

(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 2025/098443 A1

(43) 国际公布日
2025 年 5 月 15 日 (15.05.2025)

- (51) 国际专利分类号:
C07D 207/48 (2006.01) **C07C 303/44** (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2024/130537
- (22) 国际申请日: 2024 年 11 月 7 日 (07.11.2024)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
202311506706.0 2023 年 11 月 9 日 (09.11.2023) CN
- (71) 申请人: 江苏柯菲平医药股份有限公司 (JIANGSU CAREPHAR PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省南京市玄武区徐庄路6号1幢 210000 (CN)。
- (72) 发明人: 秦引林(QIN, Yinlin); 中国江苏省南京市玄武区徐庄路6号1幢 210000 (CN)。 苏梅(SU, Mei); 中国江苏省南京市玄武区徐庄路6号1幢 210000 (CN)。 王志强(WANG, Zhiqiang); 中国江苏省南京市玄武区徐庄路6号1幢 210000 (CN)。
- (74) 代理人: 北京弘权知识产权代理有限公司 (CHINABLE IP); 中国北京市朝阳区安定路35号六层35-10-2内620室 100029 (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, 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))。

(54) **Title:** METHOD FOR PREPARING 1-[5-(2-FLUOROPHENYL)-1-{[3-(3-METHOXYPROPOXY)PHENYL]SULFONYL}-1H-PYRROL-3-YL]-N-METHYLMETHYLAMINE AND HYDROCHLORIDE THEREOF

(54) 发明名称: 一种 1-[5-(2-氟苯基)-1-{[3-(3-甲氧基丙氧基)苯基]磺酰基}-1H-吡咯-3-基]-N-甲基甲胺及其盐酸盐的制备方法

(57) **Abstract:** The present invention provides a method for preparing 1-[5-(2-fluorophenyl)-1-{[3-(3-methoxypropoxy)phenyl]sulfonyl}-1H-pyrrol-3-yl]-N-methylmethylaniline and a hydrochloride thereof. In the preparation method, a treatment method after the preparation of 3-(3-methoxypropoxy)benzenesulfonyl chloride (H2) is optimized, and the purity of a sodium sulfonate salt formed after impurity removal is high. Furthermore, by means of a chlorination reaction, 3-(3-methoxypropoxy)benzenesulfonyl chloride (H2) having high purity and stable quality can be obtained. In addition, under the action of an alkali, by adding a small amount of a catalyst, a relatively high reaction conversion rate can be achieved to prepare 5-(2-fluorophenyl)-1-[3-(3-methoxypropoxy)phenyl]sulfonyl]-1H-pyrrole-3-formaldehyde (H3). The 1-[5-(2-fluorophenyl)-1-{[3-(3-methoxypropoxy)phenyl]sulfonyl}-1H-pyrrol-3-yl]-N-methylmethylaniline and the hydrochloride thereof as prepared by the method have a low impurity content and a high yield and is suitable for industrial production.

(57) 摘要: 本发明提供了一种 1-[5-(2-氟苯基)-1-{[3-(3-甲氧基丙氧基)苯基]磺酰基}-1H-吡咯-3-基]-N-甲基甲胺及其盐酸盐的制备方法, 该制备方法优化制备 3-(3-甲氧基丙氧基)苯磺酰氯(H2)后处理方式, 简单除杂后成磺酸钠盐纯度高, 再经过氯化试剂反应可获得纯度高, 质量稳定的 3-(3-甲氧基丙氧基)苯磺酰氯(H2), 同时在碱的作用下, 加入少量催化剂可以获得较高反应转化率来制备 5-(2-氟苯基)-1-[3-(3-甲氧基丙氧基)苯基]磺酰基}-1H-吡咯-3-甲醛(H3), 该方法制备的 1-[5-(2-氟苯基)-1-{[3-(3-甲氧基丙氧基)苯基]磺酰基}-1H-吡咯-3-基]-N-甲基甲胺及其盐酸盐杂质含量低, 收率高, 适合工业化生产。

WO 2025/098443 A1