

(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
2016 年 2 月 4 日 (04.02.2016)



(10) 国际公布号
WO 2016/015581 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07C 219/04 (2006.01) A61K 31/167 (2006.01)
C07C 237/20 (2006.01) A61P 23/02 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2015/084760
- (22) 国际申请日: 2015 年 7 月 22 日 (22.07.2015)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
201410373447.3 2014 年 8 月 1 日 (01.08.2014) CN
- (71) 申请人: 四川大学华西医院 (WEST CHINA HOSPITAL, SICHUAN UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。
- (72) 发明人: 唐磊 (TANG, Lei); 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。 刘进 (LIU, Jin); 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。 张文胜 (ZHANG, Wen-sheng); 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。 杨俊 (YANG, Jun); 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。 柯博文 (KE, Bowen); 中国四川省成

都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。 尹芹芹 (YIN, Qin-qin); 中国四川省成都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。

- (74) 代理人: 成都高远知识产权代理事务所(普通合伙) (GAOYUNG INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY (GENERAL PARTNERSHIP)); 中国四川省成都市高新区衣冠庙邮局 A-42 号信箱 (高朋大道 5 号博士创业园), Sichuan 610041 (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, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, 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, 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, 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,

[见续页]

(54) Title: DIMETHYLPHENYLAMMONIUM LONG-CHAIN COMPOUND, PREPARATION, SELF-ASSEMBLED STRUCTURE AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 二甲基苯铵类长链化合物、制备、自组装结构及用途

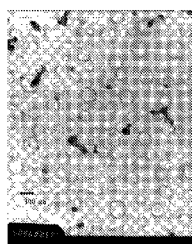
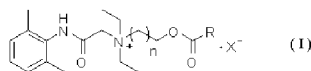


图 7 / Fig. 7



(57) Abstract: Disclosed are a dimethylphenylammonium long-chain compound, a preparation, a self-assembled structure and a use thereof. The compound can have an ultra-long-acting anaesthetic effect, is a N-diethylaminoacetyl-2,6-dimethylphenylammonium compound, and the structure thereof is as shown by formula (I). The compound can perform self-assembly in an aqueous solvent to form a micelle or a gel, and the micelle or gel can exert a long-time local anaesthetic effect on an organism, wherein the local anaesthetic and/or analgetic time may exceed 72 hours. The compound can be used as a biological material capable of performing self-assembly in water to form a micelle or gel and having a local anaesthetic effect; at the same time, the compound can also be used as a biological material for wrapping a pharmaceutically active molecule and/or drug carrier, comprising a pharmaceutically active molecule and/or drug carrier used for treating pain, pruritus and other symptoms, as well as a preparation excipient used for a delivery system, etc., all having good prospects.

(57) 摘要:

[见续页]

WO 2016/015581 A1



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))。

二甲基苯铵类长链化合物、制备、自组装结构及用途。该化合物能具有超长效麻醉效应，是一种 N-二乙氨基乙酰-2,6-二甲基苯铵化合物，结构如式（I）所示。该化合物可在含水溶剂中自组装形成胶束或凝胶，在生物体内可发挥长时间局部麻醉作用，局麻和/或镇痛作用时间可超过 72 小时。作为在水中能自组装形成的该胶束或凝胶和具有局麻作用的生物材料，同时还可以作为包裹包括治疗疼痛、瘙痒等症状的药物活性分子和/或药物载体的生物材料及传递系统等使用的制剂辅料，都具有良好的前景。