

(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



(10) 国际公布号

WO 2022/012409 A1

(43) 国际公布日
2022 年 1 月 20 日 (20.01.2022)

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/06 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)
C07D 487/02 (2006.01) A61P 9/00 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 293/10 (2006.01) A61P 3/08 (2006.01)
A61K 31/395 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/105263

(22) 国际申请日: 2021 年 7 月 8 日 (08.07.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010676711.6 2020 年 7 月 14 日 (14.07.2020) CN
202110040185.9 2021 年 1 月 11 日 (11.01.2021) 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: 李金平(LI, Jinping); 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)。曾晶(ZENG, Jing); 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)。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)。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

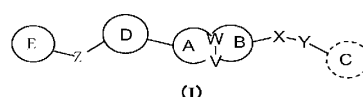
基地研发区C2-2, Hubei 430075 (CN)。柳力(LIU, Li); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道666号武汉国家生物产业基地研发区C2-2, Hubei 430075 (CN)。陈晓亚(CHEN, Xiaoya); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道666号武汉国家生物产业基地研发区C2-2, Hubei 430075 (CN)。张铁涵(ZHANG, Yihan); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道666号武汉国家生物产业基地研发区C2-2, Hubei 430075 (CN)。陈永凯(CHEN, Yongkai); 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道666号武汉国家生物产业基地研发区C2-2, Hubei 430075 (CN)。王朝东(WANG, Chaodong); 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)。吴伟(WU, 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)。袁意(YUAN, Yi); 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: 北京知元同创知识产权代理事务所(普通合伙)(BEIJING ORIGINTELLIGENCE IP LAW FIRM); 中国北京市海淀区上地三街9号嘉华大厦E座1004室刘元霞汪泉, Beijing 100085 (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,

(54) Title: ROCK INHIBITOR, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种ROCK抑制剂及其制备方法和用途



(57) Abstract: A ROCK inhibitor represented by formula (I), and a preparation method therefor and a use thereof. The ROCK inhibitor has excellent ROCK inhibition activity, particularly shows good selective inhibition on ROCK2 kinase, has good safety and metabolic stability, and is high in bioavailability. The preparation method for the ROCK inhibitor is simple, and the ROCK inhibitor is easy to purify, and therefore has a good application prospect.

(57) 摘要: 一种涉及式(I)所示的ROCK抑制剂及其制备方法和用途。其具有优异的ROCK抑制活性, 尤其表现为对ROCK2激酶有较好的选择性抑制, 具有较好的安全性和代谢稳定性, 生物利用度高。其制备方法简单、易于提纯, 因此具有良好的应用前景。

[见续页]

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)。

根据细则4.17的声明:

— 关于申请人有权要求在先申请的优先权 (细则
4.17(iii))

本国际公布:

— 包括国际检索报告 (条约第21条(3))。