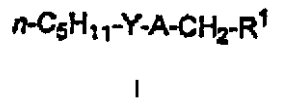
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年11月8日(2007.11.8)

【公表番号】特表2003-528042(P2003-528042A)
【公表日】平成15年9月24日(2003.9.24)
【出願番号】特願2001-536502(P2001-536502)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ　59/42　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/202　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ　59/46　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ　59/42
Ａ６１Ｋ　31/202
Ａ６１Ｐ　27/02
Ａ６１Ｐ　27/04
Ｃ０７Ｃ　59/46

【手続補正書】
【提出日】平成19年9月14日(2007.9.14)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】　ドライアイおよび眼の湿潤を必要とする他の障害の処置のための組成物であって、該組成物は、薬学的に受容可能なキャリアおよび以下の式Ｉ：
【化１】

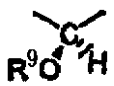


の１つ以上の化合物の薬学的有効量を含み、ここで：
R^1は、CO_2R、$CONR^2R^3$、CH_2OR^4、$CH_2NR^5R^6$、CH_2N_3、CH_2Hal、CH_2NO_2、CH_2SR^{20}、$COSR^{21}$、または２，３，４，５－テトラゾール－１－イルであり、ここで：
Ｒは、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは、CO_2Rは、薬学的に受容可能なエステル部分を形成する；
NR^2R^3、NR^5R^6は、同じかまたは異なり、遊離アミノ基または官能基で修飾されたアミノ基を含む；
OR^4は、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を含む；
Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩである；
R^{20}は、Ｈ、アルキル、アシルである；
R^{21}は、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは$COSR^{21}$は薬学的に受容可能なチオエステル部分を形成する；
Ａは、$L_1-A_1-L_2$、$L_1-A_2-L_2$、$L_3-A_2-L_4$、または$L_5-A_2-L_3$であり；

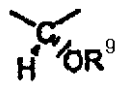
A_1はCH_2Ch_2であり；
A_2は、
【化２】



であり；
L_1は、CH_2-B-Dであり；
BおよびDは、同じかまたは異なり、CH_2CH_2、CH＝CH、またはC≡Cであり；
L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；
Kは、CH_2CH_2、CH＝CH、またはC≡Cであり；
L_3は、$CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CH$、$CH_2C\equiv C$、$CH=CHCH_2$、$C\equiv CCH_2$、またはCH＝C＝CHであり；
L_4は、$X-CH_2CH_2$であり；
Xは、$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、$CH_2CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv CCH_2$、$CH=CHCH_2CH_2$、$C\equiv CCH_2CH_2$、$CH_2CH=C=CH$、またはCH＝C＝CHCH_2であり；
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；そして
Yは、C（O）（すなわちカルボニル基）であるか、またはYは
【化３】



または
【化４】



であり、ここで、R^9Oは、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を構成する、組成物。

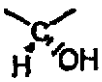
【請求項２】　請求項１に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、
R^1はCO_2Rであり、ここでRはHまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Aは、$L_1-A_1-L_2$、または$L_1-A_2-L_2$であり；
A_1は、CH_2CH_2であり；
A_2は、
【化５】



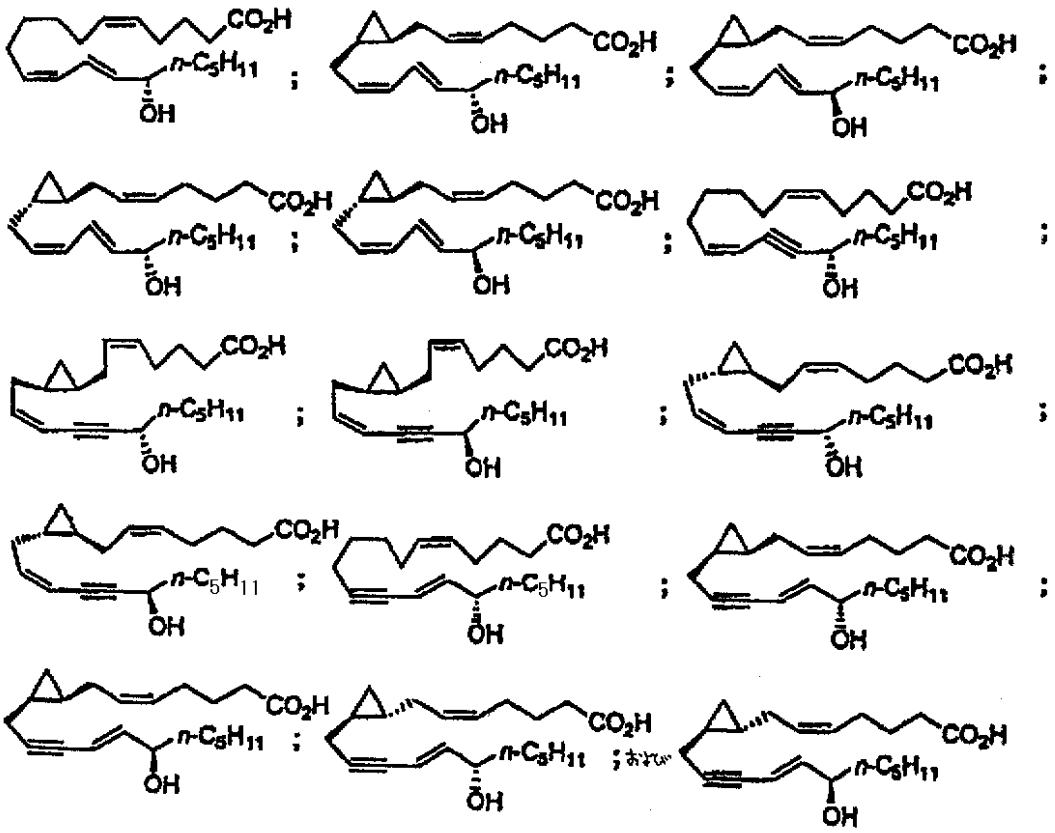
であり；
L_1は、CH_2-B-Dであり；
L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；
Bは、C≡C、またはｃｉｓ－ＣＨ＝ＣＨであり、そしてDはC≡Cまたはｔｒａｎｓ－ＣＨ＝ＣＨであり；
Kは、ｃｉｓ-ＣＨ＝ＣＨであり；そして
Yは、
【化６】



または
【化７】



である、組成物。
【請求項３】　請求項２に記載の組成物であって、ここで、前記化合物は、以下：
【化８】



からなる群から選択される、組成物。

【請求項４】　請求項１に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、

R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；

Ａは、$L_3-A_2-L_4$であり；

A_2は、

【化９】



であり；

L_3は、ｔｒａｎｓ－$CH_2CH=CH$、ｔｒａｎｓ－$CH=CHCH_2$、または$CH_2C\equiv C$であり；

L_4は、Ｘ－CH_2CH_2であり；

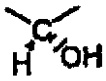
Ｘは、ｃｉｓ－$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、ｃｉｓ－$CH_2CH=CHCH_2$、またはｃｉｓ－$CH=CHCH_2CH_2$であり；そして

Ｙは、

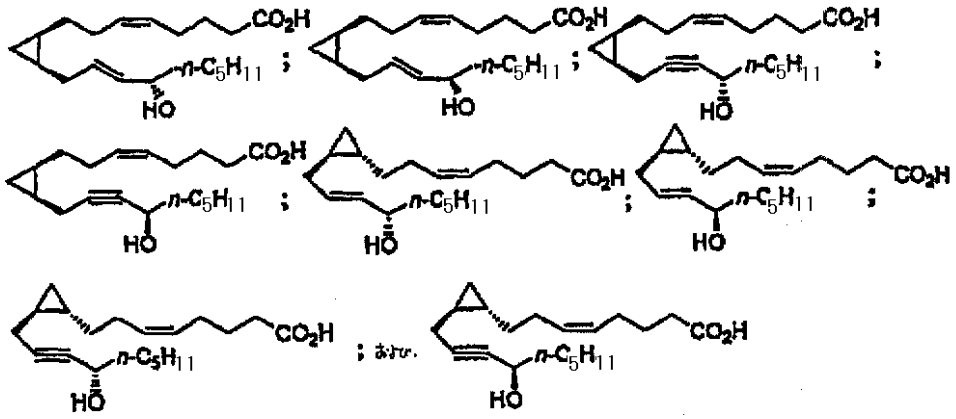
【化１０】



または
【化１１】



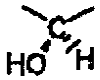
である、組成物。
【請求項５】　請求項４に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物は、以下：
【化１２】



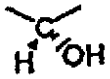
からなる群から選択される、組成物。
【請求項６】　請求項１に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、
R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Ａは、$L_5-A_2-L_3$であり；
A_2は、
【化１３】



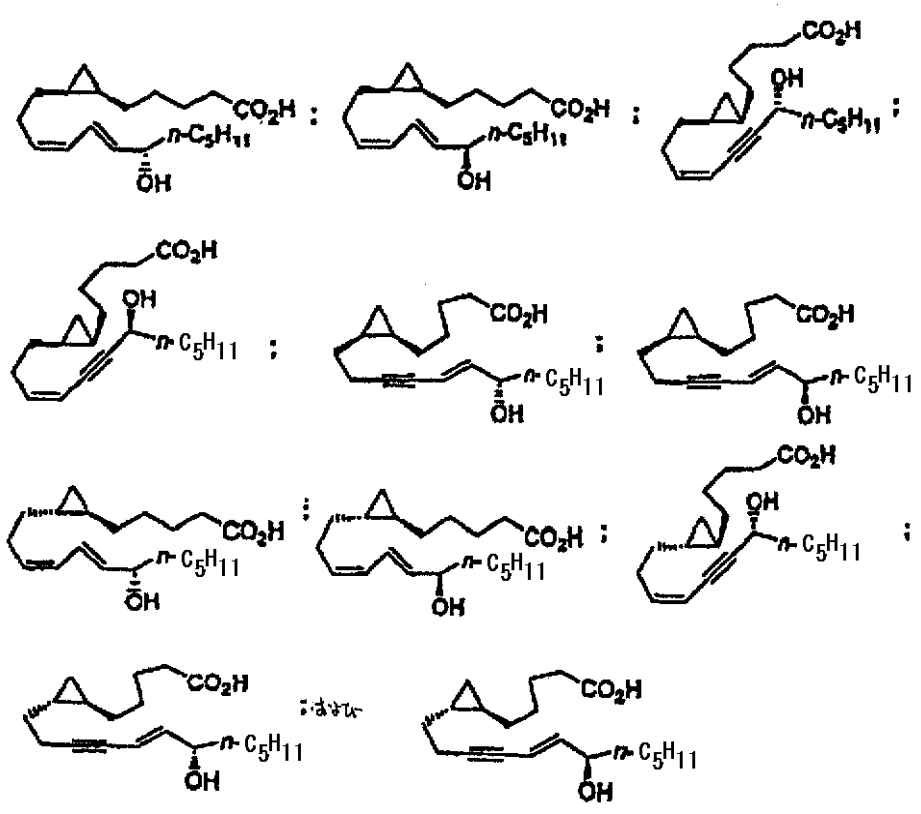
であり；
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；
L_3は、trans－$CH_2CH=CH$、trans－$CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv C$、または$CH_2CH_2CH_2$であり；
Bは、cis－$CH=CH$または$C\equiv C$であり；
Dは、trans－$CH=CH$または$C\equiv C$であり；そして
Yは、
【化１４】



または
【化１５】



である、組成物。
【請求項７】　請求項６に記載の組成物であって、ここで、前記化合物は、以下：
【化１６】

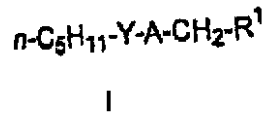


からなる群から選択される、組成物。

【請求項８】　前記組成物が、前記眼への局所的投与に適切である、請求項１に記載の組成物。

【請求項９】　哺乳動物におけるドライアイおよび眼の湿潤を必要とする他の障害を処置するための組成物であって、該組成物は、式Ｉ

【化１７】



Ｉ

に従う１つ以上の化合物を含み、ここで：

R^1は、CO_2R、$CONR^2R^3$、CH_2OR^4、$CH_2NR^5R^6$、CH_2N_3、CH_2Hal、CH_2NO_2、CH_2SR^{20}、$COSR^{21}$、または２，３，４，５－テトラゾール－１－イルであり、ここで：

Ｒは、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは、CO_2Rは、薬学的に受容可能なエステル部分を形成する；

NR^2R^3、NR^5R^6は、同じかまたは異なり、遊離アミノ基または官能基で修飾されたアミノ基を含む；

OR^4は、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を含む；

Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩである；

R^{20}は、Ｈ、アルキル、アシルである；

R^{21}は、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは$COSR^{21}$は、薬学的に受容可能なチオエステル部分を形成する；

Ａは、$L_1-A_1-L_2$、$L_1-A_2-L_2$、$L_3-A_2-L_4$、または$L_5-A_2-L_3$であり；

A_1はCH_2Ch_2であり；

A_2は、

【化１８】



であり；

L_1は、CH_2-B-Dであり；

ＢおよびＤは、同じかまたは異なり、CH_2CH_2、Ｃ＝Ｃ、またはＣ≡Ｃであり；

L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；

Ｋは、CH_2CH_2、Ｃ＝Ｃ、またはＣ≡Ｃであり；

L_3は、$CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CH$、$CH_2C\equiv C$、$CH=CHCH_2$、$C\equiv CCH_2$、または$CH=C=CH$であり；

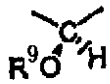
L_4は、$X-CH_2CH_2$であり；

Ｘは、$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、$CH_2CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv CCH_2$、$CH=CHCH_2CH_2$、$C\equiv CCH_2CH_2$、$CH_2CH=C=CH$、または$CH=C=CHCH_2$であり；

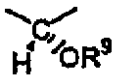
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；そして

Ｙは、Ｃ（Ｏ）（すなわちカルボニル基）であるか、またはＹは

【化１９】



または
【化２０】



であり、ここで、R^9Oは、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を構成する、組成物。

【請求項１０】　前記哺乳動物がヒトであり、そして前記組成物が局所投与用である、請求項９に記載の組成物。

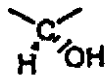
【請求項１１】　請求項９に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、
R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Ａは、$L_1-A_1-L_2$、または$L_1-A_2-L_2$であり；
A_1は、CH_2CH_2であり；
A_2は、
【化２１】



であり；
L_1は、CH_2-B-Dであり；
L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；
Ｂは、Ｃ≡Ｃ、またはｃｉｓ－ＣＨ＝ＣＨであり、そしてＤはＣ≡Ｃまたはｔｒａｎｓ－ＣＨ＝ＣＨであり；
Ｋは、ｃｉｓ-ＣＨ＝ＣＨであり；そして
Ｙは、
【化２２】



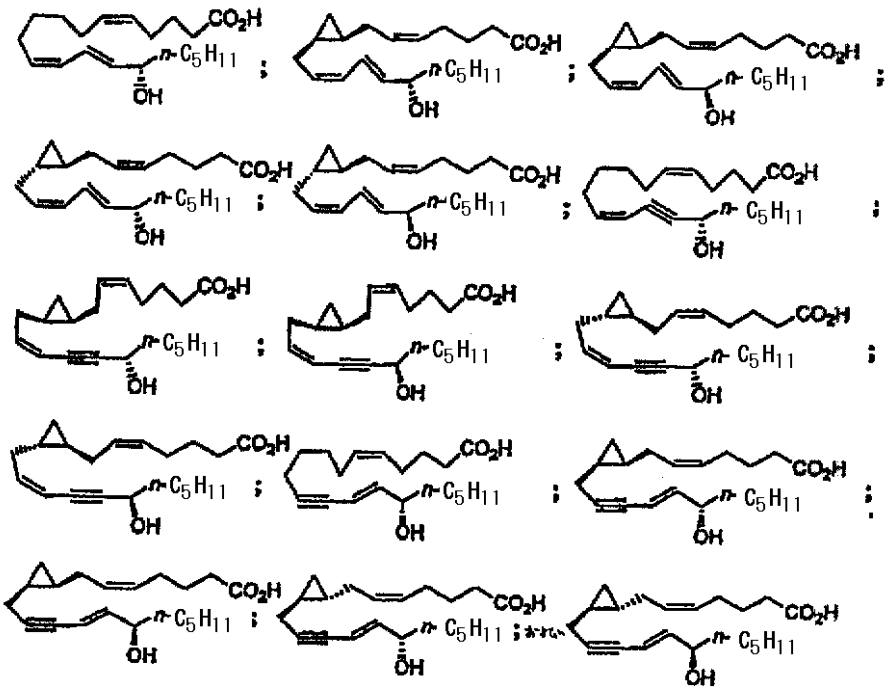
または
【化２３】



である、組成物。

【請求項１２】　請求項１１に記載の組成物であって、ここで、前記化合物が、以下：

【化２４】



からなる群から選択される、組成物。

【請求項１３】　請求項９に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、

R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；

Ａは、$L_3-A_2-L_4$であり；

A_2は、

【化２５】



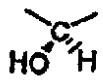
であり；

L_3は、ｔｒａｎｓ－$CH_2CH=CH$、ｔｒａｎｓ－$CH=CHCH_2$、または$CH_2C\equiv C$であり；

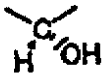
L_4は、Ｘ－CH_2CH_2であり；

Ｘは、ｃｉｓ－$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、ｃｉｓ－$CH_2CH=CHC$

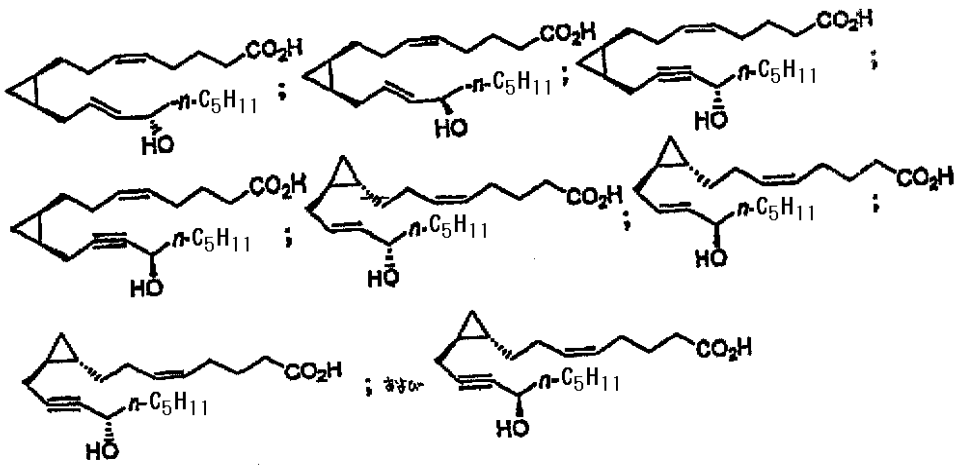
H_2、またはｃｉｓ－ＣＨ＝ＣＨＣH_2ＣH_2であり；そして
Ｙは、
【化２６】



または
【化２７】



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、前記化合物は、以下：
【化２８】



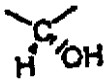
からなる群から選択される、組成物。
【請求項１５】　請求項９に記載の組成物であって、ここで、前記式Ｉの化合物について、
R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Ａは、$L_5－A_2－L_3$であり；
A_2は、
【化２９】



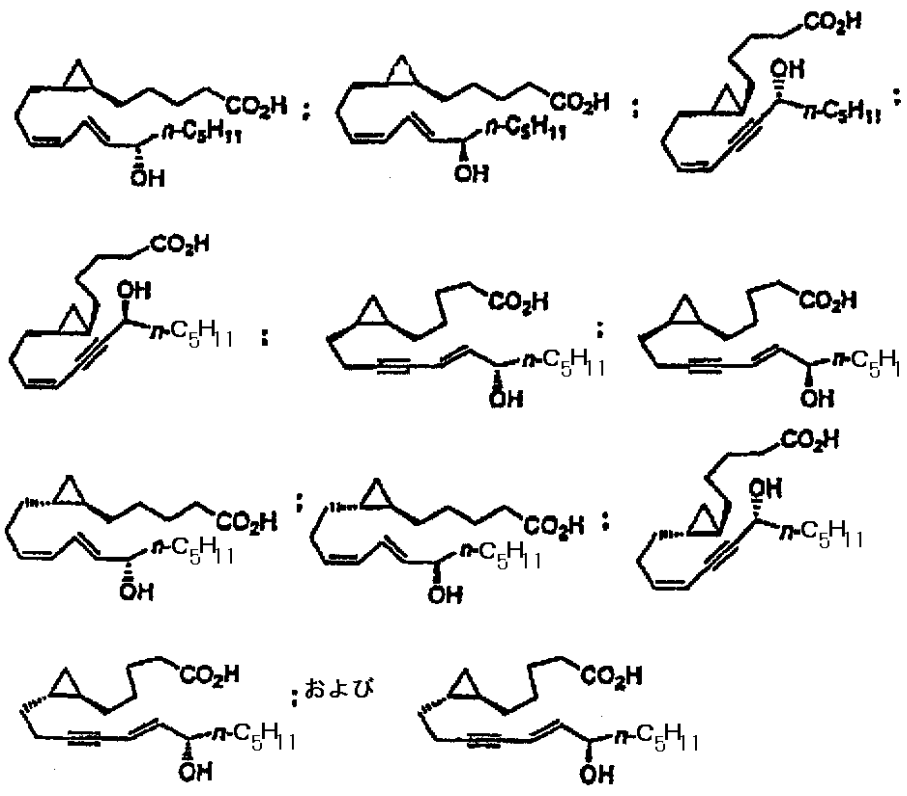
であり；
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；
L_3は、ｔｒａｎｓ－$CH_2CH=CH$、ｔｒａｎｓ－$CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv C$、または$CH_2CH_2CH_2$であり；
Ｂは、ｃｉｓ－ＣＨ＝ＣＨまたはＣ≡Ｃであり；
Ｄは、ｔｒａｎｓ－ＣＨ＝ＣＨまたはＣ≡Ｃであり；そして
Ｙは、
【化３０】



または
【化３１】



である、組成物。
【請求項１６】　請求項１５に記載の組成物であって、ここで、前記化合物は、以下：
【化３２】

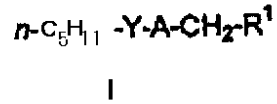


からなる群から選択される、組成物。

【請求項１７】　請求項９に記載の組成物であって、ここで、前記ドライアイおよび前記眼の湿潤を必要とする他の障害が、屈折矯正手術に関連するドライアイの症状である、組成物。

【請求項１８】　以下の式Ｉ：

【化３３】



Ｉ

の化合物であって、ここで：

R^1は、CO_2R、$CONR^2R^3$、CH_2OR^4、$CH_2NR^5R^6$、CH_2N_3、CH_2Hal、CH_2NO_2、CH_2SR^{20}、$COSR^{21}$、または２，３，４，５－テトラゾール－１－イルであり、ここで：

Ｒは、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは、CO_2Rは、薬学的に受容可能なエステル部分を形成する；

NR^2R^3、NR^5R^6は、同じかまたは異なり、遊離アミノ基または官能基で修飾されたアミノ基を含む；

OR^4は、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を含む；

Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩである；

R^{20}は、Ｈ、アルキル、アシルである；

R^{21}は、Ｈまたは薬学的に受容可能なカチオンであるか、あるいは$COSR^{21}$は、薬学的に受容可能なチオエステル部分を形成する；

Ａは、$L_1-A_2-L_2$、$L_3-A_2-L_4$、または$L_5-A_2-L_3$であり；

A_2は、

【化３４】



であり；

L_1は、CH_2-B-Dであり；

ＢおよびＤは、同じかまたは異なり、CH_2CH_2、$CH=CH$、または$C\equiv C$であり；

L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；

Ｋは、CH_2CH_2、$CH=CH$、または$C\equiv C$であり；

L_3は、$CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CH$、$CH_2C\equiv C$、$CH=CHCH_2$、$C\equiv CCH_2$、または$CH=C=CH$であり；

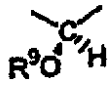
L_4は、$X-CH_2CH_2$であり；

Ｘは、$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、$CH_2CH_2CH_2CH_2$、$CH_2CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv CCH_2$、$CH=CHCH_2CH_2$、$C\equiv CCH_2CH_2$、$CH_2CH=C=CH$、または$CH=C=CHCH_2$であり；

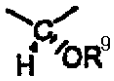
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；そして

Ｙは、Ｃ（Ｏ）（すなわちカルボニル基）であるか、またはＹは

【化３５】



または
【化３６】

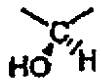


であり、ここで、R^9Oは、遊離水酸基または官能基で修飾された水酸基を構成する、化合物。

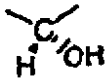
【請求項１９】　請求項１８に記載の化合物であって、ここで：
R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Ａは、$L_1-A_2-L_2$であり；
A_2は、
【化３７】



であり；
L_1は、CH_2-B-Dであり；
L_2は、$CH_2-K-CH_2CH_2$であり；
Ｂは、Ｃ≡Ｃ、またはｃｉｓ－ＣＨ＝ＣＨであり、そしてＤはＣ≡Ｃまたはｔｒａｎｓ－ＣＨ＝ＣＨであり；
Ｋは、ｃｉｓ-ＣＨ＝ＣＨであり；そして
Ｙは、
【化３８】

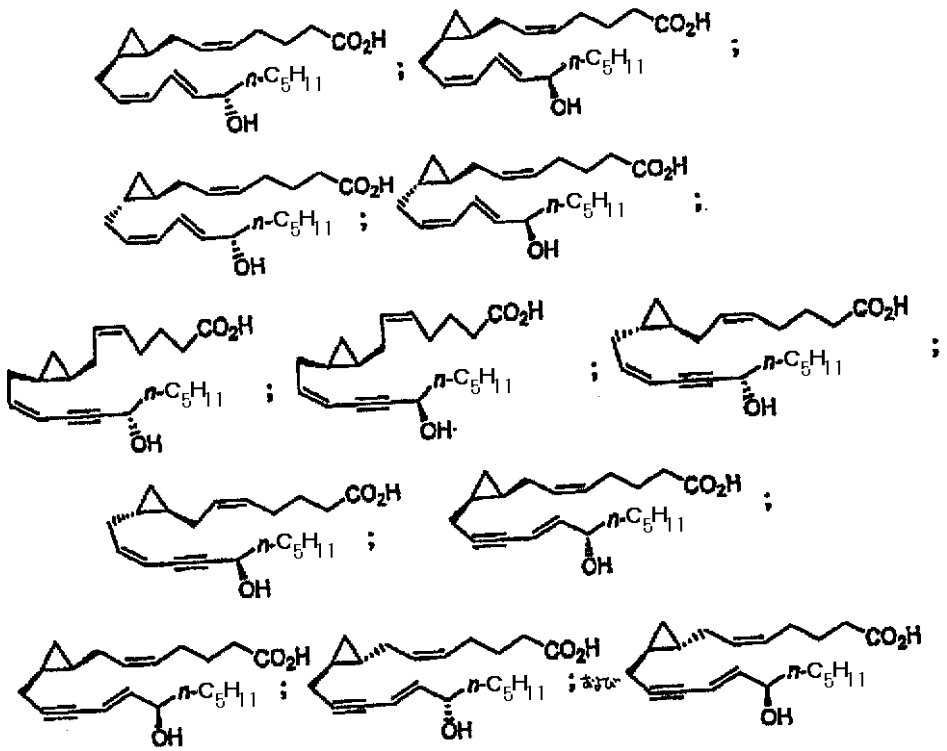


または
【化３９】



である、化合物。

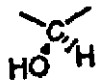
【請求項２０】　請求項１９に記載の化合物であって、該化合物は、以下：
【化４０】



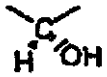
からなる群から選択される、化合物。
【請求項２１】　請求項１８に記載の化合物であって、ここで：
R^1はCO_2Rであり、ここでＲはＨまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Ａは、$L_3-A_2-L_4$であり；
A_2は、
【化４１】



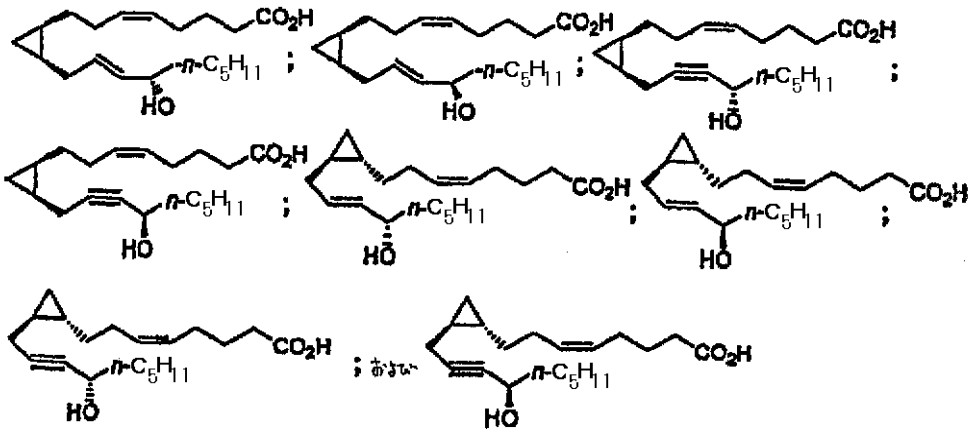
であり；
L_3は、ｔｒａｎｓ－$CH_2CH=CH$、ｔｒａｎｓ－$CH=CHCH_2$、または$CH_2C\equiv C$であり；
L_4は、Ｘ－CH_2CH_2であり；
Ｘは、ｃｉｓ－$CH_2CH_2CH=CH$、$CH_2CH_2C\equiv C$、ｃｉｓ－$CH_2CH=CHCH_2$、またはｃｉｓ－$CH=CHCH_2CH_2$であり；そして
Ｙは、
【化４２】



または
【化４３】



である、化合物。
【請求項２２】　請求項２１に記載の化合物であって、該化合物は、以下：
【化４４】

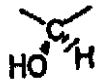


からなる群から選択される、化合物。
【請求項２３】　請求項１８に記載の化合物であって、ここで：
R^1はCO_2Rであり、ここでRはHまたは眼に受容可能なカチオン塩であるか、あるいはCO_2Rは、眼に受容可能なエステル部分を形成し；
Aは、$L_5-A_2-L_3$であり；
A_2は、
【化４５】

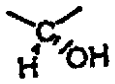


であり；
L_5は、CH_2CH_2-B-Dであり；
L_3は、trans－$CH_2CH=CH$、trans－$CH=CHCH_2$、$CH_2C\equiv C$、または$CH_2CH_2CH_2$であり；
Bは、cis－$CH=CH$または$C\equiv C$であり；

Ｄは、ｔｒａｎｓ－ＣＨ＝ＣＨまたはＣ≡Ｃであり；そして
Ｙは、
【化４６】

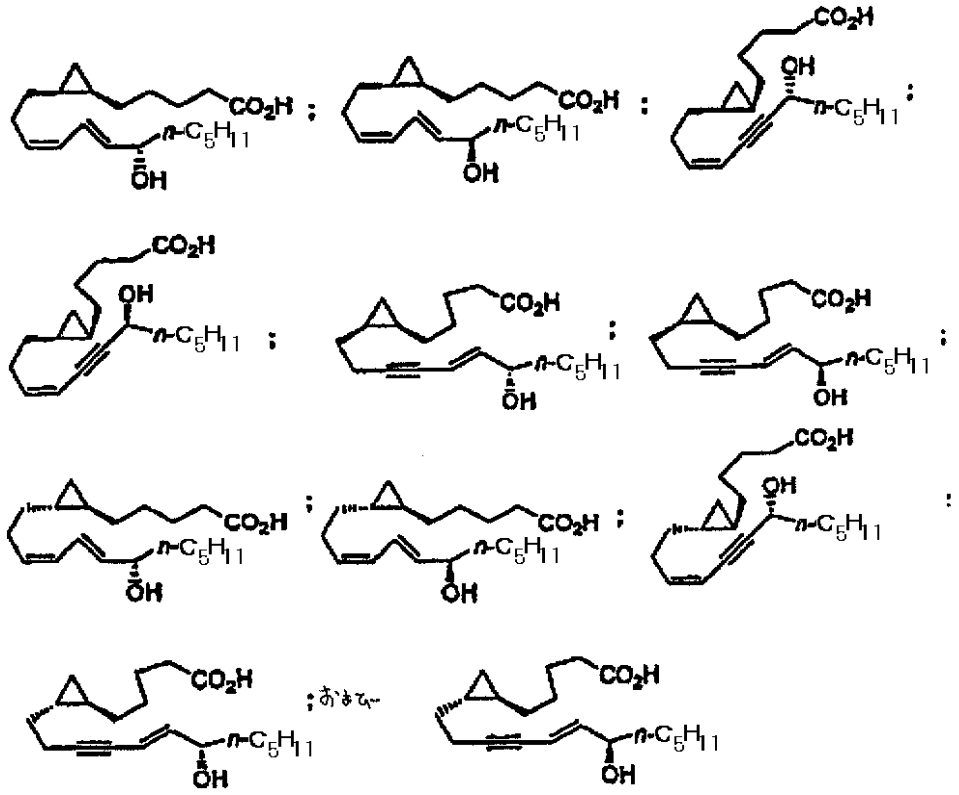


または
【化４７】



である、化合物。

【請求項２４】　請求項２３に記載の化合物であって、ここで、該化合物は、以下：
【化４８】



からなる群から選択される、化合物。