C 07 C 172 Ans.nr.: 3157/82
Indleveret: 14 jul 1982
Løbedag: 14 jul 1982
Alm. tilgængelig: 18 jan 1983
Prioritet: 17 jul 1981 NL 8103393
*DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.V.; Weesp, NL.
Opfinder: Maurits *Vandewalle; BE, Luc J. *Vanmaele; BE, Pierre J. De *Clercq; NL, Sebastianus J. *Halkes; NL.
Fuldmægtig: Internationalt Patent–Bureau

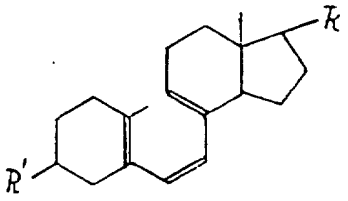
Fremgangsmåde til fremstilling af 1alfa–hydroxyvitamin–D– eller 1alfa–hydroxy–previtamin–D–forbindelser og addukter af en previtamin–D– eller tachysterolforbindelse med passende dienophiler

SAMMENDRAG

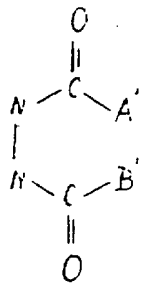
3157-82

Fremstilling af 1α-hydroxyvitamin-D- eller 1α-hydroxy-previtamin-D-forbindelser ved at man i 1α-stillingen hydroxylerer et addukt af en previtamin-D-forbindelse med et passende dienophil, i hvilket addukt eventuelt tilstedeværende hydroxygrupper om ønsket beskyttes, hvorpå man efter fjernelse af beskyttelsesgrupperne isolerer 1α-hydroxyvitamin-D- eller 1α-hydroxy-previtamin-D-forbindelsen, hvorved der opnås et højt udbytte af et rent produkt.

De anvendte addukter af previtamin-D-forbindelser og dienophiler, specielt addukter af en previtamin-D-forbindelse med formlen II med et dienophil med formlen III



II



III

hvori R er en mættet eller umættet C_1-C_{10}-alkylgruppe, som eventuelt er substitueret med hydroxy eller fluor, R' er hydrogen eller en eventuelt esterificeret eller etherificeret hydroxygruppe, og A' og B' er ens og betegner methoxy- eller ethoxygrupper (eller generelt C_1-C_4-alkoxygrupper), eller A' og B' tilsammen danner en phenylimino- eller o-phenylengruppe, er hidtil ukendte mellemprodukter.