

(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
2013 年 4 月 18 日 (18.04.2013)



(10) 国际公布号
WO 2013/053287 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07D 307/88 (2006.01) A61K 31/665 (2006.01)
C07F 9/655 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
A61K 31/365 (2006.01) A61P 25/20 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2012/081963
- (22) 国际申请日: 2012 年 9 月 26 日 (26.09.2012)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
201110309074.X 2011 年 10 月 13 日 (13.10.2011) CN
- (71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 石家庄以岭药业股份有限公司 (SHIJIAZHUANG YILING PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市高新技术产业开发区天山大街 238 号, Hebei 050035 (CN)。
- (72) 发明人: 及
- (71) 申请人 (仅对美国): 王伟 (WANG, Wei) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市高新技术产业开发区天山大街 238 号, Hebei 050035 (CN)。周亚耀 (ZHOU, Yayao) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市高新技术产业开发区天山大街 238 号, Hebei 050035 (CN)。刘亚楠 (LIU, Ya'nan) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市高新技术产业开发区天山大街 238 号, Hebei 050035 (CN)。

(74) 代理人: 北京集佳知识产权代理有限公司 (UNITALEN ATTORNEYS AT LAW); 中国北京市朝阳区建国门外大街 22 号赛特广场 7 层, Beijing 100004 (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, KM, 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。

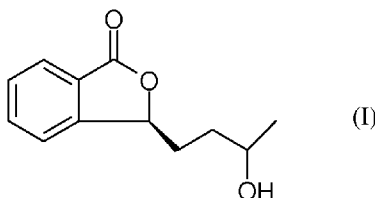
(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI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

(54) 发明名称: 一种丁苯酞的衍生物及其制法和用途



(57) Abstract: (-)-(S)-3-(3'-hydroxy)-butylphthalide (a compound shown by Formula I) and an ester formed of the same and an acid are proved by experiments to be applicable to treatment and prevention of cerebral ischemic diseases and have a sleep-improving function. The acid refers to a pharmaceutically acceptable inorganic or organic acid. The inorganic acid refers to nitric acid, sulfuric acid, or phosphoric acid. In addition to an acid radical, the organic acid at least comprises at least one of an amino group, a hydroxyl group, and a carboxyl group. None of the compound shown by Formula I and the ester thereof is water-soluble. An ester generated from the compound and the acid further react with an acid or a base to generate a salt which is water-soluble and is used to prepare injection preparation. The experiment proves that the salt does not stimulate vessels.

(57) 摘要: (-)-(S)-3-(3'-羟基)-丁基苯酞 (式 I 所示的化合物) 及其与酸成的酯, 实验证明可以用于治疗和预防脑缺血性疾病及改善睡眠的作用。所述的酸是指药学上可接受的无机酸或有机酸, 无机酸是指硝酸、硫酸或磷酸, 所述有机酸除酸根外至少还含有氨基、羟基或羧基中的一种基团、至少含有一个。式 I 所示的化合物及其酯均不溶于水, 成酯后的化合物继续与酸或碱成盐, 可以解决水溶性, 制备成注射制剂, 实验证明无血管刺激性。

WO 2013/053287 A1