

(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 2021/223751 A1

(43) 国际公布日

2021 年 11 月 11 日 (11.11.2021)

WIPO | PCT

(51) 国际专利分类号:

C07D 471/14 (2006.01) A61K 31/551 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01) A61K 45/06 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 491/08 (2006.01)

GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(21) 国际申请号:

PCT/CN2021/092315

(22) 国际申请日:

2021 年 5 月 8 日 (08.05.2021)

(25) 申请语言:

中文

(26) 公布语言:

中文

(30) 优先权:

202010390390.3 2020 年 5 月 8 日 (08.05.2020) CN

(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)。

(71) 申请人: 南京药捷安康生物科技有限公司 (NANJING TRANSTHERA BIOSCIENCES CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省南京市江北新区生物医药谷加速器二期 9 栋 3 楼, Jiangsu 210032 (CN)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告 (条约第 21 条 (3))。

(72) 发明人: 李琳 (LI, Lin); 中国江苏省南京市江北新区生物医药谷加速器二期 9 栋 3 楼, Jiangsu 210032 (CN)。康思顺 (KANG, Sishun); 中国江苏省南京市江北新区生物医药谷加速器二期 9 栋 3 楼, Jiangsu 210032 (CN)。万中晖 (WAN, Zhonghui); 中国江苏省南京市江北新区生物医药谷加速器二期 9 栋 3 楼, Jiangsu 210032 (CN)。

(74) 代理人: 中国专利代理 (香港) 有限公司 (CHINA PATENT AGENT (H.K.) LTD.); 中国香港特别行政区湾仔港湾道 23 号鹰君中心 22 字楼, Hong Kong (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, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,

(54) Title: SYNTHESIS METHOD FOR ANTI-TUMOR COMPOUND AND INTERMEDIATE THEREOF

(54) 发明名称: 抗肿瘤化合物的合成方法及其中间体

(57) Abstract: The present invention belongs to the field of medical technology, and in particular relates to a synthesis method for an anti-tumor compound and an intermediate thereof. The synthesis method of the present invention has enhanced operability and simplified process, obtains the synthesized target compound having high purity without complex recrystallization process, reduces the generation of three wastes, and is more suitable for industrial production. The intermediate provided in the present invention is used for preparing the anti-tumor compound, effectively reducing by-products during the reaction process, improving the overall yield of the reaction which is at least double higher than the existing synthesis method.

(57) 摘要: 本发明属于医药技术领域, 具体涉及一种抗肿瘤化合物的合成方法及其中间体。本发明的合成方法可操作性增强, 简化了工艺, 合成的目标化合物无需再进行复杂的重结晶工艺, 即可获得更高的纯度, 减少了三废的产生, 更适合工业化大生产。本发明提供的中间体用于制备抗肿瘤化合物, 有效的减少反应过程中的副产物, 提高了反应的总收率, 较现有合成方法提高了至少一倍。

WO 2021/223751 A1