

【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7月29日(2010.7.29)

【公表番号】特表2009-528368(P2009-528368A)

【公表日】平成21年8月6日(2009.8.6)

【年通号数】公開・登録公報2009-031

【出願番号】特願2008-557379(P2008-557379)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

C 0 7 D 235/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 P 31/12

C 0 7 D 235/04

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月14日(2010.6.14)

【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】

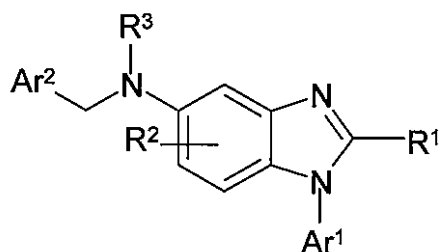
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

アレナウイルス感染または該感染に関連する疾患の治療または予防のための方法であって、以下の式 I :

【化 1】

I



式中、R 1 および R 2 は、独立に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリーラルキル、アリール、アシル、アリーラルシル、ヒドロキシ、アルキルオキシ、アルキルチオ、アミノ、アルキルアミノ、アセトアミド、ハロゲン、シアノまたはニトロであり；

R 3 は、水素、アシル、アリーラルシルまたはスルホニルであり；そして

A r 1 および A r 2 は、独立に、(非) 置換アリールまたはヘテロアリールであるの化合物を、こうした方法を必要とする哺乳動物に療法的有効量で投与する工程を含む、前記方法。

【請求項 2】

R 1 が水素である、請求項 1 の方法。

【請求項 3】

R 2 が水素である、請求項 1 の方法。

【請求項 4】

R 3 が水素である、請求項 1 の方法。

【請求項 5】

R 3 が - S (O) 2 - 置換アリールである、請求項 1 の方法。

【請求項 6】

R 3 が - S (O) 2 - 置換フェニルである、請求項 5 の方法。

【請求項 7】

R 3 が - S (O) 2 - アルコキシフェニルである、請求項 6 の方法。

【請求項 8】

R 3 が - S (O) 2 - メトキシフェニルである、請求項 7 の方法。

【請求項 9】

R 3 が - S (O) 2 - p - メトキシフェニルである、請求項 7 の方法。

【請求項 10】

A r 1 が非置換アリールである、請求項 1 の方法。

【請求項 11】

A r 1 が非置換フェニルである、請求項 10 の方法。

【請求項 12】

A r 1 がモノ置換アリールである、請求項 1 の方法。

【請求項 13】

A r 1 がモノ置換フェニルである、請求項 12 の方法。

【請求項 14】

A r 1 がアルコキシフェニルである、請求項 13 の方法。

【請求項 15】

A r 1 がメトキシフェニルである、請求項 14 の方法。

【請求項 16】

A r 1 が o - メトキシフェニルである、請求項 15 の方法。

【請求項 17】

A r 1 が p - メトキシフェニルである、請求項 15 の方法。

【請求項 18】

A r 2 が置換アリールである、請求項 1 の方法。

【請求項 19】

A r 2 が置換フェニルである、請求項 18 の方法。

【請求項 20】

A r 2 がモノ置換フェニルである、請求項 19 の方法。

【請求項 21】

A r 2 がアルコキシフェニルである、請求項 20 の方法。

【請求項 22】

A r 2 がメトキシフェニルである、請求項 21 の方法。

【請求項 23】

A r 2 が o - メトキシフェニルである、請求項 22 の方法。

【請求項 24】

A r 2 が m - メトキシフェニルである、請求項 22 の方法。

【請求項 25】

A r 2 が p - メトキシフェニルである、請求項 22 の方法。

【請求項 26】

A r 2 がエトキシフェニルである、請求項 21 の方法。

【請求項 27】

A r 2 が p - エトキシフェニルである、請求項 26 の方法。

【請求項 28】

A r 2 がアルキルフェニルである、請求項 20 の方法。

【請求項 29】

A r 2 がメチルフェニルである、請求項 28 の方法。

【請求項 30】

A r 2 が p - メチルフェニルである、請求項 29 の方法。

【請求項 31】

A r 2 がプロピルフェニルである、請求項 20 の方法。

【請求項 32】

A r 2 が p - プロピルフェニルである、請求項 31 の方法。

【請求項 33】

A r 2 が p - イソプロピルフェニルである、請求項 32 の方法。

【請求項 34】

A r 2 がハロ置換フェニルである、請求項 13 の方法。

【請求項 35】

A r 2 が p - ハロ置換フェニルである、請求項 34 の方法。

【請求項 36】

A r 2 が p - ブロモフェニルである、請求項 35 の方法。

【請求項 37】

A r 2 が p - クロロフェニルである、請求項 36 の方法。

【請求項 38】

A r 2 がヒドロキシフェニルである、請求項 13 の方法。

【請求項 39】

A r 2 が o - ヒドロキシフェニルである、請求項 38 の方法。

【請求項 40】

A r 2 がジメチルアミノフェニルである、請求項 13 の方法。

【請求項 41】

A r 2 が p - ジメチルアミノフェニルである、請求項 40 の方法。

【請求項 42】

A r 2 が - S (O) 2 - 置換アリールである、請求項 12 の方法。

【請求項 43】

A r 2 が - S (O) 2 - 置換フェニルである、請求項 42 の方法。

【請求項 44】

A r 2 が - S (O) 2 - アルコキシフェニルである、請求項 43 の方法。

【請求項 45】

A r 2 が - S (O) 2 - メトキシフェニルである、請求項 44 の方法。

【請求項 46】

A r 2 が - S (O) 2 - p - メトキシフェニルである、請求項 45 の方法。

【請求項 47】

A r 2 がジフェニルである、請求項 20 の方法。

【請求項 48】

式 I の化合物が、(4 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - ブロモ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - エトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、[1 - (4 - メトキシ -

シ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - (1 - p - トリル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - クロロ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(3 , 4 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - ブロモ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、N - (4 - エトキシ - ベンジル) - N - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド、[1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - (4 - メチル - ベンジル) - アミン、(2 , 3 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(3 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 , 3 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - イソプロピル - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、N - (4 - イソプロピル - ベンジル) - N - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アセトアミド、および N - (4 - イソプロピル - ベンジル) - N - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 4 - メチルベンゼンスルホンアミドからなる群より選択される、請求項 1 の方法。

【請求項 49】

哺乳動物がヒトである、請求項 1 の方法。

【請求項 50】

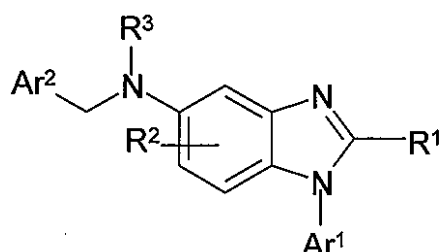
アレナウイルス属がラッサ、タカリベ、グアナリト、マチュボ、およびピチンデ (P i c h i n d e) からなる群より選択される、請求項 54 の方法。

【請求項 51】

式 I :

【化 2】

I



式中、R 1 および R 2 は、独立に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリーラルキル、アリール、アシル、アリーラルシル、ヒドロキシ、アルキルオキシ、アルキルチオ、アミノ、アルキルアミノ、アセトアミド、ハロゲン、シアノまたはニトロであり；

R 3 は、水素、アシル、アリーラルシルまたはスルホニルであり；そして

A r 1 および A r 2 は、独立に、(非) 置換アリールまたはヘテロアリールであるの化合物；

ならびに薬学的に許容されうるそのキャリアーを含む、組成物。

【請求項 52】

R 1 が水素である、請求項 51 の組成物。

【請求項 53】

R 2 が水素である、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 5 4】

R 3 が水素である、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 5 5】

R 3 が - S (O) 2 - 置換アリールである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 5 6】

R 3 が - S (O) 2 - 置換フェニルである、請求項 5 5 の組成物。

【請求項 5 7】

R 3 が - S (O) 2 - アルコキシフェニルである、請求項 5 6 の組成物。

【請求項 5 8】

R 3 が - S (O) 2 - メトキシフェニルである、請求項 5 7 の組成物。

【請求項 5 9】

R 3 が - S (O) 2 - p - メトキシフェニルである、請求項 5 8 の組成物。

【請求項 6 0】

A r 1 が非置換アリールである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 6 1】

A r 1 が非置換フェニルである、請求項 6 0 の組成物。

【請求項 6 2】

A r 1 がモノ置換アリールである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 6 3】

A r 1 がモノ置換フェニルである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 6 4】

A r 1 がアルコキシフェニルである、請求項 6 3 の組成物。

【請求項 6 5】

A r 1 がメトキシフェニルである、請求項 6 4 の組成物。

【請求項 6 6】

A r 1 が o - メトキシフェニルである、請求項 6 5 の組成物。

【請求項 6 7】

A r 1 が p - メトキシフェニルである、請求項 6 5 の組成物。

【請求項 6 8】

A r 2 が置換アリールである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 6 9】

A r 2 が置換フェニルである、請求項 6 8 の組成物。

【請求項 7 0】

A r 2 がモノ置換フェニルである、請求項 6 9 の組成物。

【請求項 7 1】

A r 2 がアルコキシフェニルである、請求項 7 0 の組成物。

【請求項 7 2】

A r 2 がメトキシフェニルである、請求項 7 1 の組成物。

【請求項 7 3】

A r 2 が o - メトキシフェニルである、請求項 7 2 の組成物。

【請求項 7 4】

A r 2 が m - メトキシフェニルである、請求項 7 2 の組成物。

【請求項 7 5】

A r 2 が p - メトキシフェニルである、請求項 7 2 の組成物。

【請求項 7 6】

A r 2 がエトキシフェニルである、請求項 7 1 の組成物。

【請求項 7 7】

A r 2 が p - エトキシフェニルである、請求項 7 6 の組成物。

【請求項 7 8】

A r 2 がアルキルフェニルである、請求項 7 0 の組成物。

【請求項 7 9】

A r 2 がメチルフェニルである、請求項 7 8 の組成物。

【請求項 8 0】

A r 2 が p - メチルフェニルである、請求項 7 9 の組成物。

【請求項 8 1】

A r 2 がプロピルフェニルである、請求項 7 8 の組成物。

【請求項 8 2】

A r 2 が p - プロピルフェニルである、請求項 8 1 の組成物。

【請求項 8 3】

A r 2 が p - イソプロピルフェニルである、請求項 8 2 の組成物。

【請求項 8 4】

A r 2 がハロ置換フェニルである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 8 5】

A r 2 が p - ハロ置換フェニルである、請求項 8 4 の組成物。

【請求項 8 6】

A r 2 が p - ブロモフェニルである、請求項 8 5 の組成物。

【請求項 8 7】

A r 2 が p - クロロフェニルである、請求項 8 6 の組成物。

【請求項 8 8】

A r 2 がヒドロキシフェニルである、請求項 7 0 の組成物。

【請求項 8 9】

A r 2 が o - ヒドロキシフェニルである、請求項 8 8 の組成物。

【請求項 9 0】

A r 2 がジメチルアミノフェニルである、請求項 7 0 の組成物。

【請求項 9 1】

A r 2 が p - ジメチルアミノフェニルである、請求項 9 0 の組成物。

【請求項 9 2】

A r 2 が - S (O) 2 - 置換アリールである、請求項 7 0 の組成物。

【請求項 9 3】

A r 2 が - S (O) 2 - 置換フェニルである、請求項 9 2 の組成物。

【請求項 9 4】

A r 2 が - S (O) 2 - アルコキシフェニルである、請求項 9 3 の方法。

【請求項 9 5】

A r 2 が - S (O) 2 - メトキシフェニルである、請求項 9 4 の組成物。

【請求項 9 6】

A r 2 が - S (O) 2 - p - メトキシフェニルである、請求項 9 5 の組成物。

【請求項 9 7】

A r 2 がジフェニルである、請求項 6 9 の組成物。

【請求項 9 8】

式 I の化合物が、(4 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - ジメチルアミノ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - ブロモ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - エトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキ

シ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、[1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - (1 - p - トリル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、(4 - クロロ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(3 , 4 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - プロモ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、N - (4 - エトキシ - ベンジル) - N - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド、[1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - (4 - メチル - ベンジル) - アミン、(2 , 3 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(3 - メトキシ - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(2 , 3 - ジメトキシ - ベンジル) - [1 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - イソプロピル - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、(4 - メトキシ - ベンジル) - (1 - フェニル - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - アミン、N - (4 - イソプロピル - ベンジル) - N - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アセトアミド、および N - (4 - イソプロピル - ベンジル) - N - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 4 - メチルベンゼンスルホンアミドからなる群より選択される、請求項 5 1 の組成物。

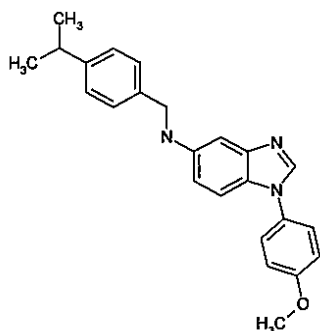
【請求項 9 9】

式 I の化合物が、(4 - イソプロピル - ベンジル) - [1 - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミンである、請求項 5 1 の組成物。

【請求項 1 0 0】

アレナウイルス感染または該感染に関連する疾患の治療または予防のための方法であって、以下の式 I :

【化 3】



の化合物を、こうした方法を必要とする哺乳動物に療法的有効量で投与する工程を含む、前記方法。

【請求項 1 0 1】

哺乳動物がヒトである、請求項 1 0 0 の方法。

【請求項 1 0 2】

アレナウイルス属がラッサ、タカリベ、グアナリト、マチュボ、およびピチンデ (P i c h i n d e) からなる群より選択される、請求項 1 0 0 の方法。

【請求項 1 0 3】

リバビリンの併用投与をさらに含む、請求項 1 0 0 の方法。