

(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 7 月 25 日 (25.07.2019)



(10) 国际公布号
WO 2019/141179 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/04 (2006.01) *A61K 31/55* (2006.01)
C07D 471/14 (2006.01) *A61P 31/16* (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)

中国江苏省苏州市工业园区星湖街 218 号
C11 楼 3 楼, Jiangsu 215123 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/071902

(22) 国际申请日: 2019 年 1 月 16 日 (16.01.2019)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201810044308.4 2018 年 1 月 17 日 (17.01.2018) CN
201811517425.4 2018 年 12 月 12 日 (12.12.2018) CN

(71) 申请人: 银杏树药业 (苏州) 有限公司
(**GINKGO PHARMA CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国江
苏省苏州市工业园区星湖街 218 号 C11 楼
3 楼, Jiangsu 215123 (CN)。

(72) 发明人: 陈力 (**CHEN, Li**); 中国江苏省苏州市工
业园区星湖街 218 号 C11 楼 3 楼, Jiangsu 215123
(CN)。邵庆 (**SHAO, Qing**); 中国江苏省苏州
市工业园区星湖街 218 号 C11 楼 3 楼, Jiangsu
215123 (CN)。薛晓剑 (**XUE, Xiaojian**); 中国江
苏省苏州市工业园区星湖街 218 号 C11 楼 3
楼, Jiangsu 215123 (CN)。李晓闻 (**LI, Xiaowen**);

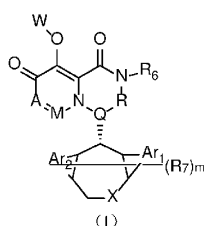
(74) 代理人: 苏州创元专利商标事务所有限公司
(**SUZHOU CREATOR PATENT AND TRADEMARK
AGENCY, LTD.**); 中国江苏省苏州市干将西
路 93 号, Jiangsu 215002 (CN)。

(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:** PYRIDONE DERIVATIVE, COMPOSITION THEREOF AND APPLICATION THEREOF AS ANTI-INFLUENZA
DRUG

(54) 发明名称: 吡啶酮衍生物、其组合物及作为抗流感病毒药物的应用



(57) **Abstract:** The present invention relates to the field of medical chemistry, and relates to a novel pyri-
done derivative represented by formula (I) or a stereoisomer thereof, a pharmaceutically acceptable salt, a
solvate or a crystal thereof, and an application thereof in the preparation of a drug for preventing or treating
viral infectious diseases such as influenza A or/and influenza B, in particular an application thereof as a
PA subunit cap-dependent endonuclease inhibitor for preventing or treating influenza A and/or influenza
B viral infectious diseases. The compound of the present invention has significant activity in inhibiting in-
fluenza endonuclease and influenza DNA, and may be used alone or in combination with a neuraminidase
inhibitor, a nucleoside drug, a PB2 inhibitor, a PB1 inhibitor, an M2 inhibitor or other anti-influenza drugs,
significantly shortening the time of influenza infection, reducing mortality, and having excellent clinical
application prospects.

(57) **摘要:** 本发明属于医药化学领域, 涉及一种式(I)所示的新型吡啶酮衍生物或其
立体异构体、可药用盐、溶剂化物或结晶及其用于制备预防或治疗流感A型或/及
流感B型等病毒性感染疾病的药物的应用, 特别是作为PA亚基帽依赖性内切酶抑
制剂在预防或治疗流感A型或/及流感B型病毒性感染疾病中的应用。本发明的化
合物具有显著的抑制流感内切酶和流感DNA的活性, 可以单独或和神经氨酸酶抑
制剂、核苷类药物、PB2抑制剂、PB1抑制剂、M2抑制剂或其他抗流感药物联合用
药, 显著缩短流感感染的时间和降低死亡率, 有极好的临床应用前景。

[见续页]

WO 2019/141179 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)。

根据细则4.17的声明:

— 发明人资格(细则4.17(iv))

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。