

(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
2023 年 3 月 30 日 (30.03.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/045909 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 305/08 (2006.01) *A61P 31/04* (2006.01)
A61K 31/38 (2006.01) *A61P 9/10* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/119825

(22) 国际申请日: 2022 年 9 月 20 日 (20.09.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202111108417.6 2021 年 9 月 22 日 (22.09.2021) CN

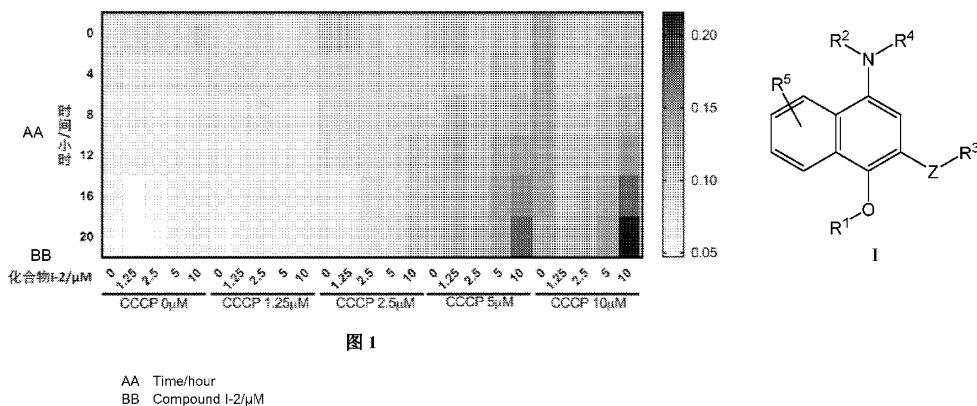
(71) 申请人: 杭州天玑济世生物科技有限公司 (HANGZHOU PHECDAMED CO., LTD.) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。

(72) 发明人: 夏宏光 (XIA, Hongguang); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 樊梦阳 (FAN, Mengyang); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 岑旭峰 (CEN, Xufeng); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 徐晓燕 (XU, Xiaoyan); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 吴荣海 (WU, Ronghai); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 刘栋 (LIU, Dong); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。 田珍 (TIAN, Zhen); 中国浙江省杭州市余杭区余杭塘路 2626 号 2 幢 301 室, Zhejiang 311100 (CN)。

(74) 代理人: 上海上谷知识产权代理有限公司 (SHANGHAI GOOIP CO., LTD.); 中国上海市

(54) Title: SMALL MOLECULE COMPOUNDS HAVING NAPHTHYLAMINE STRUCTURE AND APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一类具有萘胺结构的小分子化合物及其应用



(57) Abstract: The present application discloses small molecule compounds having a naphthylamine structure and an application thereof. In the present application, the structure of a compound having a structure as shown in general formula (I) is as shown in the drawing. The compound and the pharmaceutically acceptable salt, stereoisomer, solvate or prodrug thereof that are provided by the present application or the pharmaceutical composition provided by the present application can selectively induce autophagy in damaged mitochondria without affecting or only weakly affecting normal mitochondria, and further have superior metabolic stability and pharmacokinetic properties, lower toxicity, and better druggability.

(57) 摘要: 本申请公开了一类具有萘胺结构的小分子化合物及其应用。本申请中, 具有通式 (I) 所示结构的化合物结构如图所示。本申请提供的化合物及其药学上可接受的盐、立体异构体、溶剂化物或前药或者本申请提供的药物组合物可以在不影响或仅微弱影响正常线粒体的前提下, 选择性诱导破损线粒体自噬; 此外, 还具有优越的代谢稳定性和药物代谢动力学特性, 毒性更低, 成药性更好。

[见续页]

宜山路 900 号 1 幢 A15 楼 1504 室、1508 室,
Shanghai 200235 (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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,
BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU,
CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ,
IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ,
LA, LC, LK, LR, LS, 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, SA, SC, SD,
SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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, LR, LS, MW, MZ,
NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU,
IE, IS, IT, 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, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告 (条约第 21 条 (3))。