

【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26年5月8日(2014.5.8)

【公表番号】特表2013-523739(P2013-523739A)

【公表日】平成25年6月17日(2013.6.17)

【年通号数】公開・登録公報2013-031

【出願番号】特願2013-502678(P2013-502678)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

C 0 7 H 19/167 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 45/00

C 0 7 H 19/167

【手続補正書】

【提出日】平成26年3月24日(2014.3.24)

【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

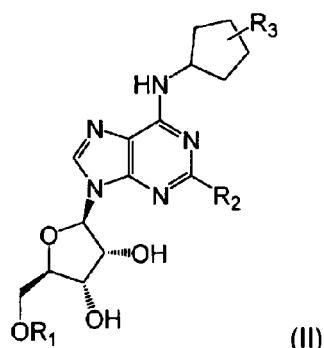
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I I

【化1】



(式中、R₁が、- (C O) C₁ ~ C₆アルキル、- (C O) C H (ハロ) ₂、- (C O) フェニル、a - (C O) C₁ ~ C₁₀の任意選択により分枝した脂肪族、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂) _n OHで任意選択により置換された- (C O) C₃ ~ C₈シクロアルキル、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂) _n OHで任意選択により置換された- (C O) アリール、および、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂) _n OHで任意選択により置換されたa - (C O) C₃ ~ C₇複素環から選択され；

R₂が、- Hおよびハロから選択され；

R₃が、ヒドロキシ、- O (C O) C H (ハロ) ₂、- O (C O) (C H₂) ₂ C H₃、- O (C O) C H (C H₃) ₂、- O (C O) C H₂ C (C H₃) ₃から選択される)

の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩であって、

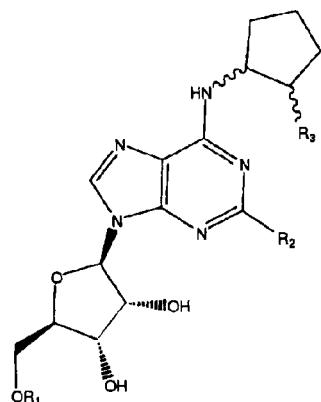
眼内圧を低下させ、ヒト対象において眼内圧上昇により引き起こされた疾患および病態を治療するために使用され、

前記化合物または薬学的に許容できるそれらの塩の有効量が前記ヒト対象の罹患眼に投与される、化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項2】

構造：

【化2】

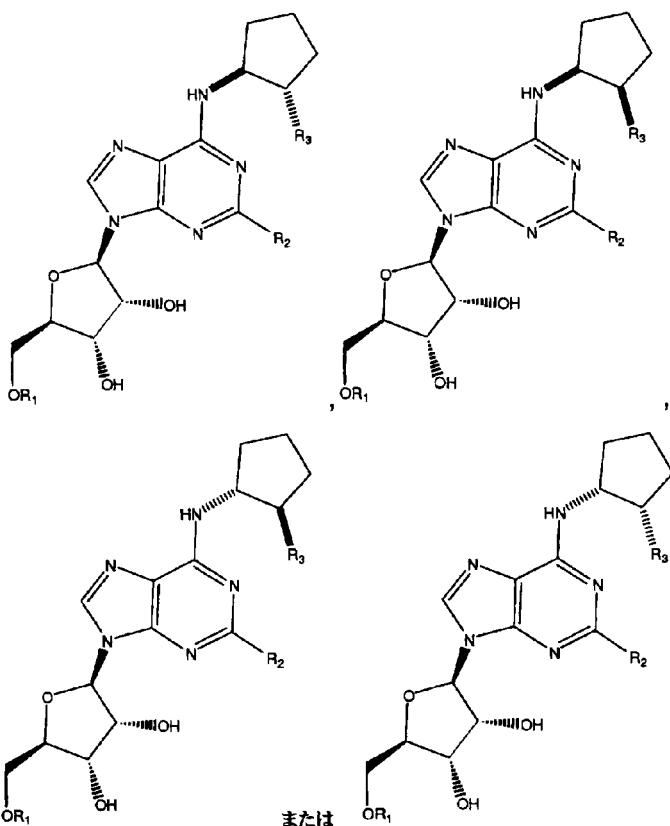


を有する、

請求項1に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項3】

【化3】



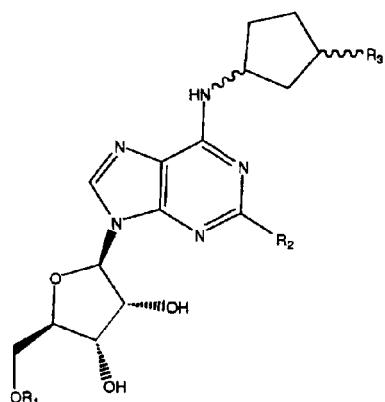
から選択される構造を有する、

請求項2に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項4】

構造：

【化4】



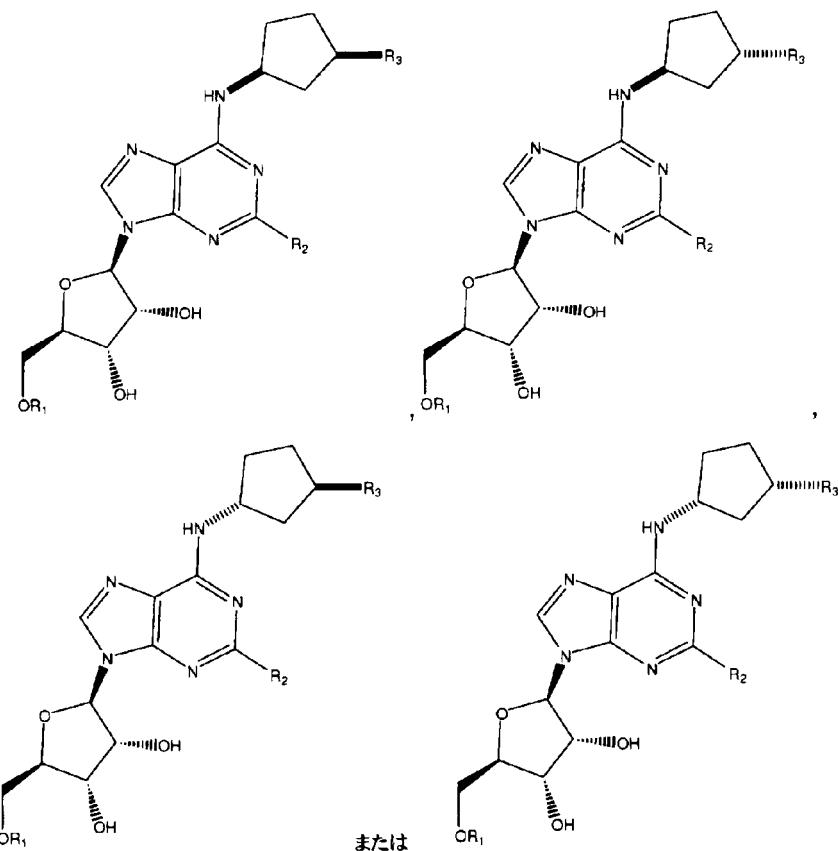
を有する、

請求項1に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項5】

構造：

【化5】



を有する、

請求項4に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項6】

R₁ が、 - (C O) C H (C H₃)₂、 - (C O) C H₂ C (C H₃)₃、 - (C O) C (C H₃)₃、 - (C O) (C H₂)₂ C H₃、 - (C O) C H₂ C H₃、 - (C O) フェニル、a - (C O) C₁ ~ C₁₀ の任意選択により分枝した脂肪族、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である - (C H₂)_n O Hで任意選択により置換された - (C O) C₃ ~ C₈ シクロアルキル、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である - (C H₂)_n O Hで任意選択により置換された - (C O) アリール、および、1つ以上の

ヒドロキシもしくは n が 1 ~ 6 である $- (C H_2)_n O H$ で任意選択により置換された a - $(C O) C_3 \sim C_7$ 複素環から選択され; R_2 が、-H およびハロから選択され; R_3 が、-H である、

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R_1 が、- $(C O) C H (C H_3)$ 、または $- (C O) (C H_2)_6 C H_3$ から選択される、

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R_2 が、-H である、

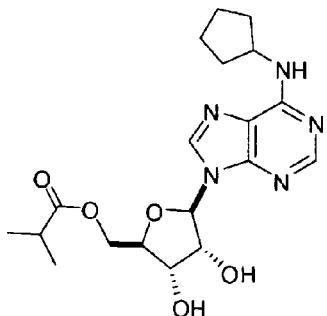
請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

前記式 II の化合物が、

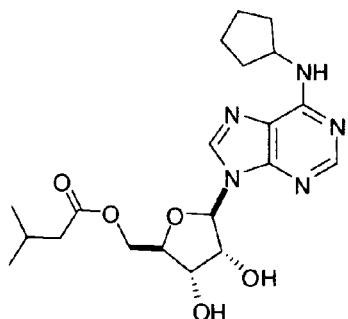
式 2 a :

【化 6】



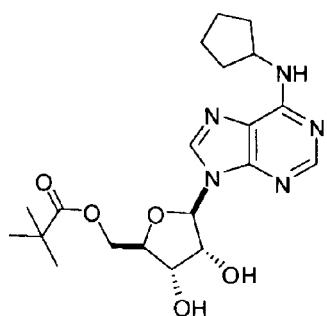
式 2 b :

【化 7】



式 2 c :

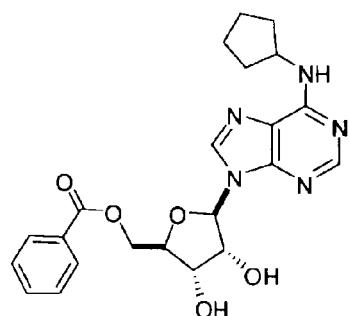
【化 8】



および

式 2 h :

【化9】



の化合物から選択される、

請求項1に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項10】

眼内圧を低下させ、ヒト対象において眼内圧上昇により引き起こされた疾患および病態を治療するために使用するための眼用製薬組成物であつて、

請求項1～9のいずれか一項に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩と、

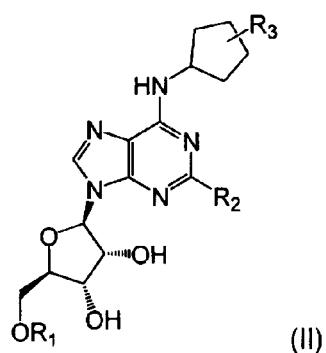
薬学的に許容できる媒体または賦形剤を含み、

前記化合物または薬学的に許容できるそれらの塩の有効量が前記ヒト対象の罹患眼に投与される、眼用製薬組成物。

【請求項11】

式II

【化10】



(式中、R₁が、-(CO)CH(CH₃)₂、-(CO)CH₂C(CH₃)₃、-(CO)C(CH₃)₃、-(CO)(CH₂)₂CH₃、-(CO)CH₂CH₃、-(CO)フェニル、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1～6である-(CH₂)_nOHで任意選択により置換された-(CO)-シクロプロピル、-シクロブチル、-シクロペニチル、-シクロヘプチル、またはシクロオクチル、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1～6である-(CH₂)_nOHで任意選択により置換された-(CO)アリール、および、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1～6である-(CH₂)_nOHで任意選択により置換されたa-(CO)C₃～C₇複素環から選択され；

R₂が、-Hおよびハロから選択され；

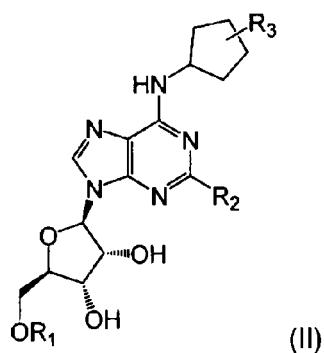
R₃が、-Hである)

の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項12】

式II

【化11】



(式中、R₁が、- (C O) C₁ ~ C₆ アルキル、- (C O) C H (ハロ) ₂、- (C O) フェニル、a - (C O) C₁ ~ C₁₀ の任意選択により分枝した脂肪族、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂)_n OHで任意選択により置換された- (C O) C₃ ~ C₈ シクロアルキル、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂)_n OHで任意選択により置換された- (C O) アリール、および、1つ以上のヒドロキシ、もしくはnが1 ~ 6である- (C H₂)_n OHで任意選択により置換されたa - (C O) C₃ ~ C₇ 複素環から選択され；

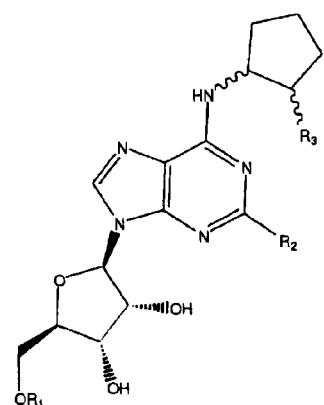
R₂が、- Hおよびハロから選択され；

R₃が、ヒドロキシ、- O (C O) C H (ハロ) ₂、- O (C O) (C H₂)₂ C H₃、- O (C O) C H (C H₃)₂、- O (C O) C H₂ C (C H₃)₃ から選択される)の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項13】

構造：

【化12】



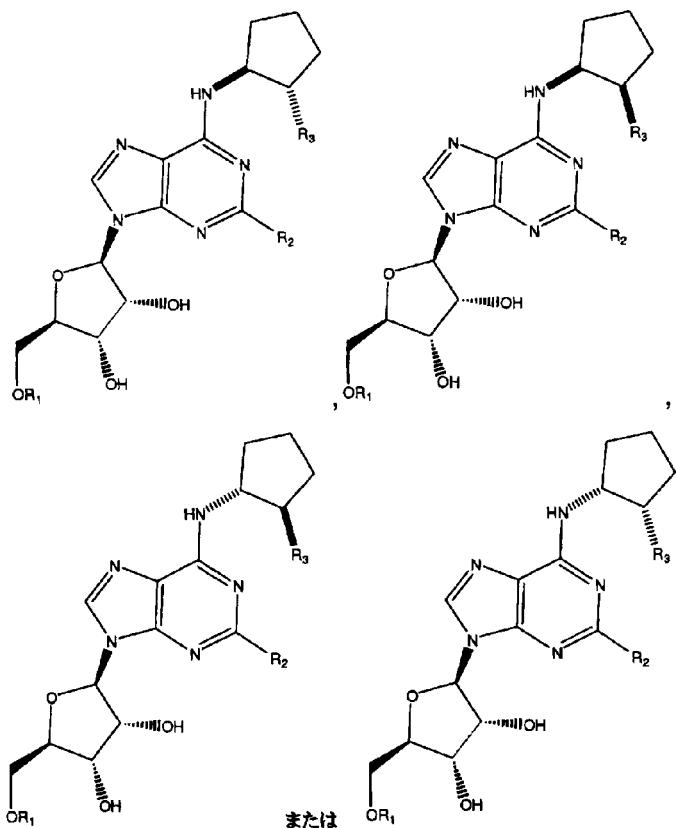
を有する、

請求項12に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項14】

構造：

【化13】



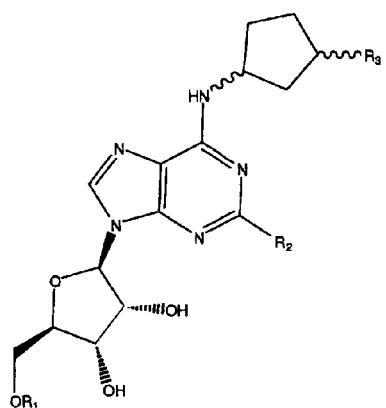
を有する、

請求項13に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項15】

構造：

【化14】



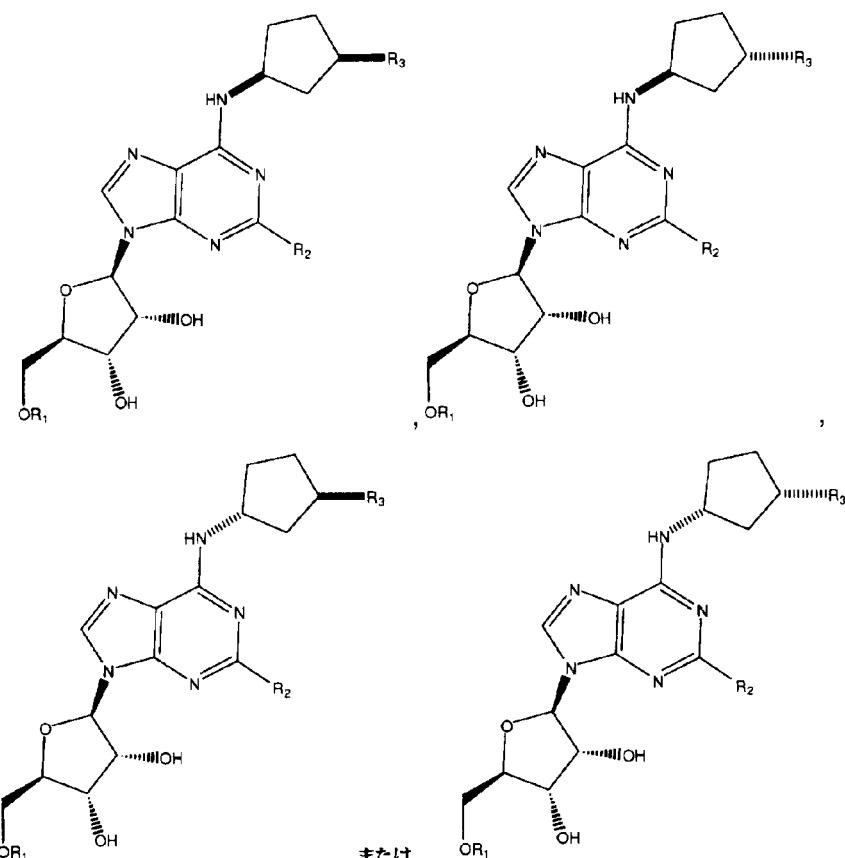
を有する、

請求項12に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項16】

構造：

【化15】



を有する、

請求項15に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項17】

R₁が、-(CO)CH(CH₃)₂である、

請求項11～16のいずれか一項に記載の式IIの化合物。

【請求項18】

R₂が、-Hである、

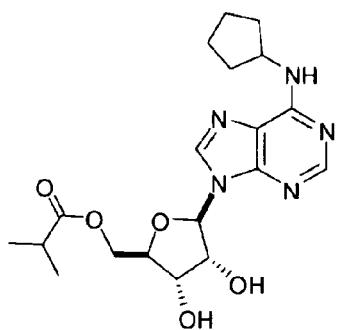
請求項11～17のいずれか一項に記載の式IIの化合物。

【請求項19】

前記式IIの化合物が、

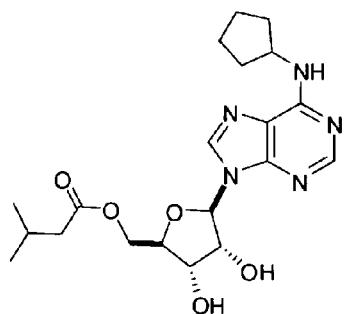
式2a：

【化16】

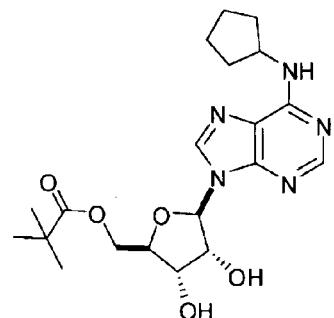


式2b：

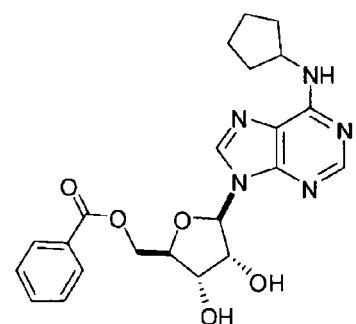
【化17】



式2c:
【化18】



、および
式2h:
【化19】



の化合物から選択される、

請求項11に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項20】

医薬としての使用のための請求項11～19のいずれか一項に記載の式IIの化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。