

(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 7 月 6 日 (06.07.2023)



(10) 国际公布号
WO 2023/125102 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 491/147 (2006.01) *C07D 491/048* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/139966

(22) 国际申请日: 2022 年 12 月 19 日 (19.12.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202111658903.5 2021 年 12 月 30 日 (30.12.2021) CN

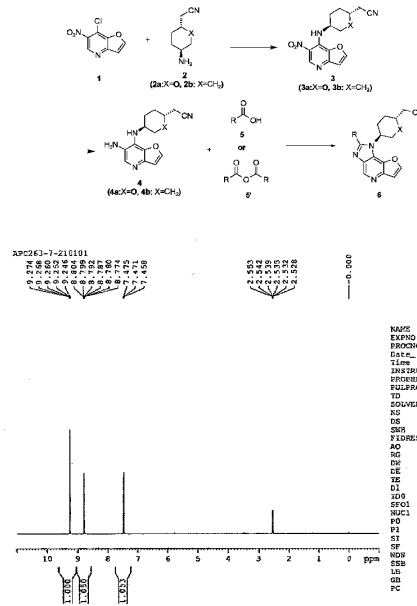
(71) 申请人: 杭州高光制药有限公司(HANGZHOU HIGHLIGHT PHARMACEUTICAL CO., LTD) [CN/CN]; 中国浙江省杭州市钱塘区和享科技中心 4 幢 301、302 室, Zhejiang 310018 (CN)。

(72) 发明人: 梁从新(LIANG, Congxin); 中国浙江省杭州市西湖区紫霞街 188 号西溪蝶园 25 幢 1002 室, Zhejiang 310012 (CN)。 李双江(LI, Shuangjiang); 中国浙江省杭州市钱塘新区和享科技中心 4 幢 301 室, Zhejiang 310018 (CN)。 黄君珉(HUANG, Junmin); 美国新泽西州普林斯顿市林邓路 179 号, Jersey 08540 (US)。 施国强(SHI, Guoqiang); 中国浙江省建德市丰和路 18 号, Zhejiang 311606 (CN)。 段亚亚(DUAN, Yaya); 中国浙江省建德市丰和路 18 号, Zhejiang 311606 (CN)。 严普查(YAN, Pucha); 中国浙江省杭州市钱塘区乔新路 500 号杭州医药港小镇 9 号楼, Zhejiang 310018 (CN)。

(74) 代理人: 北京信诺创成知识产权代理有限公司(SINO-CREATIVITY INTELLECTUAL PROPERTY LAW FIRM); 中国北京市朝阳区

(54) Title: METHOD FOR SYNTHESIZING 1H-FURO[3,2-b]IMIDAZO[4,5-d]PYRIDINE COMPOUND

(54) 发明名称: 1H-呋喃并[3,2-b]咪唑并[4,5-d]吡啶化合物的合成方法



(57) Abstract: The present invention provides a method for synthesizing a 1H-furo[3,2-b]imidazo[4,5-d]pyridine compound, the method comprising the following steps: reacting a compound 1 with a compound 2 in a solvent in the presence of a base to obtain a compound 3, reducing the compound 3 in a reduction reaction to obtain a compound 4, reacting the compound 4 with a compound 5 or compound 5' in a ring-closing reaction to obtain a compound 6 or a hydrate thereof, wherein R is methyl or ethyl, and the methyl or ethyl is optionally substituted with hydroxy.

[见续页]

WO 2023/125102 A1

区 光 华 路 7 号 汉 威 大 厦 东 区 25A3-1 室,
Beijing 100020 (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, 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, 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))。

X=O or CH₂. The method for synthesizing the 1H-furo[3,2-b]imidazo[4,5-d]pyridine compound of the present invention has a high yield and few impurities, and is easy to control, low cost, simple and convenient to operate, and suitable for industrial scale.

(57) 摘要: 本发明提供了一种 1H-呋喃并[3,2-b]咪唑并[4,5-d]吡啶化合物的合成方法, 该方法包括如下步骤: 化合物 1 与化合物 2 在碱的存在下在溶剂中反应得到化合物 3, 化合物 3 经还原反应得到化合物 4, 化合物 4 与化合物 5 或化合物 5' 经关环反应得到化合物 6 或其水合物, 其中 R 为甲基或乙基, 其中该甲基或乙基任选被羟基取代, X=O 或 CH₂。本发明的 1H-呋喃并[3,2-b]咪唑并[4,5-d]吡啶化合物的合成方法产率高、杂质少且易控、成本节约、操作简便, 适合工业化规模。