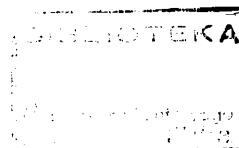


Warszawa, 15 października 1938 r.

URZĄD PATENTOWY



Co7c 169/02



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 27090.

Kl. 12 o, 25.

Gesellschaft für Chemische Industrie in Basel
(Bazyleja, Szwajcaria).

**Sposób wytwarzania estrów estradiolu zawierających
mieszane podstawniki alifatyczno-aromatyczne.**

Patent dodatkowy do patentu nr 26770.

Zgłoszono 13 marca 1937 r.

Udzielono 17 sierpnia 1938 r.

Pierwszeństwo: 16 grudnia 1936 r. (Szwajcaria).

Najdłuższy czas trwania patentu do 2 czerwca 1953 r.

Wykryto, że można otrzymywać nowe estry estradiolu, zawierające mieszane podstawniki alifatyczno - aromatyczne o trwalszym działaniu, jeśli na estradiol, w którym jedna grupa hydroksylowa jest podstawiona kwasową resztą alifatyczną o więcej niż 2 atomach węgla w cząsteczce względnie kwasową resztą aromatyczną, działa się aromatycznym względnie alifatycznym środkiem acylującym o więcej, niż dwóch atomach węgla w cząsteczce.

Nowe te związki winny znaleźć zastosowanie w lecznictwie.

Przykład I. 1,5 części wagowych 3 -

- jednobenzoesanu estradiolu ogrzewa się przez pewien czas z 10 częściami wagowymi pirydyny i 5 częściami wagowymi bezwodnika kwasu propionowego na kąpeli olejowej do temperatury 100 — 105°C. Po ochłodzeniu dodaje się powoli 300 części wagowych wody doprowadzając przez to do krystalizacji 3 - benzoesano - 17 - propionian estradiolu już w postaci bardzo czystej. Odsączony osad krystaliczny prze-mywa się kolejno 1 n. roztworem sody, wodą i 1 n. kwasem solnym oraz ponownie wodą. Dalsze oczyszczanie tego związku uskutecznia się przez krystalizację z mie-

szaniny acetonu i alkoholu. Otrzymany 3 - benzoesano - 17 - propionian estradiolu topnieje w temperaturze 167 — 168°C.

W zupełnie podobny sposób można również otrzymać 3 - benzoesano - 17 - - maślan estradiolu o punkcie topnienia 128 — 129°C lub też odnośne estry mieszanane, podstawione w położeniu 17 resztą kwasu kaprynowego, stearowego lub palmitynowego.

Przykład II. 2,0 części wagowe 3 - - jednopropionianu estradiolu o punkcie topnienia 125 — 126°C rozpuszcza się w 15 częściach wagowych pirydyny i mieszając dodaje 1,3 części wagowych chlorku benzoylowego. Po 12-ogodzinnym staniu masy reakcyjnej w temperaturze pokojowej dodaje się do niej 300 części wagowych wody i wydzielony olej rozpuszcza w eterze. Oddzielony roztwór eterowy przemawia się wodą, 1 n. roztworem sody, wodą, 1 n. kwasem siarkowym, jeszcze raz wodą i suszy nad siarczanem sodu. Po usunięciu rozpuszczalnika pozostaje 3 - propioniano - 17 - benzoesan estradiolu jako substancja krystaliczna, którą można przekrystalizować z mieszaniny acetonu, alkoholu i wody. Punkt topnienia 165 — 166°C.

Taki sam związek otrzymuje się również przez traktowanie 17 - jednobenzoesanu estradiolu środkiem propionylującym. Zupełnie podobnie można otrzymać, wychodząc np. z 3 - maślanu względnie 17 - - benzoesanu estradiolu, 3 - maślan - 17 - - benzoesan estradiolu o punkcie topnienia 141,5 — 142°C.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób wytwarzania estrów estradiolu zawierających mieszane podstawniki alifatyczno - aromatyczne według patentu nr 26 770, znamienny tym, że na estradiol, w którym jedna grupa hydroksylowa jest podstawiona alifatyczną resztą kwasową o więcej niż dwóch atomach węgla w cząsteczce względnie resztą aromatyczną, działa się aromatycznym względnie alifatycznym środkiem acylującym o więcej niż dwóch atomach węgla w cząsteczce.

Gesellschaft
für Chemische Industrie
in Basel.

Zastępca: M. Skrzypkowski,
rzecznik patentowy.