

(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
2022 年 8 月 4 日 (04.08.2022)



(10) 国际公布号
WO 2022/161421 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/437 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07C 211/50 (2006.01) A61P 37/00 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/074183

(22) 国际申请日: 2022 年 1 月 27 日 (27.01.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202110137428.0 2021 年 2 月 1 日 (01.02.2021) CN

(71) 申请人: 深圳微芯生物科技股份有限公司 (SHENZHEN CHIPSCREEN BIOSCIENCES, CO., LTD.) [CN/CN]; 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。

(72) 发明人: 杨千姣 (YANG, Qianjiao); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基

地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。山松 (SHAN, Song); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。辛利军 (XIN, Lijun); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。潘德思 (PAN, Desi); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。王晓亮 (WANG, Xiaoliang); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。宋永连 (SONG, Yonglian); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。黄卉云 (HUANG, Huiyun); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。魏奇 (WEI, Qi); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地 2 号楼 601-606 室, Guangdong 518057 (CN)。李志斌 (LI, Zhibin); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十

(54) Title: BIPHENYL COMPOUND AS IMMUNOMODULATOR, PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 作为免疫调节剂的联苯类化合物及其制备方法和应用

hPD1/hPD-L1 小鼠给药 18 天后 t-1 的组织分布 (50 mg/kg, PO) AA

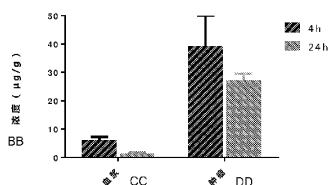
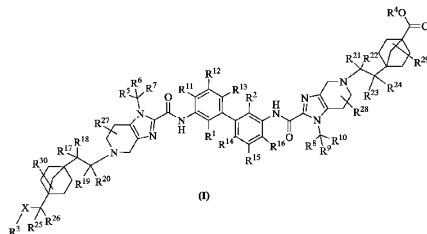


图 1

AA Tissue distribution of I-1 in hPD1/hPD-L1 mice after 18 days of administration (50 mg/kg, PO)
BB Concentration (μg/g)
CC Plasma
DD Tumor



(57) Abstract: A biphenyl compound as shown in formula (I), a preparation method therefor and use thereof, and a pharmaceutical composition comprising the compound as an active ingredient. The compound is a novel small-molecule immunomodulator having excellent oral absorption characteristics, and can be used for treating and/or preventing various immune-related diseases.

(57) 摘要: 一种式 (I) 所示联苯类化合物、其制备方法及其应用, 以及包含所述化合物作为活性成分的药用组合物。所述化合物是具有优异的口服吸收特征的新型小分子免疫调节剂, 可用于治疗和/或预防与免疫相关的多种疾病。

[见续页]

号深圳生物孵化基地2号楼601-606室, Guangdong 518057 (CN)。鲁先平(LU, Xianping); 中国广东省深圳市南山区高新中一道十号深圳生物孵化基地2号楼601-606室, Guangdong 518057 (CN)。

(74) 代理人: 北京集佳知识产权代理有限公司 (UNITALEN ATTORNEYS AT LAW); 中国北京市朝阳区建国门外大街22号赛特广场7层, Beijing 100004 (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))。