

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-506334(P2005-506334A)

【公表日】平成17年3月3日(2005.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2005-009

【出願番号】特願2003-532491(P2003-532491)

【国際特許分類】

C 0 7 D 333/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

C 0 7 D 333/40 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 333/36

A 6 1 K 31/381

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/04

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 37/06
 C 0 7 D 333/40

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月4日(2005.10.4)

【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

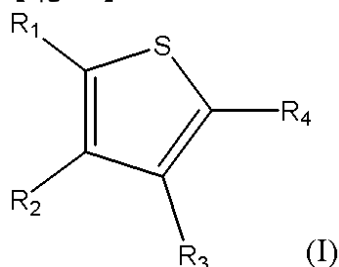
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式 I :

【化1】



[式中、

R_1 は CONH_2 、または SO_2NH_2 であり；

R_2 は NR_5R_6 であり；

R_3 は H、またはハロゲンであり；

R_4 はアリールまたはヘテロアリールであり；

R_5 は H またはアルキルであり；

ただし、 R_1 が CONH_2 である場合には、 R_6 は H、CO - アルキル、 SO_2 - アルキル、 CONH_2 、 CONH - アルキル、 CONH - アリール、 CONH - ヘテロアリール、 CSNH_2 、 CSNH - アルキル、 CSNH - アリール、 CSNH - ヘテロアリール、 SO_2NH_2 、 SO_2NH - アルキル、 SO_2NH - アリール、および SO_2NH - ヘテロアリールからなる群より選択され；

R_1 が SO_2NH_2 である場合には、 R_6 は CONH_2 であり；

R_1 が CONH_2 である場合には、 R_2 は NHCONH_2 でない] で示される化合物およびその医薬上許容される塩、水和物および溶媒和物。

【請求項2】

3 - アセチルアミノ - 5 - (4 - クロロ - フェニル) - チオフェン - 2 - カルボン酸アミド；

3 - アセチルアミノ - 5 - (4 - フルオロ - フェニル) - チオフェン - 2 - カルボン酸アミド；

5 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 - ウレイド - チオフェン - 2 - スルホン酸アミド；

5 - (3 - クロロ - フェニル) - 3 - ウレイド - チオフェン - 2 - スルホン酸アミド；

5 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 3 - ウレイド - チオフェン - 2 - スルホン酸アミド；および

5 - フェニル - 3 - ウレイド - チオフェン - 2 - スルホン酸アミド

からなる群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

病的な NF - B の活性化により特徴付けられる疾病の治療のための医薬組成物であって、有効量の請求項 1 記載の化合物を含有する医薬組成物。

【請求項 4】

疾病が炎症または組織修復障害である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 5】

疾病が、炎症および組織修復障害；特に、リウマチ性関節炎、炎症性腸疾患、喘息および COPD（慢性閉塞性肺疾患）、骨関節炎；骨粗しょう症および線維症；乾癬、アトピー性皮膚炎および紫外線照射（UV）により誘発される皮膚ダメージを包含する皮膚病；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、組織および器官の拒絶反応、アルツハイマー病、卒中、アテローム性動脈硬化、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に関連する炎症、成人の呼吸困難症候群、毛細血管拡張性運動失調からなる群より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 6】

疾病が皮膚病である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 7】

疾病が乾癬、アトピー性皮膚炎および紫外線照射による皮膚ダメージからなる群より選択される請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

疾病が自己免疫疾患、組織および器官の拒絶反応、アルツハイマー病、卒中、アテローム性動脈硬化、再狭窄、糖尿病、糸球体腎炎、骨関節炎、骨粗しょう症ならびに毛細血管拡張性運動失調からなる群より選択されるものである請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

疾病が自己免疫疾患である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

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である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 11】

疾病が癌および / または悪液質である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

癌がホジキン病である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 13】

疾病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に関連した炎症である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

疾病が AIDS である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 15】

疾病が成人の呼吸困難症候群である請求項 3 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

疾病において NF - B 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 3 記載の医薬組成物。