



ESPAÑA

ES 11 19 448954 10 A1  
21  
22  
FECHA DE PRESENTACION  
16 Junio 1976



PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
37 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 naftalen-propiónico".		
71 SOLICITANTE (S) LABORATORIOS ROGER, 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 BARCELONA- Rambla de Cataluña, 82		

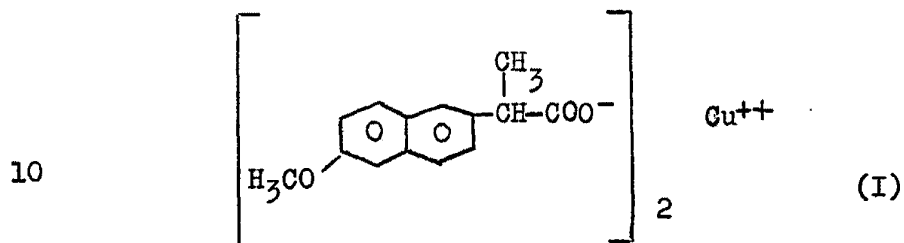


PATENTE DE INVENION

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

MEMORIA DESCRIPTIVA

5            La presente invención se refiere al procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido naftalén-propiónico, como es el 6-metoxi-naftalén- $\beta$ -2-propionato de cobre, de fórmula empírica  $C_{28} H_{26} O_6 Cu$ . de peso molecular 522,06 y estructura química desarrollada:



La obtención de este compuesto se efectúa por reacción del ácido 6-metoxi-naftalén- $\beta$ -2-propiónico disuelto en un disolvente polar iónico, preferentemente del metanol, con una solución de una sal de cobre.



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

Ejemplo:

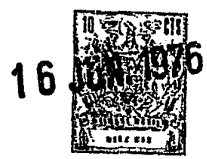
5 Se disuelven 5,75 g. de ácido 6-metoxi-naftalén-  
-β-2-propiónico en 120 ml de metanol, añadiéndoles lentamente con agitación una solución de 5 g. de acetato de cobre monohidratado en 62,5 ml de agua.

10 Se continúa la agitación durante una hora a temperatura ambiente, filtrando finalmente y lavando el precipitado formado varias veces con agua.

Se obtienen 6,36 g. de producto (I) en forma de polvo blanco que funde a 228 °C con descomposición y presenta el siguiente análisis elemental:

		<u>C</u>	<u>H</u>
15	% hallado	64,37	4,94
	% calculado	64,41	5,02

20 El compuesto de la presente invención presenta notables propiedades farmacológicas como antiinflamatorio, que se han puesto de manifiesto, comparativamente con el ácido 6-metoxi-naftalén-β-2-propiónico (de nombre genérico: naproxen), por medio de la determinación del porcentaje de



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

5	<u>Compuesto</u>	<u>Dosis</u>	<u>% de protección</u>
	Producto I	1,25 mg/Kg	31,8
		2,50 "	45,9
		5,- "	87,6

10 La actividad antiinflamatoria del compuesto (I), es en consecuencia, unas dos veces superior a la del naproxen en las mismas condiciones experimentales.

15 La toxicidad encontrada experimentalmente es menor que la del naproxen. Así, la DL<sub>50</sub> por via oral en ratón es de 1314 mg/Kg siendo de 1234 mg/Kg para el ácido correspondiente.

20 De los datos experimentales se deduce que el producto objeto de la presente invención posee un mayor índice terapéutico y una mejor tolerancia que el producto de partida. Puede administrarse en clínica, mezclado con los excipientes adecuados, por via oral en forma de comprimidos, cápsulas, suspensiones, etc. a dosis diarias normales comprendidas entre 200 y 1000 mg.



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

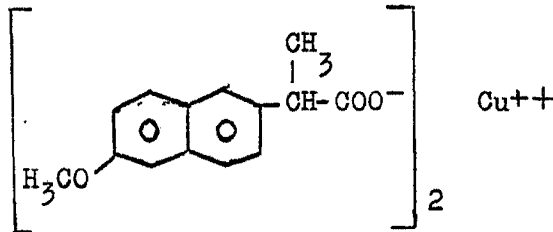
---

16 000 076 -5-

REIVINDICACIONES

Se reivindica como objeto de la presente Patente de invención:

5 1.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido naftalén-propiónico, de fórmula:



10 caracterizado porque el mismo se realiza por la reacción del ácido 6-metoxi-naftalén-β-2-propiónico, 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.

15 2.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido naftalén-propiónico, según la reivindicación primera, en el que el disolvente polar iónico es metanol.

3.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido naftalén-propiónico, según la reivindi-

16 JUN 1976

cación primera, en el que la sal de cobre utilizada es el acetato monohidratado.

4.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DEL ACIDO NAFTALEN-PROPIONICO.

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

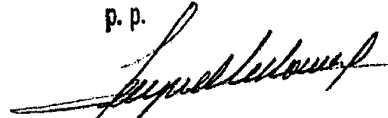
Madrid, 16 de junio de 1976

LABORATORIOS ROGER, S.A.

p.a.

PEDRO SUGRANES FERRER

p. p.



Félix Enrique de Verdoncas

