

(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 8 月 22 日 (22.08.2013)



(10) 国际公布号
WO 2013/120257 A1

(51) 国际专利分类号:

C07C 231/12 (2006.01) C07C 271/22 (2006.01)
C07C 233/47 (2006.01) C07B 53/00 (2006.01)
C07C 233/87 (2006.01) C07B 37/00 (2006.01)
C07C 269/06 (2006.01) C07F 7/18 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2012/071159

(22) 国际申请日: 2012 年 2 月 15 日 (15.02.2012)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 河南新天地药业股份有限公司 (HENAN NEWLAND PHARMACEUTICAL CO., LTD) [CN/CN]; 中国河南省长葛市轻工路东段南侧, Henan 461500 (CN)。

(72) 发明人: 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): 谢建中 (XIE, Jianzhong) [CN/CN]; 中国河南省长葛市轻工路东段南侧, Henan 461500 (CN)。郭秀彬 (GUO, Xiubin) [CN/CN]; 中国河南省长葛市轻工路东段南侧, Henan 461500 (CN)。赵立献 (ZHAO, Lixian) [CN/CN]; 中国河南省长葛市轻工路东段南侧, Henan 461500 (CN)。刘超 (LIU, Chao) [CN/CN]; 中国河南省长葛市轻工路东段南侧, Henan 461500 (CN)。

(74) 代理人: 北京集佳知识产权代理有限公司 (UNITALEN ATTORNEYS AT LAW); 中国北京市朝阳区建国门外大街 22 号赛特广场 7 层, Beijing 100004 (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, 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, 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, MD, 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))。

(54) Title: METHOD FOR SYNTHESIZING LAEVO-P-HYDROXYPHENYLGLYCINE COMPOUND

(54) 发明名称: 一种左旋对羟基苯甘氨酸类化合物的合成方法

(57) Abstract: Provided is a method for synthesizing a laevo-p-hydroxyphenylglycine compound, comprising: (1) subjecting an amine compound with a glyoxylic acid ester compound to a nucleophilic addition reaction; subjecting the product obtained in step (1) with a phenolic compound to a reaction in a manner similar to a Friedel-Crafts reaction in the presence of a chiral acid or a non-chiral acid, so as to generate the laevo-p-hydroxyphenylglycine compound. The method has advantages such as the final product having a high ee value, little pollution, and no need for treatments for resolution and racemisation.

(57) 摘要: 提供一种左旋对羟基苯甘氨酸类化合物的合成方法, 其包括: (1) 使胺化合物与乙醛酸酯化合物发生亲核加成反应; (2) 使步骤 (1) 的产物与苯酚化合物在手性酸或非手性酸的存在下发生类似傅-克反应, 生成左旋对羟基苯甘氨酸类化合物。该方法具有终产物的 ee 值高、污染少、无需拆分和消旋化处理的优点。



WO 2013/120257 A1