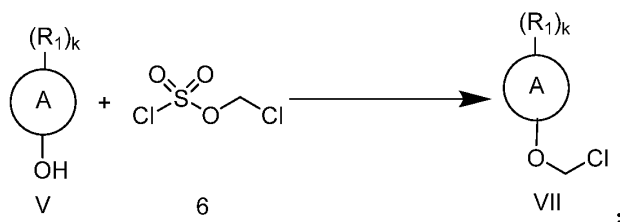


权利要求书:

1. 一种如式 VII 所示的化合物的制备方法, 其特征在于, 其包括如下步骤:

- 5 c) 在溶剂中, 在催化剂和碱存在下, 化合物 V 与化合物 6 反应, 得化合物 VII, 即可;



其中, 环 A 为芳环或杂芳环, 优选 6 至 10 元芳环或 5 至 10 元杂芳环, 更优选苯环、萘环、吡啶环或喹啉环; 羟基与环 A 上的碳连接;

- 10 每个 R_1 各自独立地选自 $-\text{R}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_2)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_2)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_2)\text{C}(=\text{O})\text{R}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NO}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_2$ 、 $-\text{S}\text{R}_2$ 、 $-\text{OR}_2$ 和 $-\text{X}$;

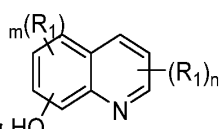
其中, 每个 R_2 各自独立地选自 $\text{C}_1\text{-C}_{20}$ 烷基, 优选 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基, 更优选甲基、乙基、正丙基或异丙基; X 选自卤素, 优选氟、氯、溴或碘;

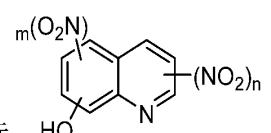
k 为 0 至环 A 上能够被取代的最大个数; 优选 k 为 0 至 6 的整数;

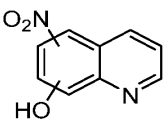
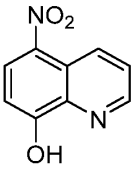
- 15 更优选 k 为 0 至 4 的整数; 进一步优选 k 为 0、1 或 2, 最优选 k 为 1;

所述溶剂为选自水、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯和二氧六环中的二元以上的溶剂体系。

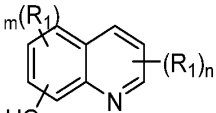
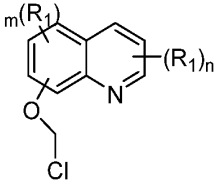
2. 根据权利要求 1 所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法, 其

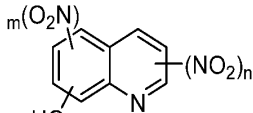
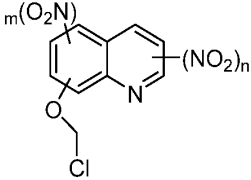
- 20 特征在于, 步骤 c) 中, 所述化合物 V 为 , m 和 n 各自

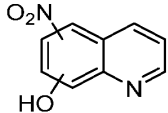
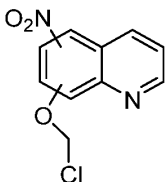
独立地为 0、1、2 或 3; 优选 , m 和 n 各自独立地为

0、1、2 或 3；更优选 ；进一步更优选 。

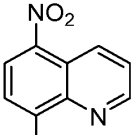
3. 根据权利要求 1 所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法，其特征在于，

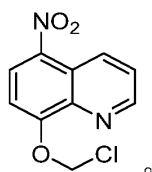
5 步骤 c) 中，所述化合物 V 为 ，所述化合物 VII 为 ，m 和 n 各自独立地为 0、1、2 或 3；

优选地，所述化合物 V 为 ，所述化合物 VII 为 ，m 和 n 各自独立地为 0、1、2 或 3；

更优选地，所述化合物 V 为 ，所述化合物 VII 为 ；

10

进一步更优选地，所述化合物 V 为 ，所述化合物 VII 为



4. 根据权利要求 1 至 3 中任一项所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法，其特征在于，步骤 c) 中，所述溶剂为选自水、四氢呋喃、
5 2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯和二氧六环中的二元溶剂体系或三元溶剂体系。

5. 根据权利要求 1 至 3 中任一项所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法，其特征在于，步骤 c) 中，所述溶剂为水/四氢呋喃、水/2-
10 甲基四氢呋喃和水/乙酸乙酯的二元溶剂体系中的任意一种；或者，水/2-甲基四氢呋喃/四氢呋喃和水/2-甲基四氢呋喃/二氧六环的三元溶剂体系中的任意一种；所述溶剂优选水/四氢呋喃二元溶剂体系或水/2-甲基四氢呋喃/四氢呋喃三元溶剂体系；更优选水/2-甲基四氢呋喃/四氢呋喃三元溶剂体系；

15 所述二元溶剂体系中，水与有机溶剂的体积比优选 10:15 至 15:0.1，更优选 0.8:1 至 1.2:1，进一步更优选 1:1；

所述三元溶剂体系中，三者的体积比优选 10:15:15 至 15:5:5，更优选 3:2:1 至 2.25:0.5:1，进一步更优选 2:1:1。

20 6. 根据权利要求 1 至 5 中任一项所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法，其特征在于，

步骤 c) 中，所述催化剂为季铵相转移催化剂，优选四丁基氢氧化铵、四丁基醋酸铵、四丁基硫酸氢铵和四丁基氯化铵中的一种或多种，更优选四丁基氢氧化铵；

25 优选地，步骤 c) 中，所述碱选自碳酸氢钠和碳酸氢钾中的一种或两种，优选碳酸氢钠；

优选地，步骤 c) 中，所述化合物 V 与所述催化剂的摩尔比为 1:0.01 至 1:0.3，优选 1:0.05 至 1:0.2，更优选 1:0.1；

优选地，步骤 c) 中，所述化合物 V 与所述碱的摩尔比为 1:2.5 至

1:15, 优选 1:6 至 1:10, 更优选 1:6 至 1:8, 进一步更优选 1:7 至 1:8;

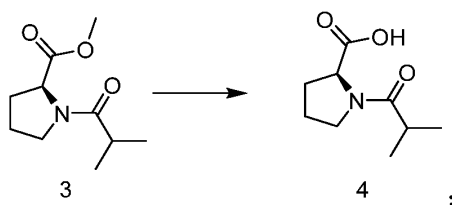
优选地, 步骤 c) 中, 所述化合物 V 与所述化合物 6 的摩尔比为 1:1 至 1:5, 优选 1:2 至 1:3, 更优选 1:2.5 至 1:2.7;

优选地, 步骤 c) 中, 所述溶剂与所述化合物 V 的体积/质量比为
 5 20 mL/g 至 50mL/g, 优选 24 mL/g 至 45 mL/g, 更优选 25 mL/g 至 40 mL/g, 进一步更优选 25 mL/g 至 35 mL/g, 再进一步更优选 30 mL/g;

优选地, 步骤 c) 中, 所述反应的反应温度为 20℃ 至 35℃, 优选 25℃ 至 30℃。

10 7. 根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法, 其特征在于, 步骤 c) 之前还进一步包括以下步骤:

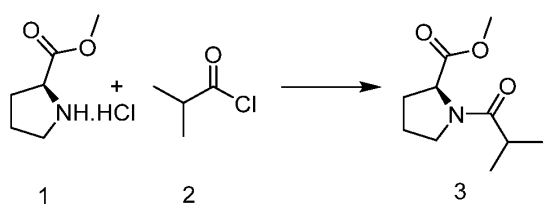
b) 在溶剂中, 在碱存在下, 化合物 3 水解, 得化合物 4,



步骤 b) 中, 所述溶剂优选 2-甲基四氢呋喃和水的混合溶剂; 所述
 15 碱优选氢氧化锂;

优选地, 步骤 b) 之前还进一步包括以下步骤:

a) 在溶剂中, 在碱存在下, 化合物 1 与化合物 2 反应, 得化合物
 3,

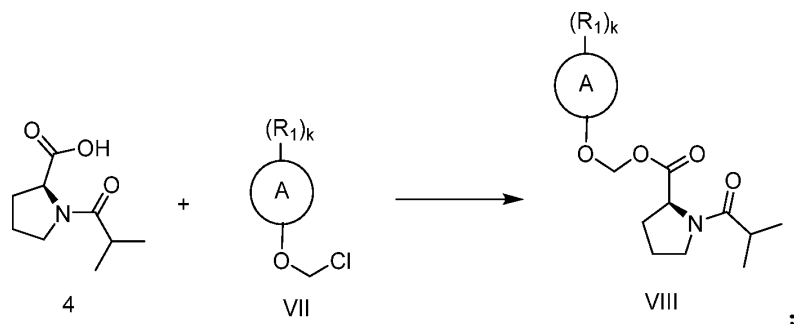


20 步骤 a) 中, 所述溶剂优选二氯甲烷; 所述碱优选三乙胺和二异丙基乙基胺中的一种或两种, 更优选三乙胺。

8. 一种如式 VIII 所示的化合物的制备方法, 其特征在于, 其包括如下步骤:

25 d) 在溶剂中, 在碱存在下, 化合物 4 与化合物 VII 反应, 得到化

合物 VIII,



其中, 环 A 为芳环或杂芳环, 优选 6 至 10 元芳环或 5 至 10 元杂芳环, 更优选苯环、萘环、吡啶环或喹啉环; -OCH₂Cl 与环 A 上的碳连接;

每个 R₁ 各自独立地选自 -R₂、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OR}_2$ 、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{H}$ 、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{R}_2$ 、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{N}(\text{R}_2)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_2)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_2)-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{R}_2$ 、-NO₂、-NO、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{S}}-\text{R}_2$ 、 $-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{S}}-\text{R}_2$ 、-S-R₂、-OR₂ 和 -X;

其中, 每个 R₂ 各自独立地选自 C₁-C₂₀ 烷基, 优选 C₁-C₆ 烷基, 更优选甲基、乙基、正丙基或异丙基; X 选自卤素, 优选氟、氯、溴或碘;

k 为 0 至环 A 上能够被取代的最大个数; 优选 k 为 0 至 6 的整数; 更优选 k 为 0 至 4 的整数; 进一步优选 k 为 0、1 或 2, 最优选 k 为 1;

所述化合物 VII 根据权利要求 1 至 7 中任一项所述的如式 VII 所示的化合物的制备方法制得;

步骤 d) 中, 所述溶剂优选 DMF、NMP 和 ACN 中的一种或多种, 更优选 DMF;

步骤 d) 中, 所述碱优选碳酸钾、碳酸铯和碳酸钠中的一种或多种, 更优选碳酸钾;

步骤 d) 中, 所述化合物 4 与所述碱的摩尔比优选 1-1.5:1, 更优选 1.2:1;

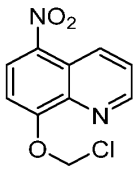
步骤 d) 中, 所述化合物 4 与所述化合物 VII 的摩尔比优选 1-1.5:1, 更优选 1.2:1;

步骤 d) 中, 所述溶剂的体积与所述化合物 4 的质量的比值优选 8:1 mL/g 至 12:1 mL/g, 更优选 10:1 mL/g;

步骤 d) 中, 所述反应的反应温度优选 20℃ 至 30℃。

9. 根据权利要求 8 中所述的如式 VIII 所示的化合物的制备方法, 其特征在于, 步骤 d) 之后还包括将化合物 VIII 分离纯化的步骤 e);
- 5 所述步骤 e) 优选包括如下步骤: 将步骤 d) 得到的化合物 VIII 溶解于正溶剂中, 然后与反溶剂混合, 得到化合物 VIII 的晶体;
- 其中, 所述正溶剂优选乙酸乙酯; 所述反溶剂优选石油醚。

10. 根据权利要求 8 或 9 中所述的如式 VIII 所示的化合物的制备

- 10 方法, 其特征在于, 所述化合物 VII 为 , 所述化合物 VIII 为

