

(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
2013 年 5 月 10 日 (10.05.2013)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2013/064128 A1

- (51) 国际专利分类号:
C07D 491/056 (2006.01) C07D 239/94 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2012/087802
- (22) 国际申请日: 2012 年 12 月 28 日 (28.12.2012)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
PCT/CN2011/081586 2011 年 10 月 31 日 (31.10.2011)
CN
- (71) 申请人: 浙江贝达药业有限公司 (ZHEJIANG BETA PHARMA INCORPORATION) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市余杭经济开发区红丰路 589 号, Zhejiang 311100 (CN)。
- (72) 发明人: 及
- (71) 申请人: 胡邵京 (Hu, Shaojing) [US/CN]; 中国北京市大兴经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。
- (72) 发明人: 龙伟 (Long, Wei); 中国北京市大兴经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。王飞 (Wang, Fei); 中国北京市大兴经济技术开发区地盛北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (CN)。李宗权 (Li, Zongquan); 中国北京市大兴经济技术开发区地盛

北街 1 号北工大软件园 B 区 29 号楼, Beijing 100176 (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, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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, 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, 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, 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))。
- 在修改权利要求的期限届满之前进行, 在收到该修改后将重新公布(细则 48.2(h))。
- 包括关于请求恢复一项或多项优先权要求的信息(细则 26 之二.3 和 48.2(b)(vii))。

(54) Title: METHODS OF PREPARING ICOTINIB AND ICOTINIB HYDROCHLORIDE, AND INTERMEDIATES THEREOF

(54) 发明名称: 埃克替尼和盐酸埃克替尼的制备方法及其中间体

(57) Abstract: The present invention relates to the technical field of medicine. Provided are methods of preparing icotinib, icotinib hydrochloride, and intermediates thereof. The methods avoid the use of phosphoryl chloride, thereby greatly reducing the emission of pollutants, which is of major benefit to the economy and environment.

(57) 摘要: 本发明属医药技术领域, 具体提供了埃克替尼和盐酸埃克替尼以及中间体的制备方法, 该方法避免使用三氯氧磷, 极大的减少了污染物的排放, 具有重大的经济和环保效益。



WO 2013/064128 A1