

(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
2019 年 7 月 4 日 (04.07.2019)



(10) 国际公布号
WO 2019/128918 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 319/18 (2006.01) *C07D 213/24* (2006.01)
C07D 241/12 (2006.01) *C07C 229/14* (2006.01)
C07D 235/02 (2006.01) *A61K 31/40* (2006.01)
C07D 231/56 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

技术产业开发区科丰路31号自编二栋华南新材料
创新园G5栋616号, Guangdong 510000 (CN)。

(21) 国际申请号:

PCT/CN2018/123066

(22) 国际申请日: 2018 年 12 月 24 日 (24.12.2018)

(25) 申请语言:

中文

(26) 公布语言:

中文

(30) 优先权:

201711486872.3 2017年12月29日 (29.12.2017) CN

(71) 申请人: 广州再极医药科技有限公司 (GUANGZHOU MAXINOVEL PHARMACEUTICALS CO., LTD) [CN/CN]; 中国广东省广州市高新技术产业开发区科丰路31号自编二栋华南新材料创新园G5栋616号, Guangdong 510000 (CN)。

(72) 发明人: 王玉光(WANG, Yuguang); 中国广东省广州市高新技术产业开发区科丰路31号自编二栋华南新材料创新园G5栋616号, Guangdong 510000 (CN)。 张农(ZHANG, Nong); 中国广东省广州市高新技术产业开发区科丰路31号自编二栋华南新材料创新园G5栋616号, Guangdong 510000 (CN)。 吴添智(WU, Tianzhi); 中国广东省广州市高新技术产业开发区科丰路31号自编二栋华南新材料创新园G5栋616号, Guangdong 510000 (CN)。 何敏(HE, Min); 中国广东省广州市高新

(74) 代理人: 上海弼兴律师事务所 (SHANGHAI BESHINING LAW OFFICE); 中国上海市小木桥路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, 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。

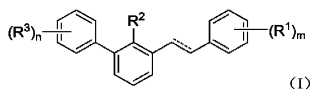
(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

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))

(54) **Title:** AROMATIC VINYL OR AROMATIC ETHYL DERIVATIVE, PREPARATION METHOD THEREFOR, INTERMEDIATE, PHARMACEUTICAL COMPOSITION, AND APPLICATION

(54) 发明名称: 芳香乙烯或芳香乙基类衍生物、其制备方法、中间体、药物组合物及应用



(1)

(57) **Abstract:** Disclosed in the present invention are an aromatic vinyl or aromatic ethyl derivative, a preparation method therefor, an intermediate, a pharmaceutical composition, and an application. The aromatic vinyl or aromatic ethyl derivative in the present invention is as represented by general formula (I). The aromatic vinyl or aromatic ethyl derivative in the present invention has an obvious inhibitory effect on PD-1/PD-L1, is a very effective small-molecule PD-1/PD-L1 inhibitor, and can effectively alleviate or treat relevant diseases such as cancer.

(57) **摘要:** 本发明公开了一种芳香乙烯或芳香乙基类衍生物、其制备方法、中间体、药物组合物及应用。本发明公开的芳香乙烯或芳香乙基类衍生物如通式(I)所示。本发明芳香乙烯或芳香乙基类衍生物对PD-1/PD-L1具有明显的抑制作用, 是一类PD-1/PD-L1非常有效的小分子抑制剂, 能够有效缓解或治疗癌症等相关疾病。

[见续页]

WO 2019/128918 A1

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。