



N° 897.217

Classif. Internat.:

C07C/A61K

Mis en lecture le:

03 -11- 1983

LE Ministre des Affaires Economiques,

Vu la loi du 24 mai 1854 sur les brevets d'invention;

Vu le procès-verbal dressé le 5 juillet 1983 à 15 h. 35
au greffe du Gouvernement provincial d'Anvers;

ARRÊTE :

Article 1. - Il est délivré à la société anonyme dite : LABORATOIRE M.
RICHARD S.A.
Sauzet, 26200 Montelimar (France)
repr. par Mr. M. Bockstael à Anvers,

un brevet d'invention pour: Nouveau médicament anti-inflammatoire,
analgésique et antipyrétique à base de (p-chlorobenzoyl-1,
méthyl-2 méthoxy-5)- indole-3 acétate de p-acétamidophénol,
qu'elle déclare avoir fait l'objet d'une demande de brevet,
non encore accordée à ce jour, déposée en France le 29 mars
1976, n° 76 09 107

Article 2. - Ce brevet lui est délivré sans examen préalable, à ses risques et périls, sans garantie soit de la réalité, de la nouveauté ou du mérite de l'invention, soit de l'exactitude de la description, et sans préjudice du droit des tiers.

Au présent arrêté demeurera joint un des doubles de la spécification de l'invention (mémoire descriptif et éventuellement dessins) signés par l'intéressé et déposés à l'appui de sa demande de brevet.

Bruxelles, le 29 juillet 1983
PAR DELEGATION SPECIALE:

Le Directeur


L. WUYTS

897217

MEMOIRE DESCRIPTIF

déposé à l'appui d'une demande de

BREVET BELGE

formulée par

Société Anonyme dite : LABORATOIRE M. RICHARD S.A.

pour

"Nouveau médicament anti-inflammatoire, analgésique et anti-pyrétique à base de (p-chlorobenzoyl-1, méthyl-2 méthoxy-5)-indole-3 acétate de p-acétamidophénol"

comme

BREVET D'INVENTION.

A toute fin utile, la Demanderesse déclare l'existence de la demande de brevet déposée en France le 29 mars 1976 sous le n° 76 09 107, en son nom, non encore accordée à ce jour.

10

"Nouveau médicament anti-inflammatoire, analgésique et anti-pyrétique à base de (p-chlorobenzoyl-1, méthyl-2 méthoxy-5)-indole-3 acétate de p-acétamidophénol"

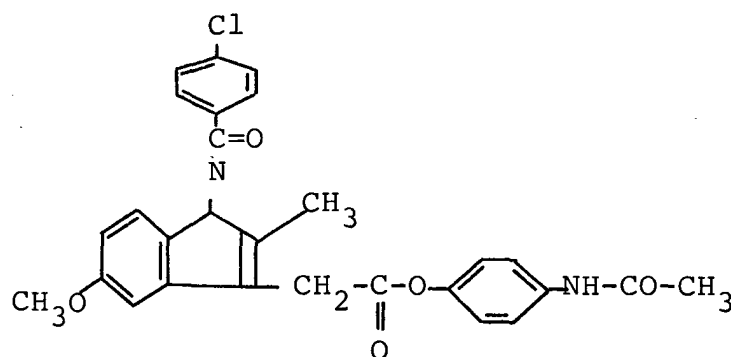
5 Dénomination chimique du produit

(p-chlorobenzoyl-1 méthyl-2 méthoxy-5)-indole-3 acétate de p-acétamidophénol.

Formule développée

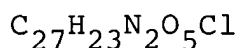
10

15



Formule brute

20



Caractères organoleptiques

Cristaux blancs solubles dans les solvants organiques aromatiques et hydroxylés, solubles dans l'acétone, peu solubles dans l'éther, insolubles dans l'eau.

25

Point de fusion (capillaire non corrigé) 184-186° après cristallisation dans un mélange acétone/éther.

093017

Analyse centésimale

		Théorie	Résultats
	C	66,0	65,44 - 65,47
	H	4,68	4,85 - 4,68
5	N	5,70	5,88 - 5,60

Toxicité

Toxicité aiguë DL 50 chez la souris 4 g par Kg.

Propriétés pharmacologiques

10 Activité anti-inflammatoire : Test au kaolin

Le produit à tester a été administré à la dose de 100 mg/kg

Pourcentage d'inhibition de l'enflure

	au bout de 2 heures	29 %
	3 heures	60%
15	4 heures	55 %
	5 heures	55 %
	6 heures	60 %

Oedème à la carraghénine

Produit administré per os à la dose de 100 mg/kg

20 Pourcentage d'inhibition

	1ère heure	50 %
	2ème heure	40 %
	3ème heure	65 %
	4ème heure	61 %

25 Activité analgésique : Test de siegmund

100 mg/kg per os

Pourcentage global d'inhibition 93 %

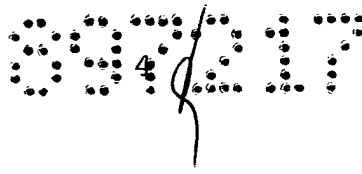
Activité antipyrétique :

100 mg/kg per os chez le lapin

30 Le pourcentage de baisse de température débute vers

3 h 30 après l'ingestion à un taux de 13 %

	après 4 h	37 %
	5 h	59 %
	6 h	82 %
35	7 h	100 %



Essai chimique du médicament

Les tests cliniques effectués avec (p-chlorobenzoyl-1 méthyl-2 méthoxy-5)-indole-3 acétate de p-acétamidophénol ont confirmé l'activité anti-inflammatoire de cette molécule. Sa

5 tolérance clinique s'est révélée particulièrement intéressante. Son action analgésique a pu être objectivée par des essais en double insu, l'activité antipyrétique a également été confirmée.

Les essais ont porté sur des posologies variants de 100 mg

10 à 2 g par jour en plusieurs reprises.

Forme galénique :

Ce médicament pourra être présenté soit à l'état pur, soit en association avec d'autres composants.

15

Usage interne : comprimés, dragées, gélules, capsules de 0,01 à 1 g.

Suspensions et solutés buvables et injectables, poudre, granulés, sirops en toutes concentrations.

20

Usage externe : poudre, suspension, solution, crème, pommade, émulsion.

897217

Revendications.

1.- Composition pharmaceutique solide ou liquide utilisable
en médecine humaine ou vétérinaire, pour traiter par voie
5 orale et rectale, ou par injection intramusculaire ou intra-
veineuse, ou par voie locale, les syndromes douloureux
d'origine inflammatoire associés ou non à des poussées fé-
briles, caractérisée en ce qu'elle contient comme principe
actif le (p-chlorobenzoyl-1 méthyl-2 méthoxy-5)-indole-3
10 acétate de p-acétamidophénol, seul ou associé à d'autres
principes actifs.

2.- Composition selon la revendication 1, caractérisée en
ce qu'elle est présentée sous une forme permettant l'admini-
15 stration de 0,1 mg à 500 mg/kg de produit actif par jour.

3.- Nouveau médicament anti-inflammatoire, analgésique et
anti-pyrétique à base de (p-chlorobenzoyl-1 méthyl-2 méthoxy-
5)-indole-3 acétate de p-acétamidophénol, substantiellement
20 tel que décrit précédemment.

p.pon de : Société Anonyme dite : LABORATOIRE M. RICHARD S.A.
Anvers le 5 juillet 1983.

25 p.pon de : Bureau des Brevets et des
Marques M.F.J. Bockstael S.A.

