

(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 2019/242692 A1

(43) 国际公布日

2019 年 12 月 26 日 (26.12.2019)

WIPO | PCT

(51) 国际专利分类号:

C07D 307/33 (2006.01) *C07D 207/27* (2006.01)

C07D 307/93 (2006.01)

中国北京市海淀区苏州街长远天地大厦A2座12楼1212室黄骏鹏, Beijing 100080 (CN)。

(21) 国际申请号:

PCT/CN2019/092105

(22) 国际申请日:

2019 年 6 月 20 日 (20.06.2019)

(25) 申请语言:

中文

(26) 公布语言:

中文

(30) 优先权:

201810651559.9 2018年6月22日 (22.06.2018) CN

(71) 申请人: 福建海西新药创制有限公司 (FUJIAN

HAIXI PHARMACEUTICALS CO., LTD) [CN/CN];

中国福建省福州市仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian 350002 (CN)。康心汕 (KANG, Xinshan)

[CN/CN]; 中国北京市大兴区北京经济技术开发区天宝园六里30-C-301, Beijing 100176 (CN)。

(72) 发明人: 冯岩 (FENG, Yan); 中国福建省福州市

仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian 350002

(CN)。王如勇 (WANG, Ruyong); 中国福建省福州市

仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian 350002

(CN)。叶一章 (YE, Yizhang); 中国福建省福州市

仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian 350002

(CN)。张风森 (ZHANG, Fengsen); 中国福建省福

州市仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian

350002 (CN)。龚轩 (GONG, Xuan); 中国福建省

福州市仓山区金山工业区金洲北路20号, Fujian

350002 (CN)。王中红 (WANG, Zhonghong); 中国

福建省福州市仓山区金山工业区金洲北路20号,

Fujian 350002 (CN)。康心汕 (KANG, Xinshan);

中国北京市大兴区北京经济技术开发区天宝

园六里30-C-301, Beijing 100176 (CN)。

(74) 代理人: 北京易捷胜知识产权代理事务所 (普通合

伙) (BEIJING EASY JOY SOON IP AGENT LTD.);

(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, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, 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, 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, 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)。

根据细则4.17的声明:

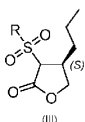
— 发明人资格 (细则4.17(iv))

本国际公布:

— 包括国际检索报告 (条约第21条(3))。

(54) Title: COMPOUND AND USE THEREOF IN SYNTHESIS OF BRIVARACETAM INTERMEDIATE AND CRUDE DRUG

(54) 发明名称: 化合物及其在合成布瓦西坦 (Brivaracetam) 中间体及原料药中的用途



(III)

(57) Abstract: The present application provides a compound in formula III, and further provides a use of the compound in the synthesis of a Brivaracetam intermediate and a crude drug, and a synthesis method. A raw material involved in the method of the present application is low in costs and easily available; (R)-4-propyl-dihydrofuran-2-ketone having high optical purity can be prepared; complicated separation and purification steps are avoided; costs are reduced, and the method is more applicable to industrial production.

(57) 摘要: 本申请提供一种式(III)化合物, 还提供其用于合成布瓦西坦 (Brivaracetam) 中间体及原料药中的用途以及合成方法。本申请所述方法涉及的原料廉价易得, 可制备出高光学纯度的(R)-4-丙基-二氢呋喃-2-酮, 避免了繁琐的分离提纯步骤, 降低了成本, 更加适合于工业生产。

WO 2019/242692 A1