

## (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 2019/223704 A1**

(43) 国际公布日

2019 年 11 月 28 日 (28.11.2019)

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/437 (2006.01)  
C07D 401/12 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)  
C07D 401/14 (2006.01) A61K 31/5025 (2006.01)  
C07D 403/12 (2006.01) A61K 31/4985 (2006.01)  
C07D 403/14 (2006.01) A61K 31/4709 (2006.01)  
C07D 453/04 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)  
C07D 487/04 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/087867

(22) 国际申请日: 2019 年 5 月 21 日 (21.05.2019)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:  
201810491115.3 2018 年 5 月 21 日 (21.05.2018) CN

(71) 申请人: 中国科学院上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 柳红(LIU, Hong); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。耿美玉(GENG, Meiyu); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。周宇(ZHOU, Yu); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。丁健(DING, Jian); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。方非非(FANG, Feifei); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。艾菁(AI, Jing); 中国上海市浦东张江祖冲之

路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。李建(LI, Jian); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。彭霞(PENG, Xia); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。蒋华良(JIANG, Hualiang); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。季寅淳(JI, Yinchun); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。陈凯先(CHEN, Kaixian); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

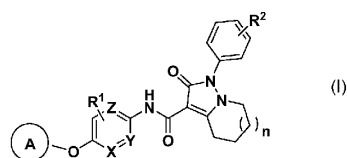
(74) 代理人: 上海一平知识产权代理有限公司(XU & PARTNERS, LLC.); 中国上海市普陀区真北路 958 号天地科技广场 1 号楼 106 室, Shanghai 200333 (CN)。

(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, 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, 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,

(54) Title: FUSED-CYCLIC PYRAZOLONE FORMAMIDE COMPOUND AND PREPARATION METHOD THEREFOR, PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一类并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物及其制备方法、药物组合物和用途



(I)

(57) Abstract: Provided are a class of fused-cyclic pyrazolone formamide compounds and a preparation method therefor, a pharmaceutical composition and the use thereof. Specifically, provided is a compound having the structure as shown in formula (I) (with each group defined in the description). The compound can be used as an AXL inhibitor in the preparation of a pharmaceutical composition for treating tumors.

(57) 摘要: 本发明提供了一类并环吡唑啉酮甲酰胺类化合物及其制备方法、药物组合物和用途, 具体地, 本发明提供了一种具有如式(I)所示结构的化合物(各基团定义如说明书中所述)。该化合物可以作为AXL抑制剂, 用于制备治疗肿瘤的药物组合物。

[见续页]

WO 2019/223704 A1

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)。

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。