

(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
2014 年 1 月 9 日 (09.01.2014)



(10) 国际公布号
WO 2014/005421 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/06 (2006.01) A61K 31/4523 (2006.01)
C07D 491/056 (2006.01) A61P 25/00 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2013/000813

(22) 国际申请日: 2013 年 7 月 3 日 (03.07.2013)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201210226125.7 2012 年 7 月 3 日 (03.07.2012) CN

(71) 申请人: 浙江海正药业股份有限公司 (ZHEJIANG HISUN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN];
中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。

(72) 发明人: 白骅 (BAI, Hua); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 赵旭阳 (ZHAO, Xuyang); 中国四川省成都市清江东路 188 号 8 幢 11 楼 2 号, Sichuan 610072 (CN)。 钟金清 (ZHONG, Jinqing); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 龚永祥 (GONG, Yongxiang); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 朱齐凤 (ZHU, Qifeng); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 刘晓宇 (LIU, Xiaoyu); 中国浙江省台州市

椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 郑晓鹤 (ZHENG, Xiaohe); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (CN)。 刘礼飞 (LIU, Lifei); 中国浙江省台州市椒江区外沙路 46 号, Zhejiang 318000 (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, 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, 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。

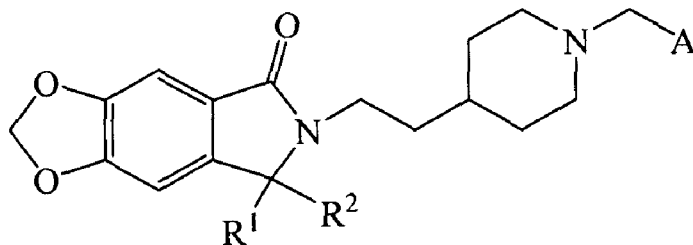
(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (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))。

(54) Title: BENZODIOXOLE DERIVATIVE AND PREPARATION METHOD AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 苯并间二氧杂环戊烯衍生物及其制备方法和用途



(I)

(57) Abstract: Provided in the present invention are novel benzodioxole derivatives and the preparation method thereof. These compounds of formula (I) or pharmaceutically acceptable salts thereof have acetylcholine esterase inhibitory activity, so can be used in the treatment or prevention of Alzheimer's disease. The definitions of R¹, R² and A of formula (I) can be seen in the description.

(57) 摘要: 本发明提供一类新的苯并间二氧杂环戊烯衍生物以及这类化合物的制备方法。这类由式 (I) 所表示的化合物或其药学上可接受的盐具有乙酰胆碱酯酶抑制活性, 可以用于治疗或者预防阿尔茨海默氏症 (Alzheimer's disease)。式 (I) 中的 R¹、R² 和 A 的定义见说明书。



WO 2014/005421 A1