

(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
2013 年 12 月 5 日 (05.12.2013)



(10) 国际公布号
WO 2013/177983 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/5386 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2013/074559

(22) 国际申请日: 2013 年 4 月 23 日 (23.04.2013)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201210177980.3 2012 年 5 月 31 日 (31.05.2012) 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: 杨春皓 (YANG, Chunhao); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。蒙凌华 (MENG, Linghua); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。陈艳红 (CHEN, Yanhong); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。王祥 (WANG, Xi-ang); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。谭村 (TAN, Cun); 中国上海市浦

东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。李家鹏 (LI, Jiapeng); 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)。陈奕 (CHEN, Yi); 中国上海市浦东张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京金信立方知识产权代理有限公司 (KINGSOUND & PARTNERS); 中国北京市海淀区紫竹院路 116 号嘉豪国际中心 B 座 11 层, Beijing 100097 (CN)。

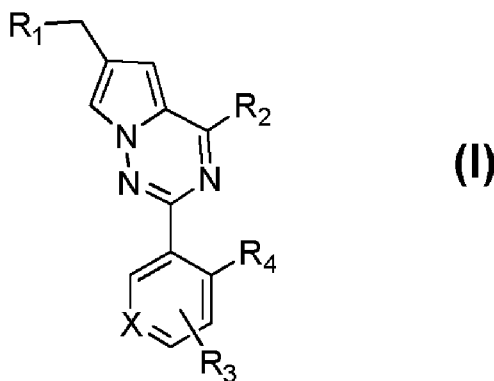
(81) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, 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, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ,

[见续页]

(54) Title: PYRROLO[2,1-f][1,2,4]TRIAZINE COMPOUND, AND PREPARATION METHOD AND APPLICATION THERE-OF

(54) 发明名称: 吡咯[2, 1-f][1, 2, 4]并三嗪类化合物, 其制备方法及其用途



(57) Abstract: The present invention relates to a pyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazine compound, an isomer thereof or a pharmaceutically acceptable salt, ester or hydrate thereof, and a preparation method and application thereof. The pyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazine compound has a structure expressed in general formula (I). The pyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazine compound expressed in general formula (I) can inhibit a phosphatidylinositol-3 kinase (PI3K) signal pathway, thereby being used to prepare medicine for treating phosphatidylinositol-3 kinase related diseases such as cancer.

(57) 摘要: 本发明涉及一种吡咯[2, 1-f][1, 2, 4]并三嗪类化合物, 其异构体或其药学上可接受的盐、酯或水合物, 其制备方法和用途。所述吡咯[2, 1-f][1, 2, 4]并三嗪类化合物具有通式 (I) 表示的结构。所述通式 (I) 表示的吡咯[2, 1-f][1, 2, 4]并三嗪类化合物可抑制磷脂酰肌醇 3-激酶 (PI3K) 信号通道, 从而用于制备磷脂酰肌醇 3-激酶相关疾病如癌症治疗的药物。



WO 2013/177983 A1



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, 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))。