(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
2013 年 7 月 4 日 (04.07.2013)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2013/097681 A1

(51) 国际专利分类号:
C07J 71/00 (2006.01) *A61P 3/06* (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01) *A61P 9/10* (2006.01)
A61K 36/06 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2012/087360

(22) 国际申请日: 2012 年 12 月 25 日 (25.12.2012)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201110441993.2 2011 年 12 月 26 日 (26.12.2011) CN
201110442009.4 2011 年 12 月 26 日 (26.12.2011) CN
201210015475.9 2012 年 1 月 18 日 (18.01.2012) CN

(71) 申请人: **北京北大维信生物科技有限公司 (BEIJING PEKING UNIVERSITY WBL BIOTECH CO., LTD.)** [CN/CN]; 中国北京市海淀区海淀南路 30 号 A 座 701-705 室, Beijing 100080 (CN)。

(72) 发明人: **段震文 (DUAN, Zhenwen)**; 中国北京市海淀区海淀南路 30 号航天精密大厦 7 层 701-705 室, Beijing 100080 (CN)。 **郭树仁 (GUO, Shuren)**; 中国北京市海淀区海淀南路 30 号航天精密大厦 7 层 701-705 室, Beijing 100080 (CN)。 **李雪梅 (LI, Xuemei)**; 中国北京市海淀区海淀南路 30 号航天精密大厦 7 层 701-705 室, Beijing 100080 (CN)。

(74) 代理人: **中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 (CCPIT PATENT AND TRADEMARK LAW OFFICE)**; 中国北京市西城区阜成门外大街 2 号万通新世界广场 8 层, Beijing 100037 (CN)。

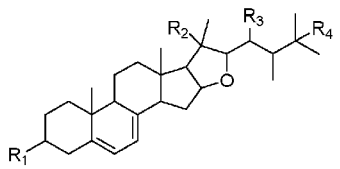
(81) 指定国 (除另有指明，要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, 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, 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,

[见续页]

(54) **Title**: STEROLS DERIVATIVE, AND PREPARATION METHOD AND PURPOSE THEREOF

(54) **发明名称**: 一种甾醇类衍生物、其制备方法及用途



I

(57) **Abstract**: The present invention relates to the field of pharmaceutical chemicals, and provides a sterols derivative, and a preparation method and purpose thereof. Specifically, the present invention relates to a compound shown in formula I, or pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein R_1 is selected from -OH, =O, H, and alkyl group containing one to three carbon atoms; R_2 is selected from -OH, H, and alkyl group containing one to three carbon atoms; R_3 is selected from -OH, =O, H, and alkyl group containing one to three carbon atoms; R_4 is selected from -OH, H, and alkyl group containing one to three carbon atoms; and any 0, 1, 2, 3, or 4 of R_1, R_2, R_3 and R_4 is -OH. The compound of the present invention can effectively suppress HMG-CoA reductase, tumor cells, and lipase, and has the potential of being used as tumor-reducing or anti-tumor medicine or diet pills.

(57) **摘要**: 本发明属于医药化工领域，涉及一种甾醇类衍生物、其制备方法及用途。具体地，本发明涉及式 I 所示的化合物，或其药学上可接受的盐，其中，R_1选自-OH、=O、H、以及 C_1-C_3烷基；R_2选自-OH、H、以及 C_1-C_3烷基；R_3选自-OH、=O、H、以及 C_1-C_3烷基；R_4选自-OH、H、以及 C_1-C_3烷基；并且 R_1、R_2、R_3和 R_4中任意 0 个、1 个、2 个、3 个或 4 个为-OH。本发明的化合物能够有效地抑制 HMG-CoA 还原酶、肿瘤细胞、以及脂肪酶，具有作为降低、抗肿瘤、或者减肥的药物的潜力。

WO 2013/097681 A1

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, 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))。