

(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 7 月 1 日 (01.07.2021)



(10) 国际公布号
WO 2021/129561 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 213/73 (2006.01) *A61K 31/44* (2006.01)
C07D 239/42 (2006.01) *A61K 31/505* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/137938

(22) 国际申请日: 2020 年 12 月 21 日 (21.12.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201911337644.9 2019 年 12 月 23 日 (23.12.2019) CN

(71) 申请人: 北京赛特明强医药科技有限公司 (BEIJING SCITECH-MQ PHARMACEUTICALS LIMITED) [CN/CN]; 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。

(72) 发明人: 张强 (ZHANG, Qiang); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。 杨磊夫 (YANG, Leifu); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。 郑南桥 (ZHENG, Nanqiao); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。 于善楠 (YU, Shannan); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。 孙月明 (SUN, Yueming); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (CN)。 郭振科 (GUO, Zhenke); 中国北京市顺义区林河北大街10号, Beijing 101320 (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,

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。

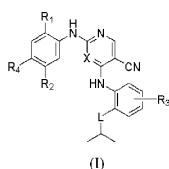
(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR),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

(54) **Title:** CYANO-SUBSTITUTED PYRIDINE AND CYANO-SUBSTITUTED PYRIMIDINE COMPOUND AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一种氰基取代吡啶及氰基取代嘧啶类化合物、制备方法及其应用



(57) **Abstract:** A cyano-substituted pyridine and cyano-substituted pyrimidine compound and a preparation method therefor and an application thereof, which specifically relate to a compound represented by formula (I) and an isomer, a hydrate, a solvate, a pharmaceutically acceptable salt, and a prodrug thereof, and a preparation method therefor and an application thereof in the preparation of a drug as a kinase inhibitor. The compound has good inhibitory activity against kinases such as FGFR4 and mutant FGFR4^{V550L}.

(57) **摘要:** 一种氰基取代吡啶及氰基取代嘧啶类化合物、制备方法及其应用, 具体涉及式 (I) 所示化合物、其异构体、水合物、溶剂化物、其药学上可接受的盐及其前药, 其制备方法及其在制备作为激酶抑制剂的药物中的应用。该化合物对FGFR4及突变型FGFR4^{V550L}等激酶均具有良好的抑制活性。

WO 2021/129561 A1