



PATENT

173814

INVENCIÓN

173814

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE SOLUCIONES", a favor de la razón social suiza F. HOFFMANN-LA ROCHE & Cie., Société Anonyme, domiciliada en Basilea (Suiza).-

- . -

#### MEMORIA DESCRIPTIVA

Se ha encontrado que el piridil-3-carbinol es muy apropiado como disolvente, para la preparación de soluciones de medicamentos difícilmente o nó solubles en el agua. Empleando el piridil-3-carbinol, o una mezcla de este cuerpo, con agua como disolvente, la solubilidad, por ejemplo, de la lactoflavina, del ácido etilfenil-barbitúrico, de la 2-metil-naftoquinona-(1,4), de la neohesperidina, de la teofilina, y de otros cuerpos, es mucho más grande que en el agua.

5.

Se puede preparar el piridil-3-carbinol, por ejemplo, haciendo reaccionar ácido nitroso sobre la amina obtenida por reducción del nitrilo del ácido nicotínico. Las soluciones medicamentosas obtenidas por medio del piridil-3-carbinol, pueden ser empleadas tanto por la vía bucal, como por la vía parental; se caracterizan, aún las nó diluídas con agua, por el hecho de que no producen ninguna acción irritante o secundaria en el

10.

15.



113814

organismo.

Los ejemplos que se citan a continuación, sirven para ilustrar la descripción del invento, sin que por éello quede reducido su alcance a estos ejemplos. En éellos, por parte, se entiende las cantidades expresadas en peso, las solubilidades se refieren a la temperatura ambiente, si no hay otra indicación a este respecto.

EJEMPLO 1.

10. 1 parte de lactoflavina es disuelta, a 40°C, en 40 partes de piridil-3-carbinol y 160 partes de agua. Se obtiene de esta manera una solución estable amarilla, con fluorescencia verde.

15. 1 a 1,2 partes de lactoflavina, son solubles a 27,5° C en 10.000 partes de agua. 1 parte de lactoflavina se disuelve en 200 partes de agua de una solución a 20 % en volumen de piridil-3-carbinol en agua.

EJEMPLO 2.

20. Se disuelven 2 partes de ácido etilfenil-barbitúrico en 20 partes de piridil-3-carbinol, y se completa con agua a 100 partes en volumen. La solución incolora es estable.

100 partes de agua a 18° C, disuelven 0,09 partes de ácido etilfenil-barbitúrico. En una mezcla compuesta de 20 partes de piridil-3-carbinol y 80 partes de agua, se puede disolver 2 1/2 partes de ácido etilfenil-barbitúrico.

EJEMPLO 3.

25. 0,5 partes de 2-metil-naftoquinona-(1,4) se disuelven en una solución a pesos iguales de piridil-3-carbinol y de agua, a 100 partes en volumen.

30.- 3 a 4 partes de 2-metil-naftoquinona-(1,4) son solubles en 10.000 partes de agua. 0,5 partes de 2-metil-naftoquinona-



173014

-(1,4) es soluble en 100 partes de piridil-3-carbinol en solución acuosa a 50 %.

EJEMPLO 4.

5. 3 partes de neohesperidina son tratadas por 20 partes de piridil-3-carbinol y 80 partes de agua, lo que da una solución límpida y estable.

10. 6 a 7 partes de neohesperidina son solubles a 18°C en 10.000 partes de agua. 3,8 partes son solubles a 18°C en una mezcla de 20 partes de piridil-3-carbinol y 80 partes de agua.

EJEMPLO 5.

Como en el ejemplo 4, se pueden disolver 6 partes de teofilina en solución de 100 partes en volumen.

15. 0,5 a 1 parte de teofilina es soluble en 100 partes de agua, 6,5 partes de teofilina se disuelven en 100 partes en volumen de una mezcla compuesta de 20 partes de piridil-3-carbinol y 80 partes de agua.

20. La invención, dentro de su esencialidad, puede llevarse a la práctica en otras formas de realización, y con los medios auxiliares más adecuados: por entrar todo dentro del espíritu de las reivindicaciones.

N O T A

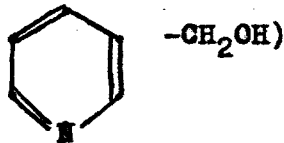
25. Hecha la descripción del presente invento, se hace constar que esta solicitud se acoge a la prioridad de la patente No. 2882, depositada en Suiza en fecha 5 de Junio de 1945, y se declaran como nuevas y de propia invención, las



173014

siguientes reivindicaciones:

- 1ª.- Procedimiento para la preparación de soluciones, de medicamentos no ó difícilmente solubles en el agua, caracterizado por el empleo de mezclas definidas de agua y de piridil-3-carbinol (fórmula  $C_6H_7ON$  6
- 5.



10.

en lugar de emplear agua solamente.

2ª.- Procedimiento para la preparación de soluciones.

- Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de cuatro hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara.
- 15.

Madrid, a 31 de Mayo de 1946.-

F. HOFFMANN-LA ROCHE & Cie., S.A.

JAIÑE IVERN

P.a.

P. P.