

【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

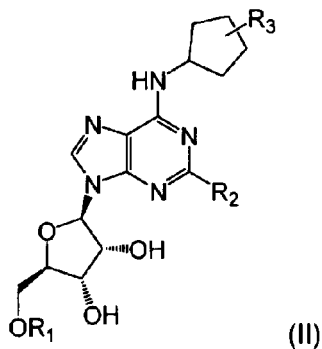
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I I

【化 1】



(式中、 $R_1$  が、 $-(CO)C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CO)CH$  (ハロ) $_2$ 、 $-(CO)$  フェニル、 $a-(CO)C_1 \sim C_{10}$  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  $-(CH_2)_n OH$  で任意選択により置換された  $-(CO)C_3 \sim C_8$  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  $-(CH_2)_n OH$  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  $-(CH_2)_n OH$  で任意選択により置換された  $a-(CO)C_3 \sim C_7$  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、ヒドロキシ、 $-O(CO)CH$  (ハロ) $_2$ 、 $-O(CO)(CH_2)_2 CH_3$ 、 $-O(CO)CH(CH_3)_2$ 、 $-O(CO)CH_2 C(CH_3)_3$  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、

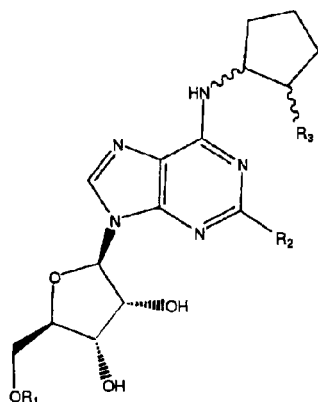
眼内圧を低下させ、ヒト対象において眼内圧上昇により引き起こされた疾患および病態を治療するために使用され、

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】

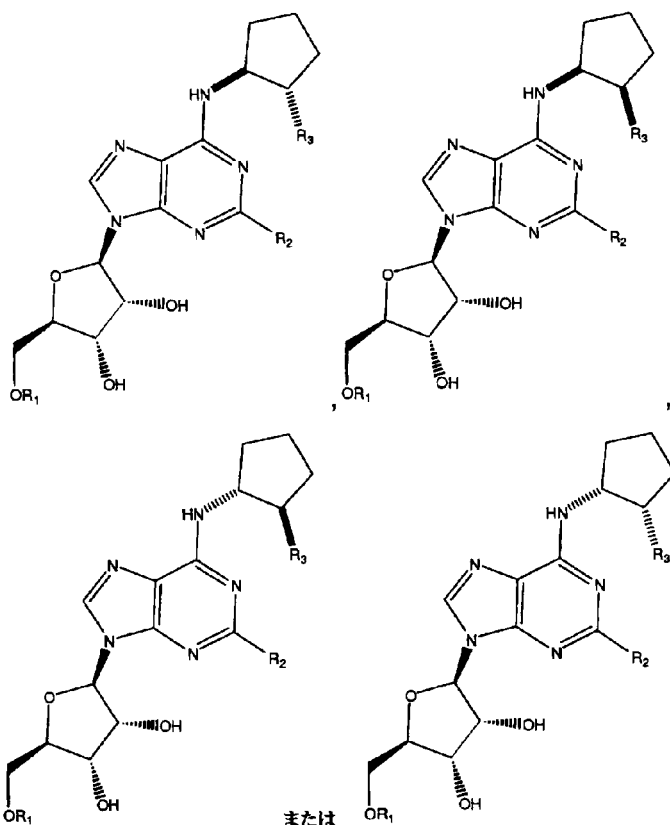


を有する、

請求項 1 に記載の式 I 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】



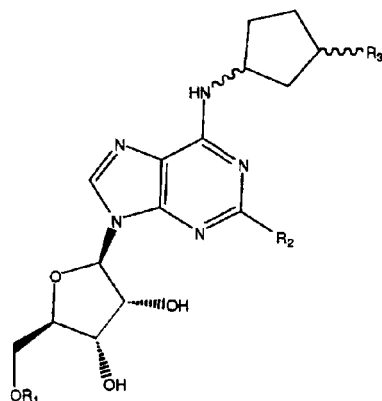
から選択される構造を有する、

請求項 2 に記載の式 I 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】



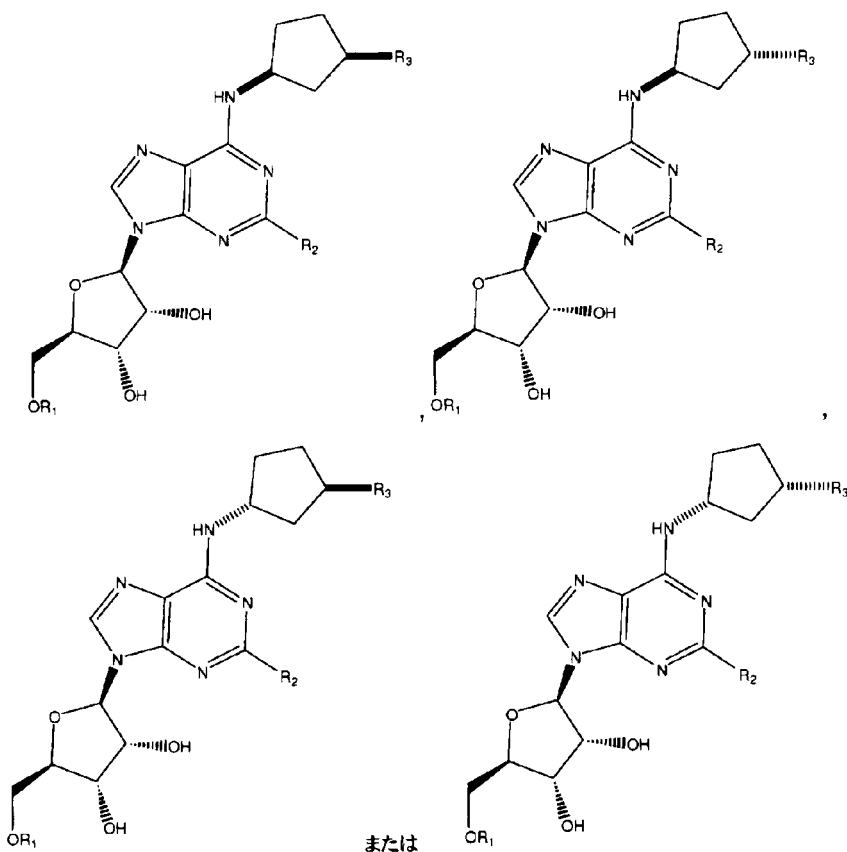
を有する、

請求項 1 に記載の式 I I 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 I I 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】

$R_1$  が、 $-(CO)CH(CH_3)_2$ 、 $-(CO)CH_2C(CH_3)_3$ 、 $-(CO)C(CH_3)_3$ 、 $-(CO)(CH_2)_2CH_3$ 、 $-(CO)CH_2CH_3$ 、 $-(CO)$ フェニル、 $\alpha-(CO)C_{1\sim C_{10}}$ 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  $-(CH_2)_nOH$  で任意選択により置換された  $-(CO)C_{3\sim C_8}$ 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  $-(CH_2)_nOH$  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  $-(CH_2)_nOH$  で任意選択により置換された  $a$  -  $(CO)C_3 \sim C_7$  複素環から選択され；  $R_2$  が、 $-H$  およびハロゲンから選択され；  $R_3$  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、 $-(CO)CH(CH_3)_2$  または  $-(CO)(CH_2)_6CH_3$  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、

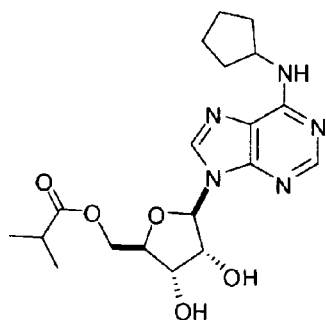
請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

前記式 I I の化合物が、

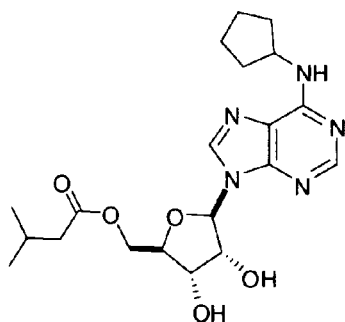
式 2 a :

【化 6】



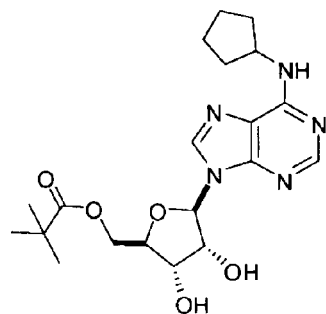
式 2 b :

【化 7】



式 2 c :

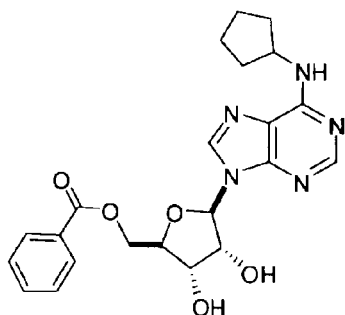
【化 8】



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 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 0】

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って、

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

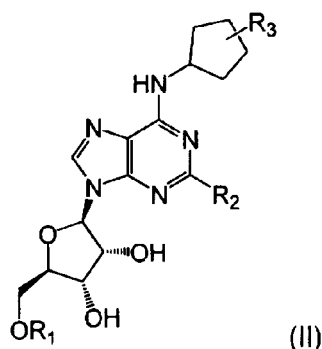
薬学的に許容できる媒体または賦形剤を含み、

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 1 1】

式 I I

## 【化 1 0】



(式中、 $R_1$  が、 $-(CO)CH(CH_3)_2$ 、 $-(CO)CH_2C(CH_3)_3$ 、 $-(CO)C(CH_3)_3$ 、 $-(CO)(CH_2)_2CH_3$ 、 $-(CO)CH_2CH_3$ 、 $-(CO)$ 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  $-(CH_2)_nOH$  で任意選択により置換された  $-(CO)$ -シクロプロピル、 $-(CO)$ -シクロブチル、 $-(CO)$ -シクロペンチル、 $-(CO)$ -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  $-(CH_2)_nOH$  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  $-(CH_2)_nOH$  で任意選択により置換された  $\alpha$ - $-(CO)C_3 \sim C_7$  複素環から選択され；

$R_2$  が、 $-H$  およびハロから選択され；

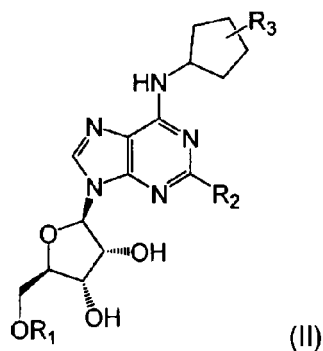
$R_3$  が、 $-H$  である)

の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 2】

式 I I

## 【化 1 1】



(式中、 $R_1$  が、 $-(CO)C_1 \sim C_6$  アルキル、 $-(CO)CH$  (ハロ)  $_2$ 、 $-(CO)$  フェニル、 $\alpha$ - $-(CO)C_1 \sim C_{10}$  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  $-(CH_2)_n OH$  で任意選択により置換された  $-(CO)C_3 \sim C_8$  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  $-(CH_2)_n OH$  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  $-(CH_2)_n OH$  で任意選択により置換された  $\alpha$ - $-(CO)C_3 \sim C_7$  複素環から選択され；

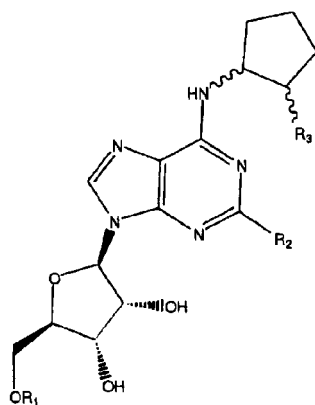
$R_2$  が、 $-H$  およびハロから選択され；

$R_3$  が、ヒドロキシ、 $-O(CO)CH$  (ハロ)  $_2$ 、 $-O(CO)(CH_2)_2 CH_3$ 、 $-O(CO)CH(CH_3)_2$ 、 $-O(CO)CH_2 C(CH_3)_3$  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 1 3】

構造：

## 【化 1 2】



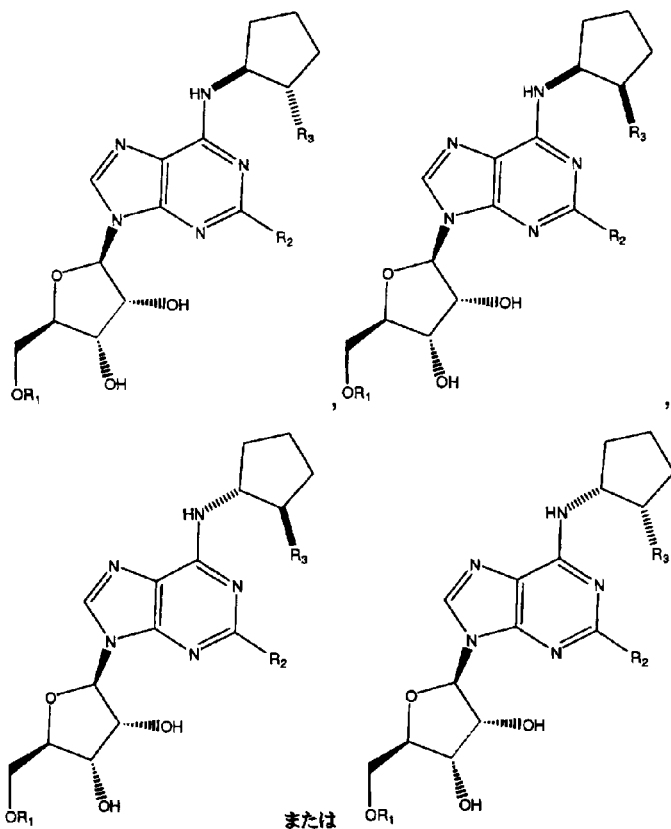
を有する、

請求項 1 2 に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 4】

構造：

## 【化 1 3】



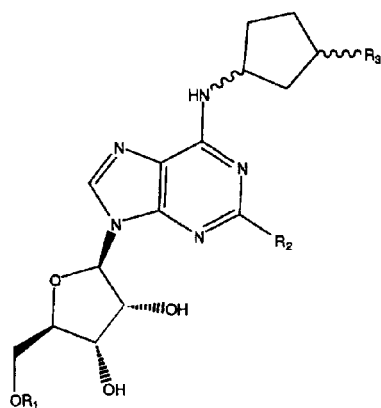
を有する、

請求項 1 3 に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 5】

構造：

## 【化 1 4】



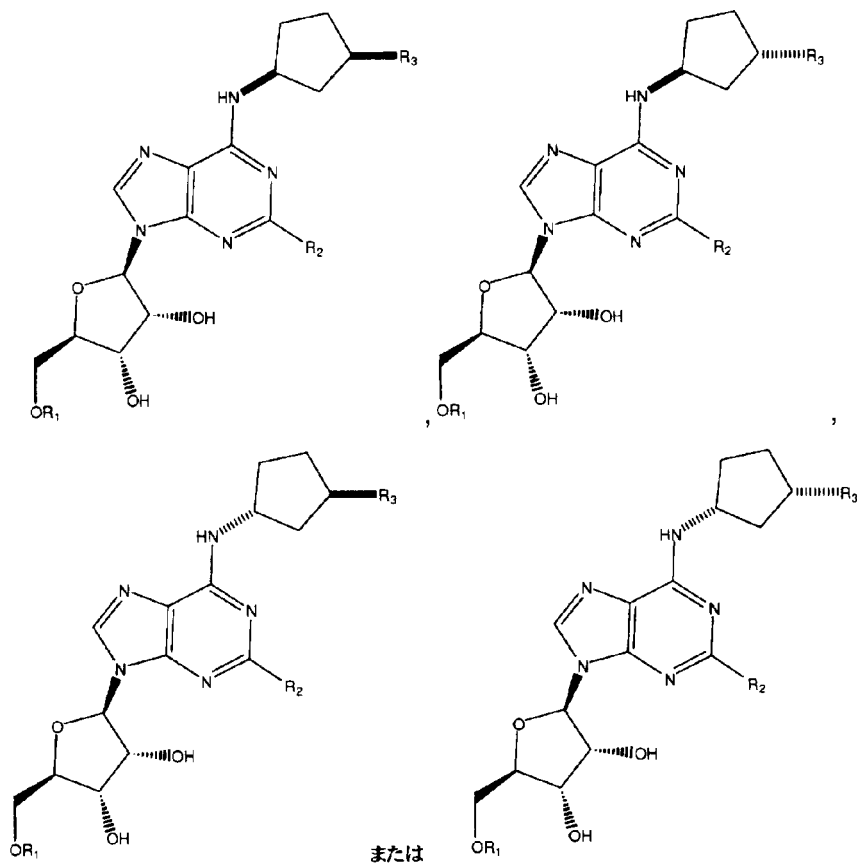
を有する、

請求項 1 2 に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 6】

構造：

## 【化 1 5】



を有する、

請求項 1 5 に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

## 【請求項 1 7】

$R_1$  が、 $-(CO)CH(CH_3)_2$  である、

請求項 1 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の式 I I の化合物。

## 【請求項 1 8】

$R_2$  が、 $-H$  である、

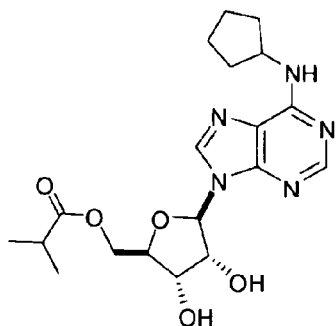
請求項 1 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の式 I I の化合物。

## 【請求項 1 9】

前記式 I I の化合物が、

式 2 a :

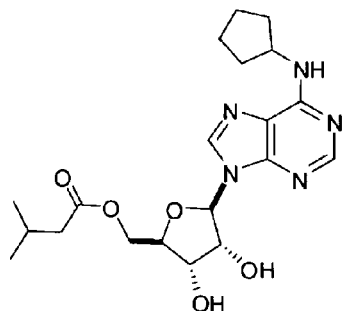
## 【化 1 6】



式 2 b :

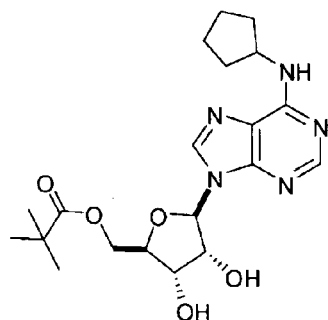


【化 1 7】



式 2 c :

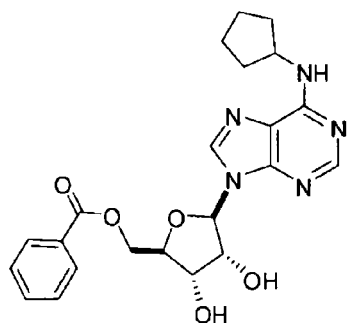
【化 1 8】



、および

式 2 h :

【化 1 9】



の化合物から選択される、

請求項 1 1 に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。

【請求項 2 0】

医薬としての使用のための請求項 1 1 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の式 I I の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩。