

385222



CO7C 000/000

385222

SECCION TECNICA
CLASIFICACION
NUMERO 007 AGI
SUBCLASE C K

PATENTE DE INVENCION

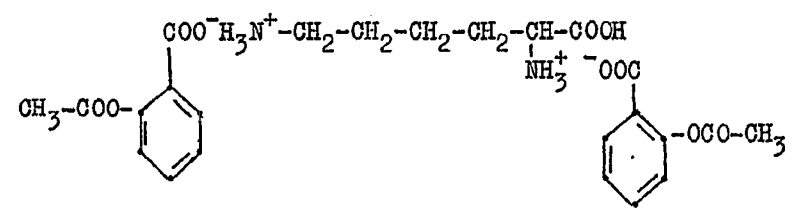
a favor de

LABORATORIOS LIADE S.A., de nacionalidad española, residente en Madrid, Josquin Costa nº 26, por: "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UNA SAL SOLUBLE DEL ACIDO ACETIL SALICILICO"

Memoria descriptiva

El objeto de esta invención es el de sintetizar una sal del ácido acetilsalicílico con el aminoácido básico lisina, de fórmula

5



que se caracteriza por su notable solubilidad en H₂O, y que sobre lo ya existente tiene las siguientes ventajas:

10

a) El acetilsalicilato de lisina posee actividades analgésicas, antiinflamatorias, antipiréticas y antirreumáticas y en



general todo el espectro farmacológico del ácido acetilsalicílico.

15 b) La gran ventaja de este producto sobre otros análogos es su buena solubilidad en agua, permitiendo así la administración parenteral, y evitando los grandes transtornos gástricos producidos con la terapéutica salicílica.

20 c) Administrado por vía oral y debido a su perfecta solubilidad se evitan las grandes concentraciones de producto en algunos puntos de la mucosa, y evitándose por tanto la aparición de úlceras y gastritis, tan frecuentes tras la administración prolongada de salicílicos.

d) Administrado por vía oral, dada su gran solubilidad, se alcanzan niveles hemáticos elevados en solo algunos minutos.

25 e) La DL 50 tanto por vía oral como parenteral es muy elevada lo que permite un campo de manejabilidad terapéutica superior al de los otros derivados salicílicos.

30 El proceso mediante el cual se une el ácido acetilsalicílico al aminoácido básico lisina se lleva a cabo disolviendo la lisina base en H₂O y adicionando sobre ésta disolución, el ácido acetilsalicílico disuelto en diversos alcoholes como etanol, propanol, isopropanol o terc. butanol. Disolviendo la aspirina en estos alcoholes se evita la desacetilación parcial del ácido acetilsalicílico. Por otra parte se ha podido comprobar que a diferencia de otras sales de aspirina que

35

385222



hidrolizan más fácilmente que la aspirina misma, esta nueva sal se desacetila solamente en condiciones enérgicas, ebullición prolongada con H₂O, ácidos fuertes, ó alcalis etc.

40 La nueva sal cristaliza en agua isopropanol 1:7, y tiene un punto de fusión de 258^o C.

El acetilsalicilato de lisina presenta un espectro ultravioleta característico con máximos a 229 m μ y 276 m μ . Por el método de Trinder's se ha determinado el contenido de aspirina por mol, resultando ser 360,4 g (71,14%). Presenta 45 bandas características en el infrarrojo.

Ejemplo

1,4 g (0,01 mol) de lisina base son disueltos en 3 cc. de agua destilada caliente, se añaden con buena agitación 3,6 g (0,02 moles) de ácido acetilsalicílico en 20 cc. 50 de alcohol isopropílico. Se agita durante 30 minutos y se deja enfriar en nevera. El acetilsalicilato de lisina cristaliza en forma de placas paralelepipedicas de punto de fusión 258^o

REIVINDICACIONES
=====

1).- Procedimiento de obtención de una sal soluble 55 del ácido acetyl salicílico, caracterizado porque el ácido acetilsalicílico es unido al aminoácido básico lisina.

2).- Procedimiento según la reivindicación anterior, caracterizado porque el compuesto acetilsalicilato de lisina se obtiene mediante disolución de lisina base en agua.

3).- Procedimiento según las reivindicaciones anterior

60



res, caracterizado porque el ácido acetilsalicílico es sometido, antes de la salificación, a un proceso de disolución en alcohol.

65

4).- Procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los alcoholes usados preferentemente son etanol, n-propanol, isopropanol o terc. butanol.

5).- Procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque el porcentaje de ácido acetilsalicílico en la sal es de un 71% aproximadamente.

70

6).- "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UNA SAL SOLUBLE DEL ACIDO ACETILSALICILICO"

Esta memoria consta de 4 hojas foliadas y mecanografiadas por un solo lado de sus caras.

Madrid, 5 de noviembre de 1970