

C 07 J

Ans.nr.: 2123/84

Indleveret: 27 apr 1984

Løbedag: 27 apr 1984 840427

Alm. tilgængelig: 30 okt 1984

Prioritet: 29 apr 1983 EP 83200618

*GIST-BROCADES N.V.; Delft, NL.

Opfinder: Albert Mattheus van *Leusen; NL,

Adriaan Marinus van *Leusen; NL.

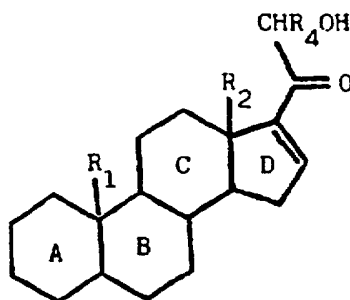
Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

Fremgangsmåde til fremstilling af 21-hydroxy-20-keto-delta¹⁶-steroider og mellemprodukter dannet ved denne fremgangsmåde

SAMMENDRAG

2123-84

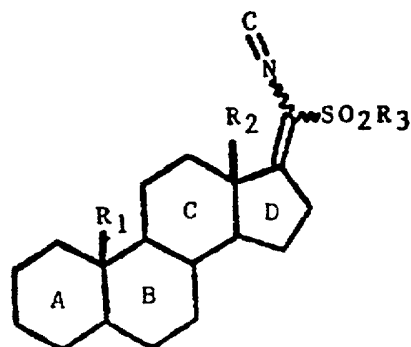
Fremstilling af 21-hydroxy-20-keto- Δ^{16} -steroider, specielt med formlen



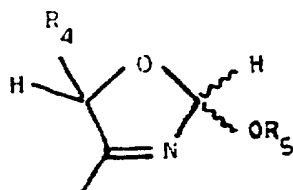
I

hvor R_1 betegner hydrogen eller C_1 - C_4 -alkyl eller ikke er til stede i tilfælde af en dobbeltbinding mellem C_{10} og C_1 , C_5 eller C_9 , R_2 betegner hydrogen eller C_1 - C_4 -alkyl, R_4 betegner hydrogen, alkyl eller phenyl, og ringene A, B, C og D eventuelt indeholder én eller flere dobbeltbindinger, eventuelt er substituerede med én eller flere hydroxygrupper, aminogruupper, oxygenatomer, halogenatomer eller alkyl-, alkyl-, alkoxy- eller alkoxyalkoxygrupper og eventuelt er disubstituerede med én

eller flere epoxy-, methylen-, alkylendioxy-, alkylendi-
thio- eller alkylendioxythiogrunder, ved omsætning af et
17-(isocyano-sulfonylmethylen)-steroid med formelen



hvor R_3 betegner alkyl eller dialkylamino, eller aryl,
der eventuelt er substitueret med ét eller flere halogen-
atomer eller alkyl-, alkoxy-, nitro- eller cyanogrunder,
med et aldehyd og en alkohol efterfulgt af hydrolyse af
det dannede, et hidtil ukendt mellemprodukt udgørende
17-(2-alkoxy-3-oxazolin-4-yl)- Δ^{16} -steroid svarende til
formlen I, dvs. med en umættet binding indført mellem
 C_{16} og C_{17} , men hvor der i 17-stillingen sidder gruppen



hvor R_5 er alkyl.

Forbindelserne I kan anvendes til fremstilling af farma-
ceutisk aktive forbindelser.