

326737



326737

P A T E N T E
D E
I N V E N C I O N

a favor de LABORATORIOS MIQUEL, S.A., entidad española,
domiciliada en Barcelona, calle Viladomat, 71, por "PRO-
CEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE QUELATOS METÁLICOS DE
2-IMINO-5-FENIL-4-OXAZOLIDINONA Y PIRIDOXINA".

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedi-
miento para la obtención de quelatos metálicos de 2-imino-
-5fenil-4-oxazolidinona y piridoxina.

5. El 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona ha demostra-
do poseer una acusada acción estimulante del sistema ner-
vioso central, son los efectos colaterales comunes a las
drogas que poseen dicha propiedad.

Las propiedades neurótropas de la vitamina B₆ o
Piridoxina están sobradamente probadas.

10. El objeto de este invento es conseguir una uni-

326737 4 MAY 1954



5. dad molecular en la que concurren, por una parte, una componente estimulante suave del sistema nervioso central y por otra, una componente coenzimática indispensable en los procesos vitales de la célula nerviosa, todo ello complementado con el factor activo constituido por el cligolamento que forma el complejo metálico.

10. Los ensayos farmacológicos realizados con la 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona (I), el quelato de Mg-(I)-piridoxina (II) y el quelato de Co-(I)-piridoxina(III), muestran que: 1ª) la acción estimulante central del (II) es sensiblemente igual a la obtenida por la dosis equivalente de (I); 2ª) la acción estimulante central del (III) es significativamente superior a la obtenida por la dosis equivalente de (I). Por tanto, con el (III) se logra una
15. potenciación de la acción estimulante central de la (I).

20. Se ha comprobado que poniendo en contacto una solución de una oxazolidinona en medio alcalino con una de clorhidrato de piridoxina también alcalinizada previamente y añadiendo a continuación una sal metálica soluble en medio acuoso, obtenemos un compuesto de propiedades y características de propiedades y características definidas.

25. Concretando las características de este invento, observamos que si disolvemos 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona en una mezcla de solución alcalina y un disolvente orgánico, y le adicionamos a dicha solución otra de piridoxina ligeramente alcalina, obtenemos una solución cuyos componentes reaccionan con soluciones acuosas de sales metálicas cobaltosas y magnésicas.

326737 4 MAY.



5. Concretando las características generales antes indicadas hemos podido comprobar que cuando ponemos en contacto, por una parte, una solución alcalina equimolecular de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina y, por otra parte, una solución también equimolecular de cloruro de magnesio en agua, obtenemos el quelato de magnesio 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.

10. Por otra parte si hacemos reaccionar la solución de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina antes citada, con el equivalente de cloruro de cobalto disuelto en agua, obtenemos en este caso el quelato de cobalto-2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.

15. Las bandas más importantes de absorción en el infrarrojo de 2,5 a 16 μ de los productos antes citados son:

a 2,82 μ vibración "stretching" OH de piridoxina
a 3 - 3,4 μ vibración "stretching" NH de oxazolidinona
a 6,09 - 6,16 μ vibración "stretching" C=N y C=C aromático
a 6,66 - 6,72 μ vibración "stretching" C=C aromático
20. a 6,96 - 7,02 μ "out of plane deformation" CH saturado
a 8,20 - 8,24 μ vibración "stretching" C - O - C en anillo
a 13,40 - 15 μ "out of plane deformation" C- H monosustitución
25. a 14,34 - 14,48 μ "out of plane deformation" C-H monosustitución.

Para facilitar la comprensión se cita a continuación unos ejemplos no limitativos del alcance del invento.

326737



4 MAY

EJEMPLO 1

Quelato de magnesio-2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.

5. Se disuelven 0,025 moles (4,4 g) de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona en 50 ml de etanol, y se adiciona con agitación, NaOH al 20% hasta su completa disolución.

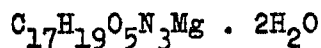
10. A esta solución se le añade, con agitación, otra formada por 0,025 moles (5,14 g.) de piridoxina clorhidrato en 100 ml de agua que previamente se ha alcalinizado ligeramente con NaOH al 20%.

Esta disolución total se precipita con 0,025 moles (5,08 g) de $Cl_2Mg \cdot 6H_2O$ en 25 ml. de agua ajustando a pH 10,5. Se deja agitar durante una hora, se filtra y se seca.

15. Análisis elemental.

	<u>Calculado</u>	<u>Encontrado</u>
% de Mg	6,00	6 - 5,9
% de N	10,35	9,2 - 9,3
% de C	50,35	46,6 - 46,7
20. % de H	5,67	5,29- 5,17

Fórmula empírica:



Peso molecular: 405,49

25.

EJEMPLO 2.

Quelato de cobalto-2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.



Se disuelven 0,025 moles (4,4 g) de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidona en 50 ml de etanol y se adiciona, con agitación NaOH al 20% hasta su completa disolución.

5. A esta solución se le añade, con agitación, otra formada por 0,025 moles (5,14 g) de piridoxina clorhidrato en 100 ml de agua que previamente se ha alcalinizado ligeramente con NaOH al 20%.

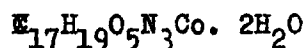
10. Esta disolución total se precipita con 0,025 moles (3,25 g) de Cl_2Co en 25 ml de agua, ajustando el pH a 10,5.

Se deja agitando durante una hora, se filtra y se seca.

Análisis elemental.

	<u>Calculado</u>	<u>Encontrado</u>
15. % de Co.	13,39	12,7 - 12,6
% de N.	9,54	9,4 - 9,2
% de C.	46,39	44,7 - 44,5
% de H.	5,22	4,34 - 4,48

20. Fórmula empírica:



Peso molecular: 440,11

25. Serán independientes del alcance de la invención los detalles accesorios tales como los medios y aparatos empleados en la puesta en práctica de la misma, por quedar todo ello comprendido en el espíritu de las siguientes reivindicaciones.

326737

4 MAY. 1948



N O T A

Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

5. 1. Procedimiento para la obtención de quelatos metálicos de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina, caracterizado esencialmente por el hecho de hacer reaccionar conjuntamente soluciones alcalinas de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y de piridoxina, con soluciones acuosas de sales metálicas.
10. 2. Procedimiento para la obtención de quelatos metálicos de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar una solución alcalina de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina, con cloruro magnésico disuelto en agua, para obtener el quelato de magnesio-2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.
15. 3. Procedimiento para la obtención de quelatos metálicos de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar conjuntamente soluciones alcalinas de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y de piridoxina, con cloruro cobaltoso, para obtener el quelato de cobalto-2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona-piridoxina.
20. 4. Procedimiento para la obtención de quelatos metálicos de 2-imino-5-fenil-4-oxazolidinona y piridoxina.
25. La presente memoria consta de siete hojas foliadas

326737

L 4 MA



escritas a máquina por una sola cara.

Barcelona, 4 de mayo de 1.966

LABORATORIOS MIQUEL, S.A.

p.a.