

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING (10) DK 0223/92 L

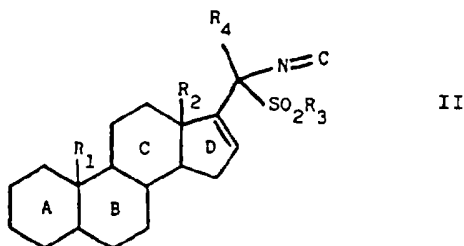
Patentdirektoratet

- 
- (21) Patentansøgning nr.: 0223/92 (51) Int. Cl. 5: C 07 J 41/00  
(22) Indleveringsdag:.... 21 feb 1992 C 07 J 13/00  
(24) Løbedag:..... 27 apr 1984  
(41) Alm. tilgængelig:.... 21 feb 1992  
(62) Stamansøgningsnummer:..... 2122/84  
(86) International ansøgning nr.:... -  
(86) International indleveringsdag:  
(85) Videreførselsdag:  
(30) Prioritet: 29 apr 1983 EP 83200617  
(71) Ansøger: \*Gist-Brocades N.V., Wateringseweg 1 P.O. Box 1; 2600 MA Delft, NL  
(72) Opfinder: Albert Mattheus Van \*Leusen, De Savornin Lohmanlaan 23; 9722 HC Groningen, NL  
Adriaan Marinus Van \*Leusen, Binnensingel 8; 9951 GD Winsum (Gr), NL  
(74) Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau, Høje Taastrup Boulevard 23, 2630, Taastrup

- 
- (54) 20-Isocyano-20-sulfonyl-delta<sup>16</sup>-steroider, fremgangsmåde til fremstilling heraf og fremgangsmåde til fremstilling af 20-keto-delta<sup>16</sup>-steroider herudfra  
(57) Sammendrag

223-92

20-Isocyano-20-sulfonyl- $\Delta^{16}$ -steroider med formelen



hvor  $R_1$  er hydrogen eller alkyl eller ikke er til stede i tilfælde af en dobbeltbinding mellem  $C_{10}$  og  $C_1$ ,  $C_5$  eller  $C_9$ ,  $R_2$  er hydrogen eller alkyl,  $R_3$  er alkyl eller dialkylamino, eller en aminogruppe, der danner en heterocyclisk ring med op til 8 ringatomer, og som eventuelt indeholder et oxygenatom, eller en arylgruppe, der eventuelt er substitueret med ét eller flere halogenatomer, alkyl-, alkoxy-, nitro- eller cyanogrunder,  $R_4$  er en alkylgruppe med 1-6 carbonatomer, som eventuelt

fortsættes

er substitueret med ét eller flere halogenatomer, med alkoxy eller phenylalkoxy eller med en cycloalkyl-gruppe med 3-8 carbonatomer eller en phenylgruppe, som eventuelt er substitueret med ét eller flere halogenatomer, alkyl-, alkoxy-, nitro- eller cyanogrupper, og ringene A, B, C og D eventuelt indeholder én eller flere dobbeltbindinger, og eventuelt er substituerede, er værdifulde mellemprodukter, som fremstilles ved omsætning af et tilsvarende 17-(isocyano-sulfonylmethylen)-steroid med et alkyleringsmiddel  $QR_4$ , hvori Q er en gruppe eller et atom, som let fortrænges af en nucleofil.

En fremgangsmåde til fremstilling af til forbindelser II svarende 20-keto- $\Delta^{16}$ -steroider, der også udgør værdifulde mellemprodukter, består i, at man hydrolyserer en forbindelse II.