(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国 际 局

(43) 国际公布日:
2004年12月16日(16.12.2004)

PCT

(10) 国际公布号:
WO 2004/108726 A1

(51) 国际分类号[7]: C07D 487/04, C07C 63/10, C07D 207/00, 207/34, A61K 31/505, A61P 15/00 // (C07D 487/04, 239:00, 209:00)

(21) 国际申请号: PCT/CN2004/000487

(22) 国际申请日: 2004年5月14日(14.05.2004)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
03142399.X 2003年6月6日(06.06.2003) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 天津天士力集团有限公司(TIANJIN TASLY GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国天津市北辰区北辰科技园辽河东路1号, Tianjin 300402 (CN)。天津倍方科技发展有限公司(TIANJIN NORTH PHARMA SCI-TECH CO., LTD) [CN/CN]; 中国天津市华苑科技产业园开华道7号三层C35, Tianjin 300384 (CN)。

(72) 发明人;及
(75) 发明人/申请人(仅对美国): 王永峰(WANG, Yongfeng) [CN/CN]; 中国天津市华苑科技产业园开华道7号三层C35, Tianjin 300384(CN)。赵柯君(ZHAO, Kejun) [CN/CN]; 中国山东省经济技术开发区珠江路32号留学人员创业基地, Shandong 264006 (CN)。

(74) 代理人: 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 (CCPIT PATENT AND TRADEMARK LAW OFFICE); 中国北京市阜成门外大街2号万通新世界广场8层, Beijing 100037 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

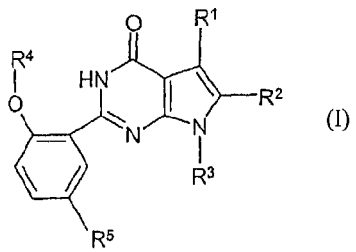
根据细则4.17的声明:
— 关于申请人在国际申请日有权申请并被授予专利(细则4.17(ii))对除美国以外的所有指定国
— 关于申请人在国际申请日有权要求该在先申请的优先权(细则4.17(iii))对除美国以外的所有指定国

本国际公布:
— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号，请参考刊登在每期PCT公报期刊起始的"代码及缩写符号简要说明"。

(54) Title: 2-SUBSTITUTED PHENYL-5,7-DIALKYL-3,7-DIHYDROPYRROLE [2,3-d] PYRIMIDINE-4-ONE DERIVATIVES, THE PREPARATION AND THE PHARMACEUTICAL USE THEREOF

(54) 发明名称: 2-取代苯基-5,7-二烃基-3,7-二氢吡咯[2,3-d]嘧啶-4-酮衍生物，其制备方法及其药物用途



(I)

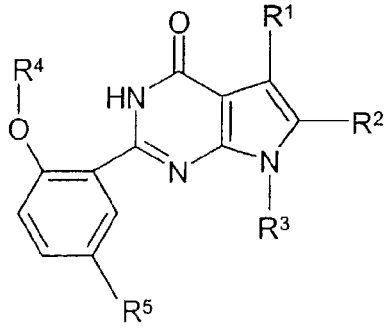
(57) Abstract: The invention relates to the compounds of formula I, their preparation and the pharmaceutical compositions containing the compounds. The invention also relates to the use of the compounds of formula I in preparing medicines, which can treat sexual dysfunction of animals including human (male and female), especially erectile dysfunction of male and the diseases in which the function of phospholipase 5 (cGMP PDE5) is involved.

[见续页]

WO 2004/108726 A1

(57) 摘要

本发明涉及通式 I 化合物，它们的制备方法和含有这些化合物的药物组合物。本发明还涉及通式 I 化合物用于制备治疗包括人（男性和女性）在内的动物性功能障碍、特别是雄性阴茎勃起障碍以及与磷脂酶 5 (cGMP PED5) 功能相关疾病的药物的用途。



I