

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-511764(P2005-511764A)

【公表日】平成17年4月28日(2005.4.28)

【年通号数】公開・登録公報2005-017

【出願番号】特願2003-552285(P2003-552285)

【国際特許分類】

C 0 7 D 307/79 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

C 0 7 D 307/82 (2006.01)

C 0 7 D 307/83 (2006.01)

C 0 7 D 307/84 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 307/79 C S P

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/46

A 6 1 P 27/06

C 0 7 D 307/82

C 0 7 D 307/83

C 0 7 D 307/84

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月10日(2005.11.10)

【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

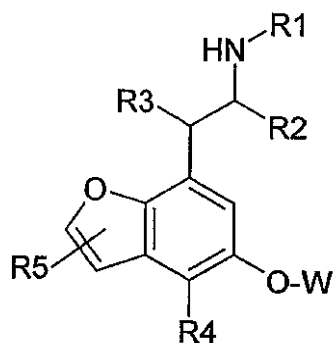
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造を有する化合物であって：

【化 1】



ここで、 R^1 は、水素または $C_1 \sim 4$ アルキルであり； R^2 は、水素、 $C_1 \sim 4$ アルキル、あるいは R^1 および R^2 は $(CH_2)_2 \sim 4$ と一緒になって、複素環式環を完成させ得； R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシまたはフッ素であり； R^4 は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロゲン、ニトリル、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオール、トリフルオロメチル、 HO によって置換された $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 3$ アルコキシから選択され、 R^5 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、ニトリルであり、 W は、水素または $C(=O)C_1 \sim 8$ アルキルである、化合物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで R^1 、 R^3 および R^5 は、水素であり、 R^2 は、メチルであり、 R^4 はハロゲン、メチルまたはトリフルオロメチル、 HO によって置換される $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 3$ アルコキシであり、 W は、水素である、化合物。

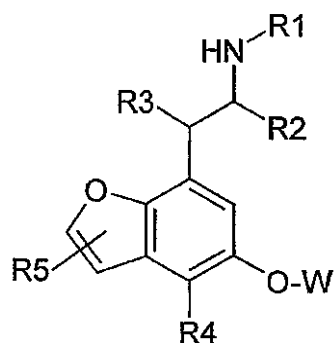
【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物であって、一級アミンを有する炭素原子で R 配置 を有する立体異性体であるとさらに規定される、化合物。

【請求項 4】

以下の構造を有する少なくとも 1 つの化合物および薬学的に受容可能な賦形剤を含む、組成物であり：

【化 2】



ここで、 R^1 は、水素または $C_1 \sim 4$ アルキルであり； R^2 は、水素、 $C_1 \sim 4$ アルキル、あるいは R^1 および R^2 は $(CH_2)_2 \sim 4$ と一緒になって、複素環式環を完成させ得； R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシまたはフッ素であり； R^4 は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロゲン、ニトリル、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオール、トリフルオロメチル、 HO によって置換された $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 3$ アルコキシから選択され、 R^5 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、ニトリルであり、 W は、水素または $C(=O)C_1 \sim 8$ アルキルである、組成物。

【請求項 5】

請求項 4 に記載の組成物であって、ここで、前記化合物は、 R^1 、 R^3 および R^5 は、水素であり、 R^2 は、メチルであり、 R^4 は、ハロゲン、メチルまたはトリフルオロメチル、H O によって置換された $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 3$ アルコキシであり、および W は、水素であるとさらに定義される請求項 4 に記載の、化合物。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の組成物であって、ここで、前記化合物は、一級アミンを有する炭素原子で R 配置を有する立体異性体であるとさらに規定される、組成物。

【請求項 7】

請求項 4 に記載の組成物であって、眼科的に受容可能な防腐剤をさらに含む、組成物。

【請求項 8】

請求項 4 に記載の組成物であって、眼科的に受容可能な界面活性剤をさらに含む、組成物。

【請求項 9】

請求項 4 に記載の組成物であって、粘度を増加させるための薬剤をさらに含む、組成物。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の組成物であって、ここで、前記薬剤は、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロースおよびポリビニルピロリドンからなる群から選択される、組成物。

【請求項 11】

請求項 4 に記載の組成物であって、眼科的に受容可能な防腐剤、眼科的に受容可能な界面活性剤および粘度を増加させるための少なくとも 1 つの薬剤をさらに含む、組成物。

【請求項 12】

請求項 4 の組成物であって、約 5 ～ 約 8 の pH を有する局所的眼科用懸濁液または眼科用溶剤としてさらに規定される、組成物。

【請求項 13】

請求項 12 に記載の組成物であって、ここで、前記化合物の濃度は、0.01 重量% ～ 5 重量%である、組成物。

【請求項 14】

請求項 13 に記載の組成物であって、ここで、前記化合物の組成は、0.25 重量% ～ 2 重量%である、組成物。

【請求項 15】

請求項 4 に記載の組成物であって、 α -遮断薬、プロスタグランジン、カルボニックアンヒドラゼ阻害剤、 α_2 -アゴニストおよび縮瞳薬からなる群から選択される少なくとも 1 つの薬剤をさらに含む、組成物。

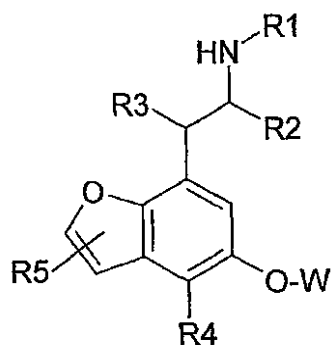
【請求項 16】

請求項 4 に記載の組成物であって、カルシウムチャネル遮断薬および NMDA アンタゴニストからなる群から選択される少なくとも 1 つの薬剤をさらに含む、組成物。

【請求項 17】

哺乳動物における眼内圧を低減するための組成物であって、該組成物は、以下の構造を有する治療的有効量の化合物を含み：

【化 3】



ここで、 R^1 は、水素または $C_1 \sim 4$ アルキルであり； R^2 は、水素、 $C_1 \sim 4$ アルキル、あるいは R^1 および R^2 は $(CH_2)_2 \sim 4$ と一緒になって、複素環式環を完成させ得； R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシまたはフッ素であり； R^4 は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロゲン、ニトリル、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオール、トリフルオロメチル、 HO によって置換された $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 3$ アルコキシから選択され、 R^5 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、ニトリルであり、 W は、水素または $C(=O)C_1 \sim 8$ アルキルである、組成物。

【請求項 18】

請求項 17 に記載の 組成物 であって、ここで R^1 、 R^3 および R^5 は、水素であり、 R^2 は、メチルであり、 R^4 はハロゲン、メチルまたはトリフルオロメチル、 HO によって置換される $C_1 \sim 4$ アルキルあるいは $C_1 \sim 3$ アルコキシであり、 W は、水素である、組成物。

【請求項 19】

請求項 18 に記載の 組成物 であって、ここで、前記化合物は、一級アミンを有する炭素原子で R 配置 を有する立体異性体であるとさらに規定される、組成物。

【請求項 20】

請求項 17 に記載の 組成物 であって、ここで、該組成物は、局所的眼科用懸濁液または眼科用溶剤の形態である、組成物。