

- 6 NOV. 1978

ES

NUMERO
469533
FECHA DE PRESENTACION
5-5-78

A1



ESPAÑA

AH Concedido el Registro de acuerdo con los datos que figuran en la presente descripción y según el contenido de la Memoria adjunta.

469533

PATENTE DE INVENCION

50 PRIORIDADES: 31 NUMERO	52 FECHA	53 PAIS
------------------------------	----------	---------

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07C 143/58 // A61K	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA 31/185
------------------------	---	--

54 TITULO DE LA INVENCION
UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE DERIVADOS DE 4 - (CICLOALQUILENIMINO SULFONIL) - BENZOICO.

71 SOLICITANTE (S)
LABORATORIOS ALTER, S.A.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Mateo Inurria, 30 - MADRID - 16

72 INVENTOR (ES)
D. CARLOS SUNKEL LETELIER; D. FERNANDO DORREGO RODRIGUEZ ambos de nacionalidad española.

73 TITULAR (ES)

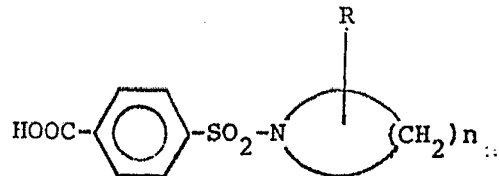
74 REPRESENTANTE
D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU

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-
dad de las invenciones de tipo industrial que tienen por
5 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 La presente invención se refiere a un procedi-
miento de obtención de derivados de 4 - (cicloalquilenimino
5 sulfonil) - benzoico de fórmula general (I),



10 donde $n = 4, 5, 6$ y $R = H$ ó CH_3

Los ejemplos de estos derivados están reflejados en la
Tabla I.

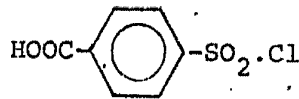
Tabla I

n	R
4	H
5	H
5	2- CH_3
5	3- CH_3
6	H

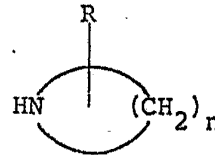
15 Estos derivados facilitan la eliminación del
ácido úrico cuando se administran a animales de laboratorio
lo cual los hace útiles como agentes uricosúricos.

20 La obtención de estos derivados se realiza al
25 hacer reaccionar a temperatura ambiente el cloruro del 4-car-
boxibencenosulfonilo (II) con una cicloalquilenimina (III),
en la que n y R tienen el mismo significado anterior, en me-
dio acuoso y en presencia de una base como el NaOH.

1



(II)



(III)

5

El rendimiento de estos derivados así obtenidos varía entre el 40 % a 80 %. La pureza y estructura se confirmaron por cromatografía en capa fina, análisis elemental y por espectroscopía, U.V., I.R. y N.M.R.

10

Bien entendido que tanto el disolvente como la base no tienen otro carácter que el meramente ilustrativo.

Una posible forma de dosificación de estos compuestos sería la siguiente:

Fórmula por comprimido

15

Acido 4 - (piperidin-sulfonil) - benzoico	300 mg
Talco.....	5 mg
Lactona.....	45 mg

20

Ejemplo

Método general de obtención de derivados de 4 - (cicloalquilenimino sulfonil) - benzoico.

25

A una suspensión de 0,2 moles de la correspondiente cicloalquilenimina (III) en 200 ml de solución acuosa de NaOH al 10 %, se adicionan 32,4 g (0,5 moles) de (II) con agitación vigorosa y manteniendo la temperatura inferior a 20° C.

30

A continuación se mantiene la reacción a temperatura ambiente durante 50 minutos. Se ajusta la reacción a pH 2.

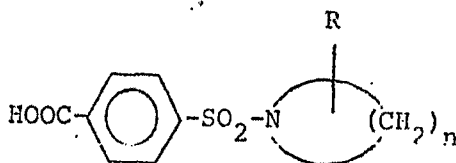
El solido resultante se filtra y lava con 50 ml

1 de H₂O y finalmente se recristaliza de etanol.

Aplicando este método general se han obtenido los productos reseñados en la Tabla II.

5

Tabla II



10

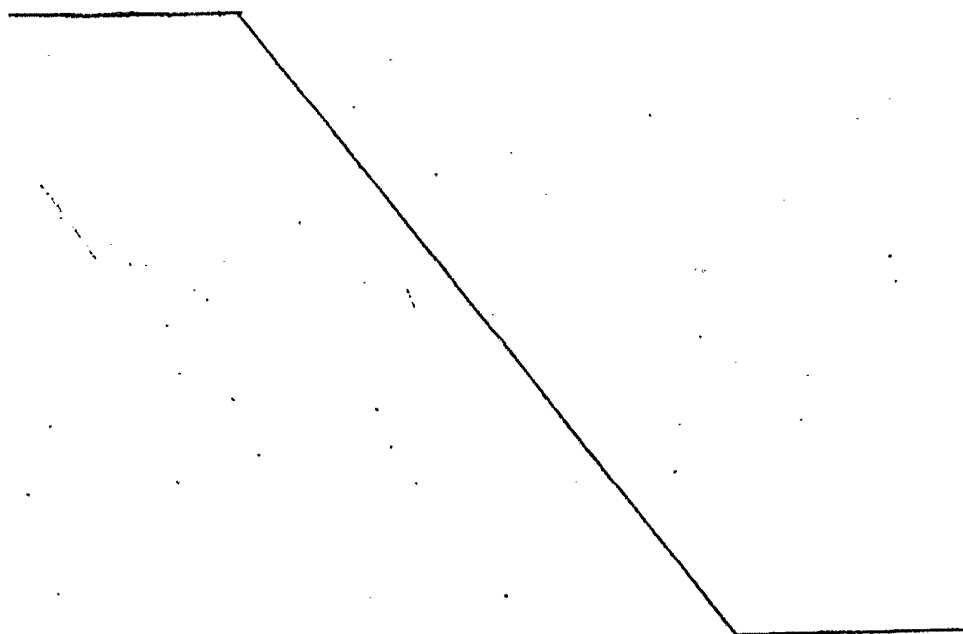
n	R	p.f. °C	Rendimiento %
4	H	235-237 (desc.)	63
5	H	256-259 (desc.)	43
5	2-CH ₃	205-207	61
5	3-CH ₃	242-245	79
6	H	234-236 (desc.)	52

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.

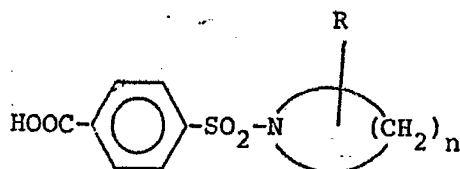
Este principio, en cuanto al alcance de la protec-
ción del objeto patentado se refiere, se halla confirmado
por numerosas Sentencias del Tribunal Supremo, y entre -
ellas, como más terminantes, en las de fechas 16 de octubre
20 de 1954, 23 de enero de 1959, 20 de marzo de 1964 y otras.

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

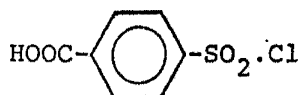
En resumen, el privilegio de explotación exclusi-
va que se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones si-
30 guientes:

1 1a.- UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE DERIVADOS DE 4 - (CICLOALQUILENIMINO SULFONIL) - BENZOICO, de fórmula general (I),

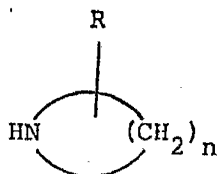


10 donde $n = 4, 5, 6$ y $R = H$ ó CH_3

15 procedimiento que se caracteriza porque se hace reaccionar a temperatura ambiente el cloruro del 4-carboxibenceno sulfonilo (II) con una cicloalquilenimina (III), en la que n y R tienen el mismo significado anterior, en medio acuoso y en presencia de una base.



(II)



(III)

25 2a.- UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE DERIVADOS DE 4 - (CICLOALQUILENIMINO SULFONIL) - BENZOICO, según la reivindicación 1, caracterizado porque la base empleada en la reacción del compuesto (II) y (III) es el NaOH.

30 3a.- Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE DERIVADOS DE 4 - (CICLOALQUILENIMINO SULFONIL) - BENZOICO.

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

5 Madrid, 5 de Mayo de 1.978

BERNARDO UNGRIA

P.D.



10

15

20

25

30