロメチ  
ル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2-カルボン酸(後溶出性HPLCジアステレオマー  
) ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 2 ((3,5 ジクロロフェニル)エチニル) 3 ヒ  
ドロキシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 2 ((3 エチルフェニル)エチニル) 3 ヒドロ  
キシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 2 ((3 (ブテ 3 エニル)フェニル)エチニル) 5 クロロ  
3 ヒドロキシシクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (チオフェン 2 イルエチニ  
ル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5-クロロ 3 ヒドロキシ 2 (チオフェン 3 イルエチニ  
ル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (ピリジン 2 イルエチニル  
)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸 ;  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (ピリジン 3 イルエチニル

)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸；  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (ピリジン 4 イルエチニル  
シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸；  
5 (3 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 ((3 (3 ヒドロキシプロピ  
ル)フェニル)エチニル)シクロペンチル)プロピル)チオフェン 2 カルボン酸；  
2 (2 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 2 ((3,5 ジクロロフェニル)エチニル) 3 ヒ  
ドロキシシクロペンチル)エチルチオ)チアゾール 4 カルボン酸；および、  
2 (2 ((1R,2S,3R,5R) 5 クロロ 3 ヒドロキシ 2 (フェニルエチニル)シクロペ  
ンチル)エチルチオ)チアゾール 4 カルボン酸。