

(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 10 月 3 日 (03.10.2019)



(10) 国际公布号
WO 2019/185016 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 207/34 (2006.01) *A61K 31/4025* (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01) *A61P 31/20* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2019/080412

(22) 国际申请日: 2019 年 3 月 29 日 (29.03.2019)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201810286111.1 2018 年 3 月 30 日 (30.03.2018) CN
201810730325.3 2018 年 7 月 5 日 (05.07.2018) CN
201910073465.2 2019 年 1 月 25 日 (25.01.2019) CN

(71) 申请人: 正大天晴药业集团股份有限公司 (CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

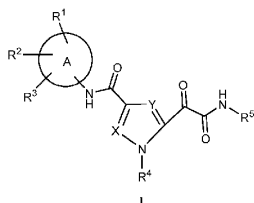
(72) 发明人: 张寅生(ZHANG, Yinsheng); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。敖汪伟(AO, Wangwei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。李元(LI, Yuan); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。王辉(WANG, Hui); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。沈杭州(SHEN, Hangzhou); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。倪杰(NI, Jie); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。张欢(ZHANG, Huan); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(CN)。吴杰(WU, Jie); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。张立(ZHANG, Li); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。曹凯(CAO, Kai); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。陆鹏(LU, Peng); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。刘戌时(LIU, Xushi); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。汪杰(WANG, Jie); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。赵天笑(ZHAO, Tianxiao); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。葛兴枫(GE, Xingfeng); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。卢丹丹(LU, Dandan); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。陈硕(CHEN, Shuo); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。马雪琴(MA, Xueqin); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。施伟(SHI, Wei); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。王晓金(WANG, Xiaojin); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。徐宏江(XU, Hongjiang); 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(74) 代理人: 北京英赛嘉华知识产权代理有限公司 (INSIGHT INTELLECTUAL PROPERTY LIMITED); 中国北京市海淀区知春路甲48号盈都大厦A座19A, Beijing 100098 (CN)。

(54) Title: N-HETEROCYCLIC FIVE-MEMBERED RING-CONTAINING CAPSID PROTEIN ASSEMBLY INHIBITOR, PHARMACEUTICAL COMPOSITION THEREOF, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 含有N杂五元环的衣壳蛋白装配抑制剂、其药物组合物和用途



(57) Abstract: A N-heterocyclic five-membered ring-containing capsid protein assembly inhibitor, and a pharmaceutical composition and use thereof, specifically relating to a compound as represented by formula I, a stereoisomer, a tautomer, a geometrical isomer, a solvate, an active metabolite, a hydrate, a prodrug or a pharmaceutically acceptable salt thereof, a pharmaceutical composition thereof, and a medical use thereof. The medical use comprises the use in treating diseases benefiting from the capsid protein assembly inhibitor, and in particular, diseases caused by hepatitis B virus infection.

(57) 摘要: 一种含有N杂五元环的衣壳蛋白装配抑制剂、其药物组合物和用途, 具体而言, 涉及式I所示的化合物、其立体异构体、互变异构体、几何异构体、溶剂化物、活性代谢物、水合物、前药或药学上可接受的盐, 其药物组合物及医药用途, 包括用于治疗受益于衣壳蛋白装配抑制的疾病用途, 尤其是乙型肝炎病毒感染引起的疾病。

[见续页]

WO 2019/185016 A1

(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, 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))。