

A39555

Int. Cl.: CO7C/AG1K

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

por "UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE ACETILSALICILATO DE ARGININA", a favor de la firma española, Laboratorios Viñas, S.A. domiciliada en BARCELONA, Torrente de Vidalet, nº 29.

= . =

A39555

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a una nueva sal del ácido acetilsalicílico para usos industriales y farmacéuticos.

- Se conocen las propiedades farmacológicas del
5. ácido acetilsalicílico. Mediante esta nueva sal se eliminan los inconvenientes del ácido acetilsalicílico, debidos sustancialmente a su insolubilidad. Ello hace que:

- La administración del medicamento por vía oral produce una irritación de la mucosa gástrica, con las
10. posibles consecuencias de : hemorragia masiva u oculta, úlcera gastroduodenal, intolerancia gástrica.

forma lacas en alcohol y cloroformo, Insoluble en éter, cetona, benceno, dioxano etc.

Fórmula empírica = $C_{15}H_{22}O_6N_4$

50,8% C, 6,21% H, 15,82% N, 27,12% O

5. La invención tiene por objeto la preparación del acetilsalicilato de arginina, en la que se hace reaccionar la arginina base o el carbonato de arginina con el ácido acetilsalicílico a una temperatura inferior a 100 C, en un medio disolvente. Es mejor realizar la reacción a temperaturas cercanas a 0°C, para evitar procesos de hidrólisis.

10. La curva de neutralización representada en la figura ilustra el proceso. En esta figura la ordenada representa los valores del pH y la abcisa representa mililitros de arginina 0,5 N. Cuando se utiliza como solvente el agua, se recomienda liofilizar como última etapa.

Ejemplo 1º

20. 17 gramos de arginina base son colocados en un recipiente adecuado para que se pueda pasar una corriente de anhídrido carbónico, se añaden 35 ml. de agua y seguidamente se pasa la corriente de anhídrido carbónico a fin de obtener el carbonato de arginina. Una vez formado éste, se enfría la solución a una temperatura cercana a 0°C. En este momento se añade poco a poco y con agitación 18 gramos de ácido acetilsalicílico, se continúa agitando hasta una completa reacción. Finalmente se liofiliza la solución obteniéndose el acetilsalicilato de arginina, de características físicas, químicas y farmacológicas correctas.

Ejemplo 2º

- 20 gramos de arginina se hacen reaccionar, con agitación, en medio alcohólico (40 ml. alcohol metílico) con 20 gramos de ácido acetilsalicílico a temperatura cercana a 0°C a fin de obtener el acetilsalicilato de arginina, una vez formado éste, se filtra, se lava con metanol y se seca en estufa de aire sin calentar. Se obtiene 32 gramos de acetilsalicilato de arginina, que pueden tamizarse y esterilizarse, presentando características físico-químicas y farmacológicas correctas.
- 5.
10. Ejemplo 3º
1,8 gramos de arginina base se disuelven a temperatura ordinaria en 50 ml. de agua, una vez disuelta toda la arginina se enfría a temperatura cercana a 0°C. En este momento se añade poco a poco y con agitación 1,8 gramos de ácido acetilsalicílico, hasta completa reacción de todo el acetilsalicílico. Finalmente se liofiliza la solución obteniéndose el acetilsalicilato de arginina de características físico-químicas y farmacológicas correctas.
- 15.
20. El acetilsalicilato de arginina, consecuente de la invención, es un medicamento adaptado a la administración oral, rectal, intramuscular y endovenosa.
Se puede formular en polvo de 0,5 a 4 gramos destinados a la dilución extemporánea para la administración parenteral en algunos ml. de agua o soluciones fisiológicas
- 25.

REIVINDICACIONES

Descrito el objeto del presente invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindi-

caciones.

5. 1. Un procedimiento de preparación de acetilsalicilato de arginina, caracterizado por hacer reaccionar, en medio disolvente, la arginina base o una sal de arginina, con ácido acetilsalicílico, a temperatura inferiores a 100°C y preferentemente alrededor de 0°C, cristalizándose el acetilsalicilato en el disolvente.

2. Un procedimiento de preparación de acetilsalicilato de arginina.

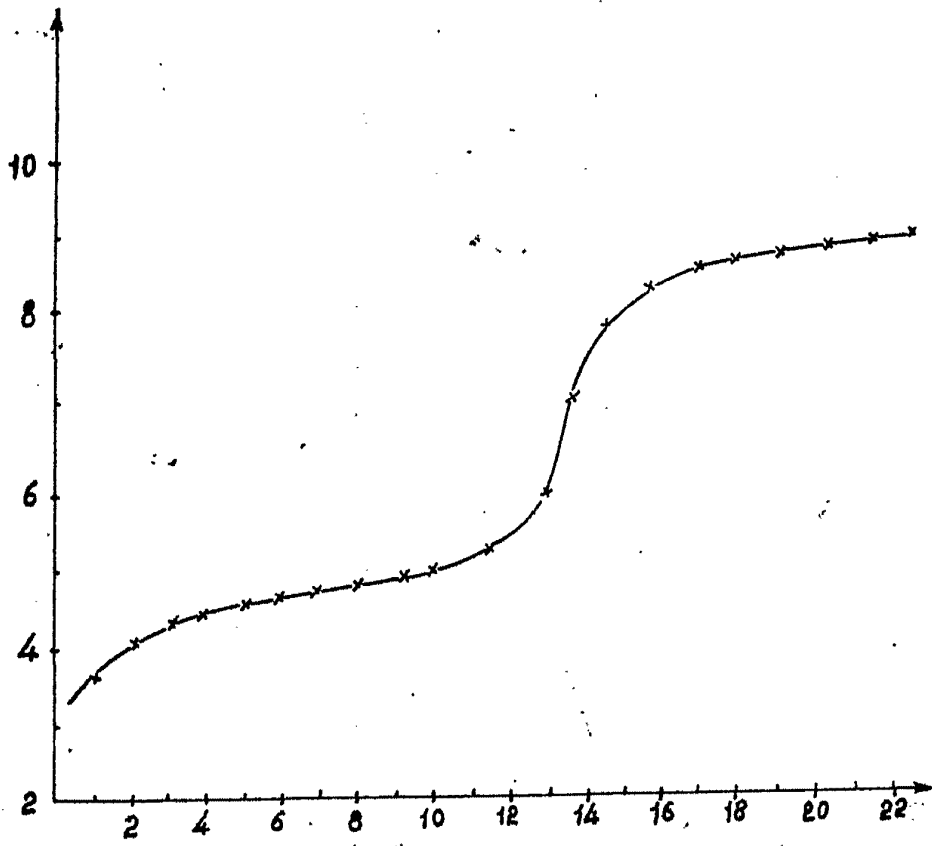
10. Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de 5 páginas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 17 Julio 1975

p. a.

p. p. JAIME ISERN

Firmado: JOSE F. NIETO



Madrid, o 17 JUL. 1975

p. o.

JAIME ISERN

p. p.

Firmado: JOSE F. NIETO