

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

AH

6 NOV. 1978 ES

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

11	NUMERO	10	AI
21	469591		
22	FECHA DE PRESENTACION		
	8-5-78		

PATENTE DE INVENCION

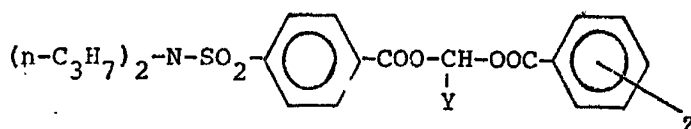
30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
17 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07C 67H0, 69/78/A61K31/245	
64 TITULO DE LA INVENCION		
UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CIERTOS ESTERES MIXTOS DEL ACIDO 4- { (DIPROPILAMINO)-SULFONIL } -BENZOICO		
71 SOLICITANTE (ES)		
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 GOBURU		

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 ciertos ésteres mixtos del ácido 4-
{(dipropilamino)-sulfonil} -benzóico de fórmula general (I).



donde Y = H ó CH₃ y Z = H; Cl; CH₃ ó CF₃

10 En la tabla I están reseñadas las posiciones
que ocupan estos sustituyentes.

Tabla I

15

Y	Z
H	H
H	2-Cl
H	3-Cl
H	4-Cl
H	2-CH ₃
H	3-CH ₃
H	4-CH ₃
H	3-CF ₃
CH ₃	H
CH ₃	2-Cl
CH ₃	3-Cl
CH ₃	4-Cl
CH ₃	2-CH ₃
CH ₃	3-CH ₃
CH ₃	4-CH ₃

20

25

30

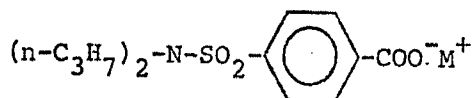
1

Estos derivados son útiles como agentes urico-
súricos, ya que facilitan la eliminación del ácido úrico cuan-
do son administrados a animales de laboratorio.

5

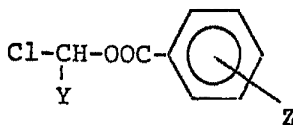
La obtención de estos ésteres mixtos se reali-
za haciendo reaccionar la sal de un metal alcalino (II) con
los clorometilésteres (III), donde Y y Z tienen el mismo sig-
nificado que en la fórmula (I), en el seno de un disolvente
inerte como acetona y en presencia de KI como catalizador.

10



(II)

15



(III)

Bien entendido que el disolvente y catalizador
no tienen otro carácter que el meramente ilustrativo.

20

El rendimiento de estos derivados así obteni-
dos oscila del 26 al 78 %. Su pureza y estructura se confir-
maron por cromatografía en capa fina, análisis elemental y
espectroscopía U.V., I.R. y N.M.R.

25

Una posible forma de dosificación de estos com-
puestos sería la siguiente fórmula por comprimido:

4- {(dipropilamino)-sulfonil } -benzoato de {(4-metil)- benzoil } -metilo.....	400 mg
Talco.....	8 mg
Lactona.....	42 mg

30

E j e m p l o

METODO GENERAL DE OBTENCION DE LOS ESTERES MIXTOS DEL ACIDO
4- {(dipropilamino)-sulfonil} -benz6ico.

A una suspensi6n de 32,1 g (0,1 moles) de sal
p6tastica del 6cido (II) en 200 ml de acetona anhidra se adi-
cionan 0,09 moles del compuesto (III) y 1 g de IK.

La mezcla se hierve a reflujo durante 22 horas.
El producto de reacci6n se filtra y al l6quido resultante se
adicionan 200 ml de cloruro de metileno. La disoluci6n resul-
tante se lava sucesivamente con 200 ml de agua, 100 ml de so-
luci6n saturada de CO_3NH_4 y 200 ml de agua; sec6ndose poste-
riormente con SO_4Na_2 anhidro. Se elimina el disolvente a va-
c6o y el residuo se recristaliza de etanol.

Seg6n este m6todo general se han sintetizado
los compuestos rese6ados en la Tabla II.

Tabla II

Y	Z	p.f. 6C	Rendimiento %
H	H	83-5	52
H	2-Cl	64-6	36
H	3-Cl	75-7	50
H	4-Cl	97-8,5	48
H	2-CH ₃	61-3	53
H	3-CH ₃	84-6	56
H	4-CH ₃	93-5	40
H	3-CF ₃	65,5-7	42
CH ₃	H	66-9	46
CH ₃	2-Cl	liq.	39
CH ₃	3-Cl	59-61	43

1	Y	Z	p.f. °C	Rendimiento %
	CH ₃	4-Cl	91-3	42
	CH ₃	2-CH ₂	liq.	50
5	CH ₃	3-CH ₃	79-81	36
	CH ₃	4-CH ₃	89-91	52

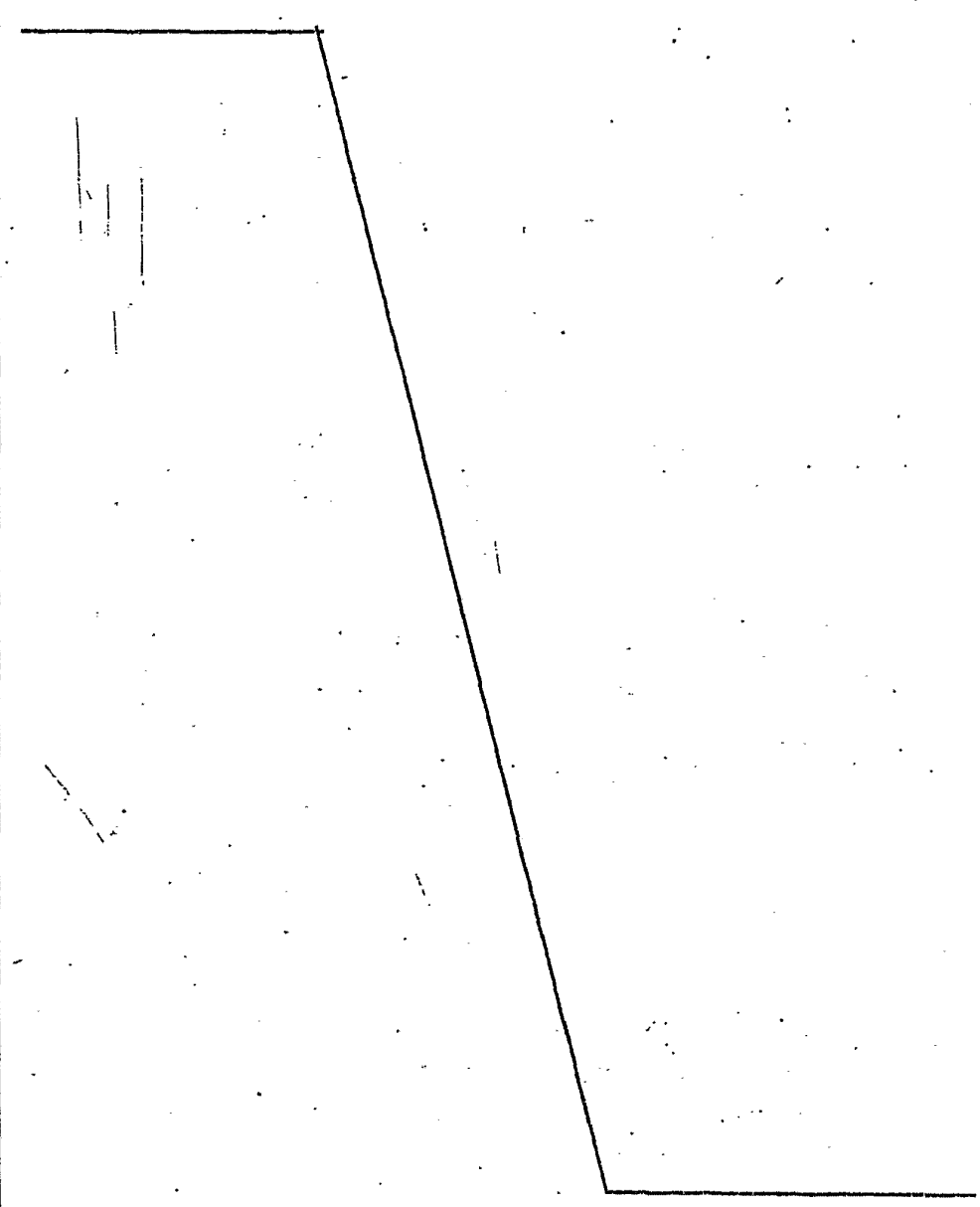
10

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.

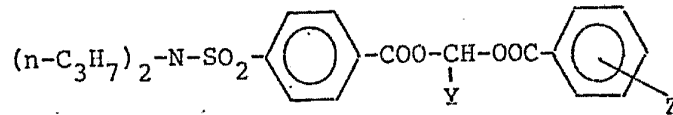
Este principio, en cuanto al alcance de la protec-
ción del objeto patentado se refiere, se halla confirmado
por numerosas Sentencias del Tribunal Supremo, y entre -
ellas, como más terminantes, en las de fechas 16 de octubre
20 de 1954, 23 de enero de 1959, 20 de marzo de 1964 y otras.

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 CIER-
TOS ESTERES MIXTOS DEL ACIDO 4- { (DIPROPILAMINO)-SULFONIL }
-BENZOICO, de fórmula general (I),



(I)

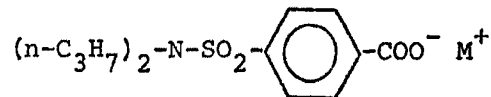
donde Y y Z están reseñados en la tabla (I)

10 Tabla I

Y	Z
H	H
H	2-Cl
H	3-Cl
H	4-Cl
H	2-CH ₃
H	3-CH ₃
H	4-CH ₃
H	3-CF ₃
CH ₃	H
CH ₃	2-Cl
CH ₃	3-Cl
CH ₃	4-Cl
CH ₃	2-CH ₃
CH ₃	3-CH ₃
CH ₃	4-CH ₃

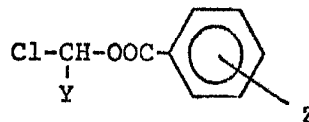
30

1 procedimiento que se caracteriza, porque se hace reaccionar
la sal alcalina (II) con los correspondientes clorometilés-
teres (III), donde Y y Z tienen el mismo significado que en
la fórmula (I), en el seno de un disolvente inerte y en pre-
5 sencia de un catalizador.



(II)

10



(III)

15

2a.- UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CIER-
TOS ESTERES MIXTOS DEL ACIDO 4- {(DIPROPILAMINO)-SULFONIL}
-BENZOICO, según la reivindicación 1, caracterizado porque
el disolvente empleado en la reacción de la sal alcalina (II)
y el clorometiléster (III) es la acetona.

20

3a.- UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CIER-
TOS ESTERES MIXTOS DEL ACIDO 4- {(DIPROPILAMINO)-SULFONIL}
-BENZOICO, según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado
porque el catalizador empleado en la reacción de la sal al-
calina (II) y el clorometiléster (III) es el KI.

25

4a.- Se reivindica por último como objeto so-
bre el que ha de recaer la patente de invención que se soli-
cita: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CIERTOS ESTERES
MIXTOS DEL ACIDO 4- {(DIPROPILAMINO)-SULFONIL}-BENZOICO.

30

