

(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 1 月 2 日 (02.01.2025)



(10) 国际公布号
WO 2025/001956 A1

(51) 国际专利分类号:

C07D 405/14 (2006.01) **A61K 31/4439** (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) **A61P 7/02** (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/100315

(22) 国际申请日: 2024 年 6 月 20 日 (20.06.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202310808231.4 2023年6月30日 (30.06.2023) CN

(71) 申请人: 远森制药(杭州)有限公司(LONGWOOD PHARMACEUTICALS (HANG-ZHOU) CO., LTD) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。

(72) 发明人: 王永钢(WANG, Yonggang); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。余飞(YU, Fei); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。高燕珊(GAO, Yanshan); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室,

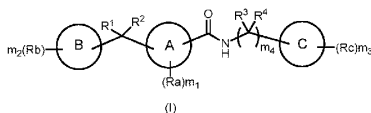
Zhejiang 311199 (CN)。付登荣(FU, Dengrong); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。孙喜成(SUN, Xicheng); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。吴功雄(WU, Gongxiong); 中国浙江省杭州市临平区兴国路503号5幢4层416室, Zhejiang 311199 (CN)。

(74) 代理人: 北京戈程知识产权代理有限公司(GE CHENG & CO., LTD); 中国北京市东城区东长安街1号东方广场东三办公楼10层, Beijing 100738 (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。

(54) Title: HETEROAROMATIC FORMAMIDE COMPOUNDS AND USES THEREOF IN MEDICINE

(54) 发明名称: 杂芳族甲酰胺类化合物及其在医药上的应用



(57) Abstract: The present invention relates to heteroaromatic formamide compounds and the uses thereof in medicine. In particular, the present invention relates to heteroaromatic formamide compounds represented by general formula (I), a preparation method therefor, a pharmaceutical composition containing said compounds, and the use of same as a therapeutic agent, in particular, the use as a selective inhibitor for plasma kallikrein (PKa) and the use in treating and/or preventing diseases which may benefit from the inhibition of plasma kallikrein, especially being used in preventing and/or treating diabetic macular edema (DME), age-related macular degeneration (AMD), choroidal neovascularization, hereditary angioedema (HAE), cerebral edema after a stroke, etc.

(57) 摘要: 本发明涉及杂芳族甲酰胺类化合物及其在医药上的应用。具体而言, 本发明涉及一种通式(I)所示的杂芳族甲酰胺类化合物、其制备方法以及含有该类化合物的药物组合物以及其作为治疗剂的用途, 特别是作为血浆激肽释放酶(plasma kallikrein, PKa)选择性抑制剂的用途和在治疗和/或预防可能受益于血浆激肽释放酶抑制的疾病中的用途, 特别是用于预防 and/或治疗糖尿病性黄斑部水肿(DME)、年龄相关的黄斑部变性(AMD)、脉络膜新生血管、遗传性血管性水肿(HAE)及中风后的脑水肿等。

[见续页]



WO 2025/001956 A1

(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))。