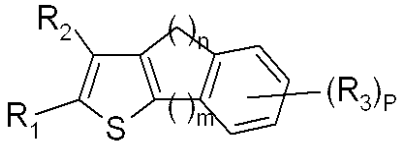
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年6月1日(2006.6.1)

【公表番号】特表2005-528386(P2005-528386A)
【公表日】平成17年9月22日(2005.9.22)
【年通号数】公開・登録公報2005-037
【出願番号】特願2003-583335(P2003-583335)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 333/50 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/18 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 333/74 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 333/50 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/381
Ａ６１Ｐ 1/00
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 9/08
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 11/06
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 17/00
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 19/04
Ａ６１Ｐ 19/10
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 29/00

Ａ６１Ｐ　29/00　　１０１
Ａ６１Ｐ　31/12
Ａ６１Ｐ　31/18
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　37/02
Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
Ｃ０７Ｄ 333/74

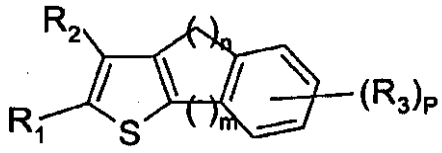
【手続補正書】
【提出日】平成18年3月30日(2006.3.30)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】



(I)

［式中、
R_1は、NR_4R_5を表し；
R_2は、$CONH_2$またはSO_2NH_2を表し；
R_3は、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、NH_2、CF_3、OCF_3、Ｏ－アルキル、Ｓ－アルキル、ＣＮ、ＣＨＯ、SO_2－アルキル、$(CH_2)_qNR_7R_8$、Ｏ－$(CH_2)_qNR_7R_8$、$(CH_2)_q$－アリール、Ｏ－$(CH_2)_q$－アリール、$(CH_2)_q$－ヘテロアリール、Ｏ－$(CH_2)_q$－ヘテロアリール、$(CH_2)_q$－ヘテロアルキル、Ｏ－$(CH_2)_q$－ヘテロアルキルおよびNO_2からなる群から選択され；
R_4は、ＨまたはC_{1-4}アルキルを表し；
R_5は、Ｈまたは$CONHR_6$を表し；
R_6は、水素、アルキルおよびアリールからなる群から選択され；
R_7は、C_{1-4}アルキルを表し；
R_8は、C_{1-4}アルキルを表し；
ｍは、０、１、２または３であり；
ｎは、０、１、２または３であり；
ｐは、１、２または３であり；
ｑは、１、２、３または４である］
で示される化合物またはその医薬上許容される塩。
【請求項２】
式（Ｉａ）；

【化２】



(Ia)

［式中、
R_1は、NR_4R_5を表し；
R_2は、$CONH_2$を表し；
R_3は、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、NH_2、CF_3、OCF_3、Ｏ－アルキル、Ｓ－アルキル、ＣＮ、ＣＨＯ、SO_2－アルキル、$(CH_2)_qNR_7R_8$、Ｏ－$(CH_2)_qNR_7R_8$、$(CH_2)_q$－アリール、Ｏ－$(CH_2)_q$－アリール、$(CH_2)_q$－ヘテロアリール、Ｏ－$(CH_2)_q$－ヘテロアリール、$(CH_2)_q$－ヘテロアルキル、Ｏ－$(CH_2)_q$－ヘテロアルキルおよびNO_2からなる群から選択され；
R_4は、Ｈを表し；
R_5は、$CONHR_6$を表し；
R_6は、Ｈを表し；
R_7は、C_{1-4}アルキルを表し；
R_8は、C_{1-4}アルキルを表し；
ｍは、０であり；
ｎは、１または２であり；
ｐは、１または２であり；
ｑは、１、２、３または４である］
で示される化合物またはその医薬上許容される塩。
【請求項３】
化合物が
２－アミノ－４Ｈ－インデノ[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－ウレイド－４Ｈ－インデノ[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アセチルアミノ－４Ｈ－インデノ[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アミノ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アセチルアミノ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－ウレイド－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アミノ－８－メトキシ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
８－メトキシ－２－ウレイド－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アミノ－７－メトキシ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アセチルアミノ－７－メトキシ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アミノ－７－ブロモ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；
２－アセチルアミノ－７－ブロモ－４，５－ジヒドロ－ナフト[１，２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；および

７－ブロモ－２－ウレイド－４,５－ジヒドロ－ナフト[１,２－ｂ]チオフェン－３－カルボン酸アミド；または
その医薬上許容される塩
からなる群から選択されるものである、請求項１記載の化合物。
【請求項４】
病的ＮＦ－κＢ活性化により特徴付けられる疾患の治療を必要とする患者に請求項１記載の化合物の有効量を投与することにより該病的活性化を阻害することを含むかかる疾患の治療のための医薬組成物であって、請求項１記載の化合物を含む医薬組成物。
【請求項５】
疾患が炎症または組織修復障害である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項６】
疾患が炎症および組織修復障害、特に、関節リウマチ、炎症性腸疾患、喘息およびＣＯＰＤ（慢性閉塞性肺疾患）、変形性関節症、骨粗鬆症および線維性疾患、乾癬、アトピー性皮膚炎および紫外線（ＵＶ）誘発性皮膚損傷を包含する皮膚疾患、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、乾癬性関節炎、強直性脊椎炎を包含する自己免疫疾患、組織および臓器拒絶、アルツハイマー病、脳卒中発作、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、糖尿病、糸球体腎炎、ホジキン病を包含する癌、悪液質、後天性免疫不全症候群（ＡＩＤＳ）を包含する感染およびある種のウイルス感染と付随した炎症、成人呼吸窮迫症候群、および毛細血管拡張性運動失調症からなる群から選択されるものである、請求項５記載の医薬組成物。
【請求項７】
疾患が皮膚疾患である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項８】
疾患が乾癬、アトピー性皮膚炎、およびＵＶ誘発性皮膚損傷からなる群から選択されるものである、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項９】
疾患が自己免疫疾患；組織および臓器拒絶、アルツハイマー病、脳卒中発作、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、糖尿病、糸球体腎炎、変形性関節症、骨粗鬆症、および毛細血管拡張性運動失調症からなる群から選択されるものである、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１０】
疾患が自己免疫疾患である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１１】
自己免疫疾患が全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、乾癬性関節炎または強直性脊椎炎、糖尿病である請求項１０記載の医薬組成物。
【請求項１２】
疾患が癌および／または悪液質である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１３】
癌がホジキン病である、請求項１２記載の医薬組成物。
【請求項１４】
疾患が後天性免疫不全症候群（ＡＩＤＳ）を包含する感染およびある種のウイルス感染と付随した炎症である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１５】
疾患がＡＩＤＳである、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１６】
疾患が成人呼吸窮迫症候群である、請求項４記載の医薬組成物。
【請求項１７】
ＮＦ－κＢおよびチェックポイントキナーゼの二重阻害が存在する、請求項４記載の医薬組成物。