

(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



(10) 国际公布号
WO 2021/223780 A2

(43) 国际公布日
2021 年 11 月 11 日 (11.11.2021)

(51) 国际专利分类号:
C07D 293/12 (2006.01) *A61K 31/4439* (2006.01)
A61K 31/41 (2006.01) *A61P 31/14* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/104644

(22) 国际申请日: 2021 年 7 月 6 日 (06.07.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202010373848.4 2020 年 5 月 6 日 (06.05.2020) CN

(71) 申请人: 上海元熙医药科技有限公司(SHANGHAI YUANXI MEDICINE CORP.) [CN/CN]; 中国上海市中国(上海)自由贸易试验区芳春路 400 号 1 幢 3 层, Shanghai 201207 (CN)。

(72) 发明人: 曾慧慧(ZENG, Huihui); 中国上海市中国(上海)自由贸易试验区芳春路 400 号 1 幢 3 层, Shanghai 201207 (CN)。 尹汉维(YIN, Hanwei); 中国上海市中国(上海)自由贸易试验区芳春路 400 号 1 幢 3 层, Shanghai 201207 (CN)。

(74) 代理人: 北京知元同创知识产权代理事务所(普通合伙)(BEIJING ORIGINTELLIGENCE IP LAW

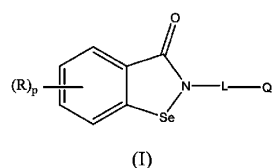
FIRM); 中国北京市海淀区上地三街 9 号嘉华大厦 E 座 1004 室刘元霞汪泉, Beijing 100085 (CN)。

(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, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, 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)。

(54) Title: USE OF BENZISOSSELAZOLE DERIVATIVE FOR ANTI-CORONAVIRUS AND CONTROL OF INTERSTITIAL LUNG DISEASE (ILD) RELATED TO CORONAVIRUS

(54) 发明名称: 苯并异噻唑啉衍生物用于抗冠状病毒及控制冠状病毒相关的间质性肺疾病 (ILD) 的用途



(57) Abstract: The present invention provides the use of the benzisoxazole derivative of formula (I) for preparing an anti-coronavirus drug or a drug for treating diseases caused by coronaviruses. The benzisoxazole derivatives of the present invention can effectively inhibit the activity of 2019-nCoV 3CLpro proteolytic enzyme, thus inhibiting the activation of 2019-nCoV RNA polymerase, inhibiting virus replication, while also effectively treating interstitial lung disease (ILD) caused by coronavirus.

(57) 摘要: 本发明提供了式(I)的苯并异噻唑啉衍生物用于制备抗冠状病毒药物或者治疗由冠状病毒引起的疾病的药物的用途。本发明的苯并异噻唑啉衍生物能够有效抑制 2019-nCoV 3CLpro 蛋白水解酶的活性, 进而抑制 2019-nCoV RNA 聚合酶的活化, 抑制病毒复制, 同时, 有效治疗由冠状病毒引起的间质性肺疾病 (ILD)。

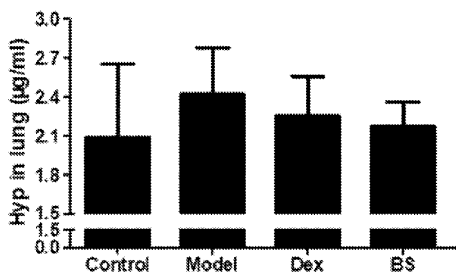


图 11

[见续页]

本国际公布：

- 不包括国际检索报告，在收到该报告后将重新公布(细则48.2(g))。
- 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息(细则26之二.3和48.2(b)(vii))。