

## (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  
2006 年 11 月 30 日 (30.11.2006)

(10) 国际公布号  
**WO 2006/125397 A1**

(51) 国际专利分类号:

C07C 225/22 (2006.01) C07C 221/00 (2006.01)  
C07C 229/60 (2006.01) C07C 227/00 (2006.01)  
C07D 211/06 (2006.01) A61K 31/341 (2006.01)  
C07D 307/52 (2006.01) A61K 31/44 (2006.01)

国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。苏昊然(SU, Haoran) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。高捷(GAO, Jie) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2006/001106

(22) 国际申请日: 2006 年 5 月 26 日 (26.05.2006)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:  
200510026252.2  
2005 年 5 月 27 日 (27.05.2005) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 中国科学院上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。四川大学(SICHUAN UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国四川省成都市一环路南一段24号, Sichuan 610065 (CN)。

(72) 发明人: 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): 王明伟(WANG, Mingwei) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。邓勇(DENG, Yong) [CN/CN]; 中国四川省成都市一环路南一段24号, Sichuan 610065 (CN)。周彩红(ZHOU, Caihong) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区祖冲之路555号, Shanghai 201203 (CN)。杨大成(YANG, Dacheng) [CN/CN]; 中国四川省成都市一环路南一段24号, Sichuan 610065 (CN)。惠昕(HUI, Xin) [CN/CN]; 中

(74) 代理人: 北京金信立方知识产权代理有限公司(KINGSOUND & PARTNERS); 中国北京市海淀区紫竹院路116号嘉豪国际中心B座11层, Beijing 100089 (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, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, 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 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, 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)。

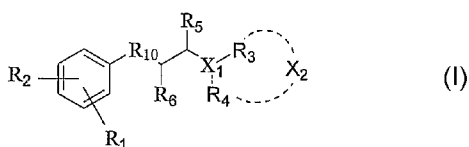
本国际公布:

— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码及其它缩写符号, 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: NONSTEROIC ANDROGEN ACCEPTOR REGULATORS, PREPARATION PROCESS, PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 非甾体雄激素受体调节剂及其制备方法、药物组合物和用途



(57) Abstract: Nonsteroid androgen acceptor regulator compounds of the general formula (I), pharmaceutically acceptable salts thereof, preparation process and pharmaceutically compositions containing the said compounds are disclosed. Such compounds of the general formula (I) or pharmaceutically acceptable salts thereof can be used for preparing nonsteroid medicines to treat and/or prevent conditions or

diseases such as prostatic hyperplasi, prostatic cancer, hirsutism, high hormone-dependent alopecia and cane et al. because of androgen acceptor antagonistic activity.

[见续页]

WO 2006/125397 A1



---

(57) 摘要:

本发明涉及具有通式 I 结构的非甾体雄激素受体调节剂化合物或其药学上可接受的盐及其制备方法; 还涉及包含通式 I 化合物或其药学上可接受的盐的药物组合物; 以及通式 I 化合物或其药学上可接受的盐具有雄激素受体拮抗活性, 因而可用于制备预防或/和治疗前列腺增生、前列腺癌、妇女多毛症、重度雄激素依赖型脱发和痤疮等症状或疾病的非甾体类药物。