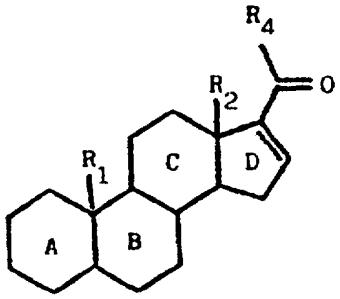
C 07 J Ans.nr.: 2122/84
Indleveret: 27 apr 1984
Løbedag: 27 apr 1984 840427
Alm. tilgængelig: 30 okt 1984
Prioritet: 29 apr 1983 EP 83200617
*GIST-BROCADES N.V.; Delft, NL.
Opfinder: Albert Mattheus van *Leusen; NL,
Adriaan Marinus van *Leusen; NL.
Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

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

SAMMENDRAG

2122-84

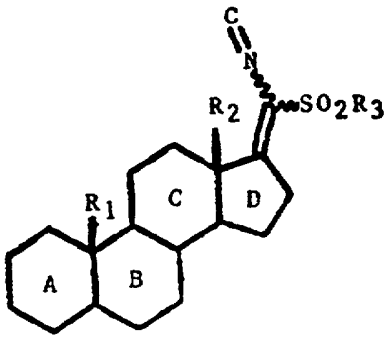
Fremstilling af 20-keto-Δ^{16}-steroider, specielt med formlen



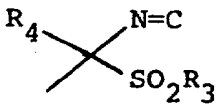
I

hvori 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 en alkylgruppe, der eventuelt indeholder én eller flere substituenter, og ringene A, B, C og D eventuelt indeholder én eller flere dobbeltbindinger, eventuelt er substituerede med én eller flere hydroxy-

grupper, aminogrupper, oxygenatomer, halogenatomer eller alkyl-, alkylen-, alkoxy- eller alkoxyalkoxygrupper og eventuelt er disubstituerede med én eller flere epoxy-, methylen-, alkylendioxy-, alkylendithio- eller alkylenoxythiogrupper, ved omsætning af et 17-(isocyano-sulfonylmethylen)-steroid med formlen



hvori R_3 betegner alkyl eller dialkylamino, eller aryl, der eventuelt er substitueret med ét eller flere halogenatomer eller alkyl-, alkoxy-, nitro- eller cyanogrupper, med et alkyleringsmiddel QR_4, hvor Q er en gruppe eller et atom, som let fortrænges af en nucleofil, efterfulgt af hydrolyse af det dannede, et hidtil ukendt mellemprodukt udgørende 20-isocyano-20-sulfonyl-Δ^{16}-steroid svarende til formlen I, dvs. med en umættet dobbeltbinding indført mellem C_{16} og C_{17}, men hvor der i 17-stillingen sidder gruppen



Forbindelserne I kan anvendes til fremstilling af farmaceutisk aktive forbindelser.