

19 RÉPUBLIQUE FRANÇAISE
INSTITUT NATIONAL
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE
PARIS

11 N° de publication :

2 938 438

(à n'utiliser que pour les
commandes de reproduction)

21 N° d'enregistrement national :

08 06411

51 Int Cl⁸ : A 61 K 31/245 (2006.01), A 61 K 31/695, A 61 P 9/10

12

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

A1

22 Date de dépôt : 17.11.08.

30 Priorité :

43 Date de mise à la disposition du public de la
demande : 21.05.10 Bulletin 10/20.

56 Liste des documents cités dans le rapport de
recherche préliminaire : *Se reporter à la fin du
présent fascicule*

60 Références à d'autres documents nationaux
apparentés :

71 Demandeur(s) : GUENOUN GILBERT — FR.

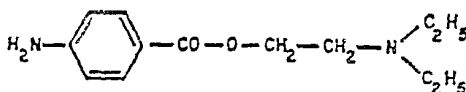
72 Inventeur(s) : NON RENSEIGNE.

73 Titulaire(s) : GUENOUN GILBERT.

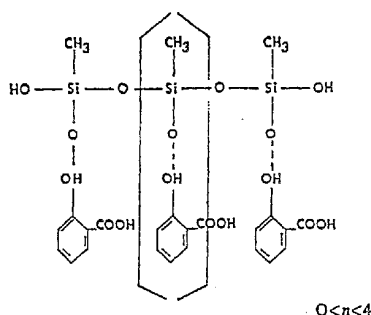
74 Mandataire(s) : GUENOUN GILBERT.

54 COMPOSITION POUR L'ELIMINATION DE LA PLAQUETTE D'ATHEROME.

57 L'invention met en oeuvre un mélange de deux principes actifs pour l'élimination de la plaquette d'athérome: de la procaine de formule:



Et, un alcooxysilane ou ariloxysilane pharmaceutiquement acceptable et, plus particulièrement, le salicylate monométhyltrisilanol de formule



Dans laquelle les liaisons hydrogènes qui unissent les fonctions OH des silanols aux fonctions phénol de l'acide salicylique sont suffisamment fortes pour empêcher, même à haute température, la polycondensation et donc l'insolubilisation du salicylate de monométhyltrisilanol (principe actif d'un médicament commercialisé sous la marque « CONJONCTYL » les proportions des deux principes actifs au sein de la composition administrable par voie intramusculaire, varient de 30 à 60 ml de salicylate de monométhyltrisilanol pour 3 à 10 ml de procaine. La fréquence des injections s'établira en cures de 20 à 40 séances.

FR 2 938 438 - A1



COMPOSITION POUR L'ELIMINATION DE LA PLAQUETTE D'ATHEROME

L'invention concerne une nouvelle composition à caractère pharmaceutique utilisable notamment pour les applications préférentielles suivantes suivante

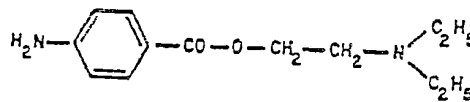
- L'élimination de la plaque d'athérome.
- 5 - Les ischémies circulatoires :
 - Cérébrales :
 - Insuffisances vertébro-basilaires.
 - insuffisances carotidiennes.
 - Des coronaires :
 - 10 - Angine de poitrine.
 - AVC
 - Prévention de l'infarctus du myocarde.
 - Des mésentériques
 - Artérite digestive.
 - 15 - Des membres
 - Artérite des membres inférieurs en traitement médical ou complémentaire d'une intervention chirurgicale restauratrice ou vasodilatatrice
 - Syndrome de Leriche.
 - Syndrome de Raynaud.
- 20 - Anesthésie locale d'infiltration et de conduction
 - Anuries.
 - Troubles neurovégétatifs.
 - Gériatologie.
 - Troubles du vieillissement.

25

L'invention met en œuvre un mélange de deux principes actifs :

- de la procaine de formule :

30



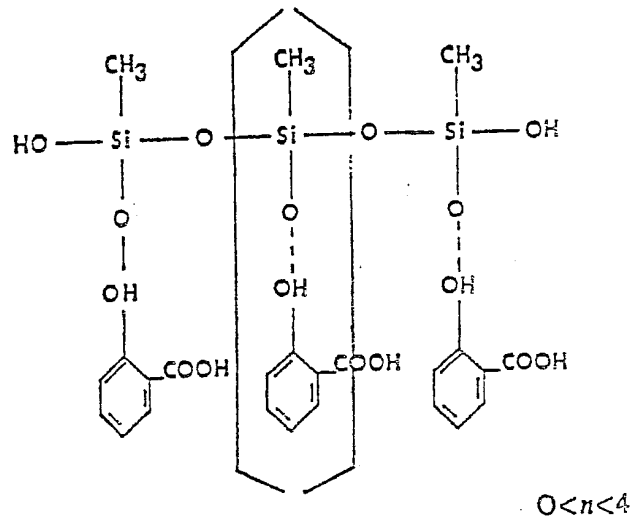
Et, un alcoxysilane ou ariloxysilane pharmaceutiquement acceptable et, plus
 35 particulièrement, le salicylate monométhyltrisilanol de formule

40

5

10

15



Dans laquelle les liaisons hydrogènes qui unissent les fonctions OH des silanols aux fonctions phénol de l'acide salicylique sont suffisamment fortes pour empêcher, même à haute température, la polycondensation et donc l'insolubilisation du salicylate de monométhyltrisilanol (principe actif d'un médicament commercialisé sous la marque « CONJONCTYL »).

Pris individuellement ces principes actifs de médicaments sont bien connus. La procaine a souvent été utilisée comme anesthésique local. Son utilisation en gériatrie a été envisagée. De même, le salicylate de monométhyltrisilanol constitue le principe actif d'un médicament qui, (notamment par voie intraveineuse ou orale, permet une régénération du tissu conjonctif et, plus particulièrement de l'élastine et du collagène lorsqu'ils ont été détériorés sous l'effet de causes pathologiques.

Son utilisation a été recommandée pour le traitement des troubles de l'état général, plus particulièrement dans le domaine rhumatologique (arthroses, rhumatismes inflammatoires et dégénératifs, scléroses des tissus conjonctifs). De même conduit-il, dans un certain nombre de cas, à un meilleur contrôle du taux sanguin de cholestérol, des lipides et des triglycérides, d'où l'application qui en a été envisagée en cardiologie.

L'invention résulte donc de la découverte que l'administration du salicylate monométhyltrisilanol par voie intramusculaire, en présence de procaine, permettrait d'éliminer les plaques d'athérome dans les artères correspondantes.

De préférence, les proportions des deux principes actifs au sein de la composition administrable par voie intramusculaire, varient de 30 à 60 ml de salicylate de monométhyltisilanol pour 3 à 10 ml de procaïne.

Il appartient au praticien de choisir les sites, le nombre et la fréquence des injections intramusculaires. La fréquence des injections s'établira en cures de 20 à 40 séances selon l'importance de la pathologie à traiter.

A titre d'exemple, une proportion galénique appropriée est une solution à 1% de monométhyltrisilanol orthohydroxybenzoate de sodium (4,5 ml), une solution à 1% de procaïne (0,5 ml) et de l'eau pour soluté injectable (q.s.p.) (100 ml).

Il va de soi que les deux principes actifs peuvent être utilisés sous des formes différentes, par exemple sous forme de sel pharmaceutiquement acceptables.

De même les compositions mettant en jeu des analogues de l'un et/ou de l'autre des deux constituants principaux mentionnés ci-dessus entrent elles-mêmes dans le cadre de la protection demandée par l'intermédiaire des revendications qui suivent : par exemple chlorhydrate de diétyl-(2,6 xylidil)-acétamide (marque XYLOCAÏNE) ou chlorhydrate de diéthylamino-2,6-diméthyl=acétanilide (marque LIGNOCAÏNE) en lieu et place de la procaïne.

20

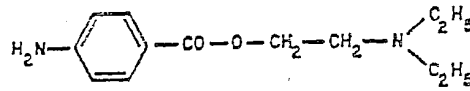
25

30

REVENDEICATIONS :

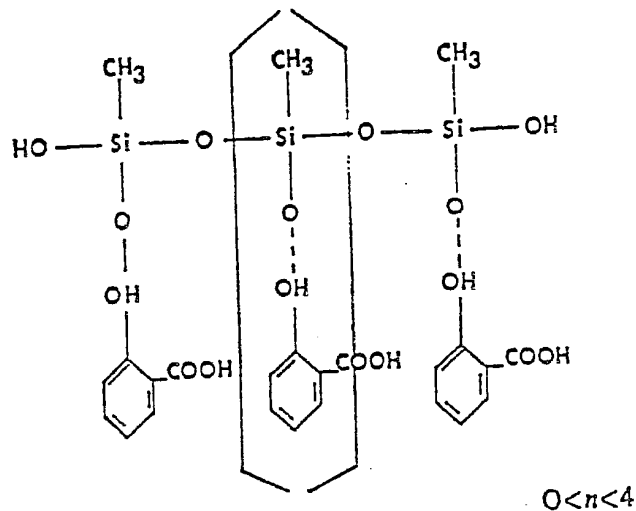
1) Composition pharmaceutique pour l'élimination de la plaquette d'athérome contenant, en association, de la procaine, de formule :

5



et un alcoxysilane ou aryloxysilane pharmaceutiquement acceptable et, plus particulièrement, le salicylate de monométhyltrisilanol de formule :

10



15

20

25

2) composition selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comprend 30 ml de salicylate de monométhyltrisilanol pour 3 ml de procaine.

3) Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comprend 60 ml de salicylate de monométhyltrisilanol pour 10 ml de procaine.

30 4) Composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, caractérisée en ce qu'elle se trouve sous une forme permettant son administration par voie intramusculaire.

5) Utilisation de la composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, pour la production de médicaments utilisables pour :

- L'élimination de la plaque d'athérome.
- Les ischémies circulatoires :
 - 5 - Cérébrales :
 - Insuffisances vertébro-basilaires.
 - insuffisances carotidiennes.
 - Des coronaires :
 - Angine de poitrine.
 - 10 - AVC
 - Prévention de l'infarctus du myocarde.
 - Des méésentériques
 - Artérite digestive.
 - Des membres
 - 15 - Artérite des membres inférieurs en traitement médical ou complémentaire d'une intervention chirurgicale restauratrice ou vasodilatatrice
 - Syndrome de Leriche.
 - Syndrome de Raynaud.
- Anesthésie locale d'infiltration et de conduction
- 20 - Anuries.
- Troubles neurovégétatifs.
- Gériologie.
- Troubles du vieillissement.



**RAPPORT DE RECHERCHE
PRÉLIMINAIRE**

N° d'enregistrement
national

établi sur la base des dernières revendications
déposées avant le commencement de la recherche

FA 716531
FR 0806411

DOCUMENTS CONSIDÉRÉS COMME PERTINENTS		Revendication(s) concernée(s)	Classement attribué à l'invention par l'INPI
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas de besoin, des parties pertinentes		
X	EP 0 391 769 A (GUEYNE JEAN [MC]; SEGUIN MARIE CHRISTINE [MC]; CRUSSOL GILBERT H [FR]) 10 octobre 1990 (1990-10-10) * page 4, ligne 38 - ligne 42 *	1-5	A61K31/245 A61K31/695 A61P9/10
A	FR 2 683 455 A (GUENOUN GILBERT [FR]) 14 mai 1993 (1993-05-14) * le document en entier *	1-5	
A	DATABASE EMBASE [Online] ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL; 1959, ASLAN A ET AL: "Action of procaine (substance H3) in the course of experimental atherosclerosis in rabbits" XP009122435 Database accession no. EMB-0008241536 * le document en entier * & INFORMATION MEDICALE ROUMAINE 1959, vol. APRIL-JUNE, 1959, pages 92-94, ISSN: 0443-1251	1-5	DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHÉS (IPC) A61K A61P
Date d'achèvement de la recherche		Examineur	
8 septembre 2009		Trifilieff-Riolo, S	
CATÉGORIE DES DOCUMENTS CITÉS		T : théorie ou principe à la base de l'invention	
X : particulièrement pertinent à lui seul		E : document de brevet bénéficiant d'une date antérieure	
Y : particulièrement pertinent en combinaison avec un autre document de la même catégorie		à la date de dépôt et qui n'a été publié qu'à cette date de dépôt ou qu'à une date postérieure.	
A : arrière-plan technologique		D : cité dans la demande	
O : divulgation non-écrite		L : cité pour d'autres raisons	
P : document intercalaire		
		& : membre de la même famille, document correspondant	

**ANNEXE AU RAPPORT DE RECHERCHE PRÉLIMINAIRE
RELATIF A LA DEMANDE DE BREVET FRANÇAIS NO. FR 0806411 FA 716531**

La présente annexe indique les membres de la famille de brevets relatifs aux documents brevets cités dans le rapport de recherche préliminaire visé ci-dessus.

Les dits membres sont contenus au fichier informatique de l'Office européen des brevets à la date du 08-09-2009

Les renseignements fournis sont donnés à titre indicatif et n'engagent pas la responsabilité de l'Office européen des brevets, ni de l'Administration française

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
EP 0391769	A	10-10-1990	DE 69007661 D1	05-05-1994
			DE 69007661 T2	06-10-1994
			ES 2052203 T3	01-07-1994
			FR 2645442 A1	12-10-1990
			JP 2290819 A	30-11-1990
			US 5087452 A	11-02-1992

FR 2683455	A	14-05-1993	AUCUN	
