

338642

C 07 D 45/10 // C 07 D 43/16 // C 07 C 87/00

29. N.º



MEMORIA DESCRIPTIVA

=====

Correspondiente a la solicitud de registro de Patente de In-
vención, que por veinte años, se solicita para España y sus
Colonias, a favor de Don Roland-Yves MAUVERNEY, de nacionali-
dad francesa, residente en Route de Marsat, 63 RIOM (Francia)
con prioridad de la Patente francesa núm. PV. 58.013, de fe-
cha 18 de Abril de 1.966, -----

p o r

"PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN NUEVO DERIVADO DE -
LA ESCOPOLAMINA".

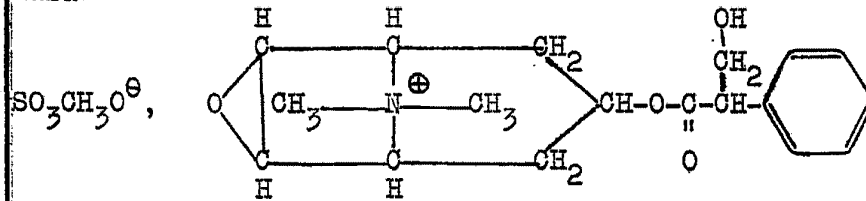
=====

La presente invención se refiere a un procedimiento para
la preparación de un nuevo compuesto químico que presenta in-
terés especialmente en razón de sus propiedades terapéuticas
que son superiores a las de los derivados de la escopolamina
más próximos.



338642

Este compuesto es el metilsulfato de escopolamina, de fórmula:



10 Dicho compuesto se presenta bajo la forma de un polvo ---
 cristalino blanco muy soluble en el agua y en el alcohol, po
 co soluble en la acetona y el acetato de etilo, insoluble en
 el éter, P.F.= 172º C, que no parece que haya sido descrito
 en la literatura.

15 Según la invención, éste compuesto se prepara por reacción
 de la escopolamina con el sulfato de dimetilo, en frio y en
 medio acetónico.

La realización de ésta reacción no da lugar a dificulta--
 desparticulares, según se pone de relieve en el modo operato
 20 rio que se detalla a continuación:

Se disuelven 30'3 grs. de escopolamina base en 150 ml. de
 acetona. Se añaden 15'12 grs. de sulfato de dimetilo. El di-
 metilo sulfato de escopolamina precipita en frio.

25 Lo más interesante de éste compuesto es que posee una ac-
 tividad vagolítica, sensiblemente más marcada y más durable
 que el compuesto más próximo actualmente en el mercado, a sa
 ber el bromhidrato de escopolamina, de acuerdo con el siguier
 te cuadro:

EFEECTO VAGOLITICO COMPARADO (sobre el perro: i.v.)

30 Dosis	<u>Metilsulfato</u>		<u>Bromhidrato</u>	
	<u>g/kg</u>	<u>Inhibición (%) retorno(mn)</u>	<u>Inhibición (%) retorno</u>	<u>(mn)</u>
5	Total	30	Total	80
	"	"	Nula	-
	"	"	Nula	-
	"	"	Total	90
				(sin retorno)



	10	Total	150	(Nula	(-
				(30	(35
35	25	Total	200	-	-
		(sobre la rata: i.v.)			
	1	Total	40	Parcial	15
		"	>30	Total	15
		"	20	Parcial	15
		"	25	Parcial	15
	2'5	Total	sin retorno	Parcial	15
		"	"	Parcial	25

40 Esta acción vagolítica es utilizable en terapéutica humana. Se administra entonces el producto en ampollas inyectables dosificadas a 1 o 2 mg. de principio activo y administradas a razón de 1 o 2 por día, o bien en comprimidos o cápsulas dosificadas a 1 y 5 mg. de principio activo asociado a los excipientes habituales y administradas a razón de 1 a 3 por día.

Las indicaciones terapéuticas de éste compuesto son principalmente:

- 50 espasmos del esófago y del cardias.
- gastritis.
- úlceras gastro-duodenales.

Podrá ser variable todo aquello que no suponga una alteración de la esencialidad del objeto expuesto en la pasada descripción, la cual deberá ser tomada en su más amplio sentido y no como una limitación de posibilidades de realización.

N O T A

60 EN RESUMEN: La Patente de Invención que, por veinte años, se solicita para España y sus Colonias, con prioridad de la Patente francesa núm. PV. 58.013, de fecha 18 de Abril de 1.966, ha de recaer sobre las siguientes reivindicaciones:

1a.- "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN NUEVO DERIVADO DE LA ESCOPOLAMINA", como es el metilsulfato de escopolamina, caracterizado porque se hace reaccionar la escopolamina sobre el sulfato de dimetilo en frío y en medio acetóni

338642,29.1



65 co, con lo que el dimetilo sulfato de escopolamina precipita
llegándose a la obtención del compuesto que se presenta bajo
la forma de un polvo cristalino blanco muy soluble en agua y
en alcohol, poco soluble en acetona y en acetato de etilo, -
insoluble en el éter y con un P.F. = 172°C.

70 2a.- Por último se reivindica como objeto sobre el que ha
de recaer la Patente de Invención que, por veinte años, se -
solicita para España y sus Colonias, -----

p o r

75 "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN NUEVO DERIVADO DE -
LA ESCOPOLAMINA".

Todo conforme queda expresado en la presente Memoria des-
criptiva que consta de cuatro páginas escritas a máquina por
una sola cara.

Madrid, 29 de Marzo de 1.967.-

P. A.
ANTONIO ARICHA
R. F.

Firmado por **JUAN GUERRERO**