(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
2021 年 10 月 28 日 (28.10.2021)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2021/213538 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 239/54 (2006.01) *A61P 5/02* (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/094748

(22) 国际申请日: 2021 年 5 月 20 日 (20.05.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202010311436.8 2020年4月20日 (20.04.2020) CN

(71) 申请人: 上海英诺富成生物科技有限公司 (**SHANGHAI INNOFORTUNE BOITECH CO.LTD**) [CN/CN]; 中国上海市金山区廊下镇景乐路228号7幢(廊下经济小区), Shanghai 201516 (CN)。

(72) 发明人: 刘国强 (**LIU, Guoqiang**); 中国上海市金山区廊下镇景乐路228号7幢(廊下经济小区), Shanghai 201516 (CN)。 刘伟(**LIU, Wei**); 中国上海市金山区廊下镇景乐路228号7幢(廊下经济小区), Shanghai 201516 (CN)。 王延东(**WANG, Yandong**); 中国上海市金山区廊下镇景乐路228号7幢(廊下经济小区), Shanghai 201516 (CN)。

(74) 代理人: 上海光华专利事务所 (普通合伙) (**J.Z.M.C. PATENT AND TRADEMARK LAW OFFICE**); 中国上海市杨浦区国定路335号5022室余明伟, Shanghai 200433 (CN)。

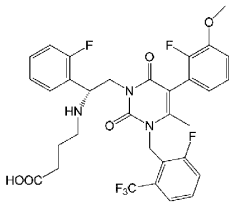
(81) 指定国(除另有指明，要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, 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, 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, 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))。
— 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息(细则26之二.3和48.2(b)(vii))。

(54) **Title:** GONADOTROPIN RELEASING HORMONE RECEPTOR ANTAGONIST AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 促性激素释放激素受体拮抗剂及其用途



I

(57) **Abstract:** Provided is a compound or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, prodrug, polymorph, or solvate thereof, and a preparation method therefor and use thereof. The compound is used as a GnRHR antagonist in a calcium flux detection experiment, has an activity equivalent to or better than that of Elagolix, and has better pharmacokinetic properties.

(57) 摘要: 提供了一种化合物或其药学上可接受的盐、异构体、前药、多晶型物或溶剂化物及其制备方法和用途。所述化合物在钙流检测实验中作为GnRHR拮抗剂，活性与Elagolix相当或更优，且具有更好的药代动力学特性

WO 2021/213538 A1