

376906

376906

P. - 44.080



CO7 D 213/67, 31/30, 209/20, 27/56

18 A

Memoria descriptiva

SECCION
CLASIFICACION
CLASE	e 07
SUBCLASE	D

para solicitar PATENTE DE INVENCION EN ESPAÑA por 20 años

a nombre de LABORATORIOS MADE, S.A.

entidad / ~~de nacionalidad~~ española

con domicilio en Avenida de Burgos, Km. 5,850, Madrid

por: "UN METODO DE OBTENCION DE ALFA-CETOGLUTARATO DE PIRIDOXINA Y 5-HIDROXITRIPTOFANO"

(Clase Internacional CO7d)

=====

11.4.72.

376906



En la patente española nº 360.566 otorgada a Laboratorios Made, se describe un método para la obtención de α -cetoglutarato de piridoxina y sus derivados.

5 La presente invención se refiere a un método para la preparación del compuesto formado por la sal anterior con el 5-hidroxitriptófano. Esta nueva sal del 5-hidroxitriptófano tiene la gran ventaja de favorecer la solubilidad del último y aumentar la estabilidad del mismo, muy baja en otro tipo de disoluciones.

10 El método general de síntesis de este compuesto consiste en disolver el α -cetoglutarato de piridoxina (piriglutina ^(R)) en agua destilada y agregar con agitación la cantidad estequiométrica de 5-hidroxitriptófano, liofilizando a continuación la disolución resultante o
15 precipitando la sal sólida mediante un disolvente orgánico soluble en agua.

Ejemplo:

En un matraz se ponen 315,28 g (1 mol) α -cetoglutarato de piridoxina y 1000 ml de agua, se disuelve con agitación mediante un agitador electromagnético y una vez disuelto se comienzan a agregar 220,23 g
20 (1 mol) de 5-hidroxitriptófano, poco a poco, según se vaya disolviendo. Una vez terminada la adición, se filtra sobre placa para eliminar algún sólido ocasional en suspensión y se somete a liofilizado a temperatura ambiente
25 y a una presión de 2×10^{-2} mm de Hg.

La sal, largas agujas blancas, formada con rendimiento prácticamente cuantitativo, se cristaliza, y una vez seca a vacío sobre pentóxido de fósforo, a la temperatura ambiente, se manda analizar.

30
11.4.72.

376906



Calculado para $C_{24}H_{29}N_3O_{11}$:

C: 53,83%; H: 5,41%; N: 7,43%

Encontrado:

C: 53,88%; H: 5,42%; N: 7,53%

5 Espectro Infrarrojo:

Además de las bandas correspondientes al α -cetolutarato de piridoxina, que figuran en la patente citada anteriormente, aparecen bandas a 3.400 y 1.200 cm^{-1} (OH fenólico), aunque parcialmente solapadas con las de la sustancia madre.

10

Espectro de Resonancia Magnética Nuclear. Aparecen bandas a $\tau = 7,75$ (3 hidrógenos correspondientes al metilo de la piridoxina) $7,4$ (4 hidrógenos correspondientes a los dos metilenos del ácido α -cetoglutarico); $6,9$ (2 hidrógenos correspondientes al metileno del aminoácido); $6,2$ (1 hidrógeno correspondiente al metileno del aminoácido); $5,5$ (4 hidrógenos correspondientes a los hidrógenos metilénicos de los grupos alcohólicos de la piridoxina); $3,4$ (1 hidrógeno correspondiente al H en α -pirrólico); $2,8-3,3$ (3 hidrógenos aromáticos del anillo indólico); $2,2$ (1 hidrógeno correspondiente al α -piridínico) p.p.m.

15

20

Espectro Ultravioleta:

Presenta un máximo a $293 \text{ m}\mu$ ($\log \epsilon = 4,051$).

25

El producto es un sólido blanco, cristalizado en forma de agujas que se descompone a 110°C , aunque comienza a ablandarse mucho antes. Es soluble en agua e insoluble en disolventes apolares.

El producto obtenido por este método es nuevo, por lo que se sabe no está descrito en la bibliografía,

30
11.4.72.

376906

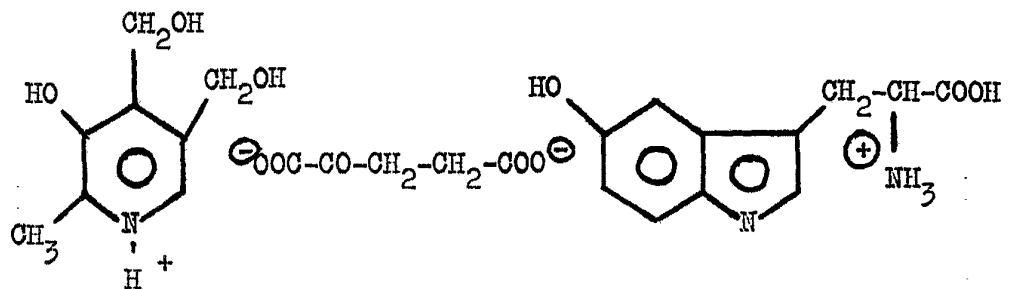


y en las aplicaciones específicas a que está destinado, tiene las ventajas de aumentar la estabilidad del 5-hidroxitriptófano, así como su solubilidad en agua.

REIVINDICACIONES

5 Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

10 1.- Un método de obtención de alfa-cetoglutarato de piridoxina y 5-hidroxitriptófano, caracterizado porque se hacen reaccionar disueltos en agua el α -cetoglutarato de piridoxina y el 5-hidroxitriptófano, aislando a continuación la sal producida por concentración o precipitación, y que tiene la fórmula:



2.- Un método de obtención de alfa-cetoglutarato de piridoxina y 5-hidroxitriptófano.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que

16
11.4.72.

376906

18 ABR



antecede y para los fines que se han especificado.

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

18 ABR 1972

Madrid,

P. A.

Alberto de Ezarburu
Por Poderes

G.D.S.
11.4.72.