

【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】

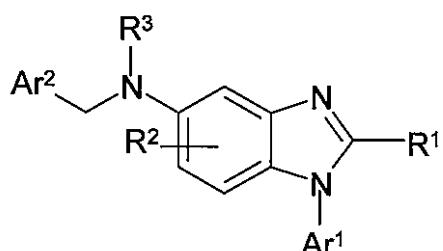
【特許請求の範囲】

【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つて、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、アリールアルキル、アリール、アシル、アリールアシル、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、アリールアシルまたはスルホニルであり；そして

Ar 1 および Ar 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 - フェニル) - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - アミン、

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ニアミド、[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ニ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 4 9】

哺乳動物がヒトである、請求項 1 の方法。

## 【請求項 5 0】

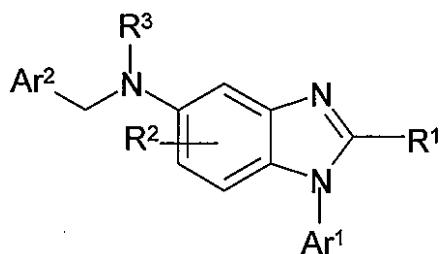
アレナウイルス属がラッサ、タカリベ、グアナリト、マチュポ、およびピチンデ (Pichinde) からなる群より選択される、請求項 5 4 の方法。

## 【請求項 5 1】

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、アリールアルキル、アリール、アシル、アリールアシル、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、アリールアシルまたはスルホニルであり；そして

Ar 1 および Ar 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 5 2】

R 1 が水素である、請求項 5 1 の組成物。

## 【請求項 5 3】

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<sub>r</sub>2がアルキルフェニルである、請求項70の組成物。

【請求項79】

A<sub>r</sub>2がメチルフェニルである、請求項78の組成物。

【請求項80】

A<sub>r</sub>2がp-メチルフェニルである、請求項79の組成物。

【請求項81】

A<sub>r</sub>2がプロピルフェニルである、請求項78の組成物。

【請求項82】

A<sub>r</sub>2がp-プロピルフェニルである、請求項81の組成物。

【請求項83】

A<sub>r</sub>2がp-イソプロピルフェニルである、請求項82の組成物。

【請求項84】

A<sub>r</sub>2がハロ置換フェニルである、請求項51の組成物。

【請求項85】

A<sub>r</sub>2がp-ハロ置換フェニルである、請求項84の組成物。

【請求項86】

A<sub>r</sub>2がp-ブロモフェニルである、請求項85の組成物。

【請求項87】

A<sub>r</sub>2がp-クロロフェニルである、請求項86の組成物。

【請求項88】

A<sub>r</sub>2がヒドロキシフェニルである、請求項70の組成物。

【請求項89】

A<sub>r</sub>2がo-ヒドロキシフェニルである、請求項88の組成物。

【請求項90】

A<sub>r</sub>2がジメチルアミノフェニルである、請求項70の組成物。

【請求項91】

A<sub>r</sub>2がp-ジメチルアミノフェニルである、請求項90の組成物。

【請求項92】

A<sub>r</sub>2が-S(O)2-置換アリールである、請求項70の組成物。

【請求項93】

A<sub>r</sub>2が-S(O)2-置換フェニルである、請求項92の組成物。

【請求項94】

A<sub>r</sub>2が-S(O)2-アルコキシフェニルである、請求項93の方法。

【請求項95】

A<sub>r</sub>2が-S(O)2-メトキシフェニルである、請求項94の組成物。

【請求項96】

A<sub>r</sub>2が-S(O)2-p-メトキシフェニルである、請求項95の組成物。

【請求項97】

A<sub>r</sub>2がジフェニルである、請求項69の組成物。

【請求項98】

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)-1H-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)-1H-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-1H-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-1H-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)-1H-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)-1H-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)-1H-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 - 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 5 1 の組成物。

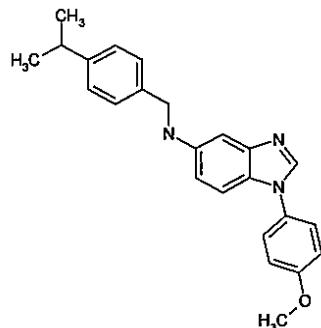
#### 【請求項 9 9】

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つて、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、マチュポ、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。