



- 1 -

199246

199246

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña

a la solicitud de

Una PATENTE DE INVENCION, por VEINTE AÑOS en ESPAÑA,

a favor de

BRISTOL LABORATORIES INC., residente en SYRACUSE 1 -N.Y.

(Estados Unidos) Thompson Road

por

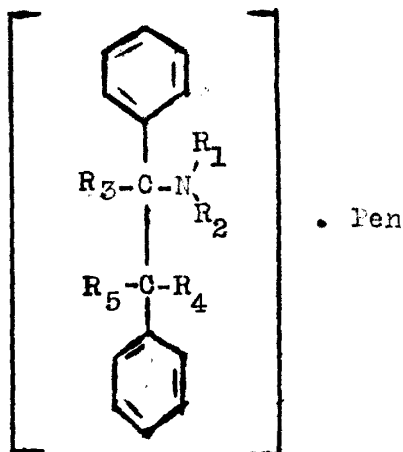
PROCEDIMIENTO PARA OBTENER SALES DE ALINO ORGANICAS

Con prioridad de la solicitud en Estados Unidos Ser
nº.211.438 del 16 de Febrero de 1951.



El presente invento se refiere a nuevas sales de amino de penicilina.

Las nuevas sales del presente invento corresponden a la siguiente fórmula general



15

20

en la cual R_1 , R_2 , R_3 y R_4 , son miembros de la clase que consiste en hidrógeno y alquilo bajo; R_5 es un miembro de la clase que consiste en hidrógeno e hidroxy; y "Pen" se refiere al radical de penicilina ácida o una mitad activa de la misma, capaz de formar una sal adicional con el amino antes citado.

Queda entendido que en los casos en los cuales R_4 y R_5 no son idénticos, existen dos átomos de carbono asimétricos. Sin embargo, el invento no se limita a isómeros determinados, sino que comprende todos los isómeros posibles.

25

Las sales de amino de penicilina del presente invento, son capaces de ejercer una acción antibiótica repositoria prolongada.

Una comprensión más amplia del invento se consigue mediante referencia a los ejemplos siguientes:

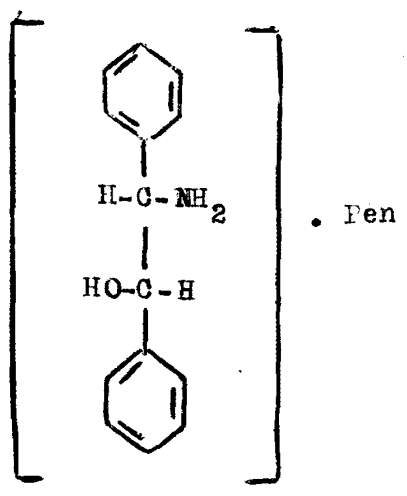
30

EJEMPLO I

α , β - DIFENIL- β - HIDROXILETILAMINO SAL DE PENICILINA



35



40

A 0,48 g de α, β -difenil- β -hidroxietilamino hidrocloreto disuelto en 6 ml. de agua destilada, se agregó una solución conteniendo 1 g de sodio penicilina G en 4 ml. de agua. Se revolvió bien dicha solución precipitándose un aceite. Rayando y agitándolos se formaron cristales. Después de haberse quedado durante media hora en un baño de hielo, los cristales se separaron por filtración y se secaron en un secador por vacío.

45

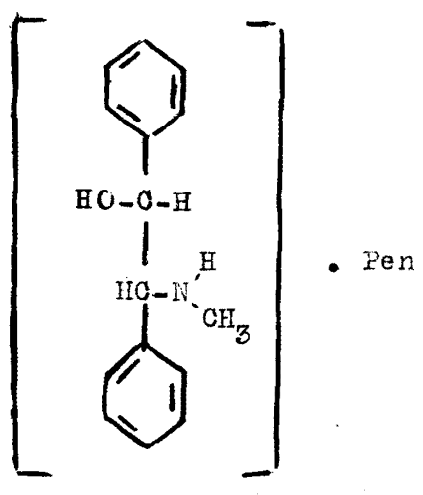
50

Un ensayo dió por resultado una potencia de 1207 u./mg y una solubilidad en agua de 6630 u./ml.

EJEMPLO II

α, β -DIFENIL- β -HIDROXY-N-METILLETILAMINO SAL DE PENICILINA

55



60



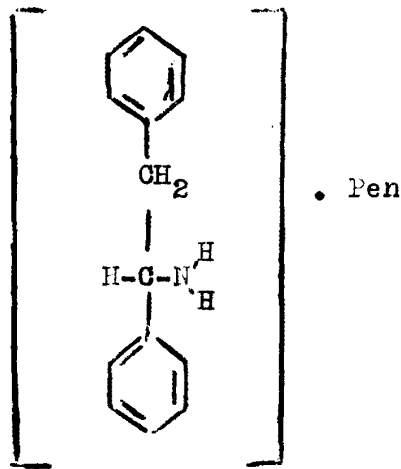
A 0,46 g de α, β - difenil- β - hidroxy-N-metiletilemino hidrocloreto disuelto en 5,5 ml. de agua, se agregó una solución de 1 g de sodio penicilina G en 4 ml. de agua. El aceite precipitado se convirtió en cristales bajo la acción de rayado y agitación. Los cristales se apartaron por filtración y se secaron en vacío.

65

EJEMPLO III

α, β - DIFENILETILAMINO SAL DE PENICILINA

70



75

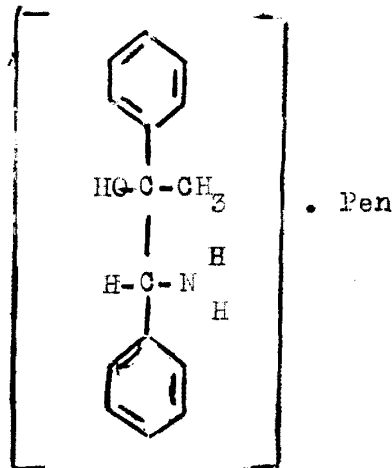
Una solución de 1,5 g de sodio penicilina G en 5 ml. de agua, se agregó a una solución de 1 g de α, β - difeniletilemino hidrocloreto en 7 ml. de agua. La agitación y rayado de la solución produjo cristales que se filtraron y se secaron en vacío.

80

EJEMPLO IV

α, β - DIFENIL- β - HIDROXIPROPIL AMINO SAL DE PENICILINA

85



90

199246

- 5 -



95

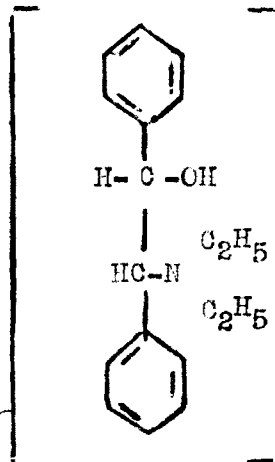
A 0,30 g de α, β -difenil- β -hidroxipropilamino hidrocloreto en 6 ml. de agua se agregó una solución de 1 g. de sodio penicilina G, disuelta en 4 ml de agua. El aceite precipitado, al ser agitado, se convirtió en cristales mediante rayado. Los cristales se filtraron y fueron colocados en un desecador al vacío.

EJEMPLO V

100

α, β -DIFENIL- β -HIDROXY-N,N-DIETILAMINO SAL DE PENICILINA

105



. Pen

110

A 0,70 g de α, β -difenil- β -hidroxy-N, N-dietilamino hidrocloreto en 9 ml. de agua, se agregaron 2 g. de sodio penicilina G disuelto en 8 ml de agua. El aceite precipitado se convirtió en reposo en cristales mediante rayado. Dichos cristales se filtraron y secaron en vacío.

115

Aunque el presente invento haya sido descrito con referencia particular a las sales de amino de penicilina G, queda entendido que las sales de amino de otras penicilinas entran también dentro del marco del invento; como ejemplos se pueden citar la penicilina G, X dihidro F y K.

N O T A

120

En resumen: La Patente de Invención cuyo registro se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones siguientes:

1) Procedimiento para obtener sales de amino orgánicas, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina y un amino, cuyo amino corresponde a la fór-

199246

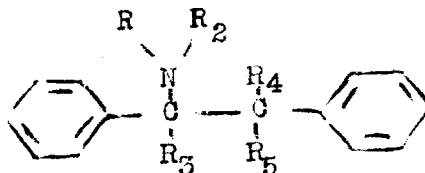
- 6 -



125

mula general.

130



135

según la cual R_1 es un miembro de la clase que consiste de hidrógeno y alquilo; R_2 es un miembro de la clase que consiste de hidrógeno y alquilo; R_3 es un miembro de la clase que consiste de hidrógeno y alquilo; R_4 es un miembro de la clase que consiste de hidrógeno y alquilo conteniendo de 1 a 6 inclusivos átomos de carbono; y R_5 es un miembro de la clase que consiste de hidrógeno e hidroxy.

140

2) Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina G y α , β -difeníl- β -hidroxi-etilamino.

145

3) Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina G y α , β -difeníl- β -hidroxy-N-metil-etilamino.

150

4) Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina G y α , β -difeníl-etilamino.

5) Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina G y α , β -difeníl- β -hidroxypropilamino.

155

6) Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la utilización de una sal de penicilina G y α , β -difeníl- β -hidroxy-N,N-dietil-etilamino.

199246



7) Se reivindica, por último, como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita, PROCEDIMIENTO PARA OBTENER SALES DE AMINO ORGANICAS.

Todo conforme queda descrito en la presente Memoria, que consta de siete páginas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 16 de Agosto de 1951

ALFONSO UNGRIA

160