

(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, 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))。

一种在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法

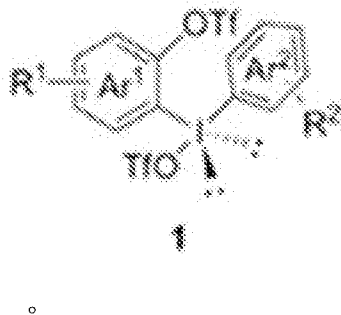
技术领域

[0001] 本发明属于有机合成技术领域，具体涉及由邻碘卤化物在碱金属氢化物作用下产生芳炔中间体，然后和酚偶联反应，生成2-碘代芳醚。

背景技术

[0002] 2-碘代芳醚是非常有用的有机合成砌块，可用于多种含氧杂环的合成，还可以把碘进行多样的转化，制备邻位取代的芳醚衍生物。现有技术中，碳-碳或碳-杂原子键形成反应需要金属催化剂或强碱作为促进剂；或者采用复杂的前体，比如以化合物1为前体，在碳酸铯存在下，反应12小时得到碘代芳醚。

[0003]



[0004] 现有技术采用贵金属催化剂催化单卤素取代芳烃与酚的反应，未见采用双卤素取代芳烃与酚反应的报道。

发明概述

技术问题

[0005] 本发明提供一种室温下一步反应合成2-碘代芳醚的方法；这是首次使用邻碘卤化物在碱金属氢化物作用下吸收另一分子邻碘卤化物的卤素原子成为2-碘代芳醚产物。本发明是一种碱金属氢化物促进的苯酚和邻碘卤化物的偶联反应，这类转化快速、简捷而且温和，不需要过渡金属催化，没有过度偶联的副产物，是一种快速构建各种2-碘代芳醚的新颖方法。

问题的解决方案

技术解决方案

[0006] 本发明实现以上提及的合成2-碘代芳醚的技术手段是把碱金属氢化物、酚和1, 2-二碘芳烃混合在溶剂中, 无需其他试剂, 搅拌反应得到产物。具体技术方案如下: 一种在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法, 包括以下步骤, 在碱金属氢化物存在下, 1, 2-二碘芳烃与酚反应, 得到2-碘代芳醚; 优选的, 将碱金属氢化物和酚加入溶剂中, 然后加入1, 2-二碘芳烃, 0~100℃下进行反应, 得到2-碘代芳醚产物。

[0007] 本发明中, 所述酚为苯酚、取代的苯酚或者杂环苯酚。

[0008] 本发明中, 所述碱金属氢化物为氢化钠、氢化钾和氢化锂, 优选氢化钠和氢化钾, 更优选氢化钠。

[0009] 本发明中, 所述溶剂为DMF (N,N-二甲基甲酰胺)、DMA (N,N-二甲基乙酰胺)、THF (四氢呋喃)、2-MeTHF (2-甲基四氢呋喃)、DME (乙二醇二甲醚)、MTBE (甲基叔丁基醚)、乙醚、DMSO、NMP (N-甲基吡咯烷酮)、甲苯中的一种或几种, 优选DMA和THF, 更优选DMA和THF的混合物。

[0010] 本发明中, 所述酚、1, 2-二碘芳烃和碱金属氢化物的摩尔比为1 : (0.1~10) : (1.2~10); 优选为1 : (0.5~5) : (1.5~5); 更优选为1 : (1~3) : (2~4); 最优选为1 : 1.5 : 3。

[0011] 上述技术方案中, 所述反应的温度为0~100℃, 优选10~50℃, 更优选室温; 所述反应的时间为0.2~10小时, 优选0.5~2小时。

[0012] 本发明中, 所述1, 2-二碘芳烃的化学结构式如下:



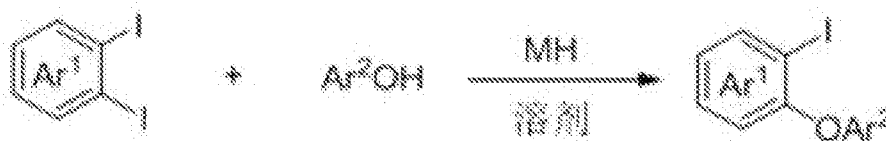
。

[0013] 本发明中, 所述苯酚的化学结构式为Ar²OH。

[0014] 本发明中, 2-碘代芳醚的化学结构式如下:



[0015] 上述技术方案可表示如下：



[0016] 本发明中，Ar¹为苯、萘等基团；Ar²为苯、萘、吡啶、喹啉、嘧啶、噻吩等基团；M为钠、钾、锂。

发明的有益效果

有益效果

[0017] 本发明用来制备2-碘代芳醚有以下几点优势：1) 偶联过程不需要添加过渡金属催化剂，不会对产物造成金属污染；2) 本发明的方法可以在室温进行，官能团兼容性高，解决了现有金属催化的偶联成芳醚反应需要在较高温度进行的问题；3) 反应简单，试剂便宜，所需的花费很小；4) 可以制备其它方法不易制备的产物，比如两边芳环都含有碘的产物。

对附图的简要说明

附图说明

[0018] 图1为产物碘代芳醚3aa的氢核磁谱图。

发明实施例

本发明的实施方式

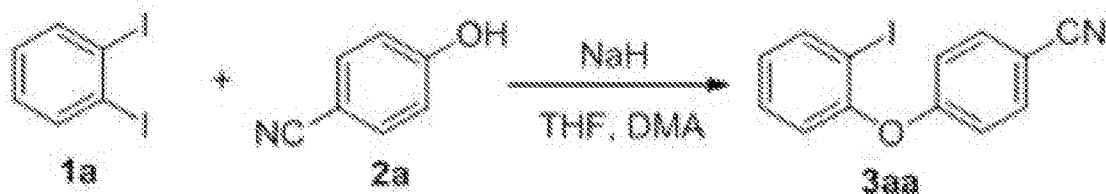
[0019] 本发明的酚和碘代物的偶联反应，无需添加任何催化剂，操作简单，反应的副产物只有碘化钠，无毒害物质产生；本发明制备2-碘代芳醚，仅需一步温和反应即可得到，无过度偶联产物，优于已有的所有方法。

[0020] 本发明的技术方案如下：将碱金属氢化物悬浮于溶剂中，再加入酚，然后加入

1,2-二碘芳烃, 室温下进行反应0.2~10小时, 加水终止反应, 用溶剂萃取, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物2-碘代芳醚。

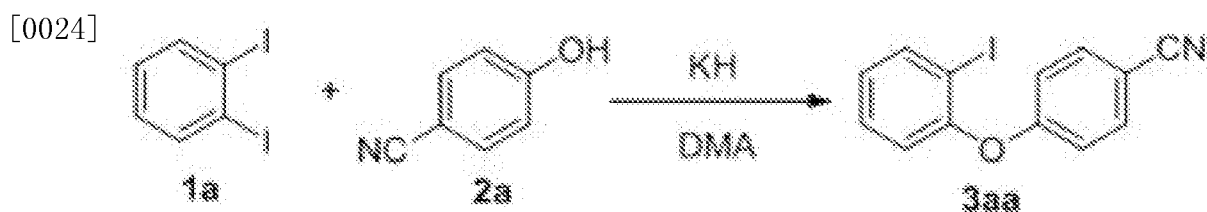
[0021] 本发明涉及的原料都是市售产品, 具体操作方法以及测试方法都为现有技术; 本发明的反应无需惰性气体, 常规环境往反应瓶内加料, 加料完成后盖盖反应即可; 具体操作与提纯为常规技术。

[0022] 实施例1:



。

[0023] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2a (36 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温反应2小时, 再加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 3aa, 收率99%, 氢核磁谱图见图1, LR-MS (ESI): m/z 322.1 $[M+H]^+$ 。



。

[0025] 用氢化钾等摩尔量替换上述氢化钠, 其余不变, 得到产物碘代芳醚 3aa, 收率39%。

[0026] 用氢化锂等摩尔量替换上述氢化钠, 其余不变, 无法得到产物碘代芳醚 3aa。

[0027] 用氢化钙等摩尔量替换上述氢化钠, 其余不变, 无法得到产物碘代芳醚 3aa。

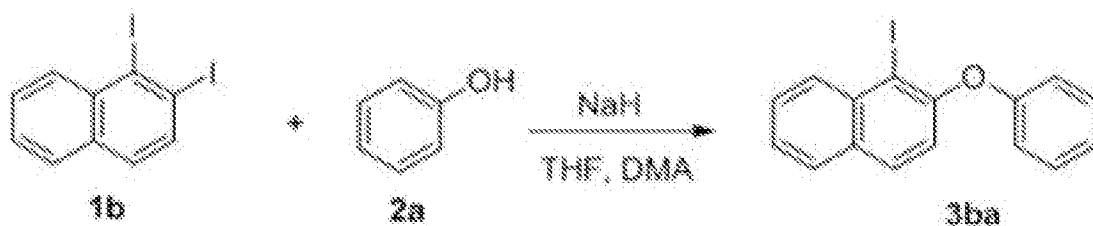
[0028] 将上述室温替换为冰水浴, 其余不变, 得到产物碘代芳醚 3aa, 收率51%。

[0029] 将上述氢化钠用量替换为2eq, 其余不变, 得到产物碘代芳醚 3aa, 收率81%。

[0030] 将上述室温反应2小时替换为室温反应1小时, 其余不变, 得到产物碘代芳醚

3aa, 收率96%。

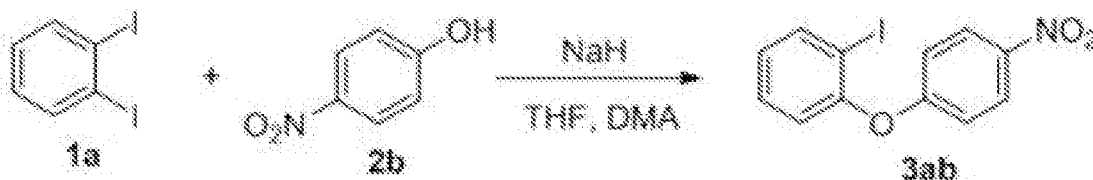
[0031] 实施例2:



。

[0032] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2a (28 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应1小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 3ba, 收率35%。

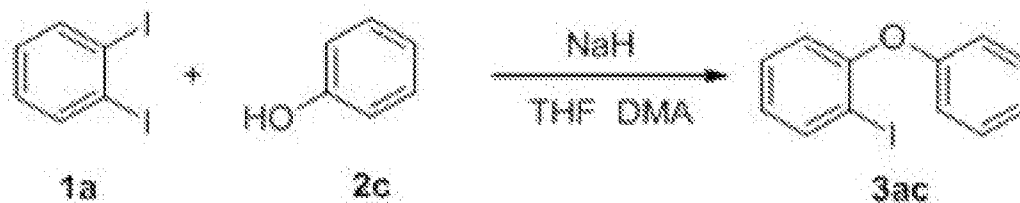
[0033] 实施例3:



。

[0034] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2b (42 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应0.5小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 3ab, 收率97%。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.22 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.92 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.43 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.03 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H). LR-MS (ESI): m/z 342.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 。

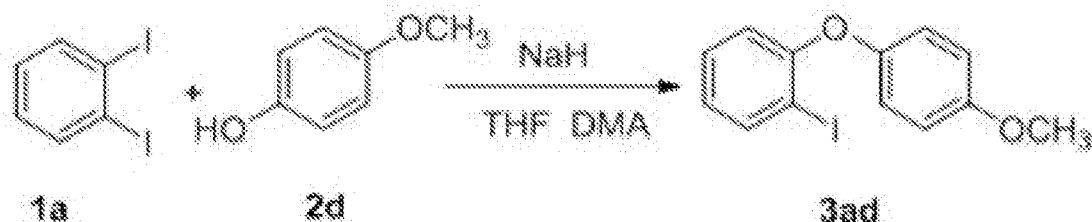
[0035] 实施例4:



。

[0036] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2c (28 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应0.5小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 **3ac**, 收率98%。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.87 (dd, $J = 7.8, 1.5$ Hz, 1H), 7.42–7.32 (m, 2H), 7.32–7.26 (m, 1H), 7.18–7.07 (m, 1H), 7.02–6.94 (m, 2H), 6.94–6.83 (m, 2H). LR-MS (ESI): m/z 297.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 。

[0037] 实施例5 :

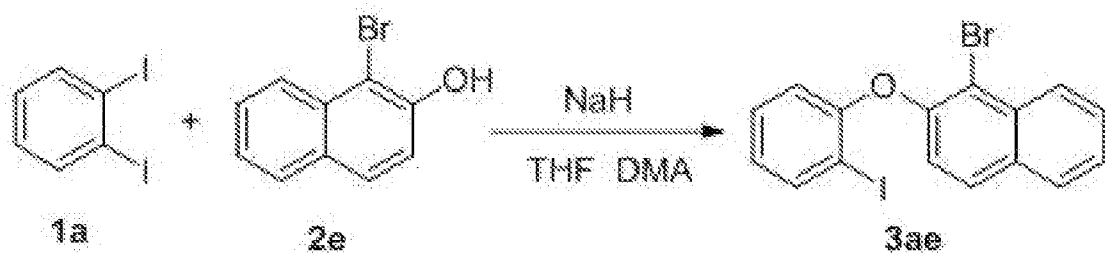


。

[0038] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2d (37 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应1小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 **3ad**, 收率89%。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 7.84 (dd, $J = 7.8, 1.5$ Hz, 1H), 7.24 (ddd, $J = 8.8, 5.7, 1.5$ Hz, 1H), 7.02–6.92 (m, 2H), 6.92–6.86 (m, 2H), 6.81 (td, $J = 7.7, 1.4$ Hz, 1H), 6.76 (dd, $J = 8.2,$

1.3 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H). LR-MS (ESI): m/z 327.2 $[M+H]^+$.

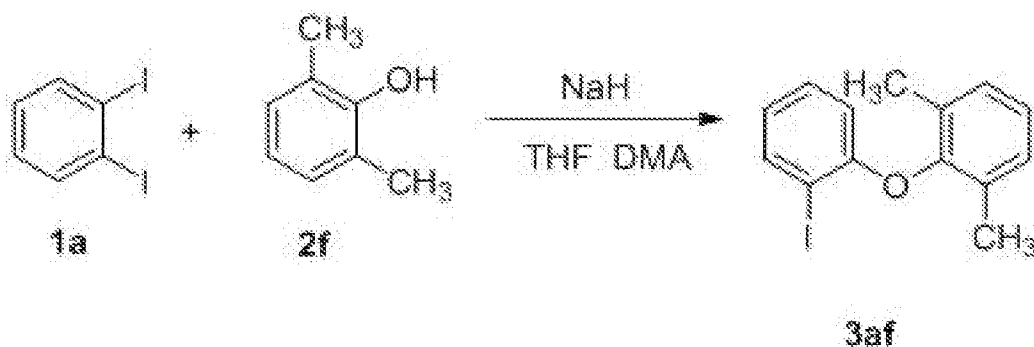
[0039] 实施例6:



。

[0040] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2e (38 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应1小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 3ae, 收率91%。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.31 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 7.89 (t, $J = 7.1$ Hz, 1H), 7.82 (dd, $J = 17.9, 8.5$ Hz, 2H), 7.64 (t, $J = 7.6$ Hz, 1H), 7.52 (t, $J = 7.4$ Hz, 1H), 7.23 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.11 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.87 (t, $J = 7.4$ Hz, 1H), 6.71 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H). LR-MS (ESI): m/z 424.7 $[M+H]^+$.

[0041] 实施例7:

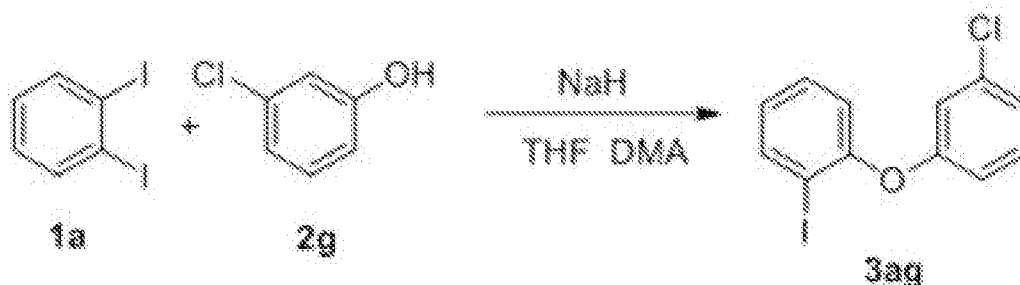


。

[0042] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2f (34mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液,

加完后室温搅拌10分钟，然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液，室温进行反应1小时，加水淬灭，用乙酸乙酯萃取三次，合并有机层，用硫酸钠干燥，蒸干，柱层析纯化，得到产物碘代芳醚 3af，收率85%。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 7.85 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.19–7.04 (m, 4H), 6.74 (dd, J = 15.2, 7.7 Hz, 1H), 6.30 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 2.13 (s, 6H). LR-MS (ESI): m/z 325.1 [M+H]⁺.

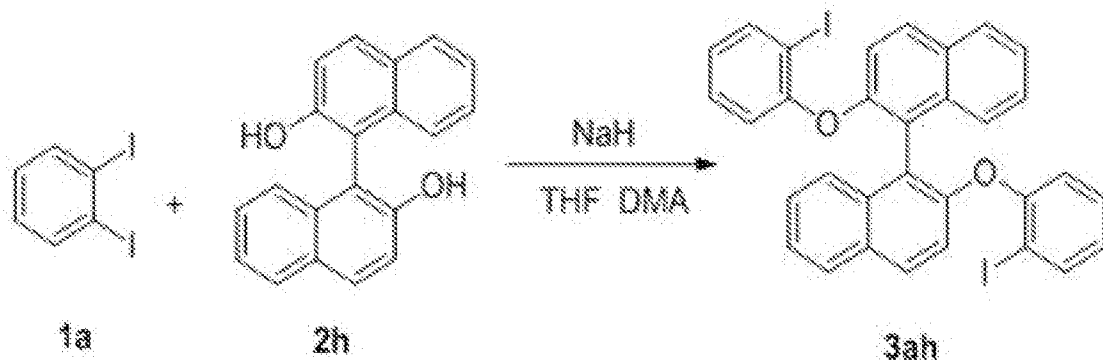
[0043] 实施例8:



。

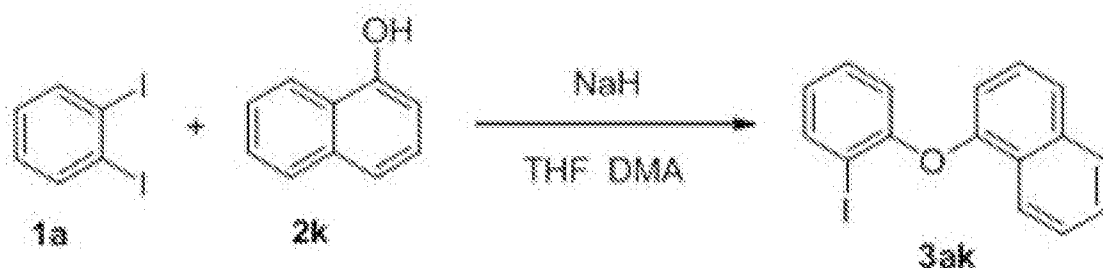
[0044] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中，常规搅拌下加入酚 2g (38 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液，加完后室温搅拌10分钟，然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液，室温进行反应0.5小时，加水淬灭，用乙酸乙酯萃取三次，合并有机层，用硫酸钠干燥，蒸干，柱层析纯化，得到产物碘代芳醚 3ag，收率96%。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 7.88 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.36–7.30 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 9.2, 7.1 Hz, 1H), 7.08 (ddd, J = 8.0, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 7.01–6.89 (m, 3H), 6.85 (ddd, J = 8.3, 2.4, 0.8 Hz, 1H). LR-MS (ESI): m/z 331.0 [M+H]⁺.

[0045] 实施例9:



[0046] 将氢化钠 (60% in oil, 72 mg, 1.8 mmol, 6 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2h (86 mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.4 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (297 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 在THF (0.6 mL) 中的溶液, 室温进行反应1小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次, 合并有机层, 用硫酸钠干燥, 蒸干, 柱层析纯化, 得到产物碘代芳醚 3ah, 收率89%. $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 7.90 (t, $J = 7.4$ Hz, 4H), 7.66 (d, $J = 7.7$ Hz, 2H), 7.47 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.41 (dd, $J = 15.2, 7.6$ Hz, 2H), 7.33 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.13 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.04 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 6.70 (t, $J = 6.9$ Hz, 4H). LR-MS (ESI): m/z 690.8 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

[0047] 实施例10:



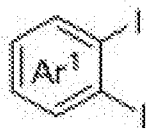
[0048] 将氢化钠 (60% in oil, 36 mg, 0.9 mmol, 3 eq.) 悬浮于THF (1 mL) 中, 常规搅拌下加入酚 2k (43mg, 0.3 mmol, 1 eq.) 在DMA (0.3 mL) 中的溶液, 加完后室温搅拌10分钟, 然后加入 1a (148 mg, 0.45 mmol, 1.5 eq.) 在THF (0.2 mL) 中的溶液, 室温进行反应1小时, 加水淬灭, 用乙酸乙酯萃取三次,

合并有机层，用硫酸钠干燥，蒸干，柱层析纯化，得到产物碘代芳醚 3aj，收率85%。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.25 – 8.16 (m, 1H), 7.89 (ddd, J = 9.4, 7.4, 2.6 Hz, 2H), 7.63 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.58 – 7.45 (m, 2H), 7.41 – 7.32 (m, 1H), 7.28 – 7.20 (m, 1H), 6.91 – 6.76 (m, 3H). LR-MS (ESI): m/z 347.2 [M+H]⁺.

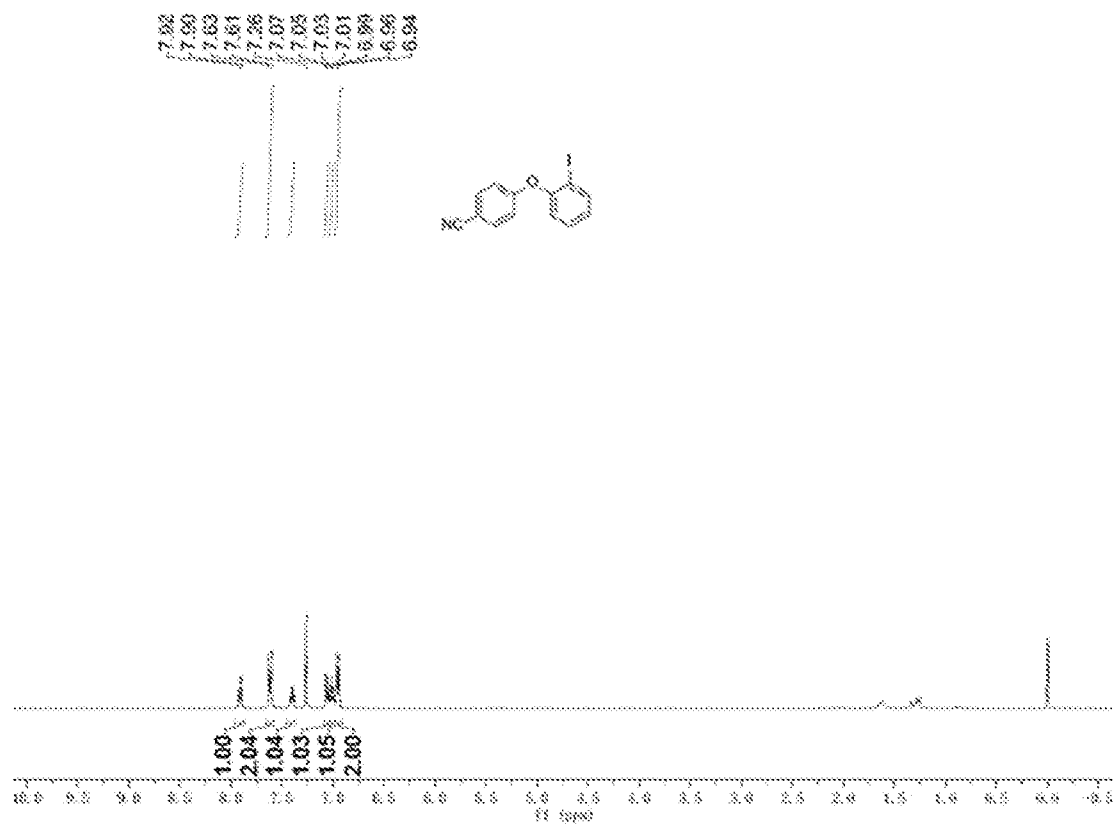
[0049] 上述实施例通过核磁测试、质谱测试验证本发明实施例的产物与设计匹配；与现有技术相比，本发明只需要从商品化的1,2-二碘芳烃和酚在碱金属氢化物作用下室温搅拌一段时间就可以得到2-碘代芳醚，从合成效率和成本上来看，明显优于已有方法。

权利要求书

- [权利要求 1] 一种在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，包括以下步骤，在碱金属氢化物存在下，1, 2-二碘芳烃与酚反应，得到2-碘代芳醚。
- [权利要求 2] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，将碱金属氢化物和酚加入溶剂中，然后加入1, 2-二碘芳烃，进行反应，得到2-碘代芳醚产物。
- [权利要求 3] 根据权利要求2所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，所述溶剂为DMF、DMA、THF、2-MeTHF、DME、MTBE、乙醚、DMSO、NMP、甲苯中的一种或几种。
- [权利要求 4] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，所述碱金属氢化物为氢化钠、氢化钾或氢化锂。
- [权利要求 5] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，所述酚为苯酚、取代的苯酚或者杂环苯酚。
- [权利要求 6] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，所述酚、1, 2-二碘芳烃和碱金属氢化物的摩尔比为1 : (0.1~10) : (1.2~10)。
- [权利要求 7] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法，其特征在于，所述反应的温度为0~100℃；所述反应的时间为0.2~10小时。
- [权利要求 8] 根据权利要求1所述在碱金属氢化物作用下制备2-碘代芳醚的方法制备的2-碘代芳醚。
- [权利要求 9] 碱金属氢化物在以1, 2-二碘芳烃、酚为原料制备2-碘代芳醚中的应用。
- [权利要求 10] 根据权利要求9所述的应用，其特征在于，所述1, 2-二碘芳烃的化学结构式如下：



其中，Ar¹为苯基或者萘基。



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/CN2021/077530

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07B 41/04(2006.01)i; C07C 253/30(2006.01)i; C07C 255/54(2006.01)i; C07C 41/16(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07B; C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CNKI; EPODOC; STN; CNPAT; DWPI; CAPLUS; REGISTRY: 碘代, 二碘, 氢化物, 酚, indo+, hydride, phenol, phenyl s ol, phenyl hydrate, phenic acid, diiodo+

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E	CN 112979400 A (SOOCHOW UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) claims 1-10	1-10
E	CN 112979497 A (SOOCHOW UNIVERSITY) 18 June 2021 (2021-06-18) embodiments 1-6, compound 3aa	8
X	WEN Song Yue et al. "A Concise Synthesis of All Four Possible Benzo[4, 5]furopyridines via Palladium-Mediated Reactions" <i>Organic Letters</i> , Vol. 4, No. 13, 31 December 2002 (2002-12-31), ISSN: 1523-706, pp. 2201-2203	1-10
X	FRANK Narjes et al. "Potent and Orally Bioavailable Inverse Agonists of ROR γ t Resulting from Structure-Based Design" <i>J. Med. Chem.</i> , Vol. 61, No. 17, 10 August 2018 (2018-08-10), ISSN: 0022-2623, pp. 7796-7813	1-10



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 November 2021

Date of mailing of the international search report

24 November 2021

Name and mailing address of the ISA/CN

China National Intellectual Property Administration (ISA/
CN)
No. 6, Xitucheng Road, Jimenqiao, Haidian District, Beijing
100088, China

Facsimile No. (86-10)62019451

Authorized officer

Telephone No.

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEN Huangguan et al. "Intramolecular Aryl Migration of Diaryliodonium Salts: Access to ortho-Iodo Diaryl Ethers" 《 <i>Angewandte Chemie, International Edition</i> 》, Vol. 57, No. 38, 31 December 2018 (2018-12-31), ISSN: 1433-7851, pp. 12313-12317	8
X	BAO Yong-Sheng et al. "One pot synthesis of diarylfurans from aryl esters and PhI(OAc) ₂ via palladium-associated iodonium ylides" 《 <i>Organic & Biomolecular Chemistry</i> 》, Vol. 13, No. 14, 02 March 2015 (2015-03-02), ISSN: 1477-0520, pp. 4179-4182	8
X	LUTZ F.Tietze et al. "A Fast Way to Fluorescence: A Fourfold Domino Reaction to Condensed Polycyclic Compounds" 《 <i>Chemistry - A European Journal</i> 》, Vol. 20, No. 39, 31 December 2014 (2014-12-31), ISSN: 0947-6539, pp. 12553-12558	8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/CN2021/077530

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
CN	112979400	A	18 June 2021	None	
CN	112979497	A	18 June 2021	None	

国际检索报告

国际申请号

PCT/CN2021/077530

A. 主题的分类

C07B 41/04(2006.01)i; C07C 253/30(2006.01)i; C07C 255/54(2006.01)i; C07C 41/16(2006.01)i

按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和IPC两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

C07B; C07C

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称, 和使用的检索词(如使用))

CNKI;EPDOC;STN;CNPAT;DWPI;CAPLUS;REGISTRY:碘代, 二碘, 氢化物, 酚, indo+, hydride, phenol, phenyl s
ol, phenyl hydrate, phenic acid, diiodo+

C. 相关文件

类 型*	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求
E	CN 112979400 A (苏州大学) 2021年 6月 18日 (2021 - 06 - 18) 权利要求1-10	1-10
E	CN 112979497 A (苏州大学) 2021年 6月 18日 (2021 - 06 - 18) 实施例1-6化合物3aa	8
X	WEN Song Yue 等. "A Concise Synthesis of All Four Possible Benzo[4, 5]furopyridines via Palladium-Mediated Reactions" 《Organic Letters》, 第4卷, 第13期, 2002年 12月 31日 (2002 - 12 - 31), ISSN: 1523-706, 第2201-2203页	1-10
X	FRANK Narjes等. "Potent and Orally Bioavailable Inverse Agonists of ROR γ t Resulting from Structure-Based Design" 《J. Med. Chem.》, 第61卷, 第17期, 2018年 8月 10日 (2018 - 08 - 10), ISSN: 0022-2623, 第7796-7813页	1-10

☒ 其余文件在C栏的续页中列出。☒ 见同族专利附件。

* 引用文件的具体类型:

“A” 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件

“E” 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利

“L” 可能对优先权要求构成怀疑的文件, 或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件(如具体说明的)

“O” 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件

“P” 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件

“T” 在申请日或优先权日之后公布, 与申请不相抵触, 但为了理解发明之理论或原理的在后文件

“X” 特别相关的文件, 单独考虑该文件, 认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性

“Y” 特别相关的文件, 当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时, 要求保护的发明不具有创造性

“&” 同族专利的文件

国际检索实际完成的日期

2021年 11月 10日

国际检索报告邮寄日期

2021年 11月 24日

ISA/CN的名称和邮寄地址

中国国家知识产权局(ISA/CN)

中国 北京市海淀区蓟门桥西土城路6号 100088

传真号 (86-10)62019451

授权官员

王博

电话号码 62086314

C. 相关文件		
类 型*	引用文件, 必要时, 指明相关段落	相关的权利要求
X	CHEN Huangguan等. "Intramolecular Aryl Migration of Diaryliodonium Salts: Access to ortho-Iodo Diaryl Ethers" 《Angewandte Chemie, International Edition》, 第57卷, 第38期, 2018年 12月 31日 (2018 - 12 - 31), ISSN: 1433-7851, 第12313-12317页	8
X	BAO Yong-Sheng等. "One pot synthesis of diarylfurans from aryl esters and PhI(OAc) ₂ via palladium-associated iodonium ylides" 《Organic & Biomolecular Chemistry》, 第13卷, 第14期, 2015年 3月 2日 (2015 - 03 - 02), ISSN: 1477-0520, 第4179-4182页	8
X	LUTZ F.Tietze等. "A Fast Way to Fluorescence: A Fourfold Domino Reaction to Condensed Polycyclic Compounds" 《Chemistry - A European Journal》, 第20卷, 第39期, 2014年 12月 31日 (2014 - 12 - 31), ISSN: 0947-6539, 第12553-12558页	8

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号

PCT/CN2021/077530

检索报告引用的专利文件			公布日 (年/月/日)	同族专利	公布日 (年/月/日)
CN	112979400	A	2021年 6月 18日	无	
CN	112979497	A	2021年 6月 18日	无	