

(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 2022/217821 A1

(43) 国际公布日
2022 年 10 月 20 日 (20.10.2022)

(51) 国际专利分类号:
C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/495 (2006.01)
C07D 473/34 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/117495

(22) 国际申请日: 2021 年 9 月 9 日 (09.09.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202110395086.2 2021 年 4 月 13 日 (13.04.2021) CN

(71) 申请人: 深圳市新捷生物科技有限公司
(SHENZHEN NEWDEL BIOTECH CO., LTD.) [CN/
CN]; 中国广东省深圳市龙华区观澜街道新
澜社区观光路 1301-76 号银星智界二期 1 号
楼 A1503, Guangdong 518110 (CN)。

(72) 发明人: 陆小云 (LU, Xiaoyun); 中国广东省广州
市天河区黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632
(CN)。 张章 (ZHANG, Zhang); 中国广东省广州
市天河区黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632
(CN)。 丁克 (DING, Ke); 中国广东省广州市天河
区黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。
项双 (XIANG, Shuang); 中国广东省广州市天河
区黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。
王杰 (WANG, Jie); 中国广东省广州市天河区黄
埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。 涂正
超 (TU, Zhengchao); 中国广东省广州市天河区
黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。 张
志民 (ZHANG, Zhimin); 中国广东省广州市天河
区黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。
唐霞 (TANG, Xia); 中国广东省广州市天河区黄
埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。 王祖

勤 (WANG, Zuqin); 中国广东省广州市天河区
黄埔大道西 601 号, Guangdong 510632 (CN)。 何
询 (HE, Xun); 中国广东省深圳市龙华区观澜
街道新澜社区观光路 1301-76 号银星智界二期
1 号楼 A1503, Guangdong 518110 (CN)。 金锋
(JIN, Feng); 中国广东省深圳市龙华区观澜街
道新澜社区观光路 1301-76 号银星智界二期
1 号楼 A1503, Guangdong 518110 (CN)。 张水华
(ZHANG, Shuihua); 中国广东省深圳市龙华区观
澜街道新澜社区观光路 1301-76 号银星智界二
期 1 号楼 A1503, Guangdong 518110 (CN)。 李振
伟 (LI, Zhenwei); 中国广东省深圳市龙华区观澜
街道新澜社区观光路 1301-76 号银星智界二期
1 号楼 A1503, Guangdong 518110 (CN)。

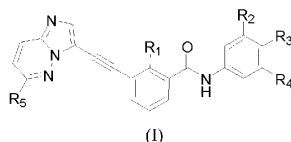
(74) 代理人: 广州广典知识产权代理事务所 (普通合
伙) (GUANGZHOU PRIME IP LAW OFFICE); 中
国广东省广州市天河区天源路 5 号天河新天地
C 座 1010 室, Guangdong 510000 (CN)。

(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,

(54) Title: ALKYNYPHENYLBENZAMIDE COMPOUND AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 炔苯基苯酰胺类化合物及其应用



(57) Abstract: The present invention relates to an alkynylphenylbenzamide compound and the use thereof. The alkynylphenylbenzamide compound of the present invention has a structure as shown in formula (I), can be used as a protein kinase inhibitor, can effectively inhibit the activity of a TRK protein kinase and can inhibit the proliferation, migration and invasion of various tumor cells, and also has the characteristics of good pharmacokinetics and low toxicity.

(57) 摘要: 本发明涉及一种炔苯基苯酰胺类化合物及其应用。本发明的炔苯基苯酰胺类化合物具有式(I)所示结构, 该类化合物可作为蛋白激酶抑制剂, 能够有效抑制TRK蛋白激酶的活性并且能抑制多种肿瘤细胞的增殖、迁移和侵袭, 同时具有较好的药代动力学和毒性低的特点。

[见续页]

WO 2022/217821 A1

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：

- 关于发明人身份(细则4.17(i))
- 关于申请人有权申请并被授予专利(细则4.17(ii))

本国际公布：

- 包括国际检索报告(条约第21条(3))。