



ESPAÑA

19 ES	11 21	NUMERO 448953	10 A1
	22	FECHA DE PRESENTACION 16 Junio 1976	



PATENTE DE INVENCION

90 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07F//A61K	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
64 TITULO DE LA INVENCION "Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico".		
71 SOLICITANTE (S) LABORATORIOS RGGER, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE BARCELONA- c/. Córcega, 541		
72 INVENTOR (ES) D. Jorge ADSARA DALMAU		
73 TITULAR (ES)		
74 REPRESENTANTE D. Pedro SUGRAÑES FERRER, Ag. Of. Prop. Ind. BARCELONA- Rambla de Cataluña, 82		

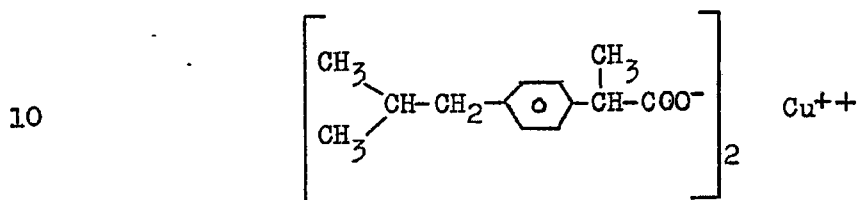
16 JUN 1978

PATENTE DE INVENCION

por "Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico".

MEMORIA DESCRIPTIVA

5 La presente invención se refiere al procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico como es el 2(p-isobutil)-fenil-propionato de cobre, de fórmula empírica $C_{26} H_{34} O_4 Cu$, cuyo peso molecular es de 474,1g y estructura química desarrollada:



La obtención de este compuesto se efectúa por reacción del ácido 2-(p-isobutil)-fenilpropiónico disuelto en un disolvente polar iónico, preferentemente el etanol, con solución de una sal de cobre.

16 JUN 1978



-2-

Se reseña a continuación un ejemplo no limitativo que ilustra la presente Patente de invención:

Ejemplo:

Se disuelven 2,06 g de ácido 2-(p-isobutil)-fenil-
5 -propiónico en 60 ml de etanol, añadiéndoles con agitación
lentamente una solución de 2 g de acetato de cobre monohi-
dratado en 25 ml de agua.

Se mantiene la solución formada con agitación du-
rante 2 horas a temperatura ambiente, aislando finalmente
10 el producto por filtración y lavado del precipitado formado
con agua.

El producto obtenido es un polvo blanco que fun-
de a 200 °C y presenta el siguiente análisis elemental:

		<u>C</u>	<u>H</u>
15	% hallado	66,01	7,45
	% calculado	65,87	7,22

El compuesto de la presente invención presenta
notables propiedades farmacológicas como antiinflamatorio,
que se han puesto de manifiesto, comparativamente con el
20 ácido 2-(p-isobutil)-fenilpropiónico (de nombre genérico:
ibuprofen), por medio de la determinación del porcentaje

16 JUN. 1976

de protección del edema inducido en la pata de la rata por inyección subplantar de carragenina (técnica de Winter y Potter: "J. Pharmacol" 369, 141, 1963) con los siguientes resultados:

	<u>Producto</u>	<u>Dosis</u>	<u>% de protección</u>
5	2-(p-isobutil)-fenilpropionato de cobre	12,5 mg/Kg	28
		50 "	56
		200 "	86
	Ibuprofen	12,5 "	23
10		50 "	40,5
		200 "	67

15 La actividad antiinflamatoria del compuesto de la presente invención es, en consecuencia, un 25% mayor que la del ibuprofen en las mismas condiciones experimentales.

La toxicidad encontrada experimentalmente es, asimismo, menor que la del ibuprofen. Así, la DL₅₀ por via oral en ratón es de 836 mg/Kg, siendo de 800 mg/Kg para el ácido correspondiente.

20 De los datos experimentales se deduce que el producto de la presente invención posee un mayor índice



16 JUN 1978

terapéutico que el producto de partida. Puede administrarse en clínica, mezclado con los excipientes adecuados, por la vía oral en forma de comprimidos, cápsulas, suspensiones, etc., a dosis desde 10 a 30 mg/Kg.

- 5 En la ejecución práctica del objeto de la presente Patente de invención podrán variar cuantos detalles no afecten a su propia esencialidad.
-

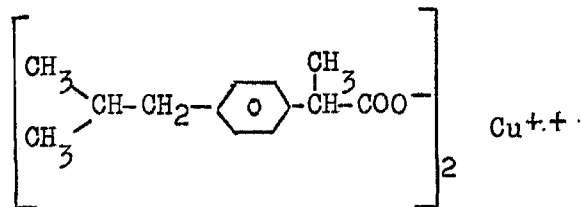
16 JUN 1976

-5-

REIVINDICACIONES

Se reivindica como objeto de la presente Patente de invención

12.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico de fórmula:



caracterizado porque el mismo se realiza por la reacción del ácido 2-(p-isobutil)fenilpropiónico, disuelto en un disolvente polar iónico con una solución de sal de cobre mediante agitación a temperatura ambiente y posterior filtración y lavado del precipitado obtenido.

29.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico, según la reivindicación primera, en el que el disolvente polar iónico es etanol.

39.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido fenil-propiónico, según la reivindicación primera, en el que la sal de cobre utilizada es el acetato monohidratado.

16 JUN 1976



4º.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DEL
ACIDO FENILPROPIONICO.

Consta la presente invención de seis hojas
foliadas y mecanografiadas por una sola cara.

Madrid, 16 de junio de 1976

LABORATORIOS ROGER, S.A.

p.a.

PEDRO SUGRANES FERRER

p. p.



Fdo. Enrique de Verdonces

