

(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 2024/230625 A1

(43) 国际公布日
2024 年 11 月 14 日 (14.11.2024) **WIPO | PCT**

(51) 国际专利分类号:
C07D 413/06 (2006.01) **C07D 207/08** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/091109

(22) 国际申请日: 2024 年 5 月 6 日 (06.05.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202310518856.7 2023年5月6日 (06.05.2023) CN

(71) 申请人: 荣昌生物制药 (烟台) 股份有限公司
(**REMEGEN CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。

(72) 发明人: 王立新(**WANG, Lixin**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。高金伟(**GAO, Jinwei**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。钟诚(**ZHONG, Cheng**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。唐海洲(**TANG, Haizhou**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。叶慧(**YE, Hui**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。赵鸿雁(**ZHAO, Hongyan**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (CN)。朱梅英(**ZHU, Marie M.**); 中国山东省烟台市中国 (山东) 自由贸易试验区烟台片区烟台开发区北京中路58号, Shandong 264006 (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)。

根据细则4.17的声明:

— 发明人资格(细则4.17(iv))

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。

(54) **Title:** PREPARATION METHOD FOR INTERMEDIATE OF AURISTATIN DERIVATIVE

(54) 发明名称: 一种奥瑞他汀衍生物中间体的制备方法

(57) **Abstract:** Provided in the present invention is a process route for preparing an intermediate of an auristatin derivative. Compared with the prior art, said process route effectively avoids using norephedrine in the synthesis path; and in addition, said process route provided in the present invention can produce a target product in one step, effectively avoiding generation of reaction intermediate products, and making a purification method simple and the yield and purity of a final product high. Therefore, the process route is suitable for industrial scale-up production.

(57) 摘要: 本发明提供了一种制备奥瑞他汀衍生物中间体的工艺路线, 与现有技术相比, 有效的避免了合成路径中对去甲麻黄碱的使用, 除此之外, 本发明提供的奥瑞他汀衍生物中间体的工艺路线能够一步生产目标产物, 能够有效的避免反应中间产物的产生, 纯化方法简单、最终产品的收率和纯度较高, 适于工业化扩大生产。

WO 2024/230625 A1