(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
2016 年 2 月 4 日 (04.02.2016)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2016/015512 A1

(51) 国际专利分类号:
C07J 9/00 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2015/079551

(22) 国际申请日: 2015 年 5 月 22 日 (22.05.2015)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201410368802.8 2014 年 7 月 30 日 (30.07.2014) CN

(71) 申请人: **浙江工业大学 (ZHEJIANG UNIVERSITY OF TECHNOLOGY)** [CN/CN]; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **浙江花园生物高科股份有限公司 (ZHEJIANG GARDEN BIOCHEMICAL HIGH-TECH CO., LTD)** [CN/CN]; 中国浙江省东阳市花园工业区, Zhejiang 322121 (CN)。 **杭州下沙生物科技有限公司 (HANGZHOU XIASHA BIOCHEMICAL TECH CO., LTD)** [CN/CN]; 中国浙江省杭州市下沙经济开发区 20 号大街 166 号, Zhejiang 310018 (CN)。

(72) 发明人: **金灿 (JIN, Can)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **苏为科 (SU, Weike)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **王子强 (WANG, Ziqiang)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **刘建刚 (LIU, Jiangang)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **孙彬 (SUN, Bin)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。 **许文灏 (XU, Wenhao)**; 中国浙江省杭州市潮王路 18 号, Zhejiang 310014 (CN)。

(74) 代理人: **杭州浙科专利事务所（普通合伙） (HANGZHOU ZHEKE PATENT AGENCY(GENERAL PARTNERSHIP))**; 中国浙江省杭州市拱墅区万达商业中心 4 幢 3 单元 1019 室, Zhejiang 310015 (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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, 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**: METHOD FOR SYNTHESIZING 25-HYDROXY CHOLESTEROL

(54) **发明名称** : 一种 25-羟基胆固醇的合成方法

(57) **Abstract**: Disclosed is a method for synthesizing 25-hydroxy cholesterol. The method is as below: subjecting 24-dehydrocholesterol derivative as a raw material and a hydroxyl containing reagent to an addition reaction in the presence of a catalyst in an organic solvent, hydrolyzing the reaction product and separating to obtain 25-hydroxy cholesterol. The present invention adopts hydroxyl containing reagents such as water, formic acid, acetic acid, propionic acid, butyric acid, benzoic acid , p-methyl benzoic acid and etc. to replace the commonly used extremely toxic reagents such as Cr reagent, Hg reagent , multi-fluorinated acetone and etc. in the prior art. The raw materials of the present invention are easily available, and have low effect on environment. The operation and post treatment are convenient. Moreover, the method has the advantages of mild reaction conditions, simple operation, good selectivity, high efficiency, high yield, simple post-treatment, easy product separation, less three wastes and easy industrialization.

(57) **摘要**: 本发明公开了一种 25-羟基胆固醇的合成方法，所述的合成方法为：以 24-脱氢胆固醇衍生物为原料，在催化下与含羟基试剂在有机溶剂中通过加成反应再经水解后分离得到 25-羟基胆固醇。本发明通过采用水、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、苯甲酸、对甲基苯甲酸等含羟基试剂代替现有技术中常用的 Cr 试剂、Hg 试剂、多氟代丙酮等剧毒试剂，原料简单易得、对环境影响小，操作和后处理方便，而且其反应条件温和、操作简单、选择性好、效率高、收率高，后处理简单，产品易分离，三废少，易于产业化。

WO 2016/015512 A1