

(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
2025 年 5 月 8 日 (08.05.2025)



(10) 国际公布号
WO 2025/092775 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 405/14 (2006.01) *A61K 31/4709* (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/128337

(22) 国际申请日: 2024 年 10 月 30 日 (30.10.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202311429738.5 2023 年 10 月 31 日 (31.10.2023) CN

(71) 申请人: 中国药科大学 (CHINA PHARMACEUTICAL UNIVERSITY) [CN/CN]; 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。苏州亚盛药业有限公司 (ASCENTAGE PHARMA (SUZHOU) CO LTD) [CN/CN]; 中国江苏省苏州市苏州工业园区新庆路 68 号 215000 (CN)。

(72) 发明人: 徐熙 (XU, Xi); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。李志裕 (LI, Zhiyu); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。张艳青 (ZHANG, Yanqing); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。常秀锦 (CHANG, Xiujin); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。瞿凡贵 (QU, Fangui); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。

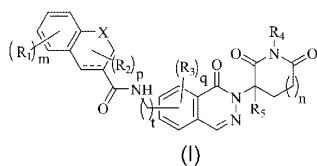
(CN)。卞金磊 (BIAN, Jinlei); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。王举波 (WANG, Jubo); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。邱志霞 (QIU, Zhixia); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。吴红茜 (WU, Hongxi); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。范忠蓬 (FAN, Zhongpeng); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。王新鸿 (WANG, Xinhong); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。刘文静 (LIU, Wenjing); 中国江苏省南京市江宁区龙眠大道 639 号 211198 (CN)。

(74) 代理人: 南京天翼专利代理有限责任公司 (NANJING TIANYI PATENT AGENT CO., LTD.); 中国江苏省南京市玄武区珠江路 680 号 210018 (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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD,

(54) Title: PHTHALAZINONE GSPT1 PROTEIN DEGRADING AGENT AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种酞嗪酮类 GSPT1 蛋白降解剂及其应用



(57) Abstract: Disclosed is a compound as shown in general formula I or a pharmaceutically acceptable salt, tautomer, mesomer, racemate, enantiomer, and diastereomer thereof. The compound of the present invention significantly improves the degradation effect of GSPT1 protein and the anti-proliferative inhibition activity of AML and solid tumor cells. Therefore, the compound of the present invention can be used in the preparation of a medicament for treating or preventing diseases related to GSPT1, IKZF1, IKZF2, IKZF3, CK1 α , N-MYC or C-MYC protein mutation, expression imbalance, and allosteric and functional abnormalities; in addition, said compound can be used to prepare a GSPT1 degrading agent.

(57) 摘要: 本发明公开了如通式 I 所示的化合物或其药学上可接受的盐、互变异构体、内消旋体、外消旋体、对映异构体、非对映异构体。本发明的化合物对 GSPT1 蛋白的降解效果、AML 及实体瘤细胞的抗增殖抑制活性显著提高。因此, 本发明化合物可以用于制备治疗或预防由 GSPT1、IKZF1、IKZF2、IKZF3、CK1 α 、N-MYC 或 C-MYC 蛋白突变、表达失衡、变构与功能异常相关疾病的药物; 可以用于制备 GSPT1 降解剂。

[见续页]

WO 2025/092775 A1

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, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ,
NA, RW, SC, 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, ME, 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))。