

C 07 J

Ans.nr.: 3955/84

Indleveret: 17 aug 1984

Løbedag: 17 aug 1984

Alm. tilgængelig: 18 feb 1985

Prioritet: 17 aug 1983 DE 3330086

17 aug 1983 DE 3330084

17 aug 1983 DE 3330085

*SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT; Berlin und Bergkamen, DE.

Opfinder: Klaus *Nickisch; DE, Henry *Laurent; DE, Peter *Esperling; DE, Dieter *Bittler; DE, Rudolf *Wiechert; DE, Wolfgang *Losert; DE.

Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

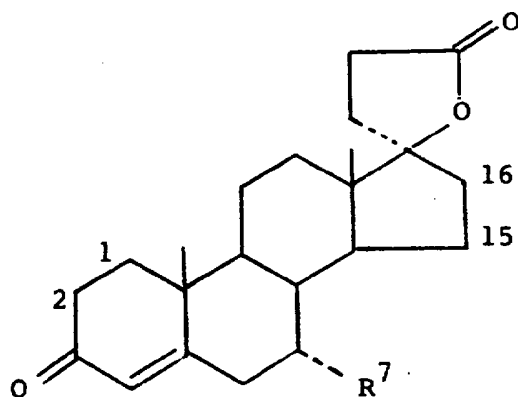
7alfa-substituerede

3-oxo-17alfa-pregn-4-en-21,17-carbolactoner og fremgangsmåde til fremstilling deraf samt farmaceutiske præparater indeholdende disse forbindelser

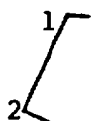
SAMMENDRAG.

3955-84

7α-substituerede 3-oxo-17α-pregn-4-en-21,17-carbolactoner med den almene formel



hvori

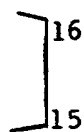


betyder en CC-enkeltbinding eller en CC-dob-

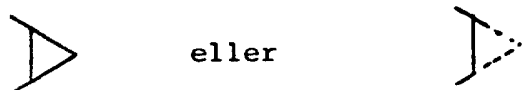
beltbinding eller gruppen



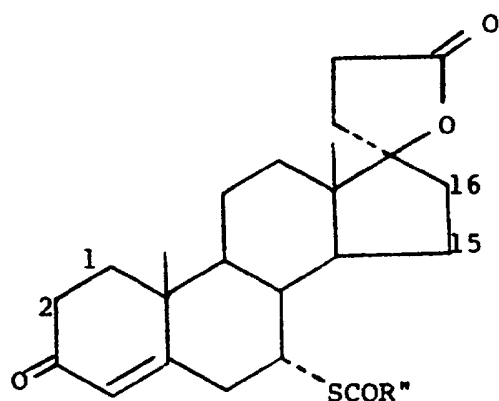
R^7 betegner gruppen SR' , hvori R' betegner et hydrogenatom eller en ligekædet eller forgrenet og eventuelt med en hydroxy- eller acyloxygruppe substitueret alkylgruppe med 1 - 6 carbonatomer, gruppen $COOR''$ eller gruppen COR'' , hvori R'' betyder en alkylgruppe med 1 - 4 carbonatomer, og



betyder en CC-enkeltbinding eller gruppen

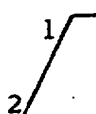
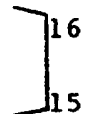


fremstilles ved, at man, såfremt R^7 er gruppen SR' med R' i betydningen hydrogen, forsæber en tilsvarende 7α -thioester med den almene formel II



(II),

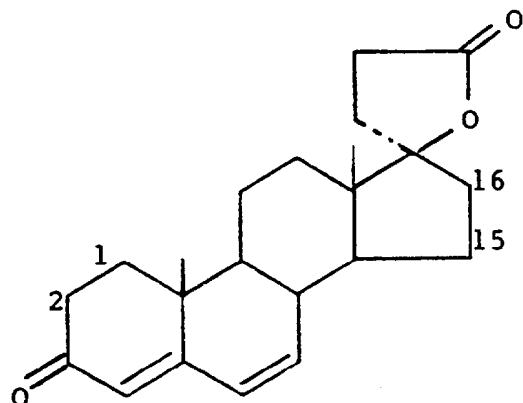
hvori

R'' ,  og  har den i formel I angivne betydning,

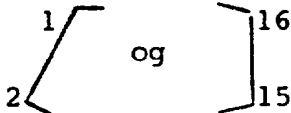
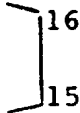
og, såfremt R^7 er gruppen SR' med R' i betydningen en ligekædet eller forgrenet og eventuelt med hydroxy substitueret

3955-84

alkylgruppe, til en Δ^6 -umættet forbindelse med den almene formel III



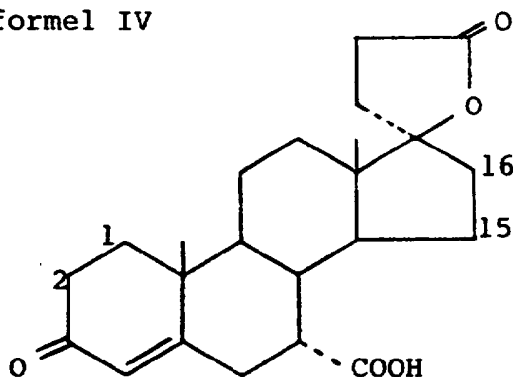
(III),

hvor i  og  har den i formel I angivne betydning,

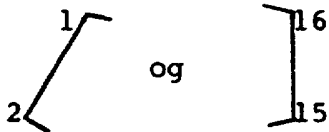
adderer en thioalkohol med formlen



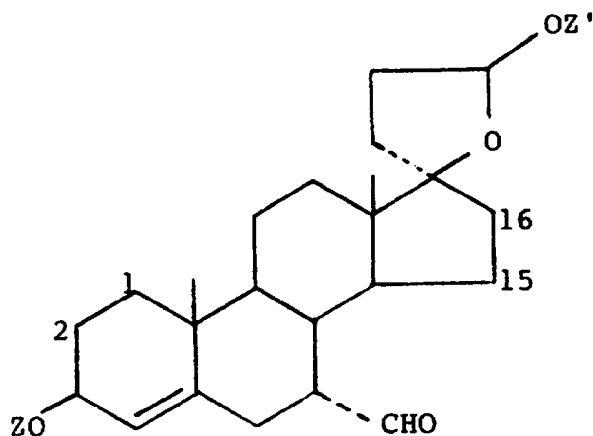
hvor i R'' har den i formel I angivne betydning, og, såfremt R^7 er gruppen $COOR''$, omsætter en 7α -carboxylforbindelse med den almene formel IV



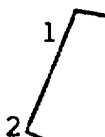
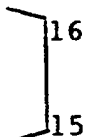
(IV),

hvor i  og  har den i formel I angivne be-

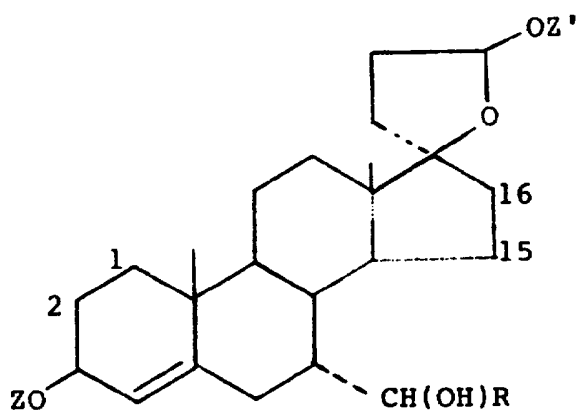
tydning, til dannelse af en C_1 - C_4 -alkylester, og, såfremt R^7 er gruppen COR'' , omsætter en 7α -formylforbindelse med den almene formel V



(V),

hvor  og  har den i formel I angivne

betydning, og Z og Z' betegner en silylgruppe, med en metalorganisk forbindelse R"-X, hvori R" har den i formel I angivne betydning, og X betegner lithium eller magnesiumhalogenid, og behandler den opnåede 7 α -(1-hydroxyalkyl)-forbindelse med den almene formel VI



(VI),

med et surt oxidationsmiddel til silyletherspaltning og oxidation af hydroxygrupperne samt eventuelt indfører Δ^1 -dobbeltbindingen og eventuelt frestrer en fri hydroxygruppe.

De omhandlede forbindelser og farmaceutiske præparater indeholdende disse har antialdosteronvirkning samtidigt med formindskede endokrinologiske bivirkninger.