

(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
2021 年 6 月 24 日 (24.06.2021)



(10) 国际公布号
WO 2021/121294 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 487/04 (2006.01) *A61P 21/00* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) *A61P 25/30* (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01) *A61P 25/28* (2006.01)
A61K 31/541 (2006.01) *A61P 9/10* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/136998

(22) 国际申请日: 2020 年 12 月 16 日 (16.12.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201911296884.9 2019 年 12 月 16 日 (16.12.2019) CN

(71) 申请人: 上海赛默罗生物科技有限公司 (SHANGHAI SIMR BIOTECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。上海赛默罗德生物科技有限公司 (SHANGHAI SIMRD BIOTECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区南汇新城环湖西二路 888 号 C 楼, Shanghai 201306 (CN)。

(72) 发明人: 金赞 (JIN, Yun); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。王非 (WANG, Fei); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。吴金华 (WU, Jinhua); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。陈南阳 (CHEN, Nanyang); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。孙勇 (SUN, Yong); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。李帅 (LI, Shuai); 中国上海市浦东新区国际医学园区半夏路 100 弄 26 号楼, Shanghai 201318 (CN)。

(74) 代理人: 上海弼兴律师事务所 (SHANGHAI BESHINING LAW OFFICE); 中国上海市徐汇区小木桥路 681 号外经大厦 21 楼, Shanghai 200032 (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, 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:

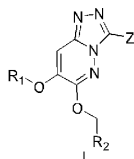
- 关于申请人有权申请并被授予专利 (细则 4.17(ii))
- 发明人资格 (细则 4.17(iv))

本国际公布:

- 包括国际检索报告 (条约第 21 条 (3))。

(54) Title: TRIAZOLOPYRIDAZINE DERIVATIVE, PREPARATION METHOD THEREFOR, PHARMACEUTICAL COMPOSITION THEREOF, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 三唑并吡嗪类衍生物、其制备方法、药物组合物和用途



(57) Abstract: Provided is a triazolo-pyridazine derivative, a preparation method therefor, a pharmaceutical composition thereof, and an application thereof. The triazolo-pyridazine derivative is represented by formula I. The triazolo-pyridazine derivative has excellent inverse agonistic activity, thermodynamic solubility, bioavailability, and pharmacokinetic properties; thus having promising application prospects.

(57) 摘要: 提供了一种三唑并吡嗪类衍生物、其制备方法、药物组合物和用途。该类三唑并吡嗪类衍生物如式 I 所示。所述三唑并吡嗪类衍生物具有良好的反向激动活性、反向激动活性、热力学溶解度、生物利用度和和药代动力学性质, 具有较好的应用前景。



WO 2021/121294 A1