

(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 2022/228547 A1

(43) 国际公布日
2022 年 11 月 3 日 (03.11.2022)

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/14 (2006.01) A61K 31/675 (2006.01)
C07F 9/53 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/090243

(22) 国际申请日: 2022 年 4 月 29 日 (29.04.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202110470748.8	2021年4月30日 (30.04.2021)	CN
202110570092.7	2021年5月25日 (25.05.2021)	CN
202110651028.1	2021年6月11日 (11.06.2021)	CN
202110824204.7	2021年7月22日 (22.07.2021)	CN
202111025788.8	2021年9月3日 (03.09.2021)	CN
202111214457.9	2021年10月22日 (22.10.2021)	CN
202210000254.8	2022年1月6日 (06.01.2022)	CN

(71) 申请人: 四川海思科制药有限公司 (SICHUAN HAISCO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。

(72) 发明人: 张晨(ZHANG, Chen); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。王健民(WANG, Jianmin); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。赵晨飞(ZHAO, Chenfei); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。钱国飞(QIAN, Guofei); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。马俊杰(MA, Junjie); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。黄正刚(HUANG, Zhenggang); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。袁帅(YUAN, Shuai); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。黄安

邦(HUANG, Anbang); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。郑少龙(ZHENG, Shaolong); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。李凯(LI, Kai); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。余彦(YU, Yan); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。叶飞(YE, Fei); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。唐平明(TANG, Pingming); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。李瑶(LI, Yao); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。倪佳(NI, Jia); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。严庞科(YAN, Pangke); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路136号, Sichuan 611130 (CN)。

(74) 代理人: 北京三友知识产权代理有限公司 (BEIJING SANYOU INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY LTD.); 中国北京市金融街35号国际企业大厦A座16层, Beijing 100033 (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, JM, 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,

(54) Title: PHOSPHONYL DERIVATIVE, AND COMPOSITION AND PHARMACEUTICAL APPLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一种膦酰衍生物及其组合物和药理学上的应用

(57) Abstract: Provided are the compound shown in general formula (I) or a stereoisomer, a deuterated compound, a solvate, a prodrug, a metabolite, a pharmaceutically acceptable salt, or co-crystal thereof, an intermediate thereof, and a use thereof in EGFR-related diseases such as cancer. B-L-K (I)

(57) 摘要: 提供一种通式(I)所述的化合物或者其立体异构体、氘代物、溶剂化物、前药、代谢产物、药理学上可接受的盐或共晶, 及其中间体, 以及在EGFR相关疾病如癌症中的用途。B-L-K(I)

[见续页]



WO 2022/228547 A1

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))。