

(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 5 月 7 日 (07.05.2020)



(10) 国际公布号
WO 2020/088442 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/404 (2006.01)
C07D 211/96 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 215/20 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/113963

(22) 国际申请日: 2019 年 10 月 29 日 (29.10.2019)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201811268572.2 2018 年 10 月 29 日 (29.10.2018) CN
201910249783.X 2019 年 3 月 29 日 (29.03.2019) CN
201910933513.0 2019 年 9 月 29 日 (29.09.2019) CN

(71) 申请人: 正大天晴药业集团股份有限公司 (CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(72) 发明人: 刘飞 (LIU, Fei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。丰巍伟 (FENG, Weiwei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。王斌 (WANG, Bin); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。徐宏江 (XU, Hongjiang); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。汪纪楠 (WANG, Jinan); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。张喜全 (ZHANG, Xiquan); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。王善春 (WANG,

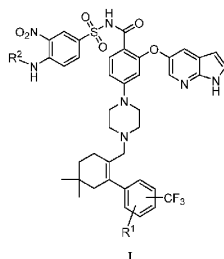
Shanchun); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。刘彦龙 (LIU, Yanlong); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。张健青 (ZHANG, Jianqing); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。姚绎炎 (YAO, Yiyang); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。唐旭静 (TANG, Xujing); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。施伟 (SHI, Wei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。张洪英 (ZHANG, Hongying); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。李洋 (LI, Yang); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。汤松 (TANG, Song); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。朱益忠 (ZHU, Yizhong); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。刘利民 (LIU, Limin); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。顾红梅 (GU, Hongmei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。杨玲 (YANG, Ling); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(74) 代理人: 北京信慧永光知识产权代理有限公司 (BEIJING SUNHOPE INTELLECTUAL PROPERTY LTD.); 中国北京市海淀区知春路9号坤讯大厦1106室, Beijing 100191 (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,

(54) Title: TRIFLUOROMETHYL-SUBSTITUTED SULFONAMIDE AS BCL-2-SELECTIVE INHIBITOR

(54) 发明名称: 三氟甲基取代的磺酰胺类选择性BCL-2抑制剂



(57) Abstract: Disclosed is a trifluoromethyl-substituted sulfonamide BCL-2-selective inhibitor, in particular disclosed are a compound of formula I, a stereoisomer or a pharmaceutically acceptable salt thereof, a preparation method therefor, and a pharmaceutical composition thereof. Also disclosed are the uses of said compound and of a pharmaceutical composition comprising same for treating anti-apoptotic BCL-2-related diseases, such as cancer.

(57) 摘要: 公开了包括三氟甲基取代的磺酰胺类选择性BCL-2抑制剂, 具体而言公开式I化合物、其立体异构体或其药学上可接受的盐、其制备方法以及该化合物的药物组合物, 还公开了该化合物以及包含该化合物的药物组合物在治疗与抗凋亡蛋白BCL-2相关疾病例如癌症中的用途。

[见续页]

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, 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))。