

(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 2024/152855 A1

(43) 国际公布日
2024 年 7 月 25 日 (25.07.2024)

(51) 国际专利分类号:

C07D 237/22 (2006.01) *A61K 31/497* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/4965 (2006.01) *A61P 25/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/141928

(22) 国际申请日: 2023 年 12 月 26 日 (26.12.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202310057843.4 2023 年 1 月 17 日 (17.01.2023) CN

(71) 申请人: 中国药科大学 (CHINA PHARMACEUTICAL UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。

(72) 发明人: 徐云根 (XU, Yungen); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。邹毅 (ZOU, Yi); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。杨解平 (YANG, Jieping); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。古宏峰 (GU, Hongfeng); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。刘晓蓉 (LIU, Xiaorong); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。赵晓琳 (ZHAO, Xiaolin); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。严文昕 (YAN, Wenxin); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。王承皓 (WANG, Chenghao); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。朱启华 (ZHU, Qihua); 中国江苏省南京市鼓楼区童家巷 24 号, Jiangsu 210009 (CN)。

(74) 代理人: 南京苏高专利商标事务所 (普通合伙) (NANJING SUGAO PATENT AND TRADEMARK FIRM (ORDINARY PARTNERSHIP)); 中国江苏

省南京市白下区中山东路 198 号龙台国际大厦 1912 室, Jiangsu 210005 (CN)。

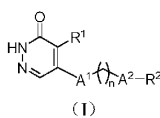
(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, 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, SC, 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, 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))。

(54) Title: PYRIDAZINONE PARP INHIBITOR, AND PREPARATION METHOD THEREFOR, AND PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 哒嗪酮类 PARP 抑制剂及其制备方法、药物组合物和应用



(57) Abstract: A pyridazinone compound as shown in formula (I), and a preparation method therefor, and a pharmaceutical composition and the use thereof. The compound, as a PARP inhibitor, has potential advantages in terms of blood-brain barrier permeability, achieves inhibitory activity on PARP enzymes at a nanomolar concentration level, and can be used in the preparation of a drug for preventing or/and treating stroke; in addition, the method for preparing the PARP inhibitor is simple and easy.

(57) 摘要: 一种式(I)所示的哒嗪酮类化合物及其制备方法、药物组合物和应用。该类化合物作为 PARP 抑制剂在血脑屏障透过性方面具有潜在优势, 对 PARP 酶的抑制活性达到纳摩尔浓度水平, 可用于制备预防或/和治疗脑卒中的药物; 此外, 该类 PARP 抑制剂的制备方法简便易行。

WO 2024/152855 A1