



AUSGEGEBEN AM
21. APRIL 1955

DEUTSCHES PATENTAMT

PATENTSCHRIFT

Nr. 926 552

KLASSE 120 GRUPPE 2505

S 28715 IVc / 120

Dr. Carl Djerassi, Dr. George Rosenkranz und Luis L. Miramontes,
Mexiko
sind als Erfinder genannt worden

Syntex S. A., Mexiko

Verfahren zur Herstellung von 19-Norprogesteron (Δ^4 -19-Norpregnen-3, 20-dion)

Patentiert im Gebiet der Bundesrepublik Deutschland vom 28. Mai 1952 an

Patentanmeldung bekanntgemacht am 23. September 1954

Patenterteilung bekanntgemacht am 24. März 1955

Die Priorität der Anmeldung in den V. St. v. Amerika vom 5. Oktober 1951 und in Mexiko
vom 30. Mai 1951 ist in Anspruch genommen

Gegenstand der Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Δ^4 -19-Norpregnen-3, 20-dion (19-Norprogesteron), das die Methylgruppe in der 10-Stellung des Progesterons nicht enthält.

5 Ein 19-Norprogesteron wurde von Ehrenstein synthetisch dargestellt und im Journ. Org. Chemistry, Bd. 9, 1944, S. 435, als ein Harz mit einem Drehungswinkel $[\alpha]_D^{20} = +89^\circ$ beschrieben, das als ein Gemisch von Isomeren, in denen die 14-Iso-17-iso-Gruppierung vorherrscht (Ehrenstein, Chem. Rev., Bd. 42, 1948, S. 475; J. Org. Chem., Bd. 16, 1951, S. 355; Plattner, Helv. Chim. Acta, Bd. 31, 1948, S. 249), angesehen wurde.

Nach dem Verfahren gemäß vorliegender Erfindung erhält man ein 19-Norprogesteron, das sich von der 15 von Ehrenstein beschriebenen Verbindung deutlich unterscheidet. Außer einem anderen Schmelzpunkt und einem gänzlich verschiedenen Drehungswinkel ($[\alpha]_D^{20} = +147^\circ$) hat die neue Verbindung die gleiche Struktur in 14- und 17-Stellung wie das Progesteron 20 selbst. Wahrscheinlich liegt am Kohlenstoffatom 10 eine β -Konfiguration vor, weil diese die stabilste Gruppierung ist, die in dem Verfahren gemäß der vorliegenden Erfindung entsteht.

Das neue 19-Norprogesteron besitzt eine spezifische 25 Wirksamkeit, die 3- bis 5mal stärker als die des Pro-