

AÑO 1957

Expediente núm.

236859



REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

PATENTE DE CERTIFICADO DE ADICIÓN

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de

una **PATENTE DE** CERTIFICADO DE ADICIÓN por 20 años, en España

a favor de

Lovens Kemiske Fabrik Ved. A. Høngsted, de nacionalidad

Danesa domiciliado en Copenhagen (Dinamarca)

calle de Bronshøjvej núm. 19

por:

“Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal 235.014 concedida en 30-4-57. por “Un procedimiento de producción de ácido xantogénico de 21-hidroxi pregnenos y pregnadienos y sus sales”.

Nº 2152

Agente Sr. García Cebriero

236859

CERTIFICADO DE ADICION, 2º



236859

MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

"MEJORAS INTRODUCIDAS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL Nº 235.014, concedida en 30 abril 1957 por: "UN PROCEDIMIENTO DE PRODUCCION DE ACIDO XANTOGENICO DE 21-HIDROXI-PREGNENOS Y PREGNADIENOS Y SUS SALES".

Solicitantes: LOVENS KEMISK FABRIK VED. A. KONGSTED, de nacionalidad danesa, residente en COPENHAGEN (Dinamarca), 19, Brónshøjvej.

INVENTOR: Poul BORREVANG, de nacionalidad danesa, residente en COPENHAGEN-VANLØSE, Tæbyvej, 98.

--

30 JUN



- 2 -

236859

La patente Nº 235.014 trata de métodos de la producción de ácidos 21-xantogénicos de Δ^4 -3,20 diceto-21-hidroxi-pregnenos y Δ^1 ,4-3,20 diceto 21- hidroxi-pregnadienos y sales de estos ácidos xantogénicos.

5 Las presentes mejoras introducidas se refieren a métodos para la producción de sales de dichos ácidos xantogénicos con aminas y sales de amonio cuaternario de dichos ácidos xantogénicos.

Estas sales son hasta la fecha compuestos desconocidos.

10 De acuerdo con la invención dichas sales se producen haciendo reaccionar los 21-hidroxi-pregnenos, o los 21-hidroxi-pregnadienos con la amina o la base cuaternaria de amonio que corresponden a las sales deseadas.

15 A los efectos terapéuticos ofrecen la ventaja sobre las sales de alcali-metal de los mismos ácidos xantogénicos que tienen un efecto irritante mucho menor, por ejemplo en la piel, si se utilizan en pomadas. Por ello se les puede emplear como las sustancias activas indicadas en pomadas para el tratamiento de enfermedades de la piel.

20 El invento se ilustrará por los siguientes ejemplos:

EJEMPLO 1º

Producción de la sal etanolamina del ácido xantogénico de

Δ^4 -pregneno-3,20-diona-11 β , 17 α 21-triol-21.

25 A 4,0 gramos de ácido hidrocortisona-21- xantogénico, se añade una solución de 20 ml al 3,1% de etanolamina en 99%

30 JUL 1955
236855
CENTROS

de etanol. El ácido xantogénico se disuelve de esta manera, y después de pocos minutos, se forma un precipitado. Después de un reposo de algún tiempo, el precipitado se separa por filtración, se lava enteramente con etanol de 99% y después con eter y se seca en el vacío sobre $P_2 O_5$. Así se obtienen 2.7 gramos de la sal deseada. Su espectro de ultravioleta demuestran máximos a $245 m\mu$ ($\Sigma = 17500$) y a $304 m\mu$ ($\Sigma = 14400$) en una solución acuosa recientemente preparada.

EJEMPLO 2º

35 Producción de una sal dietilamina del ácido Δ^4 -pregneno-3.20-diona-11 β , 17 α , 21-triol-21-xantogénico.

A 4.0 gramos ácido hidrocortisona-21-xantogénico, se añaden 27 ml de una solución al 2,5% de dietilamina en etanol de 99%. El ácido xantogénico se disuelve y se forma un precipitado. Después de un reposo de algún tiempo, el precipitado se separa mediante filtrado, y se lava energicamente con etanol al 99% y después con eter y se seca en el vacío encima de $P_2 O_5$. De esta forma se obtienen 3,5 gramos de la sal deseada. Su espectro de ultravioleta demuestra máximos a $246 m\mu$ ($\Sigma = 18.200$) y a $304 m\mu$ ($\Sigma = 14400$) en una solución acuosa recientemente preparada.

EJEMPLO 3º

50 Producción de la sal de tetraetilamonio del ácido de Δ^4 -pregneno-3.20-diona-11 β , 17 α , 21-triol-el-xantogénico.

5,0 gramos de yoduro de tetraetilamonio se disuelven en 80 ml de metanol, y a esta solución se añade una solución de

30 JUL



236 859

55

1 ml de agua y 3,5 gramos de Ag_2O . Después de remover durante tres horas la mezcla se pasa por un filtro y el filtrado se diluye con metanol hasta 100 ml. A 4,0 gramos del ácido hidrocortisona-21-xantogénico, se añaden 48 ml del filtrado diluido. El ácido xantogénico se disuelve y después de pocos minutos añade eter. Se forma un precipitado aceitoso y el líquido se decanta y el precipitado se disuelve en acetona. Luego se añade nuevamente eter y la substancia que se precipita se separa por filtración, se lava energicamente con eter y se seca en el vacio sobre $P_2 O_5$.

60

65

De esta manera se obtienen 2.8 gramos de la sal deseada. Su aspecto de ultravioleta demuestra máximos a $245 m\mu$ ($\Sigma = 17500$) y a $303 m\mu$ ($\Sigma = 14000$) en una solución acuosa recientemente preparada.

N O T A

70

El Certificado de Adición que se solicita por 2^o años en España y sus Colonias y deberá recaer sobre: "Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal nº 235.014 por: "UN PROCEDIMIENTO DE PRODUCCION DE ACIDO XANTOGENICO DE 21-HIDROXI-PREGNENOS Y PREGNADIENOS Y SUS SALES" concedida en 30 abril 1957". con prioridad inglesa nº 36.258 del 27 de noviembre de 1956, de acuerdo con las siguientes,

R E I V I N D I C A C I O N E S

75

1^a.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal nº 235.014 concedida en 30 de abril de 1957 por:



30 Jul 1957

236859

80

"Un procedimiento de producción de ácido xantogénico de 21-hidroxi pregnenos y pregnadienos y sus sales" consistentes en un método de la producción de sales de los ácidos 21-xantogénicos de Δ^4 -3.20-diceto-21-hidroxi-pregnenos y $\Delta^{1,2}$ -3.20 diceto-21-hidroxi-pregnadienos con aminas y sales de amonio cuaternario de dichos ácidos xantogénicos, según cuyo método el ácido 21- xantogénico en cuestión se hace reaccionar con la amina o la base de amonio cuaternario de la sal deseada.

85

2ª.ª "MEJORAS INTRODUCIDAS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL Nº 235.014 concedida en 30 abril 1957 por: "UN PROCEDIMIENTO DE PRODUCCION DE ACIDO XANTOGENICO DE 21-HIDROXI-PREGNENOS Y PREGNADIENOS Y SUS SALES".

90

Según queda substancialmente descrito en la presente memoria que consta de cinco hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 30 de Julio de 1.957

LOVENS KEMISKE FABRIK VED. A. KONGSTED,

P.P.

FRANCISCO GARCIA CABRERIZO

P.P.

M. S. Forquera