



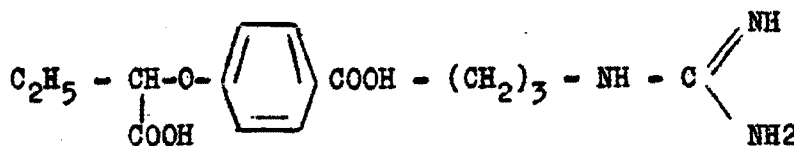
300804

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a una solicitud de patente de invención por veinte años, para España y sus Posesiones, por PROCEDIMIENTO PARA OBTENCION DE UN COMPUESTO DE ACCION COLODE-TICA a favor de la Sociedad Anónima LABORATOIRE D'ANALY-SES ET DE RECHERCHES BIOLOGIQUES MAUVERNAY, CENTRE EURO-PEEN DE RECHERCHES MAUVERNAY (C.E.R.M.) de nacionalidad francesa, residente en RIOM (Puy-de-Dôme) Francia.

La presente invención se refiere a un procedimiento para obtención de un nuevo compuesto de acción colodética, extendiéndose al mismo y a su aplicación en la terapéutica humana y en la veterinaria, empleándose a título de colo-dético.

Este compuesto es el alfa-fenoxi-butirato de argini-na, de la fórmula



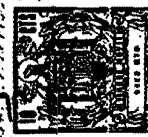
Este compuesto se presenta bajo la forma de cristales

5

10

300804

190' NA



brillantes, incoloros, o de un polvo microcristalino incoloro, de punto de fusión a los 95°C, muy soluble en el agua, en los alcoholes y en los glicoles. Es higroscópico al aire.

15 Se prepara según el siguiente proceso:

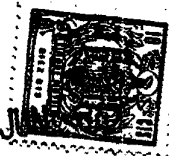
Se disuelven separadamente 270 g de ácido alfa-fenoxibutírico en 400 ml de etanol al 95% y 261 g de arginina base en 300 ml de agua destilada; el PH de esta solución se halla alrededor de 9. Bajo agitación mecánica se vierte en un delgado hilo la solución básica de arginina en la solución ácida de ácido alfa-fenoxibutírico, o a la inversa. Se expulsa el exceso de solvente hidroalcohólico al baño maría sobre vacío o con un evaporador rotativo. Al final se recoge un líquido con apariencia de un jarabe, que se lleva a la desecación completa en un desecador a vacío, con ácido sulfúrico o anhídrido fosfórico como agente desecador.

25 Este producto presenta una muy débil toxicidad, pues no se observa ninguna mortalidad a una dosis de 2000 mg/kg por hueso, en los ratones sometidos a ensayo. Su interés reside en su acción colerética superior a la de los mejores coleréticos conocidos hasta la fecha, tales como el feniletíl-acetamida, como lo demuestran los ensayos y resultados de los mismos, que se exponen más adelante.

35 La acción colerética ha sido buscada en las ratas, anestesiadas por administración, por vía duodenal, de dosis de 200 mg/kg de cada producto a experimentar, medida del débito biliar y de evaluación del porcentaje de crecimiento de este débito con relación al débito de la base registrado durante una hora antes del tratamiento.

40 Los resultados son reunidos en la Tabla siguiente:

300804



CUADRO I

45

Producto ensayado	Porcentaje de aumento del déficit biliar			
	+ 1 h	+ 2 h	+ 3 h	Total
Alfa-fenoxi-butirato de arginina	61	74	47	182
Fenil-etil-acetamida	4	16	42	62

50

Una comparación análoga entre una dosis de 200 mg/kg de fenoxi-butirato de sodio y una dosis de 400 mg/kg de fenoxi-butirato de arginina (equivalente este último, ya que contiene el 50% de ácido fenoxi-butírico) dió los resultados siguientes:

55

CUADRO II

60

Producto ensayado	Porcentaje de aumento del déficit biliar			
	+ 1 h	+ 2 h	+ 3 h	total
Alfa-fenoxi-butirato de sodio	84	88	88	260
Alfa-fenoxi-butirato de arginina	110	100	76	286

65

En la terapéutica humana, la posología de este nuevo compuesto es de 0,50 a 1 g. administrándose en solución inyectable y en comprimidos.

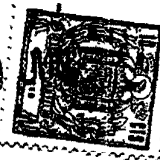
70

Finalmente, tras lo descrito sólo resta señalar que en el procedimiento precedente caben cuantas variantes de realización sean factibles sin que se altere su esencia.

- - - - -

NOTA - Descrito suficientemente lo que antecede sólo resta señalar que lo que se declara propio y nuevo del solicitante-

300804



75

te es lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES :

1 - Procedimiento para obtención de un compuesto de acción colodética caracterizado por tener como producto básico la alfa-fenoxi-butirato de arginina.

80

2 - Procedimiento, según reivindicación 1^a caracterizado porque el compuesto mencionado tiene una posología de 0,50 a 1 g en solución inyectable o en comprimidos.

85

3 - Procedimiento, según reivindicaciones 1 y 2 caracterizado porque se hace reaccionar el ácido alfa-fenoxi-butírico con la arginina en una solución hidro-alcóholica.

4 - PROCEDIMIENTO PARA OBTENCION DE UN COMPUESTO DE ACCION COLODETICA.

90

Todo según va descrito en esta memoria que consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por una sólo cara, con noventa y una líneas.

Madrid 9 Junio 1964

p.a.