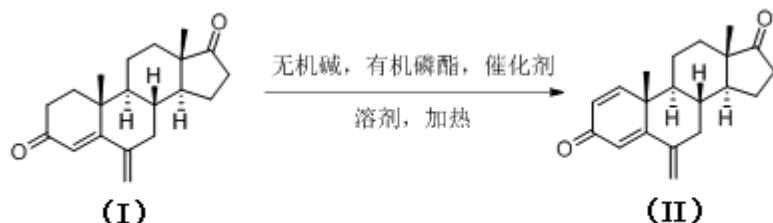


权 利 要 求 书

1、一种依西美坦的合成方法，其特征在于，其合成路线如下：



具体地，以 6-亚甲基雄甾-4-烯-3,17-二酮 (I) 为原料，在有机溶剂中、
氮气保护下、无机碱的存在下，有机磷酸酯类化合物做配基，加热回流条件下
5 经催化剂催化直接对原料进行选择性的 $\Delta 1,2$ 脱氢反应，反应一段时间后，经
后处理得到依西美坦 (II)。

2、根据权利要求 1 所述的合成方法，其特征在于，包括以下步骤：

步骤 1、将有机磷酸酯类化合物溶入有机溶剂中，再加入催化剂，在氮气
保护室温下搅拌反应，再加入无机碱和 6-亚甲基雄甾-4-烯-3,17-二酮，加热
10 至回流反应；

步骤 2、冷却至室温，抽滤除去固体不溶物，滤液经减压蒸馏去除有机
溶剂，再加入水，用二氯甲烷萃取，3 次；

步骤 3、有机相合并后用饱和氯化钠溶液洗涤，2 次，分液，将有机相
进行减压蒸馏去除溶剂，剩余物用甲醇溶解、活性炭脱色，过滤，室温结晶，
15 再用乙醇重结晶，减压干燥得到类白色固体依西美坦。

3、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中
的 6-亚甲基雄甾-4-烯-3,17-二酮、无机碱、有机磷酸酯类化合物配基与催化剂
的摩尔比为 1: 4~6: 3~6: 0.02~0.05。

4、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中
20 的有机溶剂为无水 N,N-二甲基甲酰胺或无水四氢呋喃。

5、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中
的无机碱为无水碳酸钾或无水碳酸钠。

6、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中的有机磷酸酯类化合物为磷酸烯丙基二乙酯或磷酸烯丙基二甲酯。

7、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中的催化剂为 10%钨碳、醋酸钨或 10%氢氧化钨碳。

5 8、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 1 中的搅拌反应的时间为 0.5h；回流反应时间为 12~48 h。

9、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 2 中的减压蒸馏温度为 50-80℃。

10 10、根据权利要求 1 或 2 所述的合成方法，其特征在于，所述步骤 3 中减压蒸馏温度为 30℃，减压干燥温度为 50℃。