

(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 2024/008128 A1

(43) 国际公布日
2024 年 1 月 11 日 (11.01.2024)

(51) 国际专利分类号:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)

新区华夏东路333弄6号, Shanghai 201210 (CN)。
马大为 (MA, Dawei); 中国上海市浦东新区华夏
东路333弄6号, Shanghai 201210 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/105960

(22) 国际申请日: 2023 年 7 月 5 日 (05.07.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202210798720.1 2022年7月6日 (06.07.2022) CN

(71) 申请人: 上海科恩泰生物医药科技有限公司 (KINOTECK THERAPEUTICS CO., LTD) [CN/
CN]; 中国上海市浦东新区华夏东路 333 弄
6号, Shanghai 201210 (CN)。

(72) 发明人: 常少华 (CHANG, Shaohua); 中国上海市
浦东新区华夏东路 333 弄 6 号, Shanghai 201210
(CN)。 陈晓飞 (CHEN, Xiaofei); 中国上海市浦东
新区华夏东路 333 弄 6 号, Shanghai 201210 (CN)。
李家国 (LI, Jianguo); 中国上海市浦东新区华夏东
路 333 弄 6 号, Shanghai 201210 (CN)。 李惠琼 (LI,
Huiqiong); 中国上海市浦东新区华夏东路 333 弄 6
号, Shanghai 201210 (CN)。 吴莘莲 (WU, Pinglian);
中国上海市浦东新区华夏东路 333 弄 6 号, Shanghai
201210 (CN)。 吴银辉 (WU, Yinhui); 中国上海市
浦东新区华夏东路 333 弄 6 号, Shanghai 201210
(CN)。 任小梅 (REN, Xiaomei); 中国上海市浦东

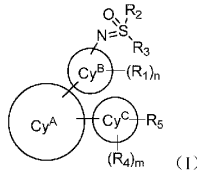
(74) 代理人: 上海一平知识产权代理有限公司 (XU & PARTNERS, LLC.); 中国上海市普陀
区真北路 958 号天地科技广场 1 号楼 106
室, Shanghai 200333 (CN)。

(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,
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,
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,

(54) Title: SULFOXIMINE COMPOUND HAVING FGFR INHIBITORY EFFECT, PHARMACEUTICAL COMPOSITION COM-
PRISING SAME, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种具有FGFR抑制作用的亚砷亚胺类化合物、包含其的药物组合物及其用途



(57) Abstract: Provided are a sulfoximine compound having an FGFR inhibitory effect, a pharmaceutical composition comprising said sulfoximine compound, and a use thereof. Specifically provided are a sulfoximine compound as represented by formula (I) which can be used as a fibroblast growth factor receptor (FGFR) inhibitor, a tautomer, a stereoisomer, a hydrate, a solvate, a pharmaceutically acceptable salt thereof, a pharmaceutical composition comprising the compound, and a use thereof in the preparation of a pharmaceutical composition; wherein R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, Cy^A, Cy^B, Cy^C, etc., are as defined in the description.

(57) 摘要: 本发明提供了一种具有FGFR抑制作用的亚砷亚胺类化合物、包含其的药物组合物及其用途, 具体地, 本发明提供了一种可用作纤维母细胞生长因子受体(FGFR)抑制剂的如式(I)所示的亚砷亚胺类化合物、其互变异构体、立体异构体、水合物、溶剂化物、其药学上可接受的盐、包含该化合物的药物组合物, 以及其在制备药物组合物中的应用。其中, R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Cy^A、Cy^B、Cy^C等具有说明书中给出的定义。

[见续页]

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))。
- 在修改权利要求的期限届满之前进行, 在收到该修改后将重新公布(细则48.2(h))。