



PATENTE **189651**  
DE  
INVENCION **189651**

por "UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE SOLUCIONES, SUSPENSIONES O EMULSIONES DE PENICILINA, ACTIVAS POR VIA GASTRICA O INYECTABLE", a favor de Don Enrique Bassas Grau, de nacionalidad española, residente en Barcelona, Paseo de Gracia, núm. 12.

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de soluciones, suspensiones o emulsiones de penicilina, activas por vía gástrica o inyectable.

Es conocida la casi imposibilidad de lograr un empleo seguro de la penicilina cuando se aplica por vía oral, puesto que los inconvenientes que se presentan son ocasionados por los siguientes motivos:

5. a).- porque la acidez del jugo gástrico destruye la mayor parte de la penicilina.
10. b).- porque aún en el caso de administrar conjuntamente alcalinos, la penicilina que ha logrado salvar la barrera gástrica, es rápidamente inactivada por la penicilinasas intestinal.
15. c).- porque el mal sabor del producto dificulta extraordinariamente su administración.

1 8 9 6 5 1



d).- porque en cualquier caso es necesario administrar grandes cantidades de penicilina, por lo menos cinco veces superiores a las dosis utilizadas para la vía parenteral.

5. Con el procedimiento que se describe se logra que la penicilina sódica comercial tenga en sí los medios que la han de hacer inatacable por el jugo gástrico y, además, que no sea inactivada por la penicilinasasa intestinal, con lo cual la administración por vía oral presentará la misma eficacia y dosificaciones que en la administración parenteral.

10. El procedimiento tiene lugar sometiendo a la penicilina sódica comercial a una transformación que la convierta en una sal penicilina-aluminio y penicilina-cobalto, activa por vía gástrica, a cuyo fin se le agrega una sal de aluminio o una sal de cobalto, por ejemplo, el cloruro de aluminio o el cloruro de cobalto.

15. Estas sales de aluminio o de cobalto, se añaden en forma de solución precipitante, en una proporción de unos 20. 2 c.c. de sal al 2%, para cada 200.000 unidades de penicilina.

20. Seguidamente se incorpora al producto cristalizado o cristalizante un vehículo estabilizador, formado por el para oxibenzoato de metilo, el ácido benzoico, o cualquier derivado benzoico que tenga la propiedad de destruir la penicilinasasa intestinal, o impedir su eliminación cuando se administra conjuntamente con la penicilina por vía oral.

25. Como ejemplo de proporciones a emplear de este vehículo estabilizador, se indica la de 2cc. por cada 200.000 unidades de penicilina transformada en sal penicilina-aluminio o penicilina-cobalto.
- 30.

189651



La aplicación del procedimiento puede realizarse en el frasco de penicilina, dotando a éste de los acoplamientos adecuados para contener por separado los elementos de adición indicados.

5. El producto obtenido tiene las siguientes propiedades:
- a).- es inatacable por el jugo gástrico.
  - b).- es de lenta solubilidad en el tubo digestivo.
  - c).- es de absorción regular.
10. d).- no se inactiva por la penicilinasa intestinal.  
e).- es de lenta eliminación.  
f).- su sabor es agradable.  
g).- requiere las mismas dosis que la administración parenteral.

15. La invención, dentro de su esencialidad, puede ser llevada a la práctica en otras formas de realización que la indicada a título de ejemplo. en la descripción, alcanzando a todas ellas la protección que se recaba. Podrá, pues, ser realizado con los medios y aparatos más apropiados, en proporciones, tiempos y temperaturas más convenientes para lograr el fin propuesto: por quedar todo éllo comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.
- 20.

N O T A

25. Hecha la descripción del presente invento, se declara como nuevas y de propia invención, las siguientes reivindicaciones:

1ª.- Un procedimiento para la preparación de solucio



8 SE

1 8 9 6 5 1

nes, suspensiones o emulsiones de penicilina, activas por vía gástrica o inyectable, caracterizado esencialmente por el hecho de someter a la penicilina sódica comercial a la acción de sales de aluminio o de cobalto, para su transformación, respectivamente, en sales de penicilina-aluminio o penicilina-cobalto, activas por vía gástrica y de acción retardada cuando se administra por vía parenteral.

5.

2ª.- Un procedimiento según la anterior reivindicación, en el que la penicilina corriente comercial, se transforma en penicilina-aluminio, por adición de una sal soluble de aluminio, por ejemplo, el cloruro de aluminio, en proporciones variables, por ejemplo 2 cc. de sal al 2%, por 200.000 unidades de penicilina.

10.

3ª.- Un procedimiento según la reivindicación 1ª, en el que la penicilina comercial se transforma en penicilina-cobalto, por adición de sal soluble de cobalto, en proporciones de 2 cc. de sal al 2'5%, por 200.000 unidades de penicilina.

15.

4ª.- Un procedimiento según las precedentes reivindicaciones, en el que, a la sal penicilina-aluminio o cobalto, se le añade un vehículo estabilizador, formado por el para-oxibenzoato de metilo, el ácido benzoico o cualquier derivado benzoico que tenga la propiedad de estabilizar la penicilina, destruir la penicilinasas intestinal o impedir su eliminación cuando se administra conjuntamente con la penicilina por vía oral, siendo la proporción aproximada, unos 20 cc. por cada 200.000 unidades de penicilina.

20.

25.

5ª.- Un procedimiento según las reivindicaciones anteriores, en el que la transformación se verifica en el propio frasco de la penicilina, preparándola así para su inme-

30.



1 8 9 6 5 1

- 8 SE

diata aplicación.

6ª.- Un procedimiento para la preparación de soluciones, suspensiones o emulsiones de penicilina, activas por vía gástrica o inyectable.

5. Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de cinco hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara, acompañadas de la documentación reglamentaria.

Madrid, a 8 de septiembre de 1949.

ENRIQUE BASSAS GRAU.

P.a.

JAIME ISERN MIRALLES

P. P.

