

(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 3 月 3 日 (03.03.2022)



(10) 国际公布号
WO 2022/042591 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 267/10 (2006.01) *C07D 417/12* (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) *A61K 31/553* (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) *A61P 11/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/114500

(22) 国际申请日: 2021 年 8 月 25 日 (25.08.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202010871912.1 2020 年 8 月 26 日 (26.08.2020) CN
202011129809.6 2020 年 10 月 21 日 (21.10.2020) CN
202110167731.5 2021 年 2 月 7 日 (07.02.2021) 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成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。

(72) 发明人: 李瑶 (LI, Yao); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。石宗军 (SHI, Zongjun); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。张国彪 (ZHANG, Guobiao); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。陈雷 (CHEN, Lei); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。王文晶 (WANG, Wenjing); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。张晓波 (ZHANG, Xiaobo); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。

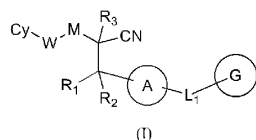
郑登宇 (ZHENG, Dengyu); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。徐波 (XU, Bo); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。刘鑫 (LIU, Xin); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。王亚军 (WANG, Yajun); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。叶飞 (YE, Fei); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。唐平明 (TANG, Pingming); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。倪佳 (NI, Jia); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。张晨 (ZHANG, Chen); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。严庞科 (YAN, Pangke); 中国四川省成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。

(74) 代理人: 北京坤瑞律师事务所 (WU, FENG & ZHANG); 中国北京市海淀区丰秀中路 3 号院 2 号楼 3 层, Beijing 100094 (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,

(54) Title: NITRILE DERIVATIVE THAT ACTS AS INHIBITOR OF DIPEPTIDYL PEPTIDASE 1 AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种作为二肽基肽酶 1 抑制剂的腈衍生物及其用途



(57) Abstract: Provided is a nitrile derivative compound represented by formula (I), a stereoisomer, a deuterated product, a co-crystal, a solvate or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein each group is as defined in the description. The compound has dipeptidyl peptidase 1 inhibitory activity and can be used to prepare a drug for treating obstructive airway diseases, bronchiectasis, cystic fibrosis, asthma, emphysema, chronic obstructive pulmonary diseases and other diseases.

(57) 摘要: 提供一种式(I)所示的腈衍生物化合物、其立体异构体、氘代物、共晶、溶剂化物或药学上可接受的盐, 其中各基团如说明书所定义。所述化合物具有二肽基肽酶 1 抑制活性, 可用于制备治疗气道阻塞性疾病、支气管扩张、囊性纤维化、哮喘、肺气肿和慢性阻塞性肺病等疾病的药物。

[见续页]

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))。