

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

| | | | |
|---------|---------------------------|--------|--------|
| (1) ES | (2) NÚMERO | 446254 | (3) A3 |
| (4) (5) | (6) FECHA DE PRESENTACIÓN | | |

PATENTE DE INTRODUCCION

| | |
|--------------------------|---|
| (47) FECHA DE PUBLICIDAD | (51) CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D/A61K |
|--------------------------|---|

| |
|--|
| (64) TITULO DE LA INVENCIÓN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE PIRROLIDONCARBOXILATO DE BETAINA. |
|--|

| |
|--|
| (58) PATENTE EXTRANJERA U OTRA FUENTE DE INFORMACION Patente nº 82 CAM de 21 de febrero de 1.964.- Paris de Origen: Francia. |
|--|

| |
|--|
| (71) SOLICITANTE (S) Dominique BOCHER |
|--|

| |
|--|
| DOMICILIO DEL SOLICITANTE Rue du Moulin-Vert nº 11, Paris (14e), Francia. |
|--|

| |
|--------------------|
| (72) INVENTOR (ES) |
|--------------------|

| |
|-------------------|
| (73) TITULAR (ES) |
|-------------------|

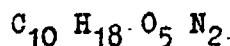
| |
|-----------------------------------|
| (74) REPRESENTANTE GOMEZ-ACERO |
|-----------------------------------|

POOR
QUALITY

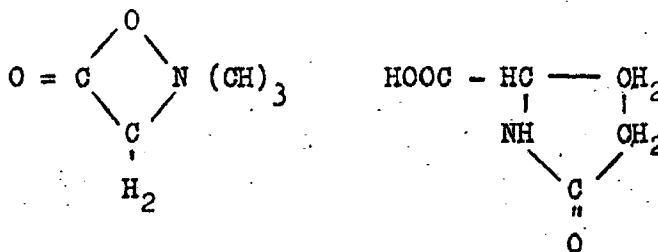
Esta patente tiene por objeto un procedimiento para la preparación de un producto activo para uso farmacéutico denominado PIRROLIDONCARBOXILATO DE BETAINA.

5 Un producto de este tipo ha sido ya dado a conocer en una patente francesa de fecha 21 de febrero de 1.964 nº 82 CAM a nombre de los herederos de Mr. Gustave ROCHER.

El PIRROLIDONCARBOXILATO DE BETAINA de fórmula bruta:



10 y de fórmula desarrollada:



y de masa molar 246 responde a la composición analítica siguiente:

20 C = 48,78 %, H = 7,30 %, O = 32,52 %, N = 11,38 %.

Es un polvo blanco, prácticamente inodoro, de sabor ácido e higroscópico que conviene conservar al abrigo de la humedad y del calor.

25 El punto de fusión instantáneo en el bloque Maquenne se sitúa en las proximidades de los 90°C, con descomposición.

Este polvo es muy soluble en agua y en etanol a 96°, pero prácticamente insoluble en éter y en cloroformo. El valor pH de la solución acuosa al 10 % es:

2,5 < pH < 3

Procedimiento de preparación

5 EL PIRROLIDONCARBOXILATO DE BETAÍNA se obtiene por reacción de la betaína con el ácido pirrolidoncarboxílico en solución acuosa.

Ejemplo: Preparación de 100 moles, o sea 24,615 kilos.

10 Se calientan 50 litros de agua depurada a 80°C y se hacen disolver en la misma 12,900 kilos de ácido pirrolidoncarboxílico de calidad normal; tras la disolución se agregan 11,715 kilos de betaína base y se lleva a ebullición durante 1/2 hora; se agregan 200 gramos de carbón vegetal y se filtra la solución todavía caliente. El valor pH debe ser próximo a 3.

15 La solución así filtrada es evaporada al vacío a una sequedad de 60° - 70°.

Propiedades

20 EL PIRROLIDONCARBOXILATO DE BETAÍNA se caracteriza por una intensa acción: amonio - protectora y amonio - reguladora, y está, por tanto, indicada en terapéutica como factor lipotrópico y protector hepático.

Administrada a ratas por vía oral, a dosis muy elevadas, 1000 mg por kilo de peso corporal y por día, no ha provocado ningún efecto tóxico.

25 Este producto puede presentarse bajo formas farmacéuticas diferentes: comprimidos, cápsulas, polvo, gránulos, solución.

A continuación se facilita una fórmula de preparación para 100 litros de solución:

| | | |
|----|----------------------------------|-----------|
| 30 | Pirrolidoncarboxilato de betaína | 6.600 kg. |
| | Sacarinato de sosa | 0,100 - |

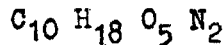
| | | | |
|---|--------------------------------------|-------|--------|
| | Parahidroxibenzoato de metilo sodado | 0,300 | - |
| | Caramelo | 0,650 | - |
| | Solución de cochinilla carmín a 5 % | 0,060 | litro |
| | Polisorbato | 0,010 | litro |
| 5 | Alcoholaturo de mandarina | 1 | litro |
| | Agua q.s.p. | 100 | litros |

Acondicionada en frascos de 300 cc, o sea 1 mg de principio activo por cucharada sopera.

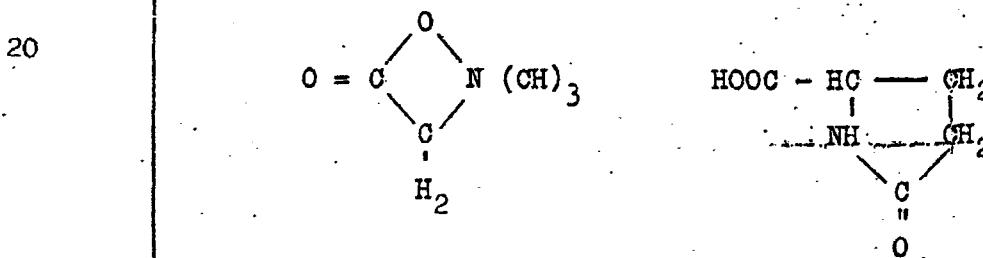
10 Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.

REIVINDICACIONES

15 1ª.- Procedimiento para la obtención de pirrolidón carboxilato de betaina, de fórmula general:



al que corresponde la fórmula desarrollada siguiente:



25 de masa molar 246 y que corresponde a la composición analítica siguiente: C = 48,78 %; H = 7,30 %; O = 32,52 %; y N = 11,38 %; caracterizado porque comprende hacer reaccionar una betaina con ácido pirrolidón carboxílico, en solución acuosa.

30 2ª.- Procedimiento para la obtención de pirrolidón

carboxilato de betaina, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 5 hojas, escritas a máquina por una sola cara.

5

Madrid

22 MAR. 1976

Dominique BOCHER

BOCHER AGUIRRE Y LEBREZ
C/ de Alarcón, 1. Guecho. Vizcaya

