



27 FEB. 1968

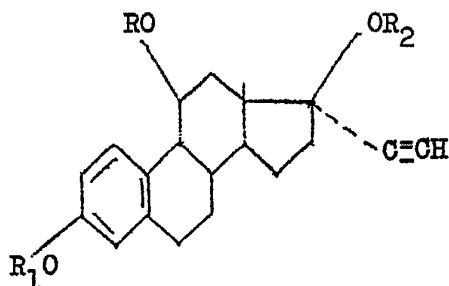
MEMORIA DESCRIPTIVA  
para solicitar  
P A T E N T E D E I N V E N C I O N  
e n  
E S P A Ñ A  
por VEINTE años

a nombre de ROUSSEL-UCLAF, sociedad anónima francesa, establecida en 35 Boulevard des Invalides, París, Francia, por:

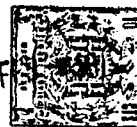
"PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE NUEVOS ESTRA-1,3,5(10)-TRIENOS OXIGENADOS EN LAS POSICIONES 3 y 17" (Clase Internacional C07c A61k)

El presente invento se refiere a un procedimiento de preparación de nuevos estra-1,3,5(10)-trienos oxigenados en las posiciones 3 y 17.

Más particularmente, el invento tiene como objeto un procedimiento de preparación de los estra-1,3,5(10)-trienos de fórmula general I



(I)



en la que R representa el radical metilo o el radical etilo,  $R_1$  y  $R_2$ , iguales o diferentes, representan hidrógeno, un radical alcohilo o el radical acilo de un ácido alifático.

5 Los nuevos estra-1,3,5(10)-trienos, obtenidos por el procedimiento del invento, están dotados de interesantes propiedades farmacológicas. Poseen especialmente una importante acción estrógena, que generalmente es bastante más intensa que la de los estrógenos conocidos, tales como, por ejemplo, el etinil-estradiol.

10 El procedimiento de preparación de los nuevos estra-1,3,5(10)-trienos de fórmula general I, objeto del invento, está caracterizado porque se hace actuar un acetiluro de metal alcalino, en el seno de un disolvente orgánico, sobre un 3-hidroxi 11beta-R-oxi 17-oxo estra-1,3,5(10)-trieno, se aísla el 3,17beta-dihidroxi 11beta-R-oxi 17alfa-etinil estra-1,3,5(10)-trieno buscado, que se esterifica o eterifica, llegado el caso, en las posiciones 3 y/o 17.

20 El ejemplo siguiente ilustra el invento, pero sin limitarlo.

Ejemplo: Preparación del 3,17beta-dihidroxi 11beta-metoxi 17alfa-etinil estra-1,3,5(10)-trieno.

25 Se calientan hasta 80°C, bajo agitación y bajo nitrógeno, 12 g de potasio en 180 cm<sup>3</sup> de alcohol ter-amílico, se agita durante 30 minutos, se enfría hasta 20°C, se añaden 60 cm<sup>3</sup> de dioxano y se hace pasar una corriente de acetileno durante 1 hora y 15 minutos; se añade una solución de 3 g de 3-hidroxi 11beta-metoxi 17-oxo estra-1,3,5(10)-trieno en 50 cm<sup>3</sup> de dioxano y se agita du





27



-trieno, se aísla el 3,17beta-dihidroxi 11beta-R-oxi 17al  
fa-etinil-estra-1,3,5(10)-trieno buscado, que se eterifi-  
ca o esterifica, llegado el caso, en las posiciones 3 y/o  
17.

5                    2.- Procedimiento de preparación de nuevos es  
tra-1,3,5(10)-trienos oxigenados en las posiciones 3 y 17.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que an  
tecede y para los fines que se han especificado.

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

27 FEB. 1968

Madrid,

P. A.

Albano de la Haza  
SECRETARIA

G.D.S.  
15.2.68.