

(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
2015 年 7 月 2 日 (02.07.2015)



(10) 国际公布号
WO 2015/096551 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07D 233/90 (2006.01) *A61P 23/00* (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2014/089898
- (22) 国际申请日: 2014 年 10 月 30 日 (30.10.2014)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
201310716377.2 2013 年 12 月 23 日 (23.12.2013) 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: 张文胜 (ZHANG, Wensheng); 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)。 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)。 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)。 柯博文 (KE, Bowen); 中国四川省成

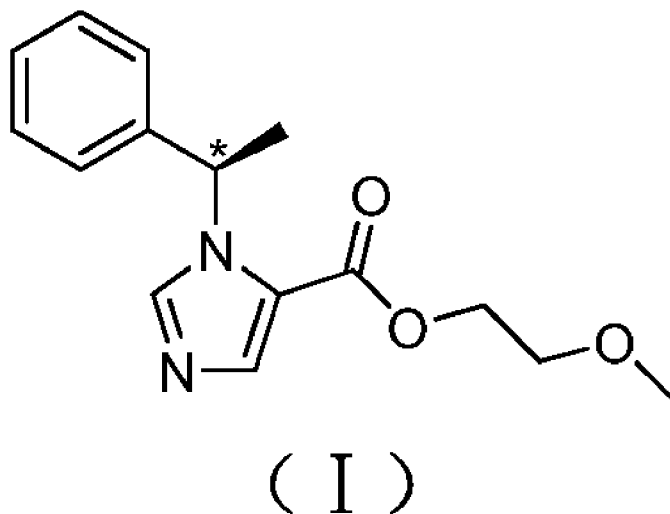
都市武侯区外南国学巷 37 号, Sichuan 610041 (CN)。

- (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, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO,

[见续页]

(54) Title: N-SUBSTITUTED IMIDAZOLE CARBOXYLIC ESTER CHIRAL COMPOUND CONTAINING ETHER SIDE CHAIN, PREPARATION METHOD AND APPLICATION

(54) 发明名称: 含有醚侧链的 N-取代咪唑羧酸酯手性化合物、制备方法和用途



(57) Abstract: An N-substituted imidazole carboxylic ester chiral compound containing an ether side chain, a preparation method and an application. The structure of the compound is represented by formula (I). The compound can generate a rapid and reversible general anesthesia effect. Animal experiments show that the compound has rapid and short-acting pharmacological characteristics and can be used as a rapid and short-acting general anesthesia medicine. Meanwhile, compared with etomidate, the compound can reduce the inhibition on synthesis of adrenal cortical hormone, recovery is rapid and thorough, and the compound has obvious advantages and good application prospects. The only chiral carbon in the structure of the compound must be of R type. The imidazole ring in the structure of the compound has acidifiable N atoms, so that the compound and medicinal salt molecules thereof can be applied to the preparation of central inhibitory medicines capable of generating sedative, hypnotic and/or anesthetic effects on animals or human through veins or paths outside veins.

(57) 摘要:

[见续页]



RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, **本国际公布:**

CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, — 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。
TG)。

含有醚侧链的 N-取代咪唑羧酸酯手性化合物、制备方法和用途。所说化合物的结构如式 (I) 所示。该化合物能够产生快速、可逆的全身麻醉效应。动物实验显示出快速、短效的药理特点, 可作一类速效、短效的全身麻醉药物使用, 同时与依托咪酯相比能够降低对肾上腺皮质激素合成的抑制, 苏醒恢复迅速而彻底, 具有明显的优势和良好的应用前景。此化合物结构中唯一的手性碳必须是 R 型。此化合物结构中咪唑环上具有可酸化的 N 原子, 因此该化合物及其可药用的盐类分子可以在制备作为经静脉或静脉外途径对动物或人产生镇静催眠和/或麻醉作用的中枢抑制性药物中应用。