



426774

P A T E N T E D E I N V E N C I O N
=====

por VEINTE años

cuyo privilegio se solicita para España,
sus territorios y plazas de soberanía, a
favor de:

ROCADOR, S.A.

entidad española, domiciliada en Esplugas
de Llobregat (Barcelona), calle Clavé, núm.
98, relativa a:

"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN
PRODUCTO DE CONDENSACION DE FENILBUTAZONA CON
ACIDO p-AMINO SALICILICO"

COFD



MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere, conforme se indica en su enunciado, a un procedimiento para la obtención de un producto de condensación de fenilbutazona con ácido p-amino salicílico. - - - - -

5. La fenilbutazona en su estructura química presenta un hidrógeno activo que permite la condensación de aquella molécula a ciertas bases, mediante aldehído fórmico, formando una base de Mannik. - - - - -

10. Se ha comprobado que alguno de estos productos son interesantes farmacológicamente, especialmente el que se obtiene mediante la condensación de la fenilbutazona con el ácido p-amino salicílico. - - - - -

15. La invención tiene por objeto un procedimiento para la obtención del referido producto de condensación, cuyo procedimiento se caracteriza esencialmente porque se hace reaccionar, a temperatura ambiente, la fenilbutazona con el ácido p-amino salicílico, en cantidades equimoleculares y en presencia de un exceso de formaldehído. - - - - -

20. La reacción tiene lugar según el siguiente esquema: - - - - -



- acido acetil salicílico. - - - - -
- A dosis de 25 mg./Kg. - - - - -
- A los 30 minutos: - - - - -
- Acido acetil salicílico: 62% de analgesia.
- 5. - Fenilbutazolidin-metilen-
- amino-salicílico: 72% de analgesia.

Acción ulcógena

- En ratas, frente a la fenilbutazona. - - - - -
- A dosis de 100 mg./Kg. - - - - -
- 10. Índice ulcógeno a las 24 horas: - - - - -
- Fenilbutazona: 14.
- Fenilbutazolidin-metilen-amino-salicílico 1,4.

Para facilitar la comprensión de las ideas expuestas se describe seguidamente un ejemplo de realización de la presente invención, el cual, dado su carácter meramente ilustrativo, deberá ser considerado como desprovisto de todo alcance limitativo respecto a la protección legal que se solicita. - - -

15.

EJEMPLO

En un matraz de 250 c.c., provisto de agitación, se colocan 15,4 g. de fenilbutazona (0,05 moles) y 7,85 g. de p-amino-salicílico (0,05 moles), en 150 c.c. de etanol absoluto, junto con 8 c.c. de formaldehído al 35%. - - - - -

20.

Se agita durante 8 horas y se deja reposar 24 horas, cristalizando una masa que, filtrada, lavada con alcohol y seca, pesa 22 g., con un P.F.: 170° C. - - - - -

25.

El análisis elemental da: - - - - -



C - 68,7 %, H - 5,8 %, N - 8,6 %

y los valores calculados son: - - - - -

C - 68,49%, H - 5,75%, N - 8,87%

5. Descritas convenientemente las características de la invención, se hace constar que en la misma se podrán introducir cuantas variantes de detalle pueda aconsejar la experiencia, siempre que con ello no se modifique su esencialidad que es la que se resume y concreta en la siguiente: - - - - -

N O T A

10. Se declaran de novedad y propiedad para España, sus territorios y plazas de soberanía, las siguientes: - - - - -

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

15. 1.- Procedimiento para la obtención de un producto de condensación de fenilbutazona con ácido p-amino salicílico, caracterizado porque se hace reaccionar, en medio alcoholico y a temperatura ambiente, la fenilbutazona con el ácido p-amino salicílico, en cantidades equimoleculares y en presencia de un exceso de formaldehido. - - - - -

20. 2.- "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN PRODUCTO DE CONDENSACION DE FENILEUTAZONA CON ACIDO p-AMINO SALICILICO". -

Todo ello conforme se describe y reivindica en la presente memoria que consta de cinco hojas foliadas y mecanografiadas por una sóla de sus caras.

MADRID, 30 MAYO 1974

P. A. M. CURELL SUÑOL

cpf

mCe

[Handwritten signature]