

378960

378960



SECCION TECNICA

CLASIFICACION

A 61

K

MEMORIA DESCRIPTIVA

Correspondiente a una PATENTE DE INVENCION por veinte años.

A favor de

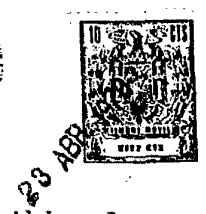
ISTITUTO GENTILI, S.p.A., de nacionalidad italiana.

Residente en PISA(Italia).-Via Mazzini, 112

p o r :

"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN PRODUCTO FARMACEUTICO
DERIVADO DE LA PRENILAMINA".

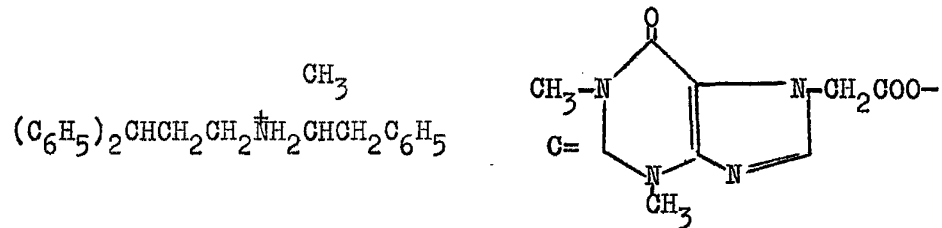
37-080



La presente memoria tiene por objeto describir el procedimiento de fabricación de un compuesto farmacéutico destinado a las enfermedades cardíacas consistente en un derivado de la prenilamina que por sus indudables características nuevas en la industria farmacéutica justifican ampliamente la concesión del privilegio que se solicita.

5.- El presente invento se refiere a un compuesto farmacéutico que presenta una intensa actividad coronario-dilatante que se obtienen mediante un procedimiento nuevo.

10.- El producto obtenido se trata de un nuevo derivado de la prenilamina: N-(3'-fenil-2'-propil)-1,1-difenil-β-propilamina y precisamente de su sal con el ácido teofilin-7-acético cuya fórmula es:



15.- Este derivado se puede obtener haciendo reaccionar una cantidad equimolecular de prenilamina y de ácido teofilin-7-acético en un solvente adecuado escogido de forma que sus dos componentes sean solubles en caliente y que a su vez la sal que se forme se separe por enfriamiento.

20.- Se puede obtener también partiendo en lugar de la prenilamina, base libre, de una de sus sales, por ejemplo, el lactato haciéndola reaccionar con el ácido teofilin-7-acético en un solvente adecuado que permita también en este caso la separación por enfriamiento del teofilin-7-acétato de prenilamina.

25.- Con el fin de facilitar la mejor interpretación de este invento a continuación se describen dos ejemplos correspondien-



tes al procedimiento para la obtención del producto antes mencionado que se incluyen únicamente a título informativo y no limitativo del invento.

EJEMPLO 1º.- Se emplea una retorta con cuello esmerilado
30.- dotada de un refrigerante a su salida y de un agitador, cuya retorta se sitúa al baño maría y se introduce 330 gramos (un mol) de prenilamina base y 240 gramos (un mol) de ácido teofilin-7-acético; se mezclan bien y se añaden cuatro litros de alcohol metílico. Se hace hervir hasta su reducción añadiendo poco a poco la cantidad de alcohol metílico necesaria para completar la solución (cerca de 500 ml). Se filtra en caliente y se deja enfriar.
35.-

Se forma un producto blanco y cristalino que se separa de la solución mediante filtración o por centrifugación, lavándolo con un poco de alcohol metílico frío.
40.-

El producto se funde a 192-194 grados; el análisis elemental corresponde a la fórmula $C_{33}H_{37}N_5O_4$, el espectro de absorción del U.V. en solución metanólica presenta un máximo entorno de 274 m μ y un mínimo entorno de 246 m μ .

EJEMPLO 2º.- En una retorta con cuello esmerilado refrigerante en la salida y agitador, situada al baño maría, se introducen 240 gramos (un mol) de lactato de prenilamina y 240 gramos (un mol) de ácido teofilin-7-acético, se mezcla bien y se añaden 10 litros de alcohol metílico. Se hace hervir hasta su reducción añadiendo además, poco a poco la cantidad de alcohol metílico necesaria para completar la solución.
45.-
50.-

La operación se prosigue como en el ejemplo 1º obteniendo el mismo compuesto.

RESULTADO FARMACO-CLINICO.- El teofilin-7-acetato de prenilamina añade a la acción coronario-dilatadora de la prenila-
55.-



mina el efecto cardiotónico y cardiosedativo del ácido teofilin-7-acético.

60.- Entre los efectos del lactato y del teofilin-acetato de prenilamina en el flujo coronario del corazón, fuera de su cavidad, no se encuentran diferencias significativas. El mismo caso se observa en la investigación farmacológica, concerniente a la distribución en los tejidos consiguiente a la administración de las dos sales.

65.- Del estudio comparativo realizado en 24 pacientes, teniendo en cuenta la anotación de la sistomatología estenocardiaca, el efecto terapéutico del teofilinacetato resulta superior al del lactato de prenilamina.

70.- El producto se suministra en forma de comprimidos, grageas o cápsulas, conteniendo 40 ó 100 mg. Asimismo dichas dosis pueden ser administradas conjuntamente con otros medicamentos.

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como dos ejemplos para la puesta en práctica del mismo, solamente cabe añadir que en dichos ejemplos es posible introducir variaciones.

75.-

R E I V I N D I C A C I O N E S

80.- 1ª).- "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN PRODUCTO FARMACEUTICO DERIVADO DE LA PRENILAMINA" que se caracteriza porque en un recipiente sometido a baño maría, dotado de un agitador y un refrigerador de salida, se introduce un mol de prenilamina y seguidamente se introduce un mol de ácido teofilin-7-acético mas una cantidad adecuada de alcohol metílico, procediendo a su mezcla íntima mediante el agitador; se hace hervir añadiendo poco a poco el alcohol metílico necesario para completar la solución; seguidamente se procede a la separación, por filtrado



85.- o centrifugación, del producto de la reacción de ambos componentes, consistente un derivado de la prenilamina: N-(3'-fenil-2'-propil)-1,1-difenil-3-propilamina.

2ª).-"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN PRODUCTO FARMACEUTICO DERIVADO DE LA PRENILAMINA" según la 1ª reivindicación
90.- que se caracteriza porque el mismo producto se obtiene empleando en lugar de un mol de prenilamina, un mol de lactato de prenilamina.

3ª).-"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN PRODUCTO FARMACEUTICO DERIVADO DE LA PRENILAMINA".

La presente memoria descriptiva consta de cinco hojas foliadas y mecanografiadas por una sola cara, componiendo un total de noventa y siete líneas, incluidas las presentes.

Madrid, 23 de Abril de 1.970.-

[Handwritten signature]
R.P.

[Large handwritten signature]