

【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22年6月24日(2010.6.24)

【公表番号】特表2009-536967(P2009-536967A)

【公表日】平成21年10月22日(2009.10.22)

【年通号数】公開・登録公報2009-042

【出願番号】特願2009-511159(P2009-511159)

【国際特許分類】

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 417/12 C S P

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 27/06

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月7日(2010.5.7)

【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】

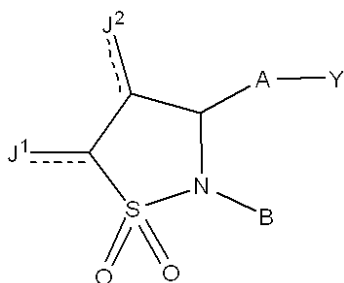
【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の構造を有する化合物、またはその製薬上許容し得る塩、またはそのプロドラッグ

:

【化1】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Yは、有機酸官能基またはその14個までの炭素原子を含むアミドもしくはエステルであるか；或いは、Yは、ヒドロキシメチルまたはその14個までの炭素原子を含むエーテルであるか；或いは、Yは、テトラゾリル官能基であり；

Aは、 $-(CH_2)_6-$ 、シス- $CH_2CH=CH-(CH_2)_3-$ または $-CH_2C \equiv C-(CH_2)_3-$ であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子はSまたはOによって置換し得；或いは、Aは、 $-(CH_2)_m-Ar-(CH_2)_o-$ であり、Arはインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、mとoの和は1、2、3または4であり、1個の CH_2 はSまたはOによって置換し得；

J¹およびJ²は、個々に、H；O；OH；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するO-アル

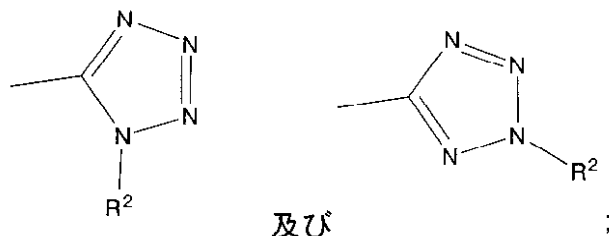
キル；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するアルキル；F；Cl；Br；I；CN；または CF_3 であり；そして、

Bは、置換アリールまたは置換ヘテロアリールである)。

【請求項2】

Yが、 CO_2R^2 、 $\text{CON}(\text{R}^2)_2$ 、 $\text{CON}(\text{OR}^2)\text{R}^2$ 、 $\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})_2$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})$ 、 CH_2OH 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $\text{CONHSO}_2\text{R}^2$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^2)_2$ 、 SO_2NHR^2 、下記：

【化2】



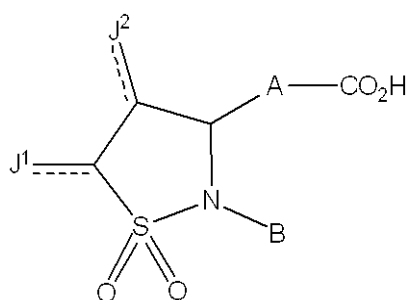
(式中、 R^2 は、個々に、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、非置換フェニルまたは非置換ビフェニルである)

から選ばれる、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

下記の構造を有する化合物、またはその製薬上許容し得る塩、またはそのプロドラッグ：

【化3】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Aは、 $-(\text{CH}_2)_6-$ 、シス- $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3-$ 、または $-\text{CH}_2\text{C}(\text{C}-(\text{CH}_2)_3)-$ であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子はSまたはOによって置換し得；或いは、Aは、 $-(\text{CH}_2)_m-\text{Ar}-(\text{CH}_2)_n-$ であり、Arはインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、mとnの和は1、2、3または4であり、1個の CH_2 はSまたはOによって置換し得；

J^1 および J^2 は、個々に、H；O；OH；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するO-アルキル；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するアルキル；F；Cl；Br；I；CN；または CF_3 であり；そして、

Bは、置換アリールまたは置換ヘテロアリールである)。

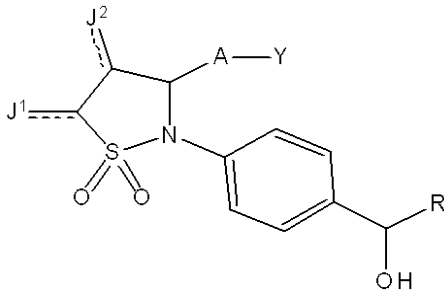
【請求項4】

Bが、置換されたフェニルである、請求項1～2のいずれか1項記載の化合物。

【請求項5】

下記の構造を有する請求項1～4のいずれか1項記載の化合物、またはその製薬上許容し得る塩、またはそのプロドラッグ：

【化 4】



(式中、Rは、水素または $C_1 \sim 10$ ヒドロカルビルである)。

【請求項 6】

Rが、アルキルである、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

Aが $-(CH_2)_m-Ar-(CH_2)_o-$ であり、Arがインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、mとoの和が1、2、3または4であり、1個の CH_2 がSまたはOによって置換し得る、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 8】

Aが、 $-(CH_2)_3Ar-$ 、 $-O(CH_2)_2Ar-$ 、 $-CH_2OCH_2Ar-$ 、 $-(CH_2)_2OAr$ 、 $-O(CH_2)_2Ar-$ 、 $-CH_2OCH_2Ar-$ または $-(CH_2)_2OAr$ であり、Arが単環式インターヘテロアリーレンである、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

Arが、インターチエニレン、インターチアゾリレンまたはインターオキサゾリレンである、請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

Aが、6-ヘキシル、または(Z)-6-ヘキサ-4-エニルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 11】

J^1 が、Hである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 12】

J^2 が、H、O、OH、F、Cl、Br、CN、または CF_3 である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の化合物の、哺乳類の緑内障または高眼圧症の治療用医薬品の製造における使用。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の化合物を含む、緑内障または高眼圧症の治療用医薬組成物。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の化合物を含む組成物、容器、並びに前記組成物を緑内障または高眼圧症の治療のために哺乳類に投与するための使用説明書を含むキット。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

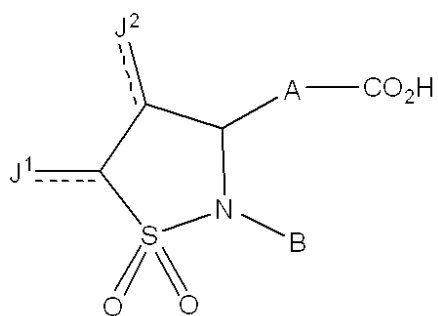
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

また、本明細書においては、カルボン酸またはそのバイオイソスター(bioisostere)、またはその製薬上許容し得る塩、またはそのプロドラッグも開示する；該カルボン酸は、下記の構造を有する：

【化 3】



(式中、点線は、結合の存在または不存在を示し；

Aは、 $-(CH_2)_6-$ 、シス- $CH_2CH=CH-(CH_2)_3-$ または $-CH_2C \equiv C-(CH_2)_3-$ であり、これらにおいて、1個または2個の炭素原子は、SまたはOによって置換し得；或いは、Aは、 $-(CH_2)_m-Ar-(CH_2)_o-$ であり、Arはインターアリーレンまたはヘテロインターアリーレンであり、mとoの和は1、2、3または4であり、1個の CH_2 はSまたはOによって置換し得；

J^1 および J^2 は、個々に、H；O；OH；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するO-アルキル；1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有するアルキル；F；Cl；Br；I；CN；または CF_3 であり；そして、

Bは、置換アリールまたは置換ヘテロアリールである)。