

(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



(10) 国际公布号
WO 2020/172932 A1

(43) 国际公布日
2020 年 9 月 3 日 (03.09.2020)

(51) 国际专利分类号:

C07D 239/94 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)
C07D 239/95 (2006.01) A61K 31/5377 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A61P 35/02 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)

(72) 发明人: 尤启冬(YOU, Qidong); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。郭小可(GUO, Xiaoke); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。陈维琳(CHEN, Weilin); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。李冬冬(LI, Dongdong); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。顾婧(GU, Jing); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。徐俊(XU, Jun); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。陈鑫(CHEN, Xin); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。姜正羽(JIANG, Zhengyu); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。徐晓莉(XU, Xiaoli); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/079160

(22) 国际申请日: 2019 年 3 月 22 日 (22.03.2019)

(25) 申请语言: 中文

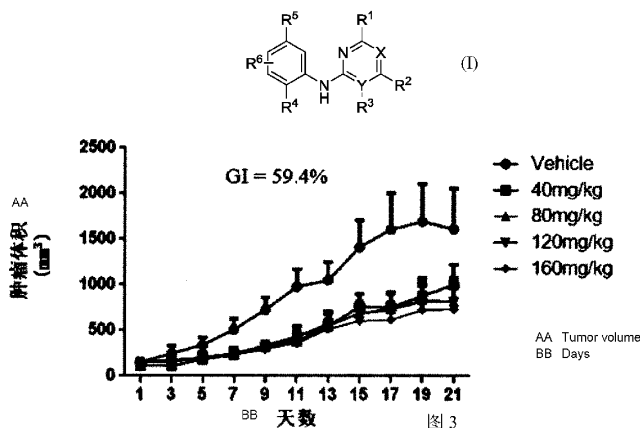
(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201910139980.6 2019年2月26日 (26.02.2019) CN

(71) 申请人: 中国药科大学 (CHINA PHARMACEUTICAL UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道639号, Jiangsu 211198 (CN)。

(54) Title: ANILINE WDR5 PROTEIN-PROTEIN INTERACTION INHIBITOR, PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 苯胺类WDR5蛋白-蛋白相互作用抑制剂及其制法和用途



(57) Abstract: Disclosed is a WDR5 protein-protein interaction inhibitor, containing a compound with a structure as shown in general formula (I). Experiments show that the inhibitor acts on the WDR5 protein and interacting proteins thereof, including, but not limited to, MLL, selectively inhibits the proliferation of leukemia cells, and inhibits, at a cellular level, the methylation of H3K4 and the expression of a downstream Hox/Meis-1 gene. Also disclosed are a method for preparing the inhibitor and the use thereof in the preparation of a drug for treating acute leukemia and other related diseases.

(57) 摘要: 本发明公开了一种WDR5蛋白-蛋白相互作用抑制剂, 包含结构如通式(I)所示的化合物。实验表明该抑制剂作用于WDR5蛋白与其相互作用蛋白包括但不限于MLL, 选择性抑制白血病细胞的增殖, 在细胞水平上抑制H3K4的甲基化和下游Hox/Meis-1基因的表达。本发明还公开了该抑制剂的制备方法以及在制备治疗急性白血病等相关疾病药物中的应用。

[见续页]

(74) 代理人: 南京经纬专利商标代理有限公司 (NANJING JINGWEI PATENT & TRADEMARK AGENCY CO., LTD); 中国江苏省南京市鼓楼区中山路179号12楼B座, Jiangsu 210005 (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, 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))。