

(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
2023 年 8 月 31 日 (31.08.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/160541 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 413/12 (2006.01) *C07D 267/10* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/077408

(22) 国际申请日: 2023 年 2 月 21 日 (21.02.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202210160847.0 2022 年 2 月 22 日 (22.02.2022) CN

(71) 申请人: 四川海思科制药有限公司 (SICHUAN HAISCO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN];
中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。

(72) 发明人: 范江(FAN, Jiang); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。 窦赢(DOU, Ying); 中国四川省成都市温江

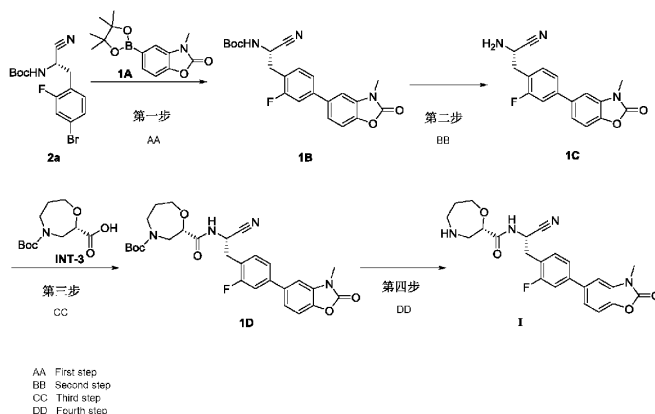
区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。 朱凤飞(ZHU, Fengfei); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。 汪成涛(WANG, Chengtao); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。 甘满(GAN, Man); 中国四川省成都市温江区海峡两岸科技园区百利路 136 号, Sichuan 611130 (CN)。

(74) 代理人: 北京三友知识产权代理有限公司 (BEIJING SANYOU INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY LTD.); 中国北京市西城区金融街 35 号国际企业大厦 A 座 16 层, Beijing 100033 (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,

(54) Title: PREPARATION METHOD OF NITROGEN-CONTAINING HETEROCYCLIC COMPOUND

(54) 发明名称: 一种含氮杂环化合物的制备方法



(57) Abstract: Disclosed is a preparation method of a nitrogen-containing heterocyclic compound represented by formula (I). The method comprises: carrying out a coupling reaction on a compound 1A and a compound 2a, and sequentially carrying out deprotection, amidation and deprotection reactions, which are four steps in total, to obtain a target compound. The method is short in reaction route, mild in condition, simple to operate, convenient in post-treatment, high in yield and high in purity, and is suitable for industrial amplification production.

(57) 摘要: 公开了一种式(I)所示的含氮杂环化合物的制备方法, 该方法由化合物1A和化合物2a发生偶联反应后, 依次进行脱保护、酰胺化和脱保护反应, 共四步制得目标化合物。该方法反应路线短、条件温和、操作简单、后处理方便、收率高、纯度高, 适合工业化放大生产。

[见续页]

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, 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))。