

(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
2010 年 4 月 8 日 (08.04.2010)



PCT



(10) 国际公布号

WO 2010/037271 A1

(51) 国际专利分类号:

C07C 237/44 (2006.01) C07D 239/52 (2006.01)
C07C 233/12 (2006.01) A61K 31/21 (2006.01)
C07C 229/54 (2006.01) A61K 31/165 (2006.01)
C07C 327/16 (2006.01) A61K 31/255 (2006.01)
C07C 307/02 (2006.01) A61P 31/12 (2006.01)
C07C 303/26 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2009/001094

(22) 国际申请日: 2009 年 9 月 28 日 (28.09.2009)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
200810168824.4 2008 年 9 月 28 日 (28.09.2008) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 中国医学科学院医药生物技术研究所 (INSTITUTE OF MEDICINAL BIOTECHNOLOGY, CHINESE ACADEMY OF MEDICAL SCIENCES) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。

(72) 发明人: 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): 蒋建东 (JIANG, Jiandong) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。余利岩 (YU, Liyan) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。岑山 (CEN, Shan) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。李卓荣 (LI, Zhuorong) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。李艳萍

(LI, Yanping) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。徐建 (XU, Jian) [CN/CN]; 中国北京市崇文区天坛西里 1 号, Beijing 100050 (CN)。

(74) 代理人: 北京科龙寰宇知识产权代理有限公司 (KELONG INTERNATIONAL PROPERTY AGENT LTD.); 中国北京市海淀区知春路 6 号锦秋国际大厦 A-1303 孙皓晨, Beijing 100088 (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, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, 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, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (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, 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: A GROUP OF AMINO SUBSTITUTED BENZOYL DERIVATIVES AND THEIR PREPARATION AND THEIR USE

(54) 发明名称: 一组氨基苯酰衍生物及其制备方法和应用

(57) Abstract: A group of amino substituted benzoyl derivatives, their preparation and their use. The screening and research on an antiviral drug with hA3G/Vif as a target point proves that the 3-amino benzoyl derivatives not only have inhibiting the combined activity for the hA3G/Vif, but also have a function of inhibiting replication of viruses. The present invention provides the possible breakthrough progress for the problem of HIV drug resistance, thereby providing a novel clinical antiviral drug which has higher efficiency.

(57) 摘要:

本发明涉及一组胺基苯酰衍生物及其制备方法和应用; 通过对 hA3G/Vif 为靶点的抗病毒药物筛选研究, 证明 3-胺基苯酰衍生物具有抑制 hA3G/Vif 结合活性, 还具有抑制病毒复制的作用, 这对解决 HIV 耐药性问题可望取得突破性进展, 从而为临床提供更有效的新型抗病毒药物。

WO 2010/037271 A1