Союз Советских Социалистических Республик

Государственный комитет СССР по делам изобретений и открытий

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

К ПАТЕНТУ

(11) 843757

(61) Дополнительный к патенту —

(22) Заявлено 06.04.79 (21) 2745050/23-04

(51) М. Кл.[3] С 07 J 1/00// А 61 К 31/56

(23) Приоритет — (32) 21.04.78

(31) P 2818164.8 (33) ФРГ

Опубликовано 30.06.81. Бюллетень № 24

Дата опубликования описания 30.06.81

(53) УДК 547.689.6.07(088.8)

(72) Авторы изобретения: Иностранцы Клаус Прецевовски, Херманн Штайнбек и Рудольф Вихерт (ФРГ)

(71) Заявитель: Иностранная фирма "Шеринг•АГ" (ФРГ)

ВСЕСОЮЗНАЯ ПАТЕНТНО-ТЕХНИЧЕСКАЯ БИБЛИОТЕКА

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ 1,3-ДИ-БЕНЗОИЛОКСИ-17α-ЭТИНИЛ-7α--МЕТИЛ-1,3,5(10)-ЭСТРАТРИЕН-1,3,17β--ТРИОЛА

1

Изобретение относится к получению нового стероидного соединения 1,3--ди-бензоилокси-17α-этинил-7α-метил--1,3,5(10)-эстратриен-1,3,17β-триола, обладающего ценными фармакологическими свойствами.

Известен 1,3-диацетокси-17α-этинил-7α-метил-1,3,5(10)-эстратриен--17β-ол, обладающий сильным эстрогенным действием [1].

Использование известной реакции этерификации спиртов в присутствии оснований позволяет получать новое стероидное соединение 1,3-ди-бензоилокси-17α-этинил-7α-метил-1,3-5(10)--эстратриен-1,3,17β-триола, обладающего высокой эстрогенной активностью [2].

Цель изобретения - расширение ассортимента стероидов с эстрогенной активностью.

Указанная цель достигается тем, что 17α-этинил-7α-метил-1,3,5(10)-эстратриен-1,3,17β-триол этерифицируют с помощью бензоилхлорида с последующим выделением целевого продукта известными методами.

2

Пример 1. К раствору 2,4 г 17α-этинил-7α-метил-1,3,5(10)-эстратриен-1,3,17β-триола в 28 мл пиридина при охлаждении льдом прибавляют по каплям в токе инертного газа 5 мл бензоилхлорида и перемешивают смесь в течение 40 мин при 0°С. После этого смесь помещают в баню со льдом с солью, декантируют от маслообразного сырого продукта, который растворяют в эфире. Эфирный раствор промывают водой, высушивают и подвергают обычной обработке. Сырой продукт подвергают хроматографической очистке и перекристаллизовывают из циклогексана. Получают 2,7 г 17α-этинил-1,3--ди-бензоилокси-7α-метил-1,3,5(10)--эстратриен-17β-ола с т.пл. 109-110°С (плавится с разложением).

Формула изобретения

Способ получения 1,3-ди-бензоилокси-17α-этинил-7α-метил-1,3,5(10)--эстратриен-1,3,17β-триола, отличающийся тем, что 17α-этинил--7α-метил-1,3,5(10)-эстратриен-1,3,17β-триол этерифицируют с помощью

бензоилхлорида с последующим выделением целевого продукта.

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе

1. Патент ФРГ № 1593509, кл. С 07 J 1/00, опублик. 1976.
2. Вейганд-Хильгетаг. Методы эксперимента в органической химии. М., "Химия", 1968, с.349.

Составитель И.Федосеева
Редактор М.Лысогорова Техред А.Савка Корректор Г.Назарова

Заказ 5203/90 Тираж 397 Подписное
ВНИИПИ Государственного комитета СССР
по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д.4/5

Филиал ППП "Патент", г.Ужгород, ул.Проектная,4