

196235

196235



28 ENE 1911

*Memoria Descriptiva
de la
Patente de Invención*

que por 20 años, para España y sus Posesiones, se solicita a favor de la firma KNOLL, A.G., de nacionalidad alemana domiciliada en LUDWIGSHAFEN AM RHEIN- ALEMANIA- por: PROCEDIMIENTO PARA OBTENER SOLUCIONES ACUOSAS CONCENTRADAS DE EFECTO ANALGETICO A BASE DE 6-METILAMINO-2-METIL-HEPTANSA-LICILATO.-

-o-o-o-o-o-

Se propuso ya unir en combinaciones dobles la dimetilaminofenildimetilpirazolona como analgético con sales del metilamino 6-metil-2-hepten-2 como espasmolítico. Según obra propuesta se obtiene una solución acuosa concentrada del metilaminometilheptensalicilato que es difícil de disolver, combinandolo con sales solubles de ácidos monocarbónicos aromáticos o con combinaciones dobles solubles de estas sales, como p.ej. dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio, las cuales sirven de mediadores de la disolución.

El 6-metilamino-2-metilheptansalicilato, que asimismo produce un efecto espasmolítico, ofrece, al citado



heptensalicilato correspondiente la ventaja de surtir más o menos el mismo buen efecto espasmolítico sin que la producción sintética de este compuesto presente la menor dificultad. Sin embargo, no es posible emplearlo directamente en combinación con dimetilaminofenildimetilpirazolona para obtener soluciones acuosas de efecto analgético, porque a base de estos dos componentes incluso con un excedente de dimetilaminofenildimetilpirazolona se pueden producir sólo aquellas soluciones acuosas que contienen menos que el 6% y más que el 25% de metilaminometilheptansalicilato mientras que al preparar soluciones cuya concentración corresponde al dominio intermedio, es decir, que contienen el 6-25% de metilaminometilheptansalicilato se forman dos capas sobrepuestas. De esta manera, para obtener soluciones claras falta precisamente aquél dominio de concentración del componente espasmolítico que se necesita para los fines terapéuticos y que está disponible al emplearse el metilaminometilheptensalicilato según la propuesta anterior. Tampoco se obtienen soluciones homogéneas en todos los grados de concentración si se aplica la combinación doble de dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio para que facilite la disolución del metilaminometilheptansalicilato.

Ahora se encontró que se pueden obtener soluciones claras de cualquier concentración de 6-metilamino-2-metilheptansalicilato, agregando dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio y además por lo menos tanto dimetilaminofenildimetilpirazolona cuanto corresponde a la proporción molecular de heptansalicilato: pirazolona como 1:1. Estas soluciones, debido a su alta concentración de pirazolona satisfacen las exigencias terapéuticas como analgético de buen efecto; son apropiadas de modo excelente tanto para ser administradas per os como para la inyección.

Al llevar a cabo este procedimiento se pueden



emplear por un lado el metilaminometilheptansalicilato ya
preparado o la base y el ácido en la proporción cantitativa
estoechiométrica, por otro lado el ya preparado dimetilamino
fenildimetilpirazolona-salicilato de calcio o sus componen-
tes, pirazolona o sea pirazonasalicilato, óxido, hidróxi-
do o carbonato de calcio y ácido salicílico en las cantida-
des calculadas. En caso de que se desee, es posible añadir
a las soluciones además otros fármacos de reacción neutral,
como p.ej. cafeincalciosalicilato, sin que sea reducida la
estabilidad de las soluciones.

Ejemplo 1

Se obtienen soluciones de metilaminometilheptan-salicilato
estables y homogéneas bajo la temperatura de 20°, si los 3
componentes se emplean de la manera siguiente:

	metilamino- metilheptan- salicilato	dimetilamino- fenil-dimetil- pirazolona- salicilato de calcio	dimetilamino- fenil.dimetil pirazolona	agua
60	10 g	20 g	8,2 g	61,8 g
65	o 20 g	20 g	16,4 g	43,6 g
	o 25 g	20 g	20,5 g	34,5 g

En vez de 20 g de dimetilaminofenildimetilpirazolona-salici-
lato de calcio pueden tomarse también 11,91 g de pirazolona
y 9,02 g de salicilato de calcio. 2H₂O.

En este caso la mezcla necesita un leve calentamiento.

Ejemplo 2

Se obtienen soluciones de metilaminometilheptansalicilato es-
tables y homogéneas bajo la temperatura de 20° de la manera
siguiente:

	metilamino- metilheptan- salicilato	dimetilamino- fenildimetil- pirazolona- salicilato de calcio	dimetilamino- fenildimetil- pirazolona	agua
75				



	10 g	10 g	12,1 g	67,9 g
	10 g	20 g	11,6 g	58,4 g
80	10 g	30 g	11,0 g	49,0 g

E j e m p l o 3

Se obtiene una solución de metilaminometilheptansalicilato estable y homogénea bajo la temperatura de 20°, disolviendo 6,17 g de metilaminometilheptansalicilato, 22,5 g de dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio, 5,08 g de dimetilaminofenildimetilpirazolona y 11,25 g de cafeinasalicilato de calcio en 55 c.c. de agua.

-REIVINDICACIONES-

Se reivindica como de la propia y nueva invención la propiedad y explotación exclusivas de:

- 1) Procedimiento para obtener soluciones acuosas concentradas de efecto analgético a base de 6-metilamino-2-metilheptansalicilato, caracterizado por el hecho de que se emplee además de dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio por lo menos tanto dimetilaminofenildimetilpirazolona como mediador de la disolución cuanto corresponde a la proporción molecular de 6-metilamino-2-metilheptansalicilato: dimetilaminofenildimetilpirazolona como 1 : 1.
- 2) Procedimiento para obtener soluciones acuosas concentradas de efecto analgético a base de 6-metilamino-2-metilheptansalicilato, según reivindicación 1, caracterizado por el hecho de que en vez de dimetilaminofenildimetilpirazolona-salicilato de calcio se empleen sus componentes, a saber dimetilaminofenildimetilpirazolona por un lado y óxido, hidróxido o carbonato de calcio así como ácido salicílico por otro, o bien dimetilaminofenildimetilpirazolonasalicilato y óxido, hidróxido o carbonato de calcio.
- 3) Procedimiento, según las reivindicaciones anteriores, ca-

196235 23 ENE



racterizado por el hecho de consistir esencialmente en.

PROCEDIMIENTO PARA OBTENER SOLUCIONES ACUOSAS CONCENTRADAS
DE EFECTO ANALGETICO A BASE DE 6-METILAMINO-2-METIL-HEPTAN-
SALICILATO.-

110

Consta la presente memoria descriptiva de cinco hojas numeradas y mecanografiadas en una sola cara.

MADRID, enero de 1951.-

Rodolfo de la Torre
P. P.