



ESPAÑA

450368

ES	11	NUMERO	10	A1
	21			
	22	FECHA DE PRESENTACION		
		2-agosto-1976		

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	63 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	CO7F/AG1X	
64 TITULO DE LA INVENCION		
"Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido benzoil-fenil-propiónico".		
71 SOLICITANTE (ES)		
LABORATORIOS ROGER, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
Barcelona, c/Córcega, 541		
72 INVENTOR (ES)		
Prof. Stefano Maiorana		
73 TITULAR (ES)		
LABORATORIOS ROGER, S.A.		
74 REPRESENTANTE		
D. Pedro Sagrañes Ferrer, Ag. Of. de la Prop. Ind.		

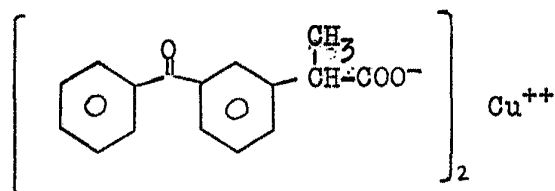
PATENTE DE INVENCION
=====

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

MEMORIA DESCRIPTIVA

5 Se refiere la presente Patente de Invención a un procedimiento de obtención de un nuevo derivado del ácido benzoil-fenil-propiónico como es el 2-(3-benzoil-fenil)-propionato de cobre, de fórmula empírica $C_{32} H_{26} O_6 Cu$, de peso molecular 570,10, y estructura

10 química desarrollada:



15 La obtención de este compuesto objeto de la presente Patente de Invención se efectúa por reacción del ácido 2-(3-benzoil-fenil)-propiónico, en suspensión en un disolvente polar iónico, preferentemente agua destilada, en medio alcalino con una solución de una sal de cobre.

A continuación se reseña un ejemplo ilustrativo pero no limitativo del procedimiento descrito en la presente Patente de Invención:

5 A una suspensión de 7,62 g. de ácido 2-(3-
-benzoil-fenil)-propiónico en 150 ml de agua destilada se le añaden con agitación enérgica y lentamente 15,6 ml de hidróxido sódico 2N. El ácido se solubiliza completamente casi enseguida, quedando la solución a un pH de alrededor de 7. Si la solución resultase turbia debido a
10 impurezas, se filtra quedando en las condiciones citadas.

A la solución obtenida se le añade lentamente una solución de 3,98 g. de sulfato cúprico pentahidratado en 70 ml de agua destilada, formándose rápidamente un precipitado.

15 Una vez ultimada la adición se mantiene en agitación durante media hora a temperatura ambiente, al fin de la cual se filtra. El precipitado obtenido se suspende con agitación mantenida durante 20 minutos en 200 ml. de agua destilada y se filtra de nuevo, repitiéndose esta operación
20 dos veces más con la misma cantidad de agua hasta que las aguas de lavado estén exentas de sulfatos.

El precipitado final se deseca, obteniéndose 7 g del producto en forma de polvo blanco que funde a 87°C con descomposición y presenta el siguiente análisis elemental:

25	C	H
Hallado	67,13	4,44
Calculado	67,41	4,59

El compuesto, objeto de la presente Patente de Invención, presenta notables propiedades farmacológicas como antiinflamatorio, que se han puesto de manifiesto, comparativamente con el ácido 2-(3-benzoil-fenil)-propiónico (nombre genérico: ketoprofen), por medio de la deter-
5 minación del porcentaje de protección del edema inducido en la pata de la rata por inyección subplantar de carrage-
nina (técnica de Winter y Poter: "J. Pharmacol." 141, 369, 1963) con los siguientes resultados:

10	<u>Compuesto</u>	<u>Dosis</u>	<u>% de protección</u>
	Producto	5 mg/Kg	17
		15 "	44
		45 "	77

La actividad antiinflamatoria del compuesto
15 a obtener es, en consecuencia, una 25 veces superior a la del ketoprofen en las mismas condiciones experimentales.

La toxicidad aguda, determinada experimentalmente como la DL₅₀ en ratón por vía oral según el método de
20 Litchfield y Wilcoxon, es de 398 mg/Kg.

De los datos experimentales se deduce que el producto objeto de la presente invención posee un mayor índice terapéutico que el producto de partida. Puede administrarse en clínica, mezclado con los excipientes adecuados, por vía oral en forma de comprimidos, cápsulas, sus-
25 pensiones, etc. a dosis diarias normales comprendidas entre 50 y 500 mg.

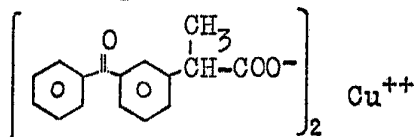
En la ejecución práctica del objeto de la presente Patente de Invención podrán variar todos aquellos detalles que no afecten a su esencialidad.

- - - - -

REIVINDICACIONES

Se reivindica como objeto de la Presente Patente de In-
vención:

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



caracterizado por obtenerse mediante la reacción del ácido
2-(3-benzoil-fenil)-propiónico, en suspensión en un disol-
vente polar iónico en medio alcalino, con una solución de
una sal de cobre mediante agitación a temperatura ambiente
y posterior lavado y desecación del precipitado obtenido.

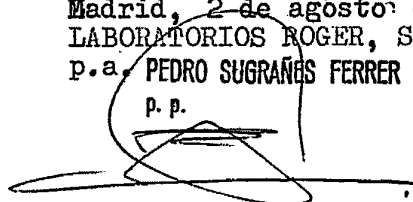
2.-Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del
ácido benzoil-fenil-propiónico, según 1, en el que el di-
solvente polar iónico es el agua.

3.- Procedimiento de obtención de un nuevo derivado del
ácido benzoil-fenil-propiónico, según 1, en el que la sal
de cobre utilizada es el sulfato cúprico pentahidratado.

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

Consta la presente memoria de 5 hojas foliadas
y mecanografiadas por una sola cara.

Madrid, 2 de agosto de 1976
LABORATORIOS ROGER, S.A.
p.a. PEDRO SUGRAÑES FERRER
p. p.



Fdo. Pedro Sugañes Moliné

