

(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

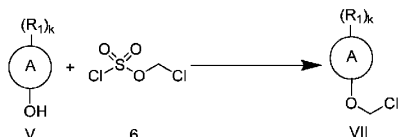
WO 2021/258979 A1

(43) 国际公布日
2021 年 12 月 30 日 (30.12.2021) WIPO | PCT

- (51) 国际专利分类号:
C07D 215/28 (2006.01) A61K 31/47 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2021/096279
- (22) 国际申请日: 2021 年 5 月 27 日 (27.05.2021)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
202010573569.2 2020 年 6 月 22 日 (22.06.2020) CN
- (71) 申请人: 江苏亚虹医药科技股份有限公司 (JIANGSU YAHONG MEDITECH CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省泰州市药城大道一号新药创制基地二期 D 幢 1009 室, Jiangsu 225316 (CN)。上海亚虹医药科技有限公司 (SHANGHAI YAHONG MEDITECH CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市自由贸易试验区金海路 1000 号 56 幢第 12 层, Shanghai 201203 (CN)。
- (72) 发明人: 吴亮(WU, Liang); 中国江苏省泰州市药城大道一号新药创制基地二期 D 幢 1009 室, Jiangsu 225316 (CN)。周琛(ZHOU, Chen); 中国江苏省泰州市药城大道一号新药创制基地二期 D 幢 1009 室, Jiangsu 225316 (CN)。邓一军(DENG, Yijun); 中国江苏省泰州市药城大道一号新药创制基地二期 D 幢 1009 室, Jiangsu 225316 (CN)。
- (74) 代理人: 北京戈程知识产权代理有限公司 (GE CHENG & CO., LTD); 中国北京市东城区东长安街 1 号东方广场东三办公楼 19 层程伟, Beijing 100738 (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, 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, IT, 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,

(54) Title: PREPARATION METHOD FOR AROMATIC ETHER COMPOUND

(54) 发明名称: 芳香醚类化合物的制备方法



(57) Abstract: A preparation method for an aromatic ether compound. The preparation method comprises the following step: c) in a solvent, in the presence of a catalyst and alkali, a compound V reacts with a compound 6 to obtain a compound VII, wherein the solvent is a solvent system having two or more elements selected from water, tetrahydrofuran, 2-methyltetrahydrofuran, ethyl acetate, and dioxane. According to the preparation method for the aromatic ether compound in the present invention, the conversion rate of the reaction can be greatly improved, and thus the yield of the step and the total yield of the whole reaction route are improved; after-treatment and purification operations for preparing the compound VII are greatly simplified, and the compound VII having high purity can be obtained only by simply filtering a reaction solution and washing and drying a filter cake. The preparation method is suitable for industrial scale-up production.

(57) 摘要: 一种芳香醚类化合物的制备方法。该制备方法包括如下步骤: 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; 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。本发明的芳香醚类化合物的制备方法, 能够极大地提高上述反应的转化率, 进而会提高该步的收率及整条反应路线的总收率; 极大地简化了制备化合物 VII 的后处理及纯化操作, 只需简单地将反应液过滤, 将滤饼洗涤, 干燥, 即可得到纯度很高的化合物 VII, 适于工业放大生产。

[见续页]

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, 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)。

本国际公布：

— 包括国际检索报告 (条约第21条(3))。