

(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
2023 年 7 月 20 日 (20.07.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/134266 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07D 401/14 (2006.01) *C07D 491/10* (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) *C07D 519/00* (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07D 491/08 (2006.01) *A61K 31/506* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/128264

(22) 国际申请日: 2022 年 10 月 28 日 (28.10.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
PCT/CN2022/072306

2022 年 1 月 17 日 (17.01.2022) CN

PCT/CN2022/092375

2022 年 5 月 12 日 (12.05.2022) CN

(71) 申请人: 苏州浦合医药科技有限公司 (SUZHOU PUHE BIOPHARMA CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。

(72) 发明人: 刘彬 (LIU, Bin); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。高峰 (GAO, Feng); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。原帅 (YUAN, Shuai); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。赵卉 (ZHAO, Hui); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。彭星哲 (PENG, Xingzhe); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天

运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。刘肿 (LIU, Chong); 中国北京市昌平区生命园路 29 号生命科学创新大厦 E 座, Beijing 102206 (CN)。邵宁 (SHAO, Ning); 中国北京市昌平区生命园路 29 号生命科学创新大厦 E 座, Beijing 102206 (CN)。郭永起 (GUO, Yongqi); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。吴勇勇 (WU, Yongyong); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。吴卓 (WU, Zhuo); 中国江苏省苏州市吴中区郭巷街道吴淞江大道 111 号天运广场 1 幢 1 号楼 19 层, Jiangsu 215124 (CN)。

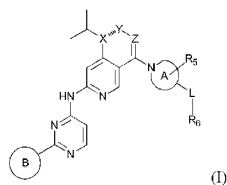
(74) 代理人: 北京市柳沈律师事务所 (LIU, SHEN & ASSOCIATES); 中国北京市海淀区彩和坊路 10 号 1 号楼 10 层, Beijing 100080 (CN)。

(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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, 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, CV, 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,

(54) Title: 2-PIPERIDYL OR 2-PYRAZOLYL SUBSTITUTED PYRIMIDINE COMPOUND SERVING AS EGFR INHIBITOR

(54) 发明名称: 2-哌啶基或2-吡唑基取代的嘧啶化合物作为EGFR抑制剂



(57) Abstract: A 2-piperidyl or 2-pyrazolyl substituted pyrimidine compound, which is a compound represented by formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt, an isotopic variant, a tautomer, a stereoisomer, a prodrug, a polymorph, a hydrate or a solvate thereof. A pharmaceutical composition comprising the compound, and a use of the pharmaceutical composition in the treatment of diseases mediated by an EGFR protein and mutants thereof.

(57) 摘要: 一种2-哌啶基或2-吡唑基取代的嘧啶化合物, 其为式(I)所示化合物或其药学上可接受的盐、同位素变体、互变异构体、立体异构体、前药、多晶型、水合物或溶剂合物。包含所述化合物的药物组合物, 及其在治疗EGFR蛋白及其突变体介导的疾病中的用途。

[见续页]

WO 2023/134266 A1

HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, 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))。