



415.348

PATENTE DE INVENCION

MEMORIA DESCRIPTIVA

CO7C; A61K

Sobre:

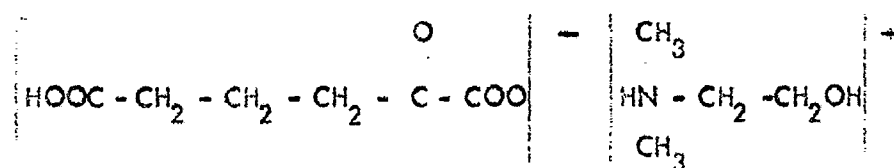
"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO
DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO"

Solicitante: La Entidad española: ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS
UNIVERSALES, S.A. (ELMU, S.A.), domiciliado en Madrid, C/ -
Emilio Vargas, nº 2.-

Inventores: Don Fernando MONTORO
Don Antonio VILA-CORO
Don José CALATAYUD.

**POOR
QUALITY**

Esta invención tiene por objeto la síntesis del compuesto α -oxo-glutarato de 2-Dimetilamino-etanol de estructura



5.- Este compuesto se caracteriza por su actividad como estimulante del sistema nervioso central.

10.- El ácido α -oxo-glutarico, como precursor del ácido glutámico, juega un papel de gran importancia en el metabolismo cerebral, ya que es capaz de cruzar la barrera hematoencefalica para dar lugar a la formación del ácido glutámico a nivel del cerebro. El 2-Dimetilamino-etanol por su parte también cruza la barrera hematoencefalica ejerciendo una acción estimulante central.

En el compuesto objeto de esta patente se han aunado estas propiedades en un solo producto consiguiéndose además una mayor estabilidad de las soluciones acuosas.

15.- Las pruebas farmacológicas realizadas permiten comprobar que el compuesto aumenta la capacidad de aprendizaje en ratas, mejorando además su aspecto y estado de nutrición por aumentar la ingesta diaria. También se ha constatado una actividad antitóxica frente a barbitúricos y en general frente a aquellos productos que se metabolizan en el hígado.

20.- El empleo terapéutico de este producto está indicado en estados de fatigabilidad psíquica, trastornos de la memoria y del estado de ánimo, estados astenodepresivos, apatía y trastornos anoréxicos debidos al empleo de medicamentos con acción sedante, tranquilizante o depresiva, astenias psico-somáticas, manifestacio-

.../...

nes psíquicas y neurológicas de la arteriosclerosis cerebral, defatigante físico general, abulia, fatiga corporal, síndromes de sobrecarga, hepatopatías, convalecencias, anemias, así como para depresiones benignas.

5.- El compuesto se muestra prácticamente atóxico pudiendo utilizarse a dosis terapéuticas de hasta cinco gramos por día. La administración puede realizarse - por vía parenteral, oral (solución, comprimidos, cápsulas, etc.) y en forma de su positorios.

DESCRIPCION DEL PROCESO

10.- Para obtener el compuesto α -oxo-glutarato de 2-Dimetilamino-etanol se ha partido del ácido α -oxo-glutarico y 2-Dimetilamino-etanol. Se han ensayado diversos medios de reacción resultando ser los idóneos aquellos disolventes que tienen un grupo nitrilo. Ha sido particularmente ventajoso para nosotros el acetonitrilo. En este caso el rendimiento es cuantitativo y puede aislarse el producto - en forma muy pura. Empleando medios alcoholicos el rendimiento es mucho más ba
15.- jo y resulta, además, un pproducto que contiene humedad y es muy difícil de secar. Empleando medios acuosos o alcoholicos-acuosos esta situación se hace mucho más patente.

20.- Se ha estudiado también la temperatura de trabajo y el margen idóneo ha resultado ser entre los cero y diez grados centígrados. Si se emplean temperaturas ma yores del orden de los treinta a cuarenta grados se forma el compuesto en forma de un aceite viscoso muy difícil de cristalizar.

La invención será descrita en el ejemplo que sigue sin que el mismo deba ser considerado como una limitación del objeto de la invención.

EJEMPLO:

25.- 49,2 gr. (0,34 moles) de ácido α -oxo-glutarico son disueltos con agitación a 45 $^{\circ}$ en 150 cc de acetonitrilo. Se enfría entre cero y cinco $^{\circ}$ C y entonces se añ da gota a gota con fuerte agitación una disolución formada por 31 gr (0,35 moles) de 2-Dimetilamino-etanol en 100 cc de acetonitrilo. El conjunto se mantiene en agita

../...

ción durante una hora y aparece un precipitado de α -oxo-glutarato de 2-Dimetilamino-etanol que se introduce durante tres o cuatro horas en un refrigerador. Se obtienen 76 gr del producto.

Rendimiento: 96%

5.- Punto de fusión: 66°C (tubo cerrado)

ANALISIS ELEMENTAL

ENCONTRADO			CALCULADO		
% C	% H	% N	% C	% H	% N
45,87	7,28	5,82	45,96	7,23	5,95

CONTENIDO EN 2-DIMETILAMINO-ETANOL: 37,87%

CONTENIDO EN ACIDO α -OXO-GLUTARICO: 62,13%

10.- ESPECTRO INFRARROJO: Se indica en la figura 1.

NOTA

La Patente de Invención que se solicita por veinte años para España, de acuerdo con la vigente Legislación deberá recaer sobre "PROCEDIMIENTO DE OBTENCIÓN DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO" según las características esenciales de las siguientes

15.-

REIVINDICACIONES

1.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCIÓN DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO caracterizado porque se hacen reaccionar proporciones equimoleculares de ácido α -oxo-glutarico y 2-Dimetilamino-etanol.

20.-

..//...



5.- 2.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO según reivindicación anterior caracterizado porque el medio de reacción empleado puede ser un nitrilo de peso molecular bajo, resultando ser el más ventajoso el acetonitrilo.

3.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO según reivindicación primera caracterizado porque la temperatura de la reacción puede oscilar entre 0º C y 5º C.

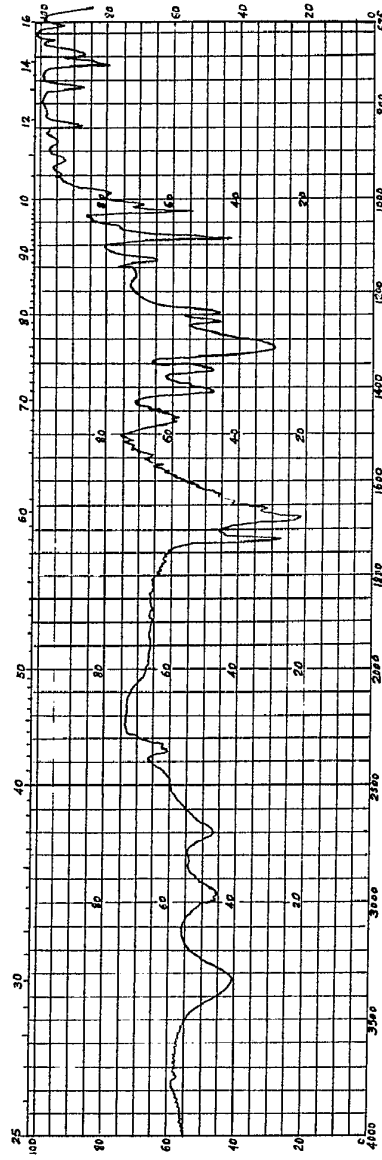
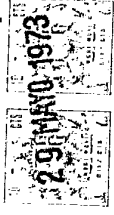
10.- 4.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL COMPUESTO α -OXO-GLUTARATO DE 2-DIMETILAMINO-ETANOL FISIOLÓGICAMENTE ACTIVO

Según queda sustancialmente descrito en la presente memoria que consta de 4 hojas, escritas a máquina, por una sola cara, tablas y dibujo.

Madrid, 29 de Mayo de 1.973.

Especialidades Lólicas - Productos Químicos
"ELMU", S. A.

Consejero-Delegado

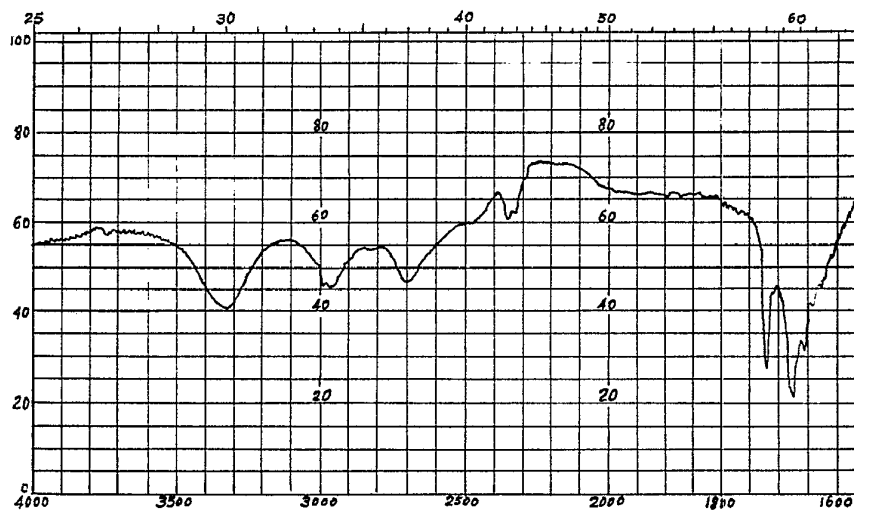


Essala variable
Madrid: 29 MAYO 1973

ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVERSALES
"ELMU", S. A.

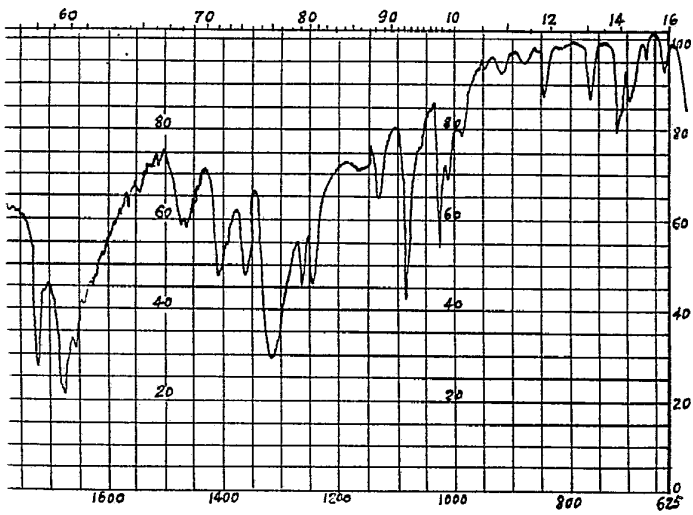
Concepción Balaguer

ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVERSALES, S.A. (ELMU, S.A.)



4.)

- HOJA UNICA -



Escala variable
Madrid: 29 MAYO 1973

Especialidades Lótimos-Medicamentos Universitarios
"ELMU", S. A.

Consejera Delegada