(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 670 477**

(21) Número de solicitud: 201890028

(51) Int. Cl.:

C07J 75/00 (2006.01)
C07D 311/78 (2006.01)
C07C 45/29 (2006.01)
C07C 49/643 (2006.01)
C07C 49/733 (2006.01)

(12) INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA R1

(22) Fecha de presentación:

28.10.2016

(30) Prioridad:

30.10.2015 IT 102015000067307

(43) Fecha de publicación de la solicitud:

30.05.2018

(88) Fecha de publicación diferida del informe sobre el estado de la técnica:
05.06.2018

(71) Solicitantes:

INDUSTRIALE CHIMICA S.R.L. (100.0%)
Via Abbondio Sangiorgio, 12
20145 Milán IT

(72) Inventor/es:

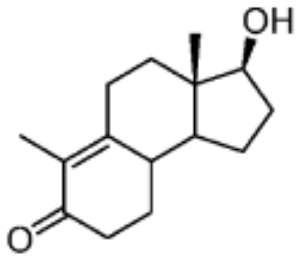
LENNA , Roberto y
DI BRISCO, Roberto

(74) Agente/Representante:

RUO , Alessandro

(54) Título: **Procedimiento para la preparación de la 17β-hidroxi-des-A-androst-9,10-en-5-ona**

(57) Resumen:
Procedimiento para la preparación de la 17β-hidroxi-des-A-androst-9,10-en-5-ona.
La presente invención se refiere a un nuevo procedimiento para la síntesis de la 17β-hidroxi-des-A-androst-9,10-en-5-ona, el compuesto con la siguiente fórmula (1):



(1)

que se puede usar como intermedio en la síntesis de las retroprogesteronas.

ES 2 670 477 R1

OFICINA ESPAÑOLA
DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(21) N.º solicitud: 201890028

(22) Fecha de presentación de la solicitud: 28.10.2016

(32) Fecha de prioridad: **30-10-2015**

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TECNICA

(51) **Int. Cl. :** Ver Hoja Adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	(56) **Documentos citados**	**Reivindicaciones afectadas**
A	G Saucy et al. STEROID TOTAL SYNTHESIS, PART II. (-)-17BETA-HIDROXY-DES-A-ANDROST-9-EN-5-ONE. Helvetica Chimica Acta, 1971, Vol. 54, Nº 7, Páginas 2121-2132 Página 2132, página 2125 compuestos 24-28	1-10
A	WO 2006/013196 A1 (AKZO NOBEL) 09/02/2006, ejemplos	1-10

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia
Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría
A: refleja el estado de la técnica
O: referido a divulgación no escrita
P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud
E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones ☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe	**Examinador**	**Página**
25.05.2018	M. Fernández Fernández	1/4

CLASIFICACIÓN OBJETO DE LA SOLICITUD

C07J75/00 (2006.01)
C07D311/78 (2006.01)
C07C45/29 (2006.01)
C07C49/643 (2006.01)
C07C49/733 (2006.01)

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

C07J, C07D, C07C

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

INVENES, EPODOC, WPI, ESPACENET, CAS, NPL

Fecha de Realización de la Opinión Escrita: 25.05.2018

Declaración

Novedad (Art. 6.1 LP 11/1986)	Reivindicaciones	1-10	**SI**
	Reivindicaciones		**NO**
Actividad inventiva (Art. 8.1 LP11/1986)	Reivindicaciones	1-10	**SI**
	Reivindicaciones		**NO**

Se considera que la solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial. Este requisito fue evaluado durante la fase de examen formal y técnico de la solicitud (Artículo 31.2 Ley 11/1986).

Base de la Opinión.-

La presente opinión se ha realizado sobre la base de la solicitud de patente tal y como se publica.

1. Documentos considerados.-

A continuación se relacionan los documentos pertenecientes al estado de la técnica tomados en consideración para la realización de esta opinión.

Documento	Número Publicación o Identificación	Fecha Publicación
D01	G Saucy et al. STEROID TOTAL SYNTHESIS, PART II. (-)-17BETA-HIDROXY-DES-A-ANDROST-9-EN-5-ONE. Helvetica Chimica Acta, Vol. 54, Nº 7, Páginas 2121-2132	1971
D02	WO 2006/013196 A1 (AKZO NOBEL)	09.02.2006

2. Declaración motivada según los artículos 29.6 y 29.7 del Reglamento de ejecución de la Ley 11/1986, de 20 de marzo, de Patentes sobre la novedad y la actividad inventiva; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

La solicitud se refiere, reivindicaciones 1-10, a un procedimiento para la preparación de la 17beta-hidroxi-des-A-androst-9,10-en-5-ona (fórmula 1 de la reivindicación 1) caracterizado por comprender las etapas:

reacción del compuesto de fórmula (II) con haluro de etilmagnesio para dar la mezcla de isómeros de fórmula (III) de la reivindicación 10
oxidación del compuesto (III) con ácido tricloroisocianúrico para dar el intermedio (IV)
ciclación del intermedio (IV) para dar la des-A-androst-9,10-en-5,17-diona (fórmula V)
reducción de (V) con un hidruro metálico para obtener la 17beta-hidroxi-des-A-androst-9,10-en-5-ona de fórmula (1).

El documento D1 divulga un procedimiento para la obtención del compuesto (1) de la solicitud a partir del intermedio (IV), pasos c) y d) en la solicitud. Sin embargo el procedimiento para obtener el compuesto (IV) que es el compuesto (24) en D1 difiere del descrito en la solicitud pues en D1 no interviene el intermedio (III), lo que implica que el procedimiento de la solicitud es nuevo.

El documento D2 divulga, ver página 4 apartado i) y ejemplos 1 y 2, un procedimiento similar a las dos primeras etapas del de la solicitud: a la sitolactona, fórmula (II) de la solicitud, se añade un reactivo de Grignard de fórmula compleja (ver ejemplo 1 de D2) siendo el utilizado en la solicitud (Et-Mg-Hal) más sencillo y accesible. Este resultado no es obvio para un técnico en la materia pues no es previsible que el reactivo de Grignard utilizado en la solicitud conduzca al mismo resultado que en D2 considerando la diferencia estructural entre ambos. Además, puesto que el procedimiento es inventivo también lo son los intermedios de fórmula (III) de la reivindicación 10.

En consecuencia se concluye que las reivindicaciones 1-10 de la solicitud son nuevas e inventivas de acuerdo con los Art 6.1 y 8.1 de la Ley de Patentes 11/1986.