

409507



Int. Cl.²: C07D.11A6LK

Nº 409.507

MEMORIA DESCRIPTIVA

correspondiente a la solicitud de concesión de una

PATENTE DE INVENCION

SOLICITANTE: LABORATORIOS PEDIATRICOS JUVENTUS, S.A.

RESIDENCIA: Valentin Beato, 44- MADRID

ENUNCIADO: PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE COMPUES-

TOS AMINOMETIL DERIVADOS DE ALANTOINA

Prioridad: Patente n.º del

Inventores: D. ENRIQUE GRANDA VEGA y Da PURIFICACION CASANOVA MORCILLO, ambos de nacionalidad española, los cuales han cedido sus derechos a la entidad solicitante.

409507 9



1

5

10

15

20

25

30

El Estatuto vigente sobre Propiedad Industrial, de 26 de Julio de 1929, en su texto refundido publicado el 30 de Abril de 1930, establece los caracteres de patentabilidad de las invenciones de tipo industrial que tienen por objeto obtener ventajas sobre lo ya conocido, admitiendo por consiguiente como patentables, las nuevas máquinas, aparatos, instrumentos, procesos de fabricación, etc. La amplitud de conceptos previstos como patentables, ha llevado al legislador a aclarar (Artº. 46) que la enumeración contenida en dicho cuerpo legal es puramente enunciativa y no limitativa, haciéndola extensiva incluso a los descubrimientos de tipo científico (Artº. 47).

El Decreto de 26 de Diciembre de 1947, recogiendo la Orden de 18 de Noviembre de 1935, confirma el criterio legal de que también serán patentables los instrumentos, objetos, o partes de los mismos, que aporten a la función a que son destinados, un beneficio o efecto nuevo, y en definitiva que constituyan una mejora sustancial sobre lo anteriormente conocido.

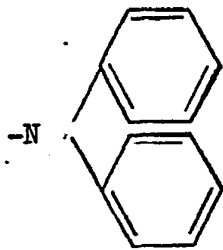
Pues bien, a tenor de lo expuesto, y en base al articulado que recoge los conceptos expresados, debe considerarse, que la invención a que se refiere la presente memoria, constituye una novedad industrial, con características y ventajas que la hacen merecedora del privilegio de explotación exclusiva que por ella se solicita, premiando así los méritos de quien aporta a la industria del país una mejora efectiva y precisamente comprendida entre las enunciadas por la Ley como patentables. (Arts. 46 y 47 en relación con el 171, en su nueva redacción afectada por la Orden de 18 de Noviembre de 1.935).

409507

9

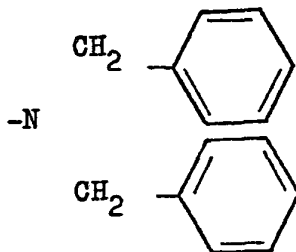


1



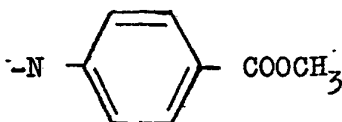
(7)

5



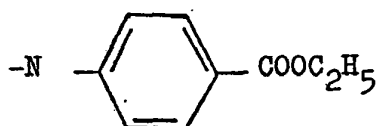
(8)

10



(9)

15



(10)

20

La preparación de estos derivados de alantoina ha sido necesaria por las características físico-químicas de esta sustancia, muy insoluble; y por haberse revelado algunos términos de esta serie como potencialmente útiles en preparaciones dermatológicas.

25

Así, los términos 1, 2, 3, 4, 5 conservan las propiedades epitelizantes de la sustancia origen, mientras en los términos 9 y 10 aparecen propiedades anestésicas locales.

30

La presente solicitud de patente vá dirigida a reivindicar el proceso que permite obtener estos aminometil derivados de alantoina.

El proceso de aminometilación puede llevarse a cabo a través de los hidroximetil derivados de la amina o



409507

1 la alantoina, aunque su preparación y purificación encarecería el proceso sin aumento del rendimiento final.

5 El procedimiento de acuerdo con la invención consiste en hacer reaccionar alantoina con formaldehído, para formaldehído o trioximetileno en medio acuoso alcohólico o hidroalcohólico, según los casos, y cualquiera de las aminas correspondientes a los radicales propuestos.

10 Hay que hacer notar que el proceso es en si el mismo, ya que tanto el formaldehído como paraformaldehído o trioximetileno son fuentes de formaldehído para reacción. El formaldehído empleado es la solución acusa al 40%.

La reacción es exotérmica y debe transcurrir en una primera parte sobre hielo, una hora aproximadamente, y calentando a reflujo a continuación durante dos horas.

15 El producto de la reacción se concentra a presión reducida, se precipita por enfriamiento y se cristaliza en disolventes adecuados del tipo alcohol, cloroformo isopropanol, etilenglicol o agua.

20 La reacción en los casos 1 y 2 debe practicarse en tubo cerrado por la volatilidad del amoníaco y la dimetilamina, aunque fundamentalmente se sigue el mismo proceso.

Los rendimientos obtenidos en todos los casos superan el 80%.

25 E J E M P L O S

1.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE N₂-DIETANOL AMINO METIL ALANTOINA.

30 A una solución de 0,05 mol. de alantoina en 20 ml. de alcohol de 50º se añaden, agitando, 7,5 ml (0,09 mol) de solución de formalina al 40% y poco a poco, sin

409507

9



1 dejar de agitar, 0,05 mol. de dietanol amina. La reacción
es exotérmica. Se deja reposar sobre hielo durante una hora
y a continuación se hierve a reflujo dos horas al baño
5 maría. El producto de la reacción precipita por enfriamien
to. Se recoge el precipitado, se disuelve en agua y se
cristaliza añadiendo alcohol.

2.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE N₂- (p-etoxi
carbonil fenil) AMINOMETIL ALANTOINA.

10 A una solución de 0,05 mol. de alantoina en 20
ml. de agua se añaden, agitando, 3 gramos de paraformaldeh
do y 0,05 mol. de P-amino benzoato de etilo disuelto en
100 ml. de alcohol. En este caso se calienta para liberar
el formaldehído del paraformaldehído. Se mantiene a reflu-
jo durante una hora y se precipita por enfriamiento, recris-
15 talizando el producto obtenido en cloroformo.

20

25

30

409507



1

Hecha la descripción a que se refiere, la memoria que antecede, es preciso insistir en que los detalles de realización de la idea expuesta, pueden variar, es decir, que pueden sufrir pequeñas alteraciones, basadas siempre en los principios fundamentales de la idea, que son en esencia los que quedan reflejados en los párrafos de la descripción hecha. En efecto, el Artículo 48 del Estatuto vigente sobre Propiedad Industrial, establece como no patentables, en su apartado tercero, "los cambios de forma, dimensiones, proporciones y materias de un objeto ya patentado" fijando así el criterio del legislador en el sentido de que patentada una idea que pueda dar lugar a una realidad práctica e industrializable, nadie podrá apoyarse en ella para, a pretexto de haber introducido ligeras modificaciones, presentarla como nueva y propia.

5

10

15

Este principio, en cuanto al alcance de la protección del objeto patentado se refiere, se halla confirmado por numerosas Sentencias del Tribunal Supremo, y entre ellas, como más terminantes, en las de fechas 16 de octubre de 1954, 23 de enero de 1959, 20 de marzo de 1964 y otras.

20

Establecido el concepto expresado, en cuanto a la amplitud que debe darse a la protección solicitada, se redacta a continuación la Nota de Reivindicaciones, de acuerdo con lo que se establece en el último párrafo del apartado tercero del Artículo 100 de la Ley, sintetizando así las novedades que se desean reivindicar:

25

NOTA DE REIVINDICACIONES

En resumen, el privilegio de explotación exclusiva que se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones siguientes:

Reg
30

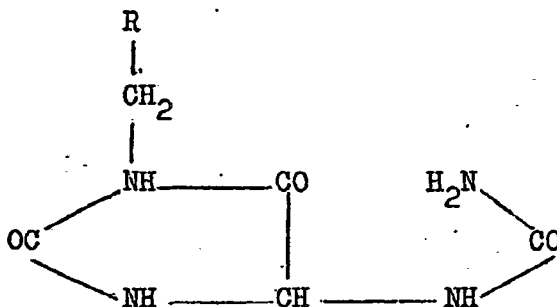
409507



1

1. Procedimiento de preparación de compuestos aminometil derivados de alantoina, de fórmula general:

5



10

en la que R representa amoniaco, dimetil amina, dietil amina, diisopropil amina, dietanol amina, dicicloehilamina, difenil amina, dibencil amina; p-aminobenzoato de metilo y p-aminobenzoato de etilo; caracterizado por la reacción entre la alantoina y la amina por medio de formaldehido en solución acuosa, paraformaldehido o trioximetileno, que cumplen la función general de proporcionar formaldehido a la reacción, realizándose dicha reacción en una primera parte sobre hielo y calentando a reflujo a continuación durante dos horas, de tal manera que el producto de la reacción se concentra a presión reducida, se precipita por enfriamiento y se cristaliza en disolventes adecuados del tipo alcohol, cloroformo, isopropanol, etilenglicol o agua.

15

20

25

2a. Se reivindica por último como objeto que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE COMPUESTOS AMINOMETIL DERIVADOS DE ALANTOINA.

Reg.

30



409507

1

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente Memoria descriptiva que consta de nueve páginas mecanografiadas.

5

Madrid, 11 de diciembre 1.972

BERNARDO UNGRIA

P.P.

10

15

20

25

30