

(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 9 月 3 日 (03.09.2015)



(10) 国际公布号
WO 2015/127872 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/5377 (2006.01)
C07D 239/48 (2006.01) A61K 31/53 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01) A61K 31/553 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) A61K 31/5386 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) A61P 3/10 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) A61P 37/02 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
C07D 491/08 (2006.01) A61P 9/00 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2015/073044

(22) 国际申请日: 2015 年 2 月 13 日 (13.02.2015)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201410065195.8 2014 年 2 月 25 日 (25.02.2014) CN

(71) 申请人: 上海海雁医药科技有限公司 (SHANGHAI HAIYAN PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY CO. LTD) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 兰炯 (LAN, Jiong); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。金云舟 (JIN, Yunzhou); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。周福生 (ZHOU, Fusheng); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。谢婧 (XIE, Jing); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。沈思达 (SHEN, Sida); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。胡毅 (HU, Yi); 中国上海市

浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。刘伟 (LIU, Wei); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。吕强 (LV, Qiang); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路 67 弄 8 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, 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, 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))。

(54) Title: 2,4-DISUBSTITUTED PHENYLENE-1,5-DIAMINE DERIVATIVES AND APPLICATIONS THEREOF, AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS AND PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE COMPOSITIONS PREPARED THEREFROM

(54) 发明名称: 2,4-二取代苯-1,5-二胺衍生物及其应用以及由其制备的药物组合物和药用组合物

(57) Abstract: The present invention provides a class of 2,4-disubstituted phenylene-1,5-diamine derivatives, having an inhibiting effect on EGFR tyrosine kinases, and pharmaceutically acceptable salt, stereoisomer, solvate, or prodrug of said derivatives. See the description for the definitions of each group in the formula. In addition, the present invention also discloses pharmaceutical compositions, pharmaceutically acceptable compositions, and applications thereof.

(57) 摘要: 本发明提供了一类对 EGFR 酪氨酸激酶具有抑制作用的 2,4-二取代苯-1,5-二胺衍生物及其药学上可接受的盐、立体异构体、溶剂化物或前药。式中各基团的定义详见说明书。此外, 本发明还公开了该化合物的药物组合物、药用组合物及其应用。



WO 2015/127872 A1