

416005



Int. Cl.²: C07F

F.C. 16-6-75

416005

MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Invención a nombre de:
BOEHRINGER MANNHEIM, S.A., de nacionali-
dad española, domiciliada en Barcelona -
6, Copérnico 61 y 63; por: "PROCEDIMIEN-
TO PARA LA OBTENCION DE γ -AMINO- β -HIDRO
XIBUTIRATO DE ALUMINIO".

-----ooo000ooo-----

Los antiácidos son de uso frecuente para corregir el pH de los fluidos gástricos en los casos de hiperacidez, especialmente cuando se padece por la existencia de úlcera gástrica o duodenal.

5

El objetivo fundamental de los antiácidos es alzar el pH por encima del valor 3.0, donde se encuentre el llamado "umbral del dolor", y sin superar el valor de 5.0 ya que anularía la actividad de la pepsina con el consiguiente entorpecimiento del proceso digestivo.

Los antiácidos sistémicos empleados, tal es el bicarbonato sódico, elevan considerablemente el pH, con lo



14/5

416005

que se produce, además del inconveniente mencionado, una estimulación de la secreción gástrica y nuevo descenso del pH. No es menos estimable la alteración que provoca en el equilibrio ácido-base del organismo.

5 Los antiácidos no sistémicos evitan estos inconvenientes si bien no producen alivio inmediato del dolor dada su lentitud de acción.

El estado de hiperexcitabilidad es frecuente en las personas afectadas por trastornos gástricos o duodenales por lo que un tratamiento moderador de esta hiperexcitabilidad es recomendable.

El producto obtenido por el procedimiento objeto de esta patente, el γ -amino- β -hidroxibutirato básico de aluminio, posee:

- 15 - acción neutralizadora rápida por el grupo amino
- acción neutralizadora retardada por el grupo - $\text{Al} \begin{matrix} \text{OH} \\ \text{OH} \end{matrix}$
- acción central moderadora de la excitabilidad por el γ -amino- β -hidroxibutirico que se libera en intestino siendo absorbible.
- 20 - el pH del jugo gástrico queda comprendido en el margen 3.0 - 4.1

El γ -amino- β -hidroxibutirato básico de aluminio es un producto de fórmula definida $\text{C}_4 \text{H}_{10} \text{O}_5 \text{N Al}$. Su comportamiento frente a los ácidos se distingue claramente del de una mezcla del ácido y del hidróxido de aluminio en proporción equivalente al compuesto mencionado. Tal diferencia se

416005



La reacción puede tener lugar a proporciones equimoleculares o con exceso del ácido.

5 La reacción puede realizarse en solución acuosa diluida o concentrada del ácido e independientemente de este factor, la temperatura a la cual se mantiene la reacción puede estar comprendida entre 5°C - 100°C. El alcoholato de aluminio puede añadirse sobre la solución acuosa del ácido en forma sólida, fundida o en solución del propio alcohol empleado. Se produce un precipitado de γ -amino- β -hidroxibutirato
10 básico de aluminio que se filtra succionando. Puede secarse al vacío o a 105 - 110°C.

Las variaciones indicadas afectan a la capacidad para formar suspensiones de mayor o menos velocidad de sedimentación.

15 EJEMPLO 1

A 130 partes de γ -amino- β -hidroxibutírico y 150 de agua a 80°C se le añaden progresivamente 205 partes de isopropilato de aluminio bajo agitación moderada. Una vez finalizada la reacción, filtrar succionando. Secar al vacío a
20 50°C.

EJEMPLO 2

A 120 partes de γ -amino- β -hidroxibutírico y 50 partes de agua a 5°C de temperatura se le añade en porciones, 205 partes de isopropilato de aluminio alternativamente con
25 porciones de hielo para evitar el ascenso de la temperatura



416005

sobre los 45°C.

El precipitado obtenido se filtra bajo succión y se deseca al vacío a 40°C.

N O T A

5 Se reivindica como nuevo y de propia invención.

1.- Procedimiento para la obtención de γ -amino- β -hidroxibutirato básico de aluminio, caracterizado porque comprende la adición de un alcoholato de aluminio de 2 a 5 átomos de carbono sobre una disolución de γ -amino- β -hidroxibutírico y posterior filtrado y secado del precipitado obtenido.

10

2.- Procedimiento, según reivindicación anterior, caracterizado porque el alcoholato de aluminio que se adiciona es isopropilato, isobutirato o etilato de aluminio.

15

3.- Procedimiento, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la adición del alcoholato de aluminio es en forma sólida o en forma fundida o en una disolución del alcohol correspondiente.

20

4.- Procedimiento, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la proporción de los reaccionantes es equimolecular, estando prevista también la posibilidad de una ligera mayor proporción de aminoácido.

25

5.- Procedimiento, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la reacción comienza a + 5°C con baño de hielo y posteriormente se compensa el calor desarrollado por adición de porciones de hielo.



416005

6.- Procedimiento, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la reacción tiene lugar a alta concentración del ácido, para lo cual la temperatura de reacción es alrededor de 80°C.

5

7.- Procedimiento, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque el precipitado obtenido se filtra bajo succión y seca al vacío a 40-50°C, estando prevista también la desecación a temperaturas comprendidas entre 105-110°C.

10

8.- "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE γ -AMINO- β -HIDROXIBUTIRATO DE ALUMINIO".

Tal como se describe y reivindica en la presente Memoria Descriptiva, que consta de seis hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 16 JUN. 1973

