

401645



401645

Int. Cl.: C07C

PATENTE DE INVENCION QUE POR VEINTE AÑOS  
SE SOLICITA EN ESPAÑA, A FAVOR DE ALTER, S.A.,  
SOCIEDAD ESPAÑOLA, DOMICILIADA EN MADRID, MATEO  
INURRIA, 30, POR: "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTEN-  
CION DE UN PREPARADO A BASE DE INOSINA Y N-ACE-  
TIL-PARA-AMINOBENZOATO DE 1-DIMETILAMINO-PROPA-  
NOL-2".

~~~~~

M E M O R I A

Como su enunciado indica, la presente in-  
vención consiste en un procedimiento para la -  
obtención de un compuesto de aplicación farma-  
céutica, de propiedades antivirales y de acción

401645

2.-

10



5

comprobada en el mejoramiento de la memoria.

10

El procedimiento que se preconiza tiene -  
por objeto la obtención de un preparado a base  
de inosina y N-acetil-para-aminobenzoato de -  
l-dimetilamino-propanol-2 y cuyo método a seguir  
es el que a continuación se describe.

15

20

Son conocidas, por los trabajos científicos  
publicados, las propiedades farmacológicas de -  
ciertos dialquilamino-alcohóles combinados con  
inosina y se ha demostrado por la experimenta-  
ción realizada en cobayas, que resultan de inte-  
rés farmacéutico por sus propiedades antivirales  
y para el mejoramiento de la memoria y de ellas  
se ha obtenido un producto basado en la unión en  
tre sí en forma compleja, un compuesto a base de  
inosina y aminoalcoholes, tales como el l-dimeti-  
lamino isopropanol con el aminoalcohol en forma  
de sales con ácido, tales como el ácido para-ace-  
tamidobenzoico.

25

Entre los aminoalcoholes empleados, el de  
mayor uso es el l-dimetilamino-propanol-2, que  
en combinación con inosina forma un complejo en  
determinadas proporciones con efectos más marca-  
dos.

30

Las propiedades más resaltadas son las an-  
tivirales; así como el incremento de memoria en  
experimentos realizados en cobayas, por favore-  
cer la síntesis de proteínas y asimismo, de áci-  
do ribonucleico en cerebro. Con estos anteceden-  
tes y los ensayos realizados en nuestros labo-

401645

3.-10



35

ratorios, exponemos lo siguiente:

40

45

Entre el compuesto de inosina y N-acetil-para-aminobenzoato de l-N-dimetilamino isopropanol-1-2 pueden lograrse diferentes proporciones, dándose el caso de existir entre los mismos una relación en forma de complejo que es necesariamente la composición óptima para su uso terapéutico. De modo general podemos señalar que se emplean con resultados satisfactorios compuestos diversos que van desde 1/2 mol de N-acetil-para-aminobenzoato de l-N-dimetilamino propanol-2 por cada mol de inosina hasta 4 moles del primero - por cada mol del segundo, no siendo limitativas las proporciones de ambas sustancias a las cantidades que exponemos en los ejemplos siguientes:

50

55

60

Ejemplo 1º.- Se disuelve en 50 c.c. de agua destilada 3,096 gr. de l-dimetilamino-propanol-2, 0,03, moles, y, a continuación, se añade a temperatura ambiente, 5,37 de ácido acetamidobenzoico, 0,03 moles. Se agita hasta que la solución queda transparente, se adicionan a continuación 2,862 g. de inosina, 0,01 mol y se concentra a vacío, hasta un volumen aproximado de 15 cc. Se calienta anteriormente a 70º 15 minutos y se concentra a sequedad a vacío en baño de agua a 70º, obteniéndose 10,1 g. de producto de color crema.

Ejemplo 2º.- En un recipiente de 50 cc. se colocan 3,096 g. de N-dimetilamino-propanol-2 disueltos en 8 cc. de agua; se añaden 5,37 g. de ácido acetamidobenzoico. Se agita después, ca-

401645

10



4.-

65                   lentando a 70° y adicionando a continuación 2,68  
g. de inosina. Se continúa luego agitando a 70°  
hasta que la solución sea transparente. Una vez  
que se mantiene 15 minutos a la temperatura men-  
cionada, se enfría hasta congelación y se elimi-  
70 na el agua por liofilización, obteniéndose así  
un polvo de color crema.

                  Descritas suficientemente las característi-  
cas de esta invención, los puntos nuevos por los  
que se demanda protección consisten en las si-  
75 guientes

#### REIVINDICACIONES

1ª.- "Procedimiento para la obtención de  
un preparado a base de inosina y N-acetil-para-  
aminobenzoato de l-dimetilamino-propanol-2", ca-  
80 racterizado por consistir en la unión entre sí  
en forma compleja, ciertos dialquilemino-alcoho-  
les combinados con inosina y aminoalcoholes, ta-  
les como el l-dimetilamino-isopropanol con el -  
aminoalcohol en forma de sales con ácidos, ta-  
85 les como el ácido para-acetamidobenzóico o, con  
el l-dimetilamino-propanol-2 en forma de comple-  
jo, un caso u otro según las proporciones.

2ª.- "Procedimiento para la obtención de  
un preparado a base de inosina y N-acetil-para-  
aminobenzoato de l-dimetilamino-propanol-2", ca-  
90 racterizado porque el producto es obtenido al  
disolver en 50 cc. de agua destilada, 3,096 g.  
de l-dimetilamino-propanol-2, 0,03 moles, y, a  
continuación, se añade a temperatura ambiente

*M*

401645

5.- 10



95 5,37 de ácido acetamidobenzoico, 0,03 moles. Se  
agita hasta que la solución queda transparente,  
se adicionan a continuación, 2,682 g. de inosina,  
0,01 mol y se concentra a vacío, hasta un volu-  
men aproximado de 15 cc. Se calienta ulteriom<sup>en</sup>  
100 te a 70° 15 minutos y se concentra a sequeda a  
vacío en baño de agua de 70°, obteniéndose 10,1  
g. de producto de color crema.

3ª.- "Procedimiento para la obtención de un  
preparado a base de inosina y N-acetil-para-ami-  
105 nobenzoato de 1-dimetilamino-propanol-2", carac-  
terizado porque en otro ejemplo para obtener un  
complejo en proporciones con efectos más marca-  
dos la obtención es, en un recipiente de 50 cc.  
se colocan 3,096 g. de N-dimetilamino-propanol-2  
110 disueltos en 8 cc. de agua; se añaden 5,37 g. de  
ácido acetamidobenzoico. Se agita después, calen-  
tando a 70° y adicionando a continuación 2,68 g.  
de inosina. Se continúa luego agitando a 70° has-  
ta que la solución sea transparente. Una vez que  
115 se mantiene 15 minutos a la temperatura menciona-  
da, se enfría hasta congelación y se elimina el  
agua por liofilización, obteniéndose así un pol-  
vo de color crema.

4ª.- "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN  
120 PREPARADO A BASE DE INOSINA Y N-ACETIL-PARA-AMI-  
NOBENZOATO DE 1-DIMETILAMINO-PROPANOL-2".

La presente Memoria consta de CINCO HOJAS  
mecanografiadas a doble espacio, por una sola  
cara y de CIENTO VEINTIUNA LINEAS.

401645

6.-

10



Madrid, 10 de Abril de 1.972,

*[Handwritten signature]*

*[Handwritten mark]*