

(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
2020 年 9 月 10 日 (10.09.2020)



(10) 国际公布号
WO 2020/177653 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/14 (2006.01) C07D 403/12 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) C07D 403/04 (2006.01)
C07D 491/107 (2006.01) A61K 31/497 (2006.01)
C07D 471/10 (2006.01) A61K 31/4985 (2006.01)
C07D 498/10 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 241/20 (2006.01) A61P 35/02 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/077391

(22) 国际申请日: 2020 年 3 月 2 日 (02.03.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201910160960.7 2019 年 3 月 4 日 (04.03.2019) CN

(71) 申请人: 勤浩医药 (苏州) 有限公司 (SUZHOU GENHOUSE PHARMACEUTICAL CO., LTD) [CN/CN]; 中国江苏省苏州市苏州工业园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。

(72) 发明人: 孙海丰 (SUN, Haifeng); 中国江苏省苏州市苏州工业园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。王奎锋 (WANG, Kuifeng); 中国江苏省苏州市苏州工业园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。张涛 (ZHANG, Tao); 中国江苏省苏州市苏州工业

园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。马梦楠 (MA, Mengnan); 中国江苏省苏州市苏州工业园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。陆金昌 (LU, Jinchang); 中国江苏省苏州市苏州工业园区若水路 388 号 D505、507 室, Jiangsu 215000 (CN)。

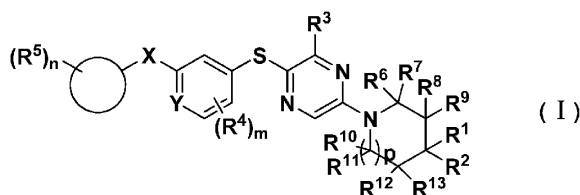
(74) 代理人: 北京林达刘知识产权代理事务所 (普通合伙) (LINDA LIU & PARTNERS); 中国北京市东城区北三环东路 36 号北京环球贸易中心 C 座 16 层, Beijing 100013 (CN)。

(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, 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: PYRAZINE DERIVATIVE AND APPLICATION THEREOF IN INHIBITING SHP2

(54) 发明名称: 吡嗪类衍生物及其在抑制 SHP2 中的应用



(57) Abstract: The present invention relates to a pyrazine derivative, an application thereof in inhibiting SHP2, and a compound of formula (I) or pharmaceutically acceptable salts, esters, isomers, solvates, prodrugs or isotope labels thereof. The structure of the compound of formula (I) is as follows. The novel pyrazine derivative provided by the present invention has excellent inhibition of SHP2 activity and can be used to prevent and/or treat non-receptor protein tyrosine phosphatase-mediated or dependent diseases or disorders.

(57) 摘要: 本发明涉及一种吡嗪类衍生物及其在抑制 SHP2 中的应用, 一种式 (I) 化合物或其药学上可接受的盐、酯、异构体、溶剂化物、前药或同位素标记物, 所述式 (I) 化合物结构如下。本发明所提供的新型吡嗪类衍生物, 具有优异的抑制 SHP2 的活性, 能够用于预防和/或治疗非受体蛋白酪氨酸磷酸酶介导的或依赖的疾病或病症。

[见续页]



WO 2020/177653 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)。

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。