

(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
2021 年 6 月 3 日 (03.06.2021)



(10) 国际公布号
WO 2021/104486 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 231/56 (2006.01) *C07D 209/44* (2006.01)
C07D 235/04 (2006.01) *C07D 487/04* (2006.01)
C07D 209/04 (2006.01) *A61P 1/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/132418

(22) 国际申请日: 2020 年 11 月 27 日 (27.11.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201911203127.2 2019 年 11 月 29 日 (29.11.2019) CN

(71) 申请人: 武汉朗来科技发展有限公司 (WUHAN LL SCIENCE AND TECHNOLOGY DEVELOPMENT CO., LTD.) [CN/CN]; 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。

(72) 发明人: 娄军 (LOU, Jun); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 陈永凯 (CHEN, Yongkai); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 张铁涵 (ZHANG, Yihan); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 郭晓丹 (GUO, Xiaodan); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 钱丽娜 (QIAN, Lina); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 柳力 (LIU, Li); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 彭微 (PENG, Wei); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道

666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 容飞 (RONG, Fei); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。 王朝东 (WANG, Zhaodong); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道 666 号武汉国家生物产业基地研发区 C2-2, Hubei 430075 (CN)。

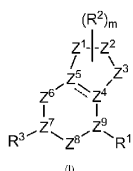
(74) 代理人: 上海弼兴律师事务所 (SHANGHAI BESHINING LAW OFFICE); 中国上海市小木桥路 681 号外经大厦 21 楼, Shanghai 200032 (CN)。

(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, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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, 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)。

(54) Title: COMPOUND CONTAINING BENZENE RING AND APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一种含苯环的化合物及其应用



(57) Abstract: Provided are a compound containing a benzene ring as shown in formula I, a pharmaceutically acceptable salt thereof, a stereoisomer thereof, a tautomer thereof, an isotopic compound thereof, a crystal form thereof, a nitrogen oxide thereof, and a solvate thereof or a solvate of the pharmaceutically acceptable salt thereof. The compound has high P2X4 antagonistic activity, good selectivity, low toxicity, and good metabolic stability.

(57) 摘要: 提供一种如式 I 所示的含苯环的化合物、其药学上可接受的盐、其立体异构体、其互变异构体、其同位素化合物、其晶型、其氮氧化物、其溶剂合物或其药学上可接受的盐的溶剂合物, 该化合物具有高的 P2X4 拮抗活性, 且具有较好的选择性, 毒性较低、代谢稳定性较好。

[见续页]

WO 2021/104486 A1

根据细则4.17的声明：

- 关于申请人有权申请并被授予专利(细则4.17(ii))
- 关于申请人有权要求在先申请的优先权(细则4.17(iii))
- 发明人资格(细则4.17(iv))

本国际公布：

- 包括国际检索报告(条约第21条(3))。