

HECHO POR COPIACION  
POR DEFALTO DEL ORIGINAL

P. 714 :  
A. 77-X



15 14 15

- 2 / BR. 1941

MEMORIA DESCRIPTIVA  
para solicitar  
CERTIFICADO DE ADICION  
a la  
PATENTE DE INVENCION  
Nº 144.919, expedida el 6 diciembre de 1939,  
en  
E S P A Ñ A  
por VEINTE años  
a nombre de la N. V. ORGANON, entidad holandesa, es-  
tablecida en Oss, HOLLANDA, por  
"UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE  
DERIVADOS SATURADOS Y NO SATURADOS DEL  
PREGNAN-3.20-DION"

---

En las solicitudes españolas depatentes Nos.  
144.911 y 144.919 se describieron algunos procedimien-  
tos que se referian, entre otras cosas, a la trans-



151415

5 formación de ácidos 3-oxi-etioicolánicos saturados pasando por los cloruros ácidos, en las diazoquetonas; éstas se transformaban con ácidos, en su caso después de saponificación de un grupo protector en el grupo 3-hidroxílico, después de lo cual el grupo 3-hidroxílico se podía oxidar para formar un grupo 3-oxilítico. Esta serie entera de transformaciones se fundaba en transformar lo antes posible las combinaciones que tienen un grupo de diazo en posición 21 en combinaciones que no tienen este grupo, para evitar la descomposición prematura de la combinación de diazo.

10 En la solicitud de Patente española número 150.333 se describe además que es posible, en los diazo-21-pregnan-ol-3ones-20 saturados y no saturados realizar la oxidación del grupo 3-hidroxílico en las combinaciones de 21-diazo, sin indeseable descomposición del grupo diazo, y esto ventajosamente por tratamiento, según métodos conocidos en sí mismos, con un exceso de una combinación carbonílica en presencia de alcoholatos metálicos.

20 Se ha comprobado ahora que por tratamiento de los Diazo-21-pregnandiones saturados y no saturados así obtenidos con ácidos inorgánicos anhidros que contengan oxígeno, en un disolvente adecuado, pueden obtenerse los ésteres de estos ácidos. Cuando se trata de ácidos polibásicos, estos ésteres tienen la propiedad de formar sales solubles



151415

en agua, por lo cual son adecuados para inyecciones intravenosas. Estos ésteres, por ejemplo, los ésteres fosfóricos, no podían obtenerse hasta ahora.

E J E M P L O

5                   Diazo-21-pregnan-dion-3.20 se calienta  
ligeramente con la cantidad calculada de ácido  
fosfórico anhidro en solución de dioxan. A una  
temperatura de 45-50° la reacción ha terminado al  
cabo de unos 10 minutos. Luego se evapora en  
10                   alto vacío, se añade agua y se agita el éster fos-  
fórico con éster acético. La solución de éster  
acético se lava luego con agua y se evapora en el  
vacío. El residuo se disuelve en metanol y se le  
añade la cantidad estrictamente necesaria de metila-  
15                   no sódico. La solución da al tornasol reacción  
ligeramente alcalina. Luego se evapora en el va-  
cío, se seca el residuo y se disuelve otra en vez  
de metanol, filtrándose los componentes insolubles;  
la solución así obtenida se evapora de nuevo hasta  
20                   un pequeño volumen, después de lo cual el producto  
se precipita con acetona. La sal así obtenida se  
vuelve a lavar con acetona y éter. Se disuelve  
bien en agua y en la determinación del fósforo da  
el valor debido.

25                   Esta solicitud, que corresponde a la pre-  
sentada en Holanda, el 9 de enero de 1940, bajo el  
número 86.522, se acoge a los beneficios del artícu-  
lo 51 del vigente Estatuto de Propiedad Industrial.



151415

-o- N O T A -o-

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de este CERTIFICADO DE ADICION, son los siguientes:

5                   1º - Un procedimiento para obtener ésteres de pregnan-ol-21-diones-3.20, saturados y no saturados, con ácidos inorgánicos que contienen oxígeno, caracterizado porque las correspondientes combinaciones de diazo-21 en solución sin agua se  
10                   tratan con el ácido.

                  2º -Un procedimiento según se reivindica en el punto 1º., caracterizado porque se emplean ácidos polibásicos y los ésteres obtenidos se transforman en su caso en sus sales.

15                   3º - Un procedimiento según se reivindica en el punto 2º., caracterizado porque se emplea ácido fosfórico.

                  4º - Modificaciones introducidas en el objeto de la Patente de Invención número 144.919, expedida el 6 de diciembre de 1939, que recae  
20                   sobre "Un procedimiento para la preparación de derivados saturados y no saturados del pregnan-3.20-  
                  -dion".

                  Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han espe-  
25



151415

oificado.

Esta Memoria consta de cinco hojas escritas por una sola cara.

Madrid, - 2 ABR, 1941

P. A.

Alberto de Eizaburu

Por Poder