

(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 2021/244609 A1

(43) 国际公布日
2021 年 12 月 9 日 (09.12.2021)

(51) 国际专利分类号:

C07D 487/04 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01) *A61P 29/00* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01) *A61P 37/02* (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01) *A61P 37/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/098124

(22) 国际申请日: 2021 年 6 月 3 日 (03.06.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010498602.X 2020 年 6 月 4 日 (04.06.2020) CN
202010882652.8 2020 年 8 月 28 日 (28.08.2020) CN
202110311256.4 2021 年 3 月 24 日 (24.03.2021) CN

(71) 申请人: 成都倍特药业股份有限公司
(CHENGDU BRILLIANT PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [CN/CN]; 中国四川省成都市高新区高
朋大道15号, Sichuan 610064 (CN)。

(72) 发明人: 王静(WANG, Jing); 中国四川省成都市
高新区高朋大道15号, Sichuan 610064 (CN)。 赵
树春(ZHAO, Shuchun); 中国四川省成都市高新
区高朋大道15号, Sichuan 610064 (CN)。 曾绍梅
(ZENG, Shaomei); 中国四川省成都市高新区高朋
大道15号, Sichuan 610064 (CN)。 王早(WANG,
Zao); 中国四川省成都市高新区高朋大道15号,
Sichuan 610064 (CN)。 韦学振(WEI, Xuezheng);
中国四川省成都市高新区高朋大道15号, Sichuan
610064 (CN)。 黄婷婷(HUANG, Tingting); 中国
四川省成都市高新区高朋大道15号, Sichuan
610064 (CN)。 邵涛(SHAO, Tao); 中国四川省
成都市高新区高朋大道15号, Sichuan 610064
(CN)。 张晓东(ZHANG, Xiaodong); 中国四川省
成都市高新区高朋大道15号, Sichuan 610064

(CN)。 唐军(TANG, Jun); 中国四川省成都市高
新区高朋大道15号, Sichuan 610064 (CN)。

(74) 代理人: 北京市中咨律师事务所(ZHONGZI LAW
OFFICE); 中国北京市西城区平安里西大街26
号新时代大厦7层, Beijing 100034 (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。

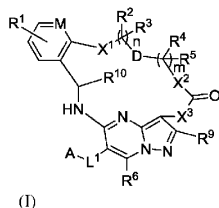
(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区
保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ,
NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT,
RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR),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

(54) 发明名称: 具有大环结构的化合物及其用途



(57) Abstract: The present invention relates to a compound of formula (I) in which L^1 , A, X^1 , X^2 , X^3 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , R^{10} , m, and n are as defined in the description, and a stereoisomer, a pharmaceutically acceptable salt, a solvate, or a tautomer thereof, and a use thereof as an RET, SRC and/BTK kinase inhibitor in the treatment of diseases such as cancer.

(57) 摘要: 涉及其中 L^1 、A、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、m、n 如说明书中所定义的式(I)化合物及其立体异构体、药
学上可接受的盐、溶剂合物、或互变异构体和其作为 RET、SRC 和/或
BTK 激酶抑制剂用于治疗疾病如癌症的用途。