

374659



PATENTE DE INVENCION

INB 5571/72.

## *Memoria Descriptiva*

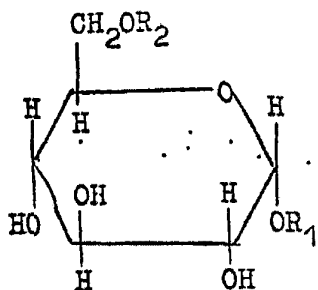
*sobre:*

PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE GLUCOSA-FOSFATOS  
DE 2-METIL 6-AMINO HEPTANO-2-OL.

SECCION TECNICA
CLASIFICACION I. P. C.
CLASE <u>C-07</u> <u>A-61</u>
SUBCLASE <u>F</u> <u>4</u>

*Solicitante:* DAUSSE S.A., entidad francesa, residente en 58, rue  
de la Glacière, París, Francia.

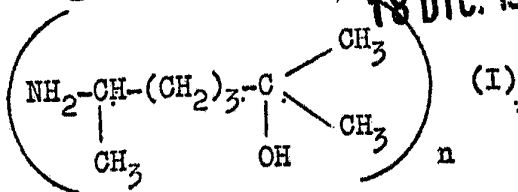
La presente invención se refiere a nuevos glu-  
cosa-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-ol de fórmula  
general (I)



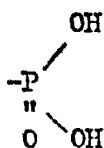
374659



18 DIC. 1962



en la que uno de los radicales R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> representa un grupo fosforilo,



siendo el otro un átomo de hidrógeno, y n es igual a 1 ó a 2.

5. La invención comprende un procedimiento de preparación de los nuevos compuestos (I), según el cual se pone en presencia, en un disolvente orgánico, elegido de preferencia entre los alcoholes de bajo peso molecular, que contienen de 1 a 4 átomos de carbono, una molécula de ácido glucosa-fosfórico con n moléculas de 2-metil 6-amino heptano-2-ol.
- 10.

Se aísla la sal formada concentrando la solución a baja temperatura, es decir sin sobrepasar los 35 grados C y bajo vacío residual igual o inferior a 20 mm de mercurio.

15.

Los glucosa-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-ol (I) para los cuales n = 2, son sólidos blancos, muy solubles en agua y en los alcoholes. Los glucosa-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-ol (I) en los que n = 1 dan soluciones acuosas muy ácidas, que se utilizan de preferencia en forma de derivado alcalino o alcalino-

20.

374659



-térreo, por ejemplo en forma de derivados sódico ó cálcico.

Los glucosa-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-ol según la invención poseen propiedades farmacológicas que les hacen preciosos para la terapéutica. Ejercen todos los efectos del 2-metil 6-amino heptano-2-ol, principalmente sobre la contracción muscular y más particularmente sobre la contracción del miocardio. Pero estos efectos están reforzados por el par ácido de su molécula, que proporciona al organismo, en su forma biológicamente activa, la glucosa, elemento indispensable de la contracción muscular.

5.  
10.

Los nuevos glucosa-fosfatos pueden utilizarse para preparar medicamentos destinados a la terapéutica cardiovascular y desfatigante.

Los ejemplos siguientes ilustran la invención sin presentar sin embargo carácter limitativo.

15.

EJEMPLO 1

Glucosa-1-fosfato de bis (2'-metil 6'-amino heptano-2'-ol).

Se disuelven 26 g (0,1 mol/g) de ácido glucosa-fosfórico y 29,5 g (0,2 mol/g) de 2-metil 6-amino heptano-2-ol en 250 ml de alcohol etílico absoluto. Se filtra y se evapora el disolvente del filtrado al baño-maría bajo vacío (20 mm de mercurio) teniendo cuidado de que la temperatura del baño-maría no sobrepase los 35°. Se recoge el glucosa-1-fosfato de bis (2'-metil 6'-amino heptano-2' ol) en forma de un sólido cristalizado blanco, no higroscópico, soluble en agua y los alcoholes.

20.  
25.

Análisis	$C_{22}H_{51}O_{11}N_2P$	(550)		
Calculado %:	C 48,00	H 9,27	N 5,09	P 5,63
30. Encontrado %:	47,76	9,15	5,00	5,45



374659

EJEMPLO 2

Glucosa-6-fosfato de bis(2'-metil 6'-amino heptano-2'-ol).

5. Se disuelven 26 g (0,1 mol/g) de ácido glucosa-6-fosfórico y 29,5 g (0,2 mol/g) de 2-metil 6-amino heptano-2-ol en 200 ml de alcohol absoluto. Se filtra sobre negro animal o vegetal para eliminar una ligera turbidez y se evapora el disolvente del filtrado al baño-maría bajo vacío (20 mm de mercurio) teniendo cuidado de que la temperatura del baño-
10. -maría no sobrepase de 30-35°. Se recoge el glucosa-6-fosfato de bis (2'-metil 6'-amino heptano-2'-ol) en forma de una sustancia cristalizada blanca, muy soluble en agua y los alcoholes.

Análisis  $C_{22}H_{51}O_{11}N_2P$  (550)

15.	- Calculado %:	C 48,00	H 9,27	N 5,09	P 5,63
	Encontrado %	47,91	9,40	5,21	5,82
		48,12	9,38	5,18	5,75

EJEMPLO 3

Glucosa-1-fosfato de 2'-metil-6'-amino-heptano-2'-ol

20. Se disuelven 13 g (0,05 mol/g) de ácido glucosa-1 fosfórico y 7,4 g (0,05 mol/g) de 2-metil-6-amino-heptano-2-ol en 100 ml de alcohol etílico absoluto. Se filtra y se evapora el disolvente del filtrado al baño-maría bajo vacío (20 mm de mercurio) teniendo cuidado de que la temperatura del baño-
25. -maría no sobrepase los 35°.

- Se recoge el glucosa-1-fosfato de 2'-metil-6'-amino-heptano -2'-ol en forma de un sólido cristalizado blanco, soluble en los alcoholes y en agua

Análisis:  $C_{14}H_{32}O_{11}N P$  (405)

30.	Calculado %:	C 41,50	H 7,91	N 3,46	P 7,65
	Encontrado	41,27	7,93	3,51	7,39
		41,39	7,75	3,27	7,45

374659



EJEMPLO 4

Glucosa-6-fosfato de 2'-metil-6'-amino-heptano-2'-ol.

Se disuelven 39 g (0,15 mol/g) de ácido glucosa-6-fosfórico y 22,2 g (0,15 mol/g) de 2-metil-6-amino-heptano-2-ol en 100 ml de alcohol absoluto. Se filtra y se evapora el disolvente del filtrado al baño-maría bajo vacío (20 mm de mercurio) teniendo cuidado de que la temperatura del baño-maría no sobrepase de 35 a 40°.

Se recogen la glucosa-6-fosfato de 2'-metil-6'-amino-heptano-2'-ol en forma de un sólido cristalizado blanco, soluble en los alcoholes y soluble en agua.

Análisis:  $C_{14}H_{32}O_{11}NP$

	Calculado %:	C	41,50	H	7,91	N	3,46	P	7,65
	Encontrado %:		41,59		8,07		3,45		7,81
15.			41,73		7,63		3,59		7,49

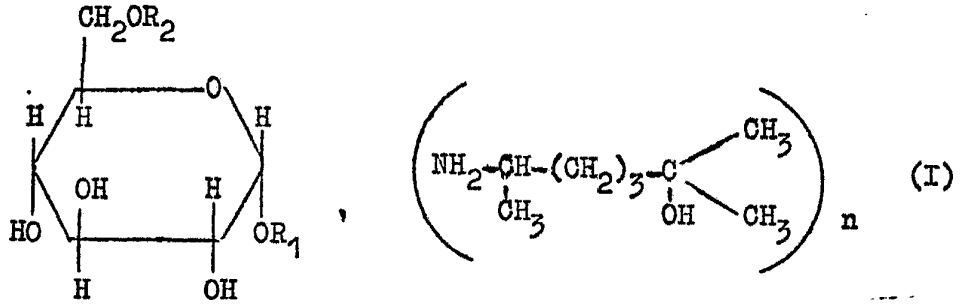
N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de Patente presentada en Francia con fecha y número siguiente: 18 de diciembre de 1968, nº 178.786; acogiéndose por lo tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor. Siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España sobre: Procedimiento para la preparación de glucosa-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-OL; caracterizándose por lo siguiente:

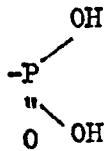
374659



1.- Procedimiento para la preparación de glucosa-  
-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-OL de fórmula general  
(I)



5. en la que uno de los radicales  $\text{R}_1$  y  $\text{R}_2$  representa un grupo fosforilo,



y el otro un átomo de hidrógeno, y  $n$  es igual a 1 ó 2, caracterizado porque se pone en presencia de una molécula de ácido glucosa-1 ó 6-fosforico con  $n$  moléculas de 2-metil 6-amino heptano-2-ol en un disolvente orgánico.

10. 2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente orgánico es un alcohol de bajo peso molecular, que contiene de 1 a 4 átomos de carbono.

15. 3.- Procedimiento según la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque sal formada, se aísla concentrando la solución a una temperatura que no sobrepase de 35 grados centígrados y bajo un vacío residual igual o in-

374659



ferior a 20 mm de mercurio.

4.- Procedimiento para la preparación de glucosa-  
-fosfatos de 2-metil 6-amino heptano-2-OL; tal y como  
queda descrito sustancialmente en la presente Memoria.

5. Esta Memoria consta de siete hojas escritas a  
máquina por una sola cara.

Madrid,

18 DICIEMBRE 1959

DAUSSE S.A.

GÓMEZ ACEBO Y MODA

Firmado: F. Hernández Esté