

【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7月12日(2007.7.12)

【公表番号】特表2006-526638(P2006-526638A)

【公表日】平成18年11月24日(2006.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2006-046

【出願番号】特願2006-514964(P2006-514964)

【国際特許分類】

C 07 D 207/27 (2006.01)

A 61 K 31/559 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 207/27 C S P A

A 61 K 31/559

A 61 P 27/02

A 61 P 27/06

A 61 P 43/00 1 1 2

【手続補正書】

【提出日】平成19年5月24日(2007.5.24)

【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

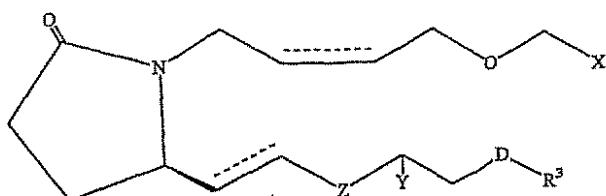
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

高眼圧または緑内障を処置する方法であつて、高眼圧または緑内障の動物に処置有効量の式1:

【化1】



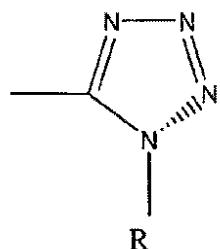
[式中、

陰影線は配置を表し、三角形の線は配置を表し、波線は配置または配置を表し、点線は二重結合の存在または不存在を表し；

Dは、共有結合、またはCH<sub>2</sub>、O、SまたはNHを表し；

Xは、CO<sub>2</sub>R、CONR<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OR、P(O)(OR)<sub>2</sub>、CONRSO<sub>2</sub>R、SONR<sub>2</sub>または

【化 2】



であり；

Yは、

【化 3】



であり；

$\text{Z}$ は、 $\text{CH}_2$ または共有結合であり；

$R$ は、 $H$ または $R^2$ であり；

$R^1$  は、H、 $R^2$ 、フェニルまたはCOR<sup>2</sup>であり；

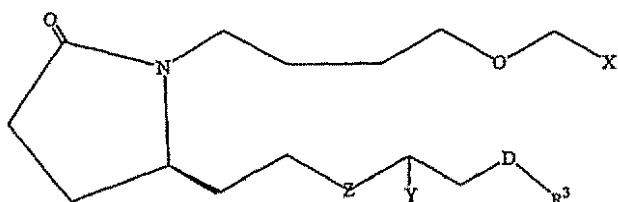
$R^2$  は、  $C_1 \sim C_5$  低級アルキルまたはアルケニルであり：

$R^3$ は、 $R^2$ 、フェニル、チエニル、フラニル、ピリジル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ナフチル、およびそれらの置換誘導体から成る群から選択され、該置換基は、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ハロゲン、 $CF_3$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $NR_2$ 、 $CO_2R$ およびORから成る群から選択される]で示される化合物を投与することを含んで成る方法。

## 【請求項 2】

化合物は式II:

【化 4】



で示される請求項 1 に記載の方法。

### 【請求項3】

Zが共有結合である請求項1に記載の方法。

## 【請求項4】

DがCH<sub>2</sub>である請求項1に記載の方法。

## 【請求項5】

XがCO<sub>2</sub>Rである請求項1に記載の方法。

【請求項 6】

RがHおよびエチルから成る群から選択される請求項5に記載

## 【請求項 7】

RがHまたはC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルである請求項5に記載の方法。

## 【請求項 9】

$R^3$ が、フェニル、クロロフェニルおよびトリフルオロメチルフェニルから成る群から選択される請求項 1 に記載の方法。

## 【請求項 10】

化合物が、

(4-{(R)-2-[4-(3-クロロフェニル)-3-ヒドロキシ-ブチル]-5-オキソ-ピロリジン-1-イル}-ブトキシ)-酢酸；および

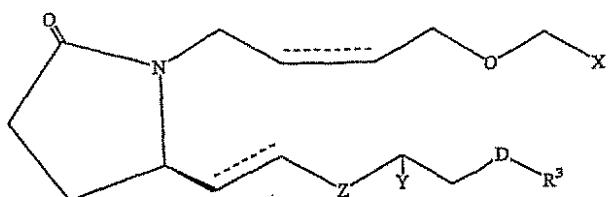
(4-{(R)-2-[{(E)-4-(3-クロロフェニル)-3-ヒドロキシ-ブタ-1-エニル]-5-オキソ-ピロリジン-1-イル}-ブトキシ)-酢酸

から成る群から選択される請求項 1 に記載の方法。

## 【請求項 11】

処置有効量の式 I :

## 【化 5】



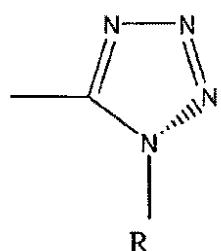
[式中、

陰影線は 配置を表し、三角形の線は 配置を表し、波線は 配置または 配置を表し、点線は二重結合の存在または不存在を表し；

Dは、共有結合、または $CH_2$ 、O、SまたはNHを表し；

Xは、 $CO_2R$ 、 $CONR_2$ 、 $CH_2OR$ 、 $P(O)(OR)_2$ 、 $CONRSO_2R$ 、 $SONR_2$ または

## 【化 6】



であり；

Yは、

## 【化 7】



であり；

Zは、 $CH_2$ または共有結合であり；

Rは、Hまたは $R^2$ であり；

$R^1$ は、H、 $R^2$ 、フェニルまたは $COR^2$ であり；

$R^2$ は、 $C_1 \sim C_5$ 低級アルキルまたはアルケニルであり；

$R^3$ は、 $R^2$ 、フェニル、チエニル、フラニル、ピリジル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ナフチル、およびそれらの置換誘導体から成る群から選択され、該置換基は、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ハロゲン、 $CF_3$ 、CN、 $NO_2$ 、 $NR_2$ 、 $CO_2R$ およびORから成る群から選択される]

で示される化合物を、非毒性の眼科的に許容される液体賦形剤と混合して含んで成る、計量適用に好適な容器に充填された眼科用液剤。

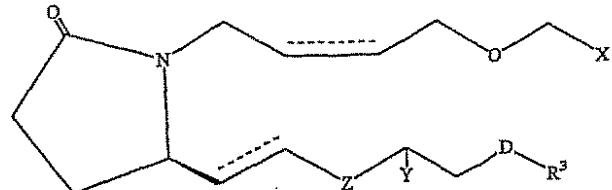
**【請求項 1 2】**

内容物を計量形態でディスペンスするのに好適な容器：および  
該容器中の、請求項 1 1 に記載の眼科用液剤  
を含んで成る医薬生成物。

**【請求項 1 3】**

式 I :

**【化 8】**



[ 式中、

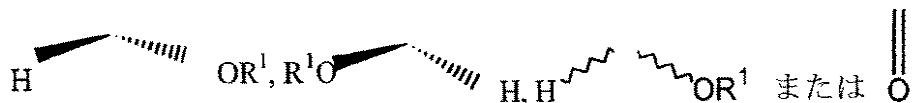
陰影線は 配置を表し、三角形の線は 配置を表し、波線は 配置または 配置を表し  
、点線は二重結合の存在または不存在を表し；

Dは、共有結合、またはCH<sub>2</sub>、O、SまたはNHを表し；

Xは、CONR<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OR、P( O ) ( OR )<sub>2</sub>、CONRSO<sub>2</sub>RまたはSONR<sub>2</sub>であり；

Yは、

**【化 9】**



であり；

Zは、CH<sub>2</sub>または共有結合であり；

Rは、HまたはR<sup>2</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、H、R<sup>2</sup>、フェニルまたはCOR<sup>2</sup>であり；

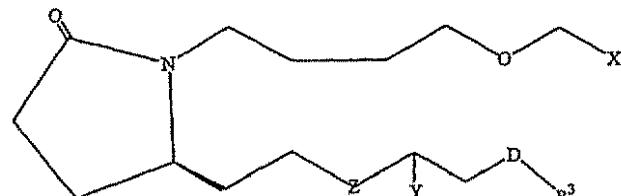
R<sup>2</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>低級アルキルまたはアルケニルであり；

R<sup>3</sup>は、R<sup>2</sup>、フェニル、チエニル、フラニル、ピリジル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ナフチル、およびそれらの置換誘導体から成る群から選択され、該置換基は、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル、ハロゲン、CF<sub>3</sub>、CN、NO<sub>2</sub>、NR<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>RおよびORから成る群から選択される] で示される、高眼圧または緑内障の処置に有用な化合物。

**【請求項 1 4】**

化合物は式 II :

**【化 1 0】**



で示される請求項 1 3 に記載の化合物。

**【請求項 15】**

Zが共有結合である請求項1\_3に記載の化合物。

**【請求項 16】**

DがCH<sub>2</sub>である請求項1\_3に記載の化合物。

**【請求項 17】**

RがHおよびエチルから成る群から選択される請求項1\_3に記載の化合物。

**【請求項 18】**

RがHまたはC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルである請求項1\_3に記載の化合物。

**【請求項 19】**

R<sup>1</sup>がHである請求項1\_3に記載の化合物。

**【請求項 20】**

R<sup>3</sup>が、フェニル、クロロフェニルおよびトリフルオロメチルフェニルから成る群から選択される請求項1\_3に記載の化合物。