



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

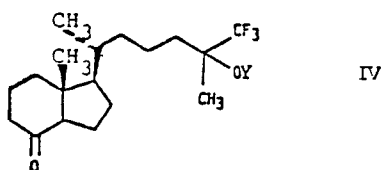
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus-Patentansökan 855017
(51) Kv.Ik.⁴/Int.Cl.⁴ C 07 C 172/00
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 17.12.85
(23) Alkupaivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 20.06.86
(86) Kv. hakemus-Int. ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 19.12.84 US 683442

- (71) Hakija/Sökande: F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft, Basel, Sveitsi
- (72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Raggiolini, Enrico 2. Pizzolato, Giacomo 3. Uskokovic, Milan 4. Truitt, Gary
- (74) Asiamies/Ombud: Kolster
- (54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä 26,26,26-trifluor-1 α -, 25 α -dihydroksikolekalsiferolin valmistamiseksi. Förfarande för framställning av 26,26,26-trifluor-1 α -, 25-dihydroksikolekalciferol.

(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee uusia 26,26,26-trifluori-1 α -, 25-dihydroksikolekalsiferolijohdannaisia, joilla on korostunut D₃-vitamiinin kaltainen vaikutus erityisesti 26,26,26-trifluori-1 α -, 25R-dihydroksikolekalsiferolia, jossa ei ole oleellista määrää 25S-epimeeriä, ja 26,26,26-trifluori-1 α -, 25S-dihydroksikolekalsiferolia, jossa ei ole oleellista määrää 25R-epimeeriä, menetelmää niiden valmistamiseksi saatamalla yhdiste, jolla on kaava IV



jossa Y on trialkyloitu Si, reagoimaan [3S-(3 α , 5 β , 2)]-2-[2-metyleni-3,5-bis[(1,1-dimetyylietyyli)dimetyylisilyylioksi]sykloheksyliideeni]-etyylidifenyylifosfiinioksidin karbanionin kanssa ja poistamalla silyyli-suojaryhmät sekä menetelmässä käytettäviä uusia väli tuotteita.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser nya 26,26,26-trifluor-1 α -, 25-dihydroksikolekalciferol-derivat med ökad vitamin-D₃-liknande aktivitet, speciellt 26,26,26-trifluor-1 α -, 25-dihydroksikolekalciferol som är väsentligen fritt från 25S-epimeren, och 26,26,26-trifluor-1 α -, 25-dihydroksikolekalciferol som är väsentligen fritt från 25R-epimeren, samt ett förfarande för framställning av desamma genom omsättning av en förening med formeln IV,

vari Y är trialkylerad Si, med karbanjonen av [3S-(3 α , 5 β , 2)]-2-[2-metylen-3,5-bis[(1,1-dimetyletyl) dimetylsilyloxi]cyklohexyliden]etylidifenyl-fosfinoxid och sedan avlägsnande av silylskyddsgrupperna, och i förfarandet användbara mellanprodukter.