

【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 29 年 11 月 2 日 (2017.11.2)

【公表番号】特表 2016-531886 (P2016-531886A)

【公表日】平成 28 年 10 月 13 日 (2016.10.13)

【年通号数】公開・登録公報 2016-059

【出願番号】特願 2016-519782 (P2016-519782)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/69

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成 29 年 9 月 22 日 (2017.9.22)

【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】

その必要がある患者における全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための組成物であって、[(1R) - 1 - ({ [(2, 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] ボロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を含む、前記組成物。

【請求項 2】

前記化合物は、二酢酸 2, 2' - { 2 - [(1R) - 1 - ({ [(2, 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] - 5 - オキソ - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン - 4, 4 - ジイル }、4 - (R, S) - (カルボキシメチル) - 2 - ((R) - 1 - (2 - (2, 5 - ジクロロベンズアミド) アセトアミド) - 3 - メチルブチル) - 6 - オキソ - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン - 4 カルボン酸またはその混合物である、請求項 1 の組成物。

【請求項 3】

前記化合物は、二酢酸 2, 2' - { 2 - [(1R) - 1 - ({ [(2, 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] - 5 - オキソ - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン - 4, 4 - ジイル } である、請求項 1 の組成物。

【請求項 4】

前記化合物は、4 - (R, S) - (カルボキシメチル) - 2 - ((R) - 1 - (2 - (2, 5 - ジクロロベンズアミド) アセトアミド) - 3 - メチルブチル) - 6 - オキソ - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン - 4 カルボン酸である、請求項 1 の組成物。

【請求項 5】

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療における使用のための、[(1R) - 1 - ({ [(2, 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] ボロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩を含む組成物。

【請求項 6】

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための医薬の製造のための、 $[(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}]$ ポロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物のまたはその薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 7】

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための医薬であって、前記医薬は、 $[(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}]$ ポロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、前記医薬。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

本発明者らは、前述の問題を解決する試みにおいて鋭意研究を行い、及び $[(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}]$ ポロン酸もしくはそのクエン酸エステルまたはその薬学的に許容される塩が全身性エリテマトーデス、狼瘡腎炎等の予防または治療のために有用であり、かつ有効性及び低毒性を有することを見いだした。この発見に基づいて、本発明者らは、鋭意研究を行い、及び本発明を完成した。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

その必要がある患者における全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための方法であって、 $[(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}]$ ポロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩の有効量を投与することを含む、前記方法。

(項目 2)

前記化合物は、二酢酸 $2, 2' - \{2 - [(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}] - 5 - \text{オキソ} - 1, 3, 2 - \text{ジオキサボロラン} - 4, 4 - \text{ジイル}\}$ 、 $4 - (R, S) - (\text{カルボキシメチル}) - 2 - ((R) - 1 - (2 - (2, 5 - \text{ジクロロベンズアミド})アセトアミド) - 3 - \text{メチルブチル}) - 6 - \text{オキソ} - 1, 3, 2 - \text{ジオキサボリナン} - 4 \text{カルボン酸}$ またはその混合物である、項目 1 の方法。

(項目 3)

前記化合物は、二酢酸 $2, 2' - \{2 - [(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}] - 5 - \text{オキソ} - 1, 3, 2 - \text{ジオキサボロラン} - 4, 4 - \text{ジイル}\}$ である、項目 1 の方法。

(項目 4)

前記化合物は、 $4 - (R, S) - (\text{カルボキシメチル}) - 2 - ((R) - 1 - (2 - (2, 5 - \text{ジクロロベンズアミド})アセトアミド) - 3 - \text{メチルブチル}) - 6 - \text{オキソ} - 1, 3, 2 - \text{ジオキサボリナン} - 4 \text{カルボン酸}$ である、項目 1 の方法。

(項目 5)

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療における使用のための、 $[(1R) - 1 - (\{[(2, 5 - \text{ジクロロベンゾイル})アミノ]アセチル\}アミノ) - 3 - \text{メチルブチル}]$ ポロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩。

(項目 6)

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための医薬の製造のための、[(1 R) - 1 - ({ [(2 , 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] ボロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物のまたはその薬学的に許容される塩の使用。

(項目 7)

全身性エリテマトーデス及び／または狼瘡腎炎の予防または治療のための医薬であって、前記医薬は、[(1 R) - 1 - ({ [(2 , 5 - ジクロロベンゾイル) アミノ] アセチル } アミノ) - 3 - メチルブチル] ボロン酸もしくはそのクエン酸エステルである化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、前記医薬。