
Octrooiraad



⑩ A Terinzagelegging ⑪ 8300726

Nederland

⑲ NL

- ⑤4 **Het calciumzout van saccharine en de bereiding daarvan.**
- ⑤1 Int.Cl³: C07D 275/06.
- ⑦1 Aanvrager: Maria Carmen Campas Granja en Maria Elisa Campas Granja beiden te Barcelona, Spanje.
- ⑦4 Gem.: Ir. H.M. Urbanus c.s.
Vereenigde Octrooibureaux
Nieuwe Parklaan 107
2587 BP 's-Gravenhage.

-
- ②1 Aanvraag Nr. 8300726.
- ②2 Ingediend 25 februari 1983.
- ③2 Voorrang vanaf 26 februari 1982.
- ③3 Land van voorrang: Spanje (ES).
- ③1 Nummer van de voorrangsaanvraag: 509932 .
- ⑥2 --

-
- ④3 Ter inzage gelegd 16 september 1983.

De aan dit blad gehechte stukken zijn een afdruk van de oorspronkelijk ingediende beschrijving met conclusie(s) en eventuele tekening(en).

Het calciumzout van saccharine en de bereiding daarvan.

Saccharine is een algemeen bekend en toegepast zoetmiddel, dat circa 350 maal zo zoet is als rietsuiker, maar niet giftig is, zodat het ook in geval van diabetes kan worden gebruikt.

In verband met zijn goede zoetmiddel eigenschappen wordt het in 5 kleine doses als pilletjes verstrekt, die geheel of gedeeltelijk uit saccharine en voor de rest uit therapeutica en/of dragerstoffen bestaan.

Saccharine zelf is niet erg goed oplosbaar in water. Het wordt derhalve ook wel in de vorm van zijn natriumzout toegepast. Daarbij zijn twee uitvoeringsvormen mogelijk: tabletten met daarin het echte 10 natriumzout van saccharine en tabletten met daarin een combinatie van saccharine (vrij zuur) met natriumwaterstofcarbonaat. Deze laatste combinatie vormt bij contact met water het gewenste natriumzout van saccharine.

De uitvinding betreft nu het calciumzout van saccharine, liefst 15 in kristallijne vorm, desgewenst in de vorm van doseringseenheden of dosishouders. Het voordeel van het calciumzout van saccharine boven het natriumzout is, dat het weinig gunstige natriumion, dat verhoogde bloeddruk kan veroorzaken, is vervangen door het gunstiger calciumion, dat de ionenbalans van het bloed minder stoort en in bijvoorbeeld de botten 20 kan worden opgenomen. Om deze redenen zijn preparaten met calciumzouten veelal beter dan preparaten met overeenkomstige natriumzouten. Verrassenderwijze bleek bovendien het onderhavige calciumzout niet minder zoet dan het natriumzout of het vrije zuur. De uitvinding betreft tevens doseringseenheden en dosishouders met het calciumzout van saccharine, 25 al of niet gecombineerd met therapeutica en/of gebruikelijke dragerstoffen.

Het volgende voorbeeld geeft een bereidingsmethode weer.

Voorbeeld.

In een tank werd een hoeveelheid saccharine (vrij zuur) bij 50 - 30 55°C in zo weinig mogelijk water gesuspendeerd en door schudden daarin opgelost. Vervolgens werd de berekende hoeveelheid calciumcarbonaat portiesgewijze toegevoegd, waarbij voorzichtig te werk moet worden gegaan, om een al te snel vrijkomen van koolzuur tegen te gaan. Wanneer de berekende hoeveelheid CaCO_3 is toegevoegd moet bij controle de pH 35 van de verkregen oplossing tussen 4,50 en 5,75 zijn gelegen. Vervolgens

wordt bij dezelfde temperatuur gefiltreerd en het filtraat drooggedampt.
Aldus wint men kristallijn calcium-saccharinezout.

C O N C L U S I E S:

1. Het calciumzout van saccharine, waarbij twee moleculen saccharine aan één atoom calcium zijn gebonden.
2. Preparaten in de vorm van tabletten, pilletjes enz. met daarin het calciumzout van saccharine in combinatie met gebruikelijke drager-
5 stoffen en/of therapeutica.
3. Werkwijze voor het bereiden van het calciumzout van saccharine door saccharine in water met calciumhydroxyde of een calciumzout te laten reageren tot de pH 4,50 - 5,75 bedraagt, de gevormde oplossing te filtreren en het filtraat droog te dampen.
- 10 4. Werkwijze volgens conclusie 3, met het kenmerk, dat als calciumbron calciumcarbonaat wordt toegepast.
5. Werkwijze volgens conclusie 3 of 4, met het kenmerk, dat het calciumzout van saccharine in kristallijne vorm wordt gewonnen.