

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING (10) DK 0890/91 A

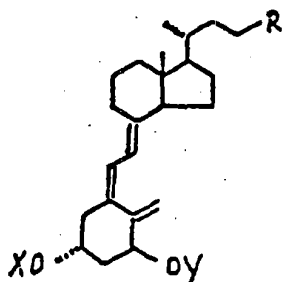
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 0890/91 (51) Int. Cl. 5: C 07 C 401/00
(22) Indleveringsdag:.... 13 maj 1991 C 07 F 7/18
(24) Løbedag:..... 18 apr 1989
(41) Alm. tilgængelig:.... 13 maj 1991
(62) Stamansøgningsnummer:..... 6665/89
(86) International ansøgning nr.:... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 29 apr 1988 US 187680
(71) Ansøger: *Wisconsin Alumni Research Foundation, 614 Walnut Street,
Masison; WI 53705, US
(72) Opfinder: Hector F. *Deluca, 1809 Highway Bb, Deerfield; WI 53531, US
Heinrich K. *Schnoes, 1806 Summit Avenue, Madison; WI 53705,
US
Kato L. *Perlman, 1 Chippewa Court, Madison; WI 53711, US
Andrzej *Kutner, Institute of Pharmaceutical Ind.; Rydygiera
8; 01-793 Warsaw, PL
(74) Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau, Sankt Annæ Plads 11, 1250,
København K

- (54) Fremgangsmåde til fremstilling af vitamin-D-forbindelser
(57) Sammendrag

890-91

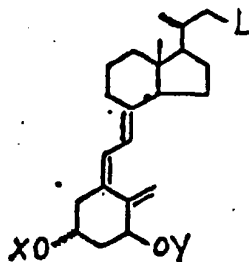
Fremgangsmåde til fremstilling af vitamin-D-forbindelser
med den almene formel



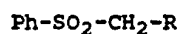
hvor X og Y, som kan være ens eller forskellige, hver for sig betegner hydrogen eller en hydroxybeskyttelsesgruppe,

fortsættes

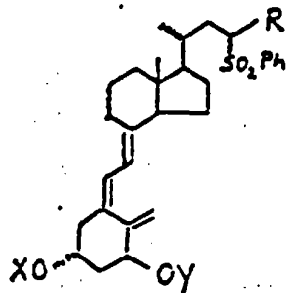
og R betegner alkyl, fluorsubstitueret alkyl, hydroxysubstitueret alkyl, hydroxy- og fluorsubstitueret alkyl, hydroxybeskyttet hydroxysubstitueret alkyl eller hydroxybeskyttet hydroxy- og fluorsubstitueret alkyl, hvilken fremgangsmåde omfatter behandling af et vitamin-D-derivat med den almene formel



hvor L betegner en fraspaltelig enhed med et alkylphenylsulfonderivat med den almene formel



hvorved opnås et sidekædesulfonaddukt med følgende almene formel



og reaktiv desulfonering af sidekædesulfonadduktet til opnåelse af den tilsvarende vitamin-D-forbindelse og eventuelt fjernelse af de(n) tilstedeværende hydroxybeskyttelsesgruppe(r).

Denne metode anvendes til fremstilling af hidtil ukendte 1 α ,25-dihydroxyvitamin-D₃-sidekædehomologer, der udviser forøget og selektiv aktivitet til at foranledige maligne cellers differentiering.

FIG. 4

