



412267

Int. Cl.: C07C 1/A61K

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

por "UN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE SALES SOLUBLES DE LISINA CON ACIDOS FENILACETICOS SUSTITUIDOS, CON ACTIVIDAD ANALGESICA", a favor de la firma española, ANTONIO GALLARDO, S.A., residente en Barcelona, C/. Cardener, 72-74.

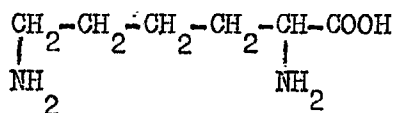
= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente patente de invención se relaciona con un procedimiento de obtención de sales de lisina con ácidos fenilacéticos sustituidos.

Dichas sales se obtienen partiendo del ácido α -

5. ϵ -diaminocaproico de fórmula



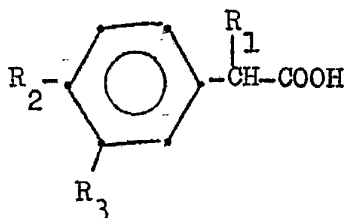
10. el cual se hace reaccionar usando un solvente polar como agua, alcohol etílico o metílico, a temperatura entre 20 y 50 $^{\circ}$ C., en cantidades estequiométricas, con ácidos fenilacéticos sustituidos de fórmula general:

412267

- 2 MAR 1974



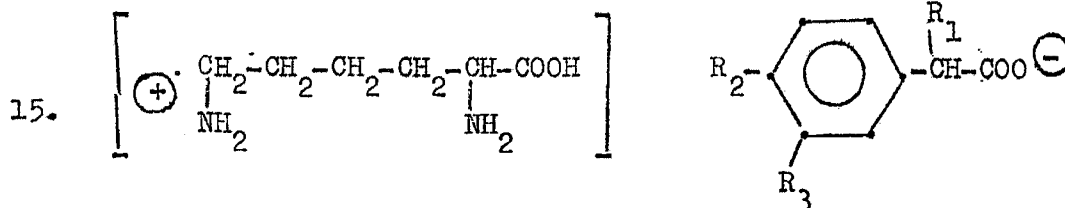
5.



donde R₁ puede ser H ó metilo, R₂ isobutil ó aliloxi y R₃, H ó cloro.

10.

Las disoluciones resultantes de la reacción por liofilización proporcionan compuestos que son sales de fórmula general:



con gran poder analgésico al que suman su facilidad de administración en fórmulas inyectables carentes de dolor.

20.

A continuación se describen algunos ejemplos:

EJEMPLO 1

2-(4-isobutilfenil) propionato de lisina

25.

A una suspensión de 6 g. (0,03 moles) de ácido 2-(4-isobutilfenil) propiónico en 50 ml. de agua, se añaden 4,4 g. (0,03 moles) de una disolución de lisina al 50% en agua. Se calienta suavemente hasta disolución completa. Se filtra y liofiliza. Queda un polvo blanco que pesó 9,7 g. P.F. = 181-2°.

412267

- 2 -



EJEMPLO 2

3-cloro-4-aliloxifenilacetato de lisina

A una suspensión de 6,8 g. (0,03 moles) del ácido 3-cloro-4-aliloxifenilacético en 50 ml. de agua se añaden 4,4 g. (0,03 moles) de una disolución de lisina al 50% en agua. Se calienta suavemente hasta disolución y filtra. El filtrado se liofiliza. Rinde un polvo blanco que pesó 10,1 g. P. F. = 173-5º

REIVINDICACIONES

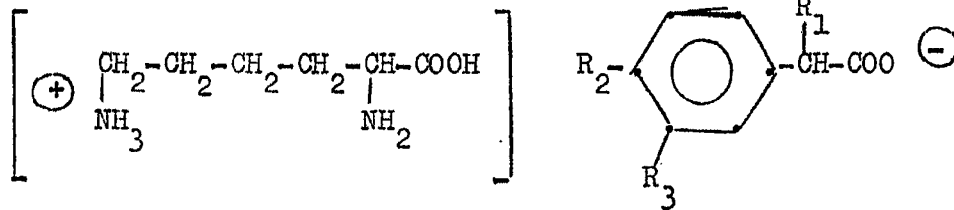
10.

Descrito el objeto del presente invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones:

15.

1.- Un procedimiento para la obtención de sales solubles de lisina con ácidos fenilacéticos sustituidos, con actividad analgésica, que responden a la estructura siguiente:

20.



25. donde R₁ puede ser H ó metilo; R₂ isobutil o aliloxi y R₃, H ó cloro, y caracterizado por la reacción de las sustancias mencionadas en solventes iónicos, agua, alcohol o metanol, entre 20 y 50º.

2.- Un procedimiento según la reivindicación anterior y caracterizado por la separación del producto final de la reacción por liofilización.

3.- Un procedimiento para la obtención de sales solubles

412267-2 MAR.



de lisina con ácidos fenilacéticos sustituidos, con actividad analgésica.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 4 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

5.

Madrid, a 2 de Marzo de 1973.

p.a. M.^a LUISA ISERN CUYAS
p. p.

~~_____~~
Firmado: JESÚS F. NÚÑO

fm.