

(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
2019 年 8 月 8 日 (08.08.2019)



(10) 国际公布号
WO 2019/149183 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/12 (2006.01) A61K 31/4433 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) A61K 31/4439 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01) A61K 31/444 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) A61P 37/02 (2006.01)
A61K 31/443 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/073594

(22) 国际申请日: 2019 年 1 月 29 日 (29.01.2019)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201810111413.5 2018 年 2 月 5 日 (05.02.2018) CN
201810770644.7 2018 年 7 月 13 日 (13.07.2018) CN

(71) 申请人: 上海和誉生物医药科技有限公司 (ABBISKO THERAPEUTICS CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 杨飞 (YANG, Fei); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。 张永贤 (ZHANG, Yongxian); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。 应海燕 (YING, Haiyan); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。 喻红平 (YU, Hongping); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自

由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。 陈椎 (CHEN, Zhui); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。 徐耀昌 (XU, Yaochang); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区哈雷路 898 弄 3 号, Shanghai 201203 (CN)。

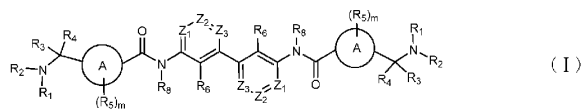
(74) 代理人: 上海一平知识产权代理有限公司 (XU & PARTNERS, LLC.); 中国上海市普陀区真北路 958 号天地科技广场 1 号楼 106 室, Shanghai 200333 (CN)。

(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, 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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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,

(54) Title: BIARYL DERIVATIVE, PREPARATION METHOD THEREOF AND PHARMACEUTICAL APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一种联芳基衍生物、其制备方法和在药理学上的应用



(57) Abstract: Disclosed are a biaryl derivative having a structure represented by Formula (I) and inhibitory activity against PD-1/PD-L1 interaction, a preparation method thereof, and a pharmaceutical application thereof. The series of compounds of the present invention can be widely applied to the preparation of a medicament for preventing and/or treating cancer or tumors, immune-related diseases and disorders, contagious diseases, infectious diseases or metabolic diseases that are mediated by a PD-1/PD-L1 signaling pathway, and shows promise for the development of a new generation of PD-1/PD-L1 inhibitors.

(57) 摘要: 本发明涉及一种式 (I) 结构具有对 PD-1/PD-L1 相互作用有抑制活性的联芳基衍生物、其制备方法和在药理学上的应用。本发明系列化合物可广泛应用于制备预防和/或治疗由 PD-1/PD-L1 信号通路介导的癌症或肿瘤、免疫相关疾病及紊乱、传染性疾病、感染性疾病或代谢性疾病的药物, 有望开发成新一代 PD-1/PD-L1 抑制剂。

[见续页]

WO 2019/149183 A1

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))。