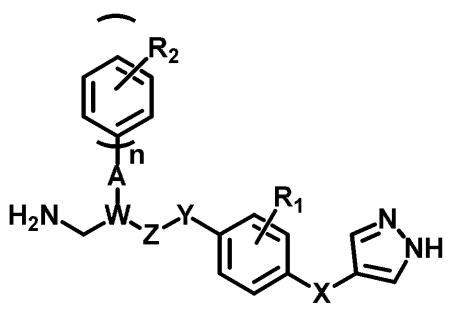
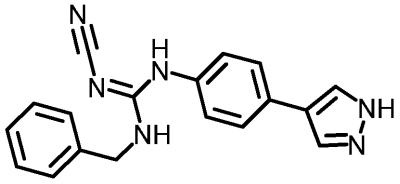
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年4月18日(2022.4.18)

【公開番号】特開2021-113185(P2021-113185A)
【公開日】令和3年8月5日(2021.8.5)
【年通号数】公開・登録公報2021-035
【出願番号】特願2020-204848(P2020-204848)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ231/12(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/06(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/415(2006.01)
Ｃ０７Ｄ405/12(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4192(2006.01)
Ｃ０７Ｄ231/18(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ231/12 ＡＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 27/06
Ａ６１Ｋ 31/415
Ｃ０７Ｄ405/12
Ａ６１Ｋ 31/4192
Ｃ０７Ｄ231/12 Ｂ
Ｃ０７Ｄ231/18

【手続補正書】
【提出日】令和4年4月7日(2022.4.7)
【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】
式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物：

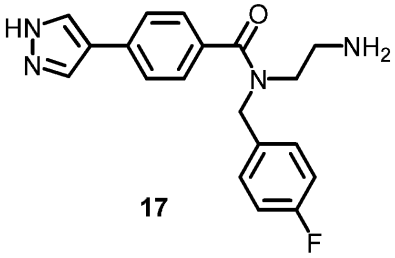


式（Ｉ）；



16

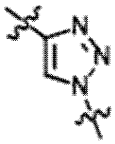
化合物１６；



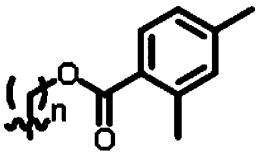
17

化合物１７、

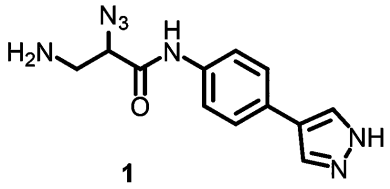
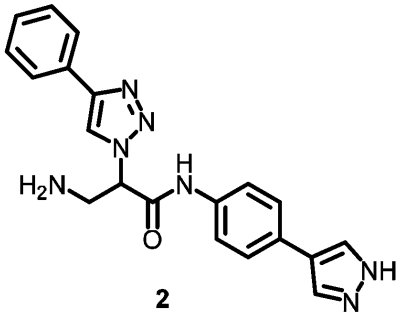
（前記式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、および化合物１７は、βアミノ酸誘導体であり、前記式（Ｉ）中：
Ｘは単結合またはＯであり；
ＹはＮＨであり；
ＺはＣ＝Ｏ、またはＣ＝Ｓであり；
ＷはＣＨまたはＮＨであり；
Ａは単結合、Ｏ、ＯＨ、ＯＣＨ２、

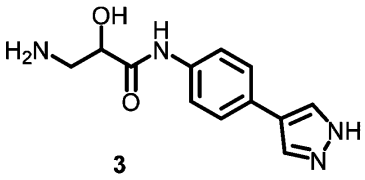
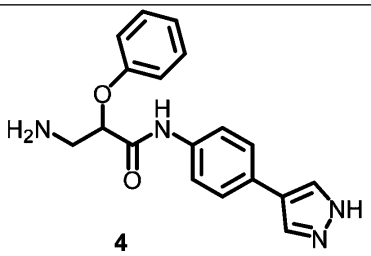
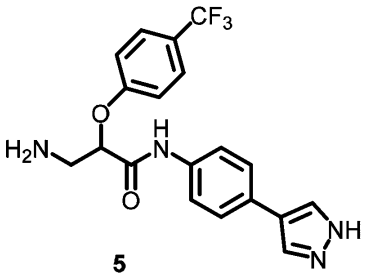
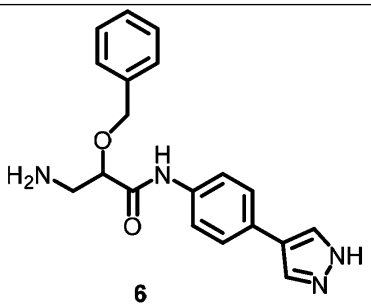
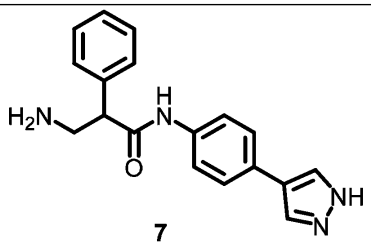
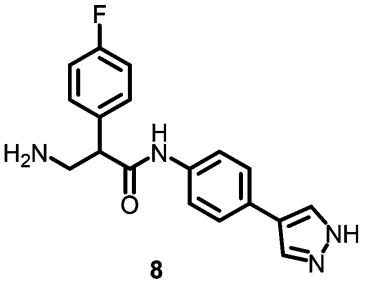
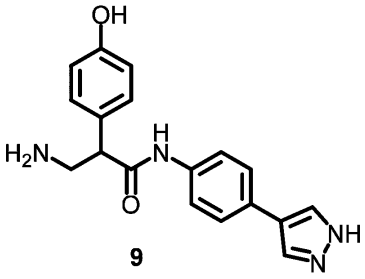
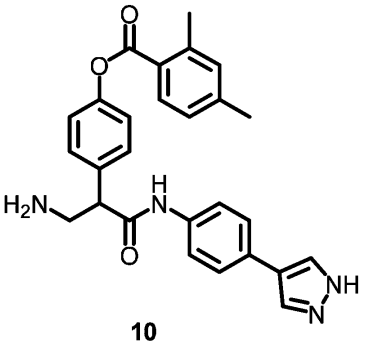


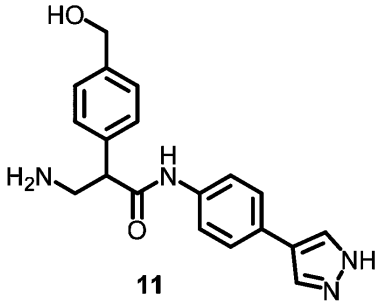
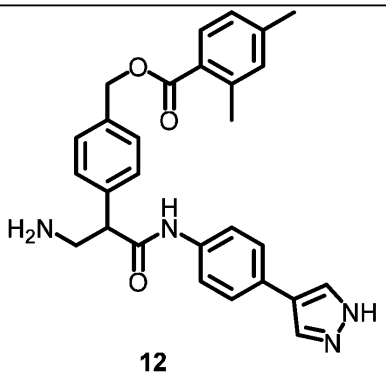
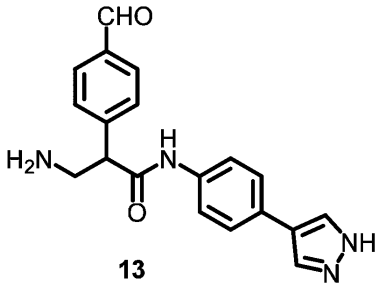
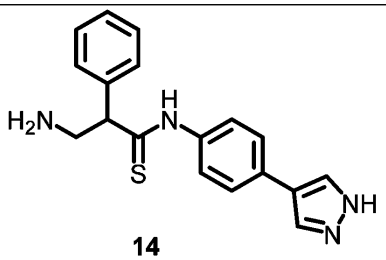
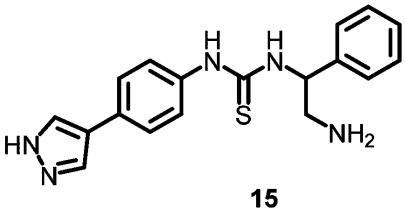
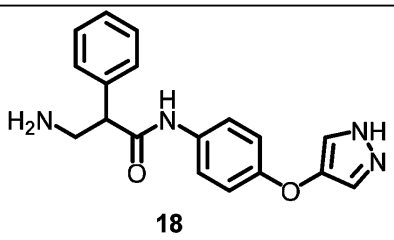
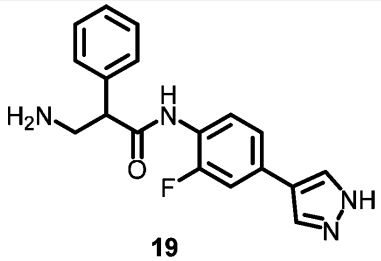
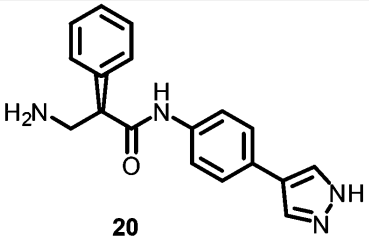
またはＮ３であり；
Ｒ１はＨまたはＦであり；
Ｒ２はＨ、Ｆ、ＯＨ、ＣＦ３、ＣＨ２ＯＨ、ＣＨＯまたは

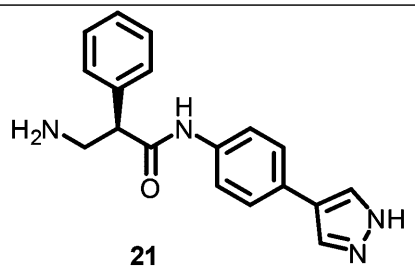


であり；かつ
ｎは０または１である）。
【請求項２】
式（Ｉ）で示される化合物が、以下：

化合物コード	化合物1	化合物2
構造式	 1	 2

化合物コード	化合物3	化合物4
構造式	 3	 4
化合物コード	化合物5	化合物6
構造式	 5	 6
化合物コード	化合物7	化合物8
構造式	 7	 8
化合物コード	化合物9	化合物10
構造式	 9	 10

化合物コード	化合物11	化合物12
構造式	 11	 12
化合物コード	化合物13	化合物14
構造式	 13	 14
化合物コード	化合物15	化合物18
構造式	 15	 18
化合物コード	化合物19	化合物20
構造式	 19	 20

化合物コード	化合物21	
構造式	 21	

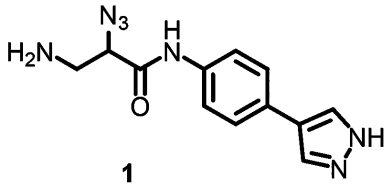
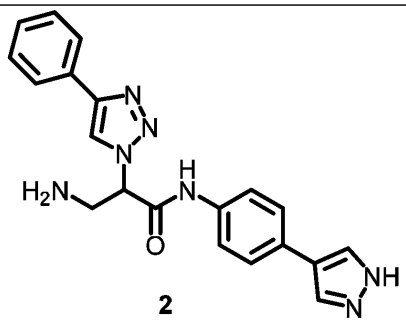
に示される、化合物１～化合物１５および化合物１８～化合物２１からなる群より選択される、請求項１に記載の式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物。

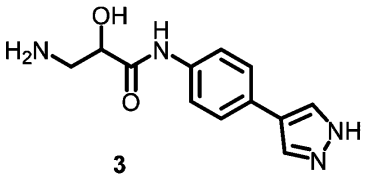
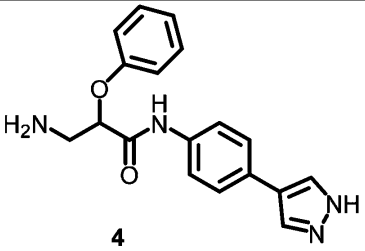
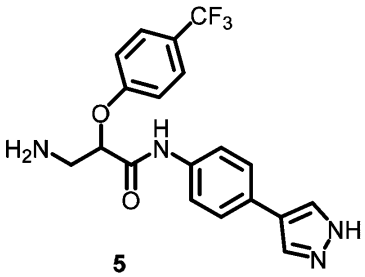
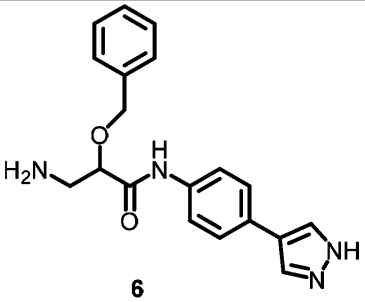
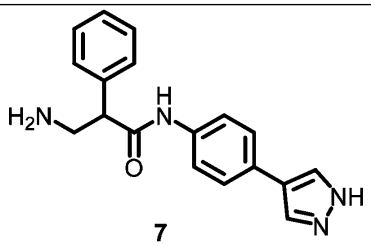
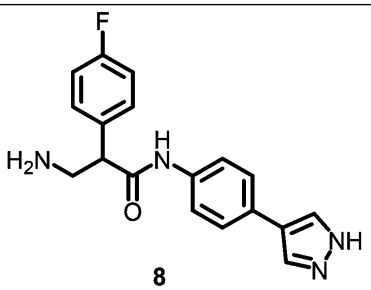
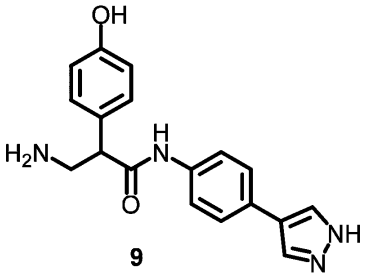
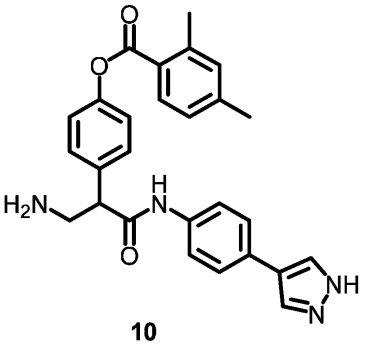
【請求項３】

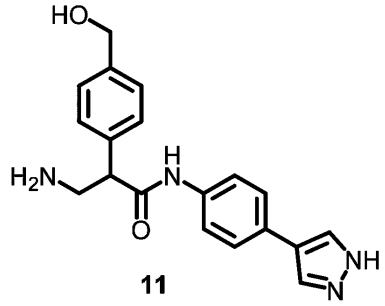
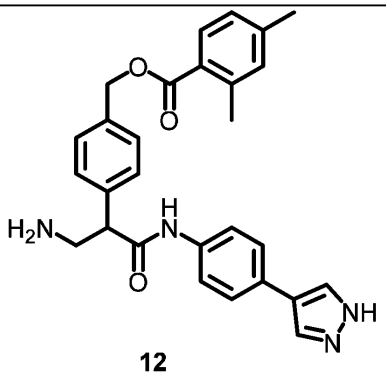
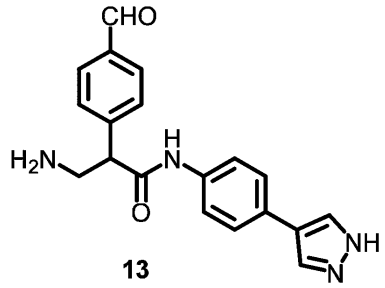
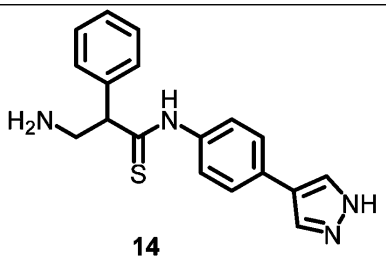
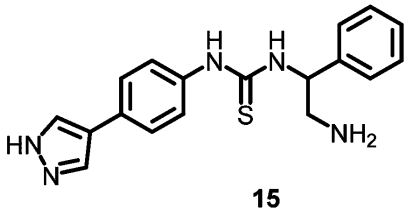
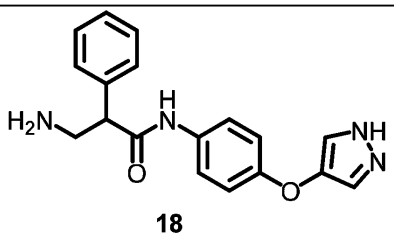
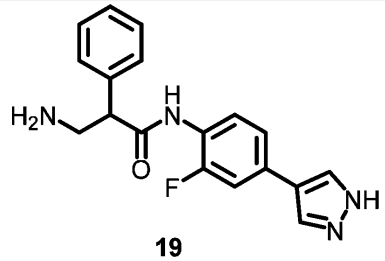
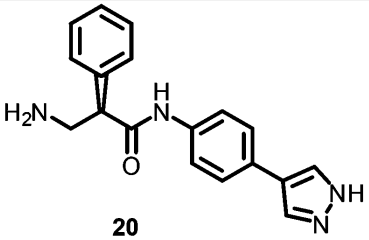
請求項１に記載の式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物を含む、キナーゼ阻害剤であって、式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物が、ミオシン軽鎖キナーゼ－４（myosin light chain kinase 4，ＭＹＬＫ－４）、および/または分裂促進因子活性化タンパク質キナーゼ－１９（mitogen-activated protein kinase 19，ＭＡＰＫ１９，ＹＳＫ－４）を抑制できる、キナーゼ阻害剤。

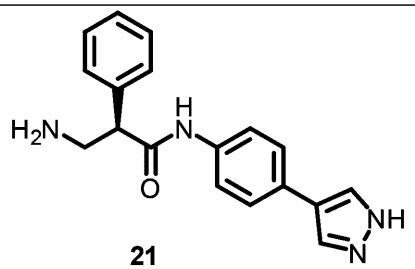
【請求項４】

式（Ｉ）で示される化合物が、以下：

化合物コード	化合物1	化合物2
構造式	 1	 2

化合物コード	化合物3	化合物4
構造式	 3	 4
化合物コード	化合物5	化合物6
構造式	 5	 6
化合物コード	化合物7	化合物8
構造式	 7	 8
化合物コード	化合物9	化合物10
構造式	 9	 10

化合物コード	化合物11	化合物12
構造式	 11	 12
化合物コード	化合物13	化合物14
構造式	 13	 14
化合物コード	化合物15	化合物18
構造式	 15	 18
化合物コード	化合物19	化合物20
構造式	 19	 20

化合物コード	化合物21	
構造式	 21	

に示される、化合物１～化合物１５および化合物１８～化合物２１からなる群より選択される、請求項３に記載のキナーゼ阻害剤。

【請求項５】

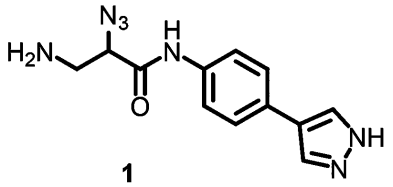
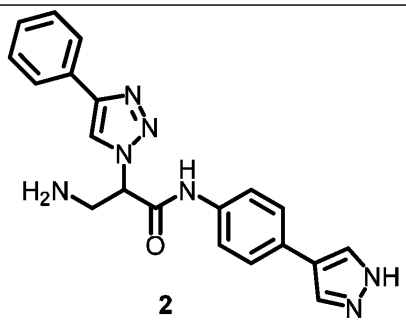
式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、または化合物１７が、Ｒｈｏ関連タンパク質キナーゼ（Rho-associated protein kinase，ＲＯＣＫ）をさらに抑制できる、請求項３に記載のキナーゼ阻害剤。

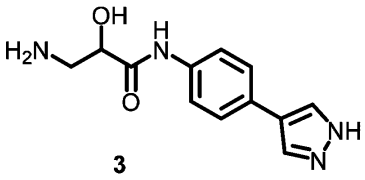
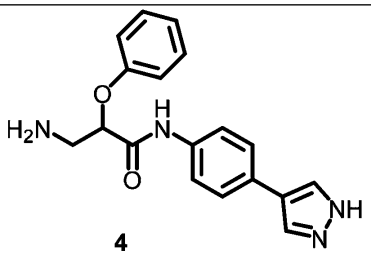
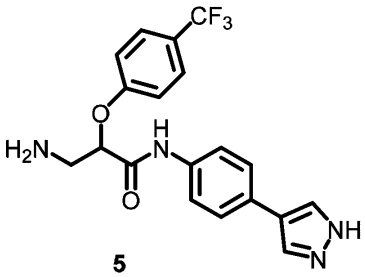
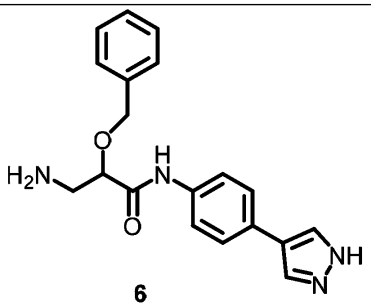
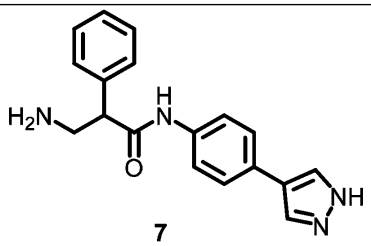
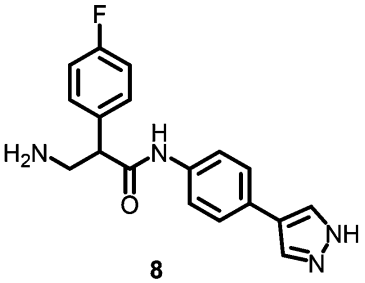
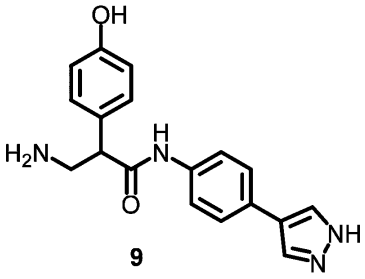
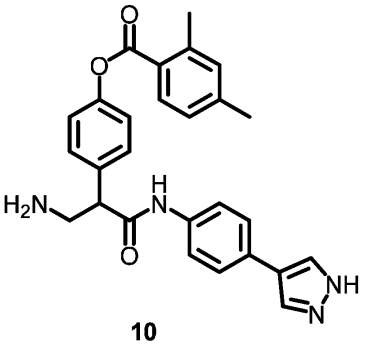
【請求項６】

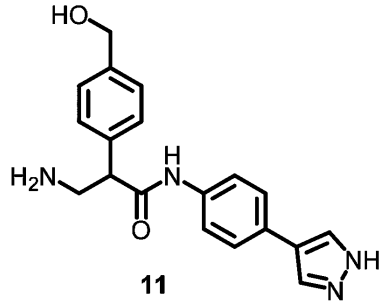
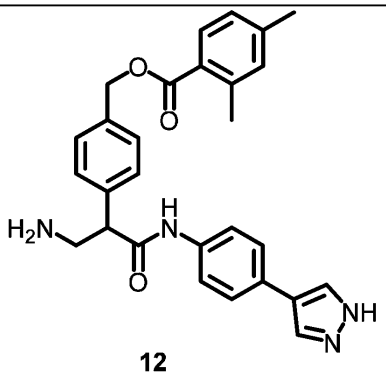
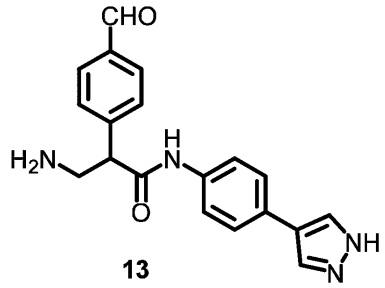
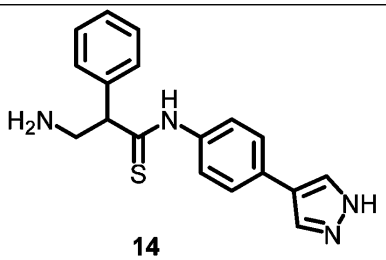
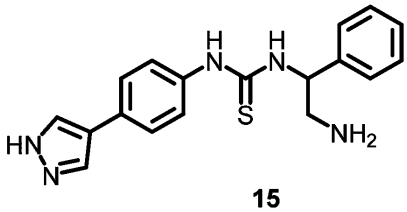
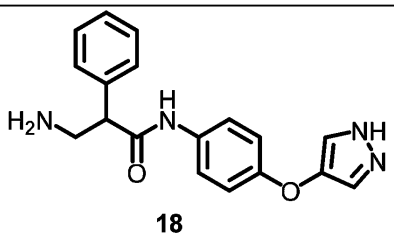
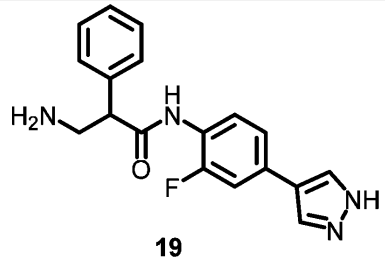
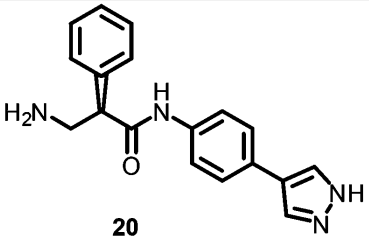
請求項１に記載の式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物を含む、医薬組成物。

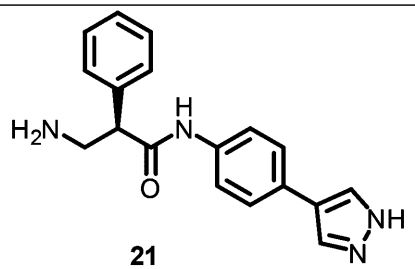
【請求項７】

式（Ｉ）で示される化合物が、以下：

化合物コード	化合物1	化合物2
構造式	 1	 2

化合物コード	化合物3	化合物4
構造式	 3	 4
化合物コード	化合物5	化合物6
構造式	 5	 6
化合物コード	化合物7	化合物8
構造式	 7	 8
化合物コード	化合物9	化合物10
構造式	 9	 10

化合物コード	化合物11	化合物12
構造式	 11	 12
化合物コード	化合物13	化合物14
構造式	 13	 14
化合物コード	化合物15	化合物18
構造式	 15	 18
化合物コード	化合物19	化合物20
構造式	 19	 20

化合物コード	化合物21	
構造式	 21	

に示される、化合物１～化合物１５および化合物１８～化合物２１からなる群より選択される、請求項６に記載の医薬組成物。

【請求項８】

請求項１に記載の式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物を含む、キナーゼ抑制により利益を受ける生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用における使用のための医薬組成物であって、該キナーゼが

ミオシン軽鎖キナーゼ－４、

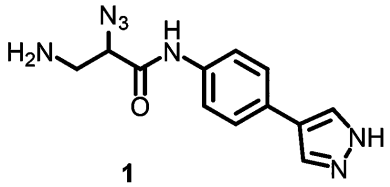
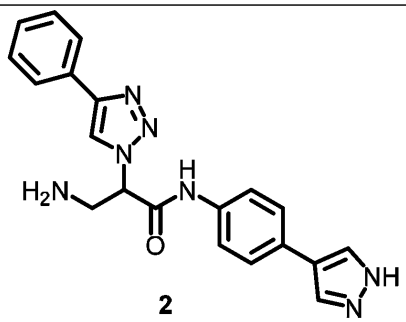
分裂促進因子活性化タンパク質キナーゼ－１９、および

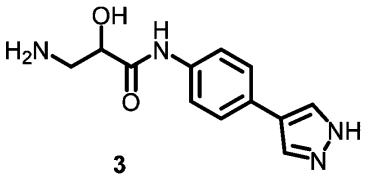
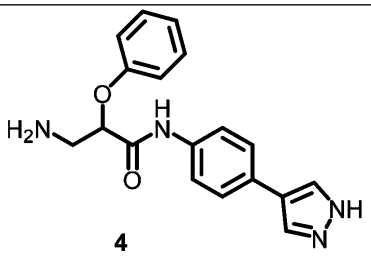
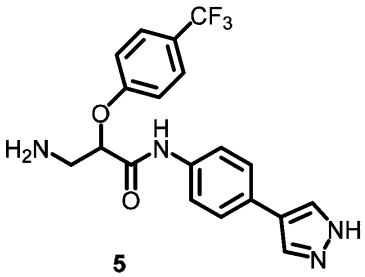
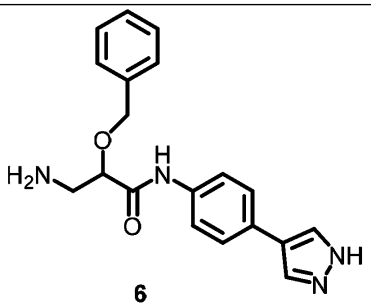
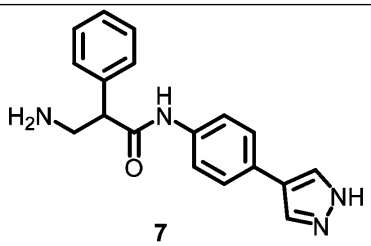
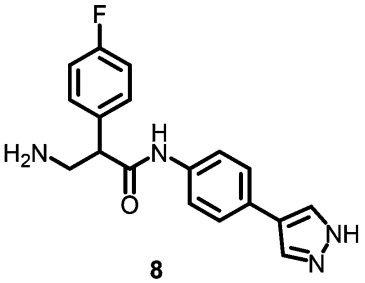
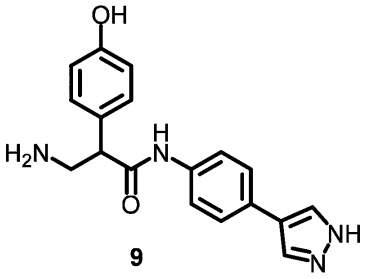
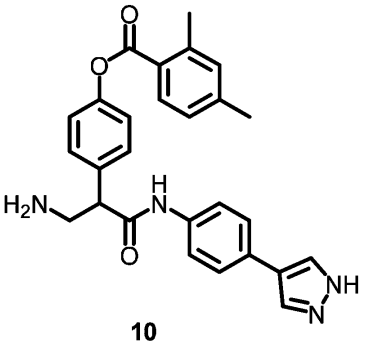
Ｒｈｏ関連タンパク質キナーゼ

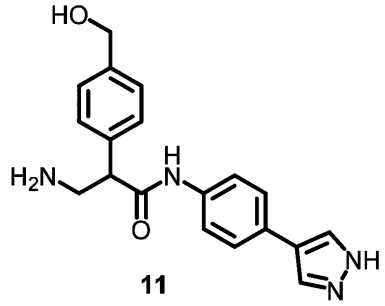
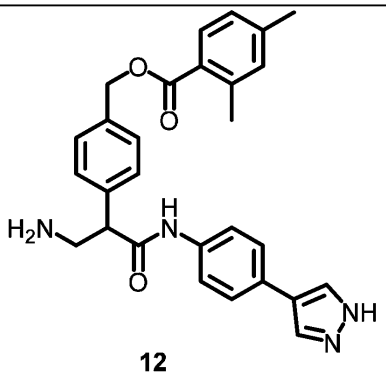
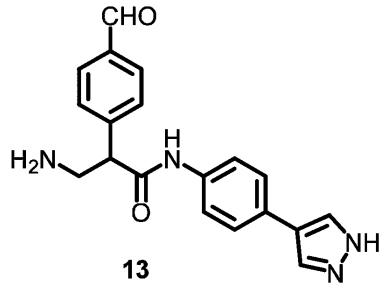
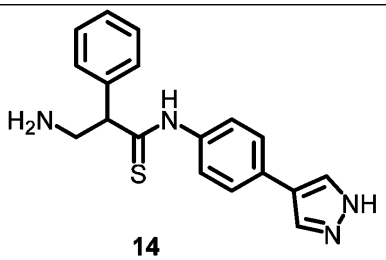
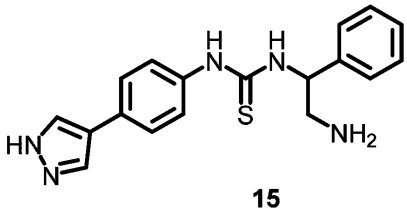
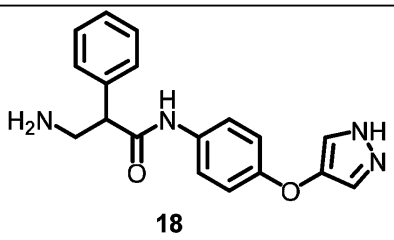
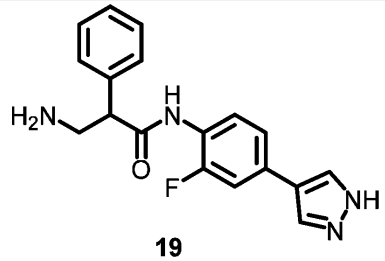
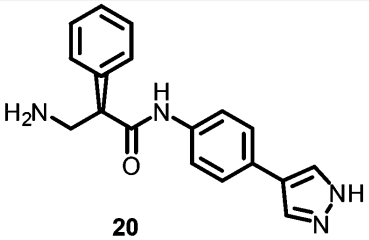
からなる群より選択される少なくとも１つである、医薬組成物。

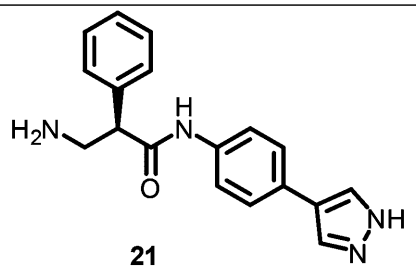
【請求項９】

（Ｉ）で示される化合物が、以下：

化合物コード	化合物1	化合物2
構造式	 1	 2

化合物コード	化合物3	化合物4
構造式	 3	 4
化合物コード	化合物5	化合物6
構造式	 5	 6
化合物コード	化合物7	化合物8
構造式	 7	 8
化合物コード	化合物9	化合物10
構造式	 9	 10

化合物コード	化合物11	化合物12
構造式	 11	 12
化合物コード	化合物13	化合物14
構造式	 13	 14
化合物コード	化合物15	化合物18
構造式	 15	 18
化合物コード	化合物19	化合物20
構造式	 19	 20

化合物コード	化合物21	
構造式	 21	

に示される、化合物１～化合物１５および化合物１８～化合物２１からなる群より選択される、請求項８に記載のキナーゼ抑制により利益を受ける生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用における使用のための医薬組成物。

【請求項１０】

生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用が、眼科に関する応用または肺に関する応用を含む、請求項８または９に記載のキナーゼ抑制により利益を受ける生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用における使用のための医薬組成物。

【請求項１１】

眼科に関する応用が、視神経の保護、並びに/または高眼圧、緑内障、網膜血管閉塞症、黄斑変性、黄斑浮腫、糖尿病網膜症、角膜内皮細胞損傷（ＦＥＣＤ）、および/もしくは角膜繊維症の予防および/または治療を含む、請求項１０に記載のキナーゼ抑制により利益を受ける生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用における使用のための医薬組成物。

【請求項１２】

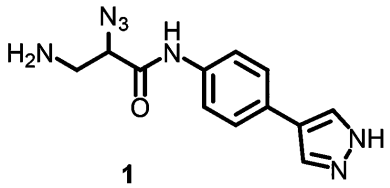
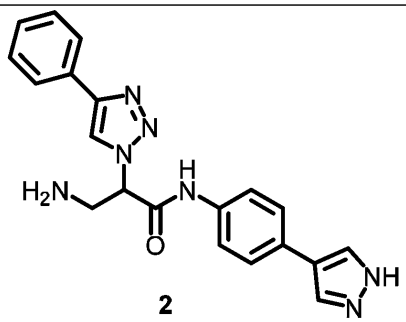
肺関連の応用が、肺高血圧症、慢性閉塞性肺疾患（ＣＯＰＤ）、特発性肺線維症（ＩＰＦ）、肺気腫、および/または肺がんの予防および／または治療を含む、請求項１０に記載のキナーゼ抑制により利益を受ける生体内（ｉｎ ｖｉｖｏ）に関する応用における使用のための医薬組成物。

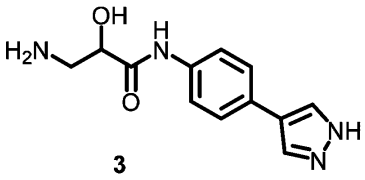
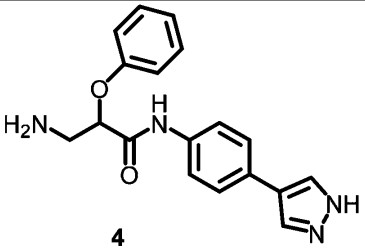
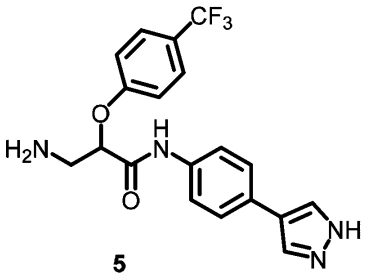
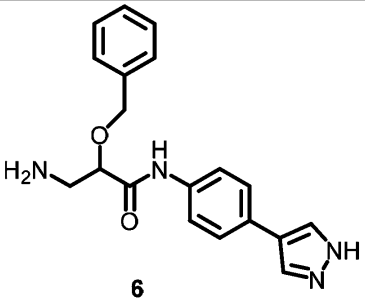
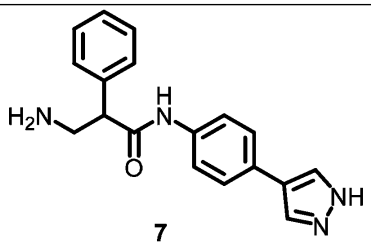
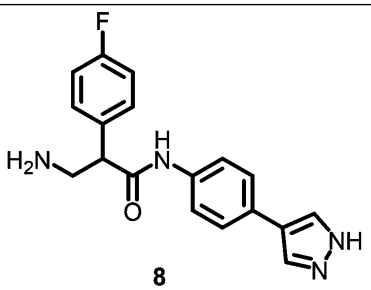
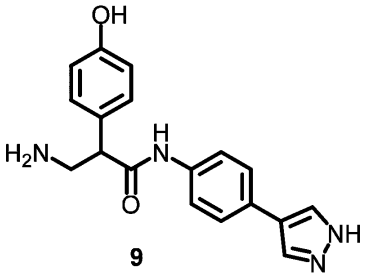
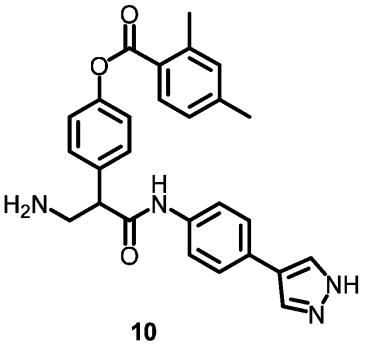
【請求項１３】

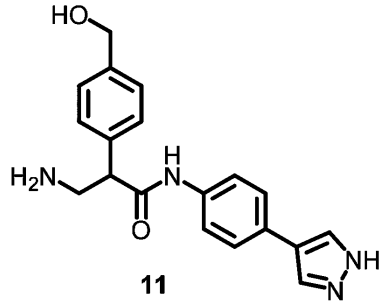
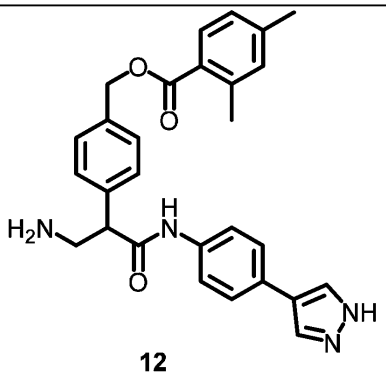
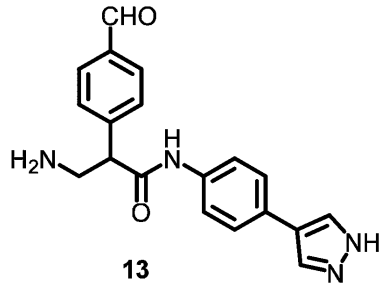
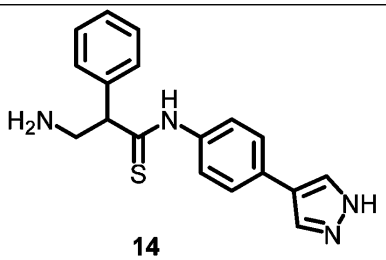
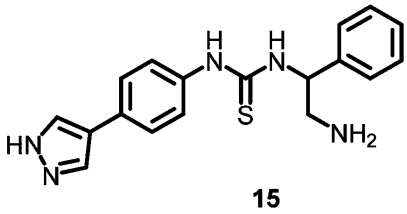
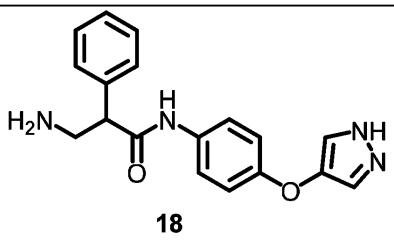
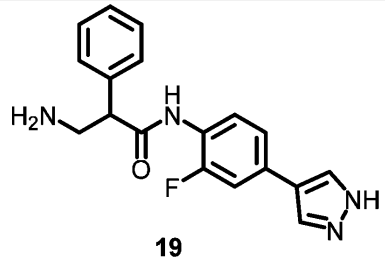
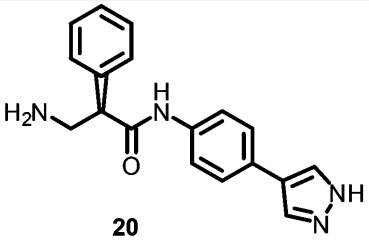
請求項１に記載の式（Ｉ）で示される化合物、化合物１６、もしくは化合物１７、またはその薬学的に許容される塩もしくはエステル、水和物、もしくは個別の光学異性体、個別のエナンチオマーの混合物、もしくはラセミ化合物を含む、眼圧下降における使用のための医薬組成物。

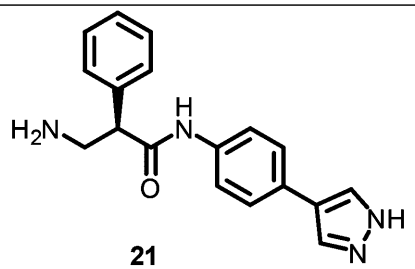
【請求項１４】

式（Ｉ）で示される化合物が、以下：

化合物コード	化合物1	化合物2
構造式	 1	 2

化合物コード	化合物3	化合物4
構造式	 3	 4
化合物コード	化合物5	化合物6
構造式	 5	 6
化合物コード	化合物7	化合物8
構造式	 7	 8
化合物コード	化合物9	化合物10
構造式	 9	 10

化合物コード	化合物11	化合物12
構造式	 11	 12
化合物コード	化合物13	化合物14
構造式	 13	 14
化合物コード	化合物15	化合物18
構造式	 15	 18
化合物コード	化合物19	化合物20
構造式	 19	 20

化合物コード	化合物21	
構造式	 21	

に示される、化合物１～化合物１５および化合物１８～化合物２１からなる群より選択される、請求項１３に記載の眼圧下降における使用のための医薬組成物。

【請求項１５】

緑内障の治療薬である、請求項１３または１４に記載の眼圧下降における使用のための医薬組成物。