

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

IN.-



15 MAR. 1978

CO. GERONA

NUM. INC.	460926
FECHA DE PRESENTACION	21-7-1.977

ES 10 A1

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D/A61K	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
64 TITULO DE LA INVENCION PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE SALES DE ACIDOS ARILALCANOICOS CON AMINOACIDOS DIBASICOS.		
71 SOLICITANTE (S) LABORATORIOS CUSI, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE MASNOU (Barcelona)		
72 INVENTOR (ES) D. Eduardo Guzman Llansa, D. Pablo Ariño Mestrojuan y D. Enrique Melendez Andreu, de nacionalidad española, los cuales han cedido sus derechos a la entidad solicitante.		
73 TITULAR (ES) El mismo solicitante		
74 REPRESENTANTE DON BERNARDO UNGRIA GOIBURU		

1 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 patentabili-
5 dade de las invenciones de tipo industrial que tienen por
objeto obtener ventajas sobre lo ya conocido, admitiendo
por consiguiente como patentables, las nuevas máquinas, a-
paratos, instrumentos, procesos de fabricación, etc. La am-
plitud de conceptos previstos como patentables, ha llevado
al legislador a aclarar (Artº. 46) que la enumeración con-
10 tenida en dicho cuerpo legal es puramente enunciativa y no
limitativa, haciéndola extensiva incluso a los descubrimien-
tos 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
15 legal de que también serán patentables los instrumentos, ob-
jetos, o partes de los mismos, que aporten a la función a
que son destinados, un beneficio o efecto nuevo, y en defi-
nitiva que constituyan una mejora sustancial sobre lo ante-
riormente conocido.

20 Pues bien, a tenor de lo expuesto, y en base al ar-
ticulado que recoge los conceptos expresados, debe conside-
rarse, que la invención a que se refiere la presente memo-
ria, constituye una novedad industrial, con características
y ventajas que la hacen merecedora del privilegio de explo-
25 tación exclusiva que por ella se solicita, premiando así
los méritos de quien aporta a la industria del país una me-
jora efectiva y precisamente comprendida entre las enuncia-
das por la Ley como patentables. (Arts. 46 y 47 en relación
con el 171, en su nueva redacción afectada por la Orden de
30 18 de Noviembre de 1.935).

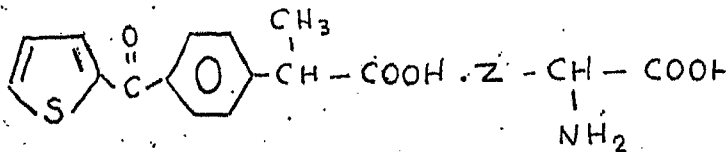
1 Según trabajos de Janssen y posteriores ensayos
farmacológicos propios se ha podido constatar que el ácido
2 α -metil, 4 (2-tienilcarbonil)fenilacético, posee propie-
dades antiinflamatorias y analgésicas altamente eficaces.

5 Ahora bien, la incorporación medicamentosa de
este ácido solamente es posible por administración oral, ya
que no es soluble en agua; ello trae como consecuencia el
que su incorporación al organismo sea más lenta que la lo-
grada por administración por otras vías, como por ejemplo
10 inyectable.

Con objeto de poder administrar el ácido a que
nos referimos por vía inyectable, se ha buscado la manera
de hacerle soluble en agua, y para ello es necesario formar
las sales correspondientes.

15 Pues bien, la invención consiste en preparar
las sales del ácido α -metil, 4(2-tienilcarbonil) fenilacé-
tico, con α -aminoácidos dibásicos, logrando con ello confe-
rir la máxima solubilidad y la toxicidad mínima.

20 Estas sales pueden representarse por la fórmula
general siguiente:



25 donde Z puede ser un alquilamino ($\text{NH}_2 - (\text{CH}_2)_n -$) ó alquil-
guanidino ($\text{NH}_2 - \underset{\text{NH}}{\text{C}} - \text{NH} - (\text{CH}_2)_n -$)
siendo n de 1 a 6

30 La reacción puede verificarse convenientemente

1 en disolvente orgánico-acuosos o en orgánicos polares a tem-
peraturas comprendidas entre la ambiente y la de ebullición
del disolvente.

5 Los tiempos de reacción se hallan comprendidos
entre 30 minutos y 6 horas, según la temperatura a que se
verifique la reacción.

El producto final puede aislarse conveniente-
mente por cualquiera de las técnicas usuales; destilación
a sequedad y recristalización en el disolvente apropiado.

10 Es evidente que el objeto de la presente in-
vención puede llevarse a cabo de diversas formas sin que
ello signifique variación alguna de las características esen-
ciales de la misma. Los ejemplos descritos a continuación
dan idea de las posibilidades prácticas del procedimiento -
15 descrito, constituyendo medio ilustrativo y no limitativo del
contenido de la memoria.

EJEMPLO 1.-

α -metil, 4-(2'-tienilcarbonil) fenil acetato de L- Arginina

20 43'5 gr. de L-Arginina se disuelven en 150 ml.
de agua .A esta disolución se añaden 65 gr. de ácido α -metil
4- (2'tienilcarbonil) fenilacético disueltos en 500 ml de -
acetona. El conjunto se calienta a reflujo durante 1 hora,
se enfria y evapora a sequedad. Se agregan 100 ml de alcohol
absoluto y se evapora a sequedad, se repite otra vez esta -
25 operación con objeto de eliminar las últimas trazas de agua.
El residuo 105 gr., se recristaliza de Alcohol-Eter y se ob-
tienen 70 gr. de producto blanco higroscópico de Pf= 90-100º
C (desc.).

EJEMPLO 2.-

30 α -metil, 4-(2'-tienilcarbonil) fenilacetato de L- Lisina.-

1

Se sigue el procedimiento del ejemplo 1, pero sustituyendo la L- Arginina por L- Lisina, Se obtiene un sólido blanco higroscópico de Pf= 118-125° C (desc.).

EJEMPLO 3.-

5

α-metil, 4-(2'- tienilcarbonil) fenilacetato de L- Ornitina.

Se sigue el procedimiento del ejemplo 1, pero sustituyendo la L-arginina por L- Ornitina, Se obtiene un sólido blanco de pf= 184-184, 5° C.

10

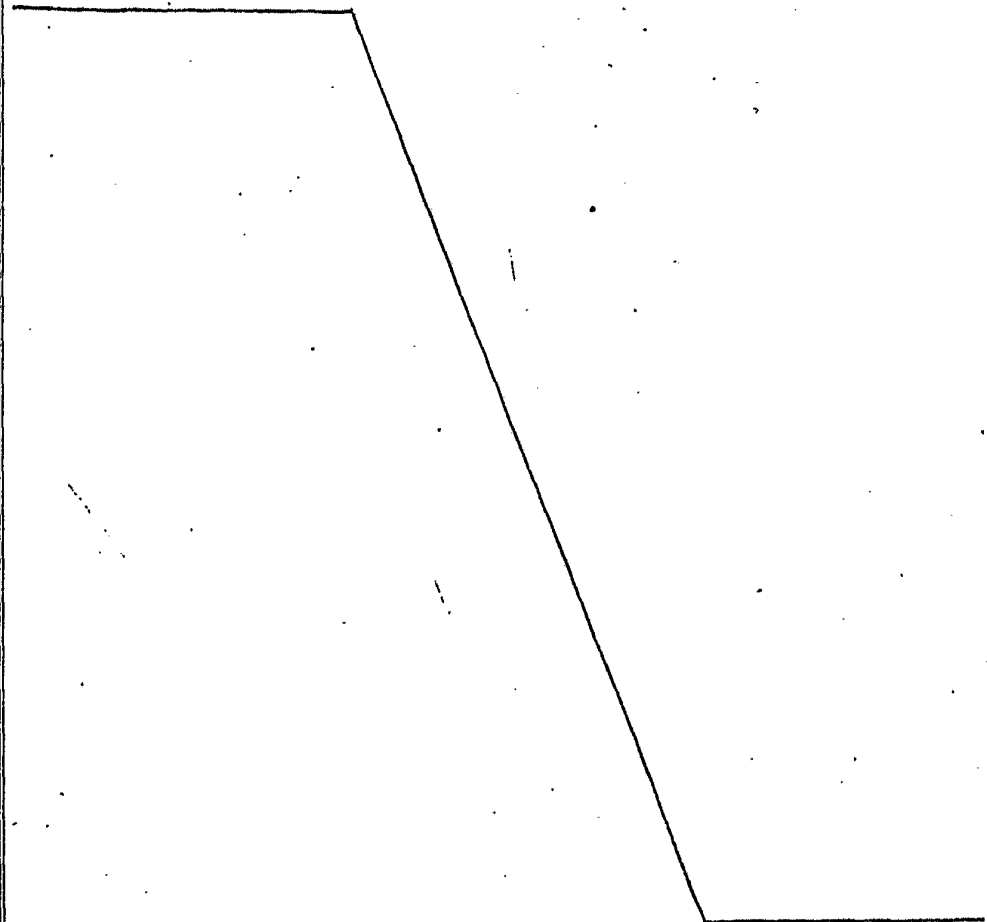
Estos compuestos presentan una actividad antiinflamatoria notable, superior a Fenilbutazona, y una actividad analgésica comparable a productos de primer orden como el - ácido acetilsalicílico. Los ensayos de toxicidad aguda por vía intraperitoneal demuestran que su $DL_{50} > 1000$ mg/ Kg.

15

20

25

30



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
5 en los principios fundamentales de la idea, que son en esen-
cia los que quedan reflejados en los párrafos de la descrip-
ción 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,
10 proporciones y materias de un objeto ya patentado" fijando
así el criterio del legislador en el sentido de que paten-
tada 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, pre-
15 sentarla como nueva y propia.

Este principio, en cuanto al alcance de la protec-
ción 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
20 de 1954, 23 de enero de 1959, 20 de marzo de 1964 y otras.

Establecido el concepto expresado, en cuanto a la
amplitud que debe darse a la protección solicitada, se re-
dacta a continuación la Nota de Reivindicaciones, de acuer-
do con lo que se establece en el último párrafo del apar-
25 tado tercero del Artículo 100 de la Ley, sintetizando así
las novedades que se desean reivindicar:

NOTA DE REIVINDICACIONES

En resumen, el privilegio de explotación exclusi-
va que se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones si-
30 guientes:

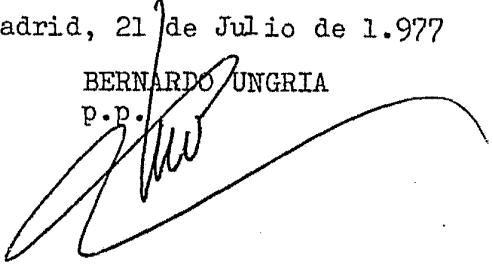
1

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

5

Madrid, 21 de Julio de 1.977

BERNARDO UNGRIA
P.P.



10

15

20

25

30

