

280 817



280817

PATENTE DE INVENCION

por VEINTE años

en España, a favor de la firma CHUGAI SEIYAKU
KABUSHIKI KAISHA, entidad japonesa, residente
en Nº 3, Nihonbashi Honcho 3-Chome CHUO-KU, To
kio (Japón), cuya patente tiene por objeto:
"PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UN COMPUESTO EFER
VESCENTE".-

MEMORIA DESCRIPTIVA

Esta invención se refiere a un compuesto
que comprende, por lo menos, un ácido glucuró
nico y sus derivados y que se disuelve en el
agua con efervescencia.

5.-

La presente invención se basa en el nuevo
conocimiento de que, cuando el ácido glucoróni

280817



5.-

oo o su derivado se suministra conjuntamente con ácido carbónico, se acelerará su absorción y se comprobará que su acción de aumentar la función hepática y su desintoxicación apareada es inmediatamente efectiva. En la administración del presente compuesto, debe verterse en agua y disolverse con efervescencia y después tomarse, Como el compuesto es sólido, tiene la ventaja de que puede llevarse encima, de que puede tomarse inmediatamente que sea preciso y de que sus efectos se observarán rápidamente.

10.-

15.-

El presente compuesto comprende, por lo menos, cualquier ácido glucurónico y sus derivados y, por lo menos, cualquiera de los ingredientes efervescentes que produzcan burbujas de ácido carbónico en el agua y que, también, pueda contener cualquier ingrediente medicinal, substancia formativa e ingrediente de aderezo.

20.-

25.-

Como ácido glucurónico y sus derivados puede mencionarse, por ejemplo, el ácido glucurónico, la glucuronolactona, la glucuronamida y las sales metálicas solubles en el agua, como el glucuronato sódico, y estéres solubles en el agua, como el glucuronato etílico. Cada uno de ellos ejerce una excelente acción en el aumento de la función hepática y su desintoxicación apareada.

El ingrediente efervescente comprende, por lo menos, cualquiera de los ingredientes ácidos y, por lo menos, cualquiera de las substancias que pueden descomponerse por el ácido para produ

280817



- 5.- cir ácido carbónico. Dichos ingredientes ácidos son, extensamente, sales ácidas y ácidos sólidos orgánicos e inorgánicos. Sin embargo, desde el punto de vista del gusto, estabilidad, toxicidad y formación del compuesto, es preferible utilizar específicamente, por ejemplo, un ácido tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, ácido ascorbico, fumarato monosódico y bifosfato sódico. Como sustancias que pueden descomponerse mediante ácidos que produzcan ácido carbónico, suelen utilizarse carbonatos y bicarbonatos. Por ejemplo, el bicarbonato de sodio es el especialmente preferido.

- 15.- Además de los indicados, hay ingredientes que se añaden según la formación y uso del compuesto. Es decir, como ingredientes medicinales pueden añadirse, convenientemente, por ejemplo: vitaminas, aminoácidos, agentes fortalecedores del hígado, analgésicos o drogas excitantes, de manera que el compuesto pueda ejercer efectos medicinales. En la mayoría de los casos, es preferible componer la mezcla en forma de tabletas. En éstas, pueden añadirse lubricantes hidrosolubles, como es el glicol de polietileno, y excipientes tales como la sacarosa, lactosa, manifa o glucosa, También se añaden sustancias edulcorantes y esencias, de modo que el compuesto pueda administrarse fácilmente.

- 25.-
- 30.- Los efectos inmediatos del ácido glucurónico o de sus derivados, debidos a dicho compuesto, pueden conocerse también gracias a los si-

28000



güentes resultados de ensayos llevados a cabo.

Los compuestos indicados a continuación se disolvieron en agua, con efervescencia, y se administraron a personas normales, midiéndose la concentración de la sangre y la cantidad de excreción en la orina. Para efectos de control, las sustancias individuales disueltas en agua se administraron de la misma forma. Los resultados del control de ambos casos se dan en las siguientes recetas:

5.-

10.-

Receta I:

Glucuronamida	2 g.
Bicarbonato sódico	1 g.
Fumarato monosódico	2 g.

15.-

Receta II:

Glucuronolactona	1,8 g.
Bicarbonato sódico	1 g.
Acido cítrico	1 g.

Control:

20.-

Se utilizaron respectivamente, 2 g. de glucuronamida y 1,8 g. de glucuronolactona.

286317



CUADRO I

Concentración en la sangre (en mg. %)

Personas	Administra- ción.	Tiempo (en horas)									
		0	1	2	3	4	6	8	10	12	16
	Receta I	8,3	9,4	10,4	10,2	9,8	9,5	8,8	8,0	8,2	8,3
H. O. (o)	Control (2 g. de glucurona- mida)	8,9	9,35	9,8	9,55	10,0	10,35	8,6	8,3	8,5	8,9
	Receta II	8,9	10,1	10,7	10,2	9,0	8,2	8,4	8,3	8,0	8,8
S.K. (o)	Control (1,8 g. de glucurono- lactona)	8,7	9,4	9,7	9,4	9,5	9,4	9,0	8,4	8,2	9,1

CUADRO 2

Cantidad de excreción en la orina (mg.)

Personas	Administra- ción.	Tiempo (en horas)						
		-3 - 0	0 - 1	1 - 2	2 - 3	3 - 4	4 - 6	
	Receta I	49,7	63,0	47,0	42,9	30,4	49,0	
H.O. (o)	Control (2g. de glucurona- mida)	51,0	31,7	35,4	59,9	42,5	65,9	
	Receta II	39,2	76,2	87,4	52,8	41,1	50,7	
S.K. (o)	Control (1,8 g. de glucuro nolactona)	42,4	62,6	72,3	66,8	81,6	76,8	

280817



Como podrá verse por los Cuadros 1 y 2, se ha podido averiguar que la concentración en la sangre y la cantidad de excreción en la orina - aumentaron en un plazo muy breve y que la absorción fué más rápida en el caso en el que la glucuronamida o la glucuronolactona se administraron disueltas en agua conjuntamente con un ingrediente efervescente que en el caso de que se hubiesen administrado individualmente.

5.-

10.-

Ejempló 19

Bicarbonato sódico	1000 mg.
Acido cítrico	800 mg.
Acido tartárico	900 mg.
Glucuronamida	1000 mg.

15.-

Substancias edulcorantes:

(Sacarina soluble	2 mg.
(Ciclamato sódico	150 mg.
(Sacarosa	177,85 mg.

Esencia en polvo 30 mg.

20.-

Agente colorante 0,15 mg.

Lubricante (glicol de polietileno 6000) 140 mg.
4200 mg.

Se elaboraron tabletas mediante procedimiento normal, utilizando las substancias arriba indicadas como ingredientes en una tableta.

25.-

Ejemplo 29:

Bicarbonato sódico	1000 mg.
Fumarato monosódico	2000 mg.
Glucuronolactona	200 mg.

280817



	Glucuronato sódico	200 mg.
	Inositol	100 mg.
	Acido tióctico	10 mg.
	Acido orótico	60 mg.
5.-	Substancias edulcorantes:	
	{ Sacarina soluble	2 mg.
	{ Ciclamato sódico	150 mg.
	{ Sacarosa	308 mg.
	Esencia en polvo	30 mg.
10.-	Lubricante (glicol de polietileno 6000)	<u>140 mg.</u> 4200 mg.

Se elaboraron tabletas mediante procedimiento normal, utilizando las substancias arriba indicadas como ingredientes en una tableta.

15.-	<u>Ejemplo 3º:</u>	
	Bicarbonato sódico	1000 mg.
	Fumarato monosódico	2000 mg.
	Glucuronamida	500 mg.
	Acido L-ascórbico	500 mg.
20.-	Hidrocloreuro de tiamina	5 mg.
	Cafeína	50 mg.
	Substancias edulcorantes:	
	{ Sacarina soluble	2 mg.
	{ Ciclamato sódico	150 mg.
	{ Sacarosa	123 mg.
25.-	Esencia en polvo	30 mg.
	Lubricante (glicol de polietileno 6000)	<u>140 mg.</u> 4500 mg.



286817

Se elaboraron tabletas mediante el procedimiento normal, utilizando las sustancias arriba indicadas como ingredientes en una tableta.

Ejemplo 42:

5.-	Bicarbonato sódico	1000 mg.
	Bifosfato sódico	2000 mg.
	Glucuronamida	500 mg.
	Aspertato de magnesio	300 mg.
	Manita	278 mg.
10.-	Substancias edulcorantes:	
	(Sacarina soluble	2 mg.
	{ Ciclamato sódico	150 mg.
	{ Sacarosa	100 mg.
	Esencia en polvo	30 mg.
15.-	Lubricante (glicol de polietileno 6000).	<u>140 mg.</u> 4500 mg.

Se elaboraron tabletas mediante el procedimiento normal, utilizando las sustancias arriba indicadas como ingredientes en una tableta.

20.-
25.-

Descrita convenientemente la naturaleza de la actual Patente de Invención, como asimismo - la forma de poderla llevar a la práctica para convertirla en una realidad industrializable, se hace constar que en la misma serán susceptibles de introducir todas aquellas modificaciones de detalle que las circunstancias y la práctica pudieran aconsejar, siempre y cuando que con las variantes que se introduzcan no se cambie, altere o modifique la esencialidad del objeto descrito.

280817.9



NOTA

Se declaran como de novedad y propiedad para todo el territorio español el contenido de las siguientes:

REIVINDICACIONES

5.-

1ª.- Procedimiento para preparar un compuesto efervescente, de acuerdo con el cual se procede a incorporar cualquier ácido glucurónico y sus derivados, con, por lo menos, un efervescente capaz de producir burbujas de ácido carbónico en el agua.

10.-

2ª.- Procedimiento para preparar un compuesto efervescente, que se caracteriza porque el ácido glucurónico y sus derivados, referidos en el apartado anterior, se incorporan como ácido glucurónico, glucuronolactona, glucuronamida, sales metálicas solubles en el agua, como el glucuronato sódico, y ésteres solubles en el agua, como el glucuronato etílico.

15.-

20.-

3ª.- Procedimiento para preparar un compuesto efervescente, que se caracteriza porque el efervescente capaz de producir burbujas de ácido carbónico en el agua, comprende por lo menos, cualquiera de los ingredientes ácidos y , cualquiera de las sustancias que pueden descomponerse por dichos ácidos para producir ácido carbónico, siendo dichos ingredientes ácido tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, ácido ascórbico, fumarato monosódico y bifosfato sódico y dichas sustancias que puedan producir

25.-

280817



ácido carbónico cuando se descomponen por ácidos que son carbonatos y bicarbonatos.

5.-

4a.- Procedimiento para preparar un compuesto efervescente, que se caracteriza porque a los cuerpos comentados en el apartado anterior se les adiciona además un ingrediente medicinal, siendo estos ingredientes medicinales vitaminas, aminoácidos, agentes fortalecedores del hígado, analgésicos y drogas excitantes.

10.-

5a.- "PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UN COMPOSTO EFERVESCENTE".-

Todo ello, conforme se describe y reivindica en la presente memoria que consta de - - DIEZ hojas escritas a máquina por una sóla de sus caras.

Madrid, 14 de Septiembre de 1.962

YACAS