

(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 2024/217344 A1**

(43) 国际公布日  
2024 年 10 月 24 日 (24.10.2024)

(51) 国际专利分类号:

|                              |                              |
|------------------------------|------------------------------|
| <i>C07D 401/04</i> (2006.01) | <i>C07C 261/04</i> (2006.01) |
| <i>C07D 401/12</i> (2006.01) | <i>A61K 31/44</i> (2006.01)  |
| <i>C07D 213/78</i> (2006.01) | <i>A61K 31/36</i> (2006.01)  |
| <i>C07D 213/82</i> (2006.01) | <i>A61K 31/167</i> (2006.01) |
| <i>C07D 317/68</i> (2006.01) | <i>A61K 31/277</i> (2006.01) |
| <i>C07C 257/18</i> (2006.01) | <i>A61P 29/00</i> (2006.01)  |
| <i>C07C 259/18</i> (2006.01) | <i>A61P 25/04</i> (2006.01)  |
| <i>C07C 257/20</i> (2006.01) | <i>A61P 19/02</i> (2006.01)  |

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/087393

(22) 国际申请日: 2024 年 4 月 12 日 (12.04.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:  
202310422192.4 2023年4月19日 (19.04.2023) CN

(71) 申请人: 中国科学院上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 高召兵(GAO, Zhaobing); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。杨春皓(YANG, Chunhao); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。谭村(TAN, Cun); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。郑月明(ZHENG,

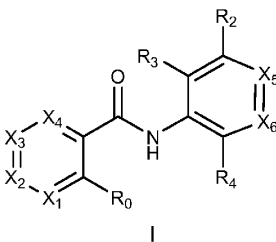
Yueming); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。符琳书(FU, Linshu); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。许海燕(XU, Haiyan); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。陈笑艳(CHEN, Xiaoyan); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。胡有洪(HU, Youhong); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。熊兵(XIONG, Bing); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。贺茜(HE, Qian); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。魏爱环(WEI, Aihuan); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。张小飞(ZHANG, Xiaofei); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。王琳琳(WANG, Linlin); 中国上海市浦东新区张江祖冲之路 555 号, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京金信知识产权代理有限公司(KINGSOUND & PARTNERS); 中国北京市海淀区紫竹院路 116 号嘉豪国际中心 B 座 11 层, Beijing 100097 (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,

(54) Title: NAV1.8 INHIBITORS, PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: Nav1.8抑制剂及其制备方法和用途



(57) Abstract: Provided in the present invention are Nav1.8 inhibitors shown as formula I, a preparation method therefor and the use thereof. The compounds provided by the present invention have good Nav1.8 selective inhibitory activity, good pharmacokinetic properties and good druggability, can be used as Nav1.8 inhibitors for preventing and/or treating diseases related to abnormal Nav1.8 channel expression activity, and thus have significant clinical application value.

(57) 摘要: 本发明提供了式I所述的Nav1.8抑制剂及其制备方法和用途。本发明的化合物具有很好的Nav1.8选择性抑制活性, 有很好药代性质, 具有较好的成药性, 作为Nav1.8抑制剂可用于预防和/或治疗与Nav1.8通道活性异常表达相关的疾病, 具有重要的临床应用价值。

[见续页]

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,  
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))。