

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges
Eigentum

Internationales Büro

(43) Internationales
Veröffentlichungsdatum
18. April 2013 (18.04.2013)



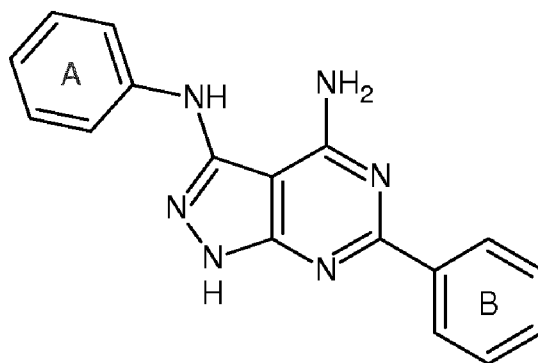
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2013/053942 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 31/12* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2012/070403
- (22) Internationales Anmeldedatum:
15. Oktober 2012 (15.10.2012)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
10 2011 116 373.9
14. Oktober 2011 (14.10.2011) DE
10 2011 116 384.4
20. Oktober 2011 (20.10.2011) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **DRITTE PATENTPORTFOLIO BETEILIGUNGSGESELLSCHAFT MBH & CO. KG** [DE/DE]; Berliner Strasse 1, 12529 Schönefeld/OT Waltersdorf (DE).
- (72) Erfinder; und
- (71) Anmelder (nur für US): **WUTZLER, Peter** [—/DE]; Hinter den Gärten 3, 99101 Erfurt-Windischholzhausen (DE). **SCHMIDTKE, Michaela** [—/DE]; Fröbelstieg 6 a, 07743 Jena (DE). **MAKAROV, Vadim** [—/RU]; Sadovnicheskaya Str. 47, Moskau, 115035 (RU).
- (74) Anwalt: **MEISSNER, BOLTE & PARTNER GBR**; Widenmayerstrasse 47-50, 80538 München (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 4-AMINO-3-PHENYLAMINO-6-PHENYLPYRAZOLO[3,4-D] PYRIMIDINE DERIVATIVES, THEIR MANUFACTURE AND THEIR USE AS ANTIVIRAL ACTIVE SUBSTANCES

(54) Bezeichnung : 4-AMINO-3-PHENYLAMINO-6-PHENYLPYRAZOLO[3,4-D]PYRIMIDIN-DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS ANTIVIRALE WIRKSTOFFE



I

(57) Abstract: The present invention relates to 5-amino-3-phenylamino-6-phenylpyrazolo[3,4-d] pyrimidine derivatives of the general formula (I) or pharmaceutically acceptable salts or prodrugs thereof, wherein at least one hydrogen atom is replaced in at least one of phenyl groups A and B by a substituent R^H, which has a Hammett constant σ_p greater than 0.23. The present invention further relates to a method of manufacturing these. Corresponding compounds have been found to have surprisingly high activity against viruses, particularly rhinoviruses and picornaviruses. Moreover, the compounds are very well tolerated. For these reasons, the compounds are suited for the treatment of viral infections and as medications.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Amino-3-phenylamino-6-phenylpyrazolo[3,4-d]pyrimidin-Derivate
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]



LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS,
SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)

der allgemeinen Formel (I) oder pharmazeutisch akzeptable Salze oder Propharmaka davon, wobei zumindest ein Wasserstoffatom in zumindest einer der Phenylgruppen A und B durch einen Substituenten R^H ersetzt ist, der eine Hammett-Konstante σ_p größer als 0,23 aufweist. Die vorliegende Erfindung betrifft ebenfalls Verfahren zu deren Herstellung. Für entsprechende Verbindungen wurde überraschend eine besonders hohe Aktivität gegen Viren, insbesondere gegen Rhinoviren und Picornaviren, festgestellt. Darüber hinaus sind die Verbindungen sehr gut verträglich. Aus diesen Gründen sind die Verbindungen für die Behandlung von Vireninfektionen und als Medikamente geeignet.