

(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 5 月 2 日 (02.05.2013)



(10) 国际公布号
WO 2013/060097 A1

(51) 国际专利分类号:

C07C 271/28 (2006.01) A61K 31/4184 (2006.01)
C07C 269/04 (2006.01) A61P 25/08 (2006.01)
C07C 233/43 (2006.01) A61P 25/04 (2006.01)
C07C 231/02 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
C07D 235/26 (2006.01) A61P 25/00 (2006.01)
A61K 31/27 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
A61K 31/167 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2012/001423

(22) 国际申请日: 2012 年 10 月 23 日 (23.10.2012)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201110328036.9 2011 年 10 月 25 日 (25.10.2011) CN

(71) 申请人: 中国科学院上海药物研究所 (SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 南发俊 (NAN, Fajun); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 利民 (LI, Min); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 高召兵 (GAO, Zhaobing); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai

201203 (CN)。 陈飞 (CHEN, Fei); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 张仰明 (ZHANG, Yangming); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 周平正 (ZHOU, Pingzheng); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 胡海宁 (HU, Haining); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 许海燕 (XU, Haiyan); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。 刘晨 (LIU, Sheng); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

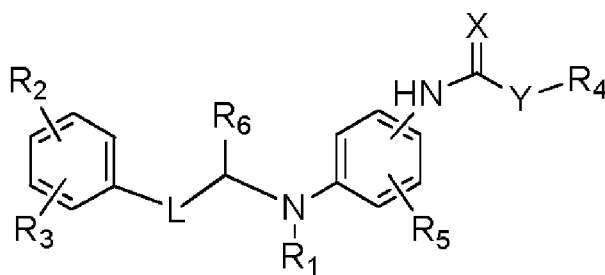
(74) 代理人: 北京金信立方知识产权代理有限公司 (KINGSOUND & PARTNERS); 中国北京市海淀区紫竹院路 116 号嘉豪国际中心 B 座 11 层, Beijing 100097 (CN)。

(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,

[见续页]

(54) Title: NOVEL COMPOUND AS KCNQ POTASSIUM CHANNEL AGONIST, PREPARATION METHOD THEREOF AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一类可用作 KCNQ 钾通道激动剂的新型化合物、其制备方法和用途



I

(57) Abstract: The present invention provides compounds having the structure represented by general formula I, pharmaceutically acceptable salts thereof, preparation methods therefor and a use thereof in the preparation of a medicine for the treatment of nervous system diseases. The compounds or pharmaceutical compositions thereof can be used as the KCNQ potassium channel agonist for treating nervous system diseases. Compared to retigabine, a compound in the prior art, the compounds of the present invention have the same or better therapeutic effect, are easier for synthesis and storage, and less prone to oxidative deterioration.

(57) 摘要: 本发明提供了一类具有以下通式 I 表示的结构的化合物及其药学上可接受的盐, 以及其制备方法和在制备治疗神经系统疾病等的药物中的用途, 所述化合物或其药物组合物可作为 KCNQ 钾通道激动剂用于治疗神经系统疾病。本发明的化合物具有与现有技术中化合物 Retigabine (瑞替加宾) 相同或更佳的治疗效果, 并且更易于合成及储存, 同时不易发生氧化变质。



WO 2013/060097 A1



SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, ZA, ZM, ZW。

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)。

- (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,

本国际公布:

- 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。