

IV.

318901



~~318901~~

P A T E N T E D E I N V E N C I Ó N

a favor de

DOCTOR ANDREU, S. A. - de nacionalidad española - domiciliada
en Rambla de Cataluña, nº 66, BARCELONA,

por :

"Procedimiento de obtención de sales de sulfonamidas de fórmula ge-
neral $R_1NHC_6H_4SO_2NR_2R_3$ con el antibiótico eritromicina y sus deri-
vados".

-----:oOo:-----

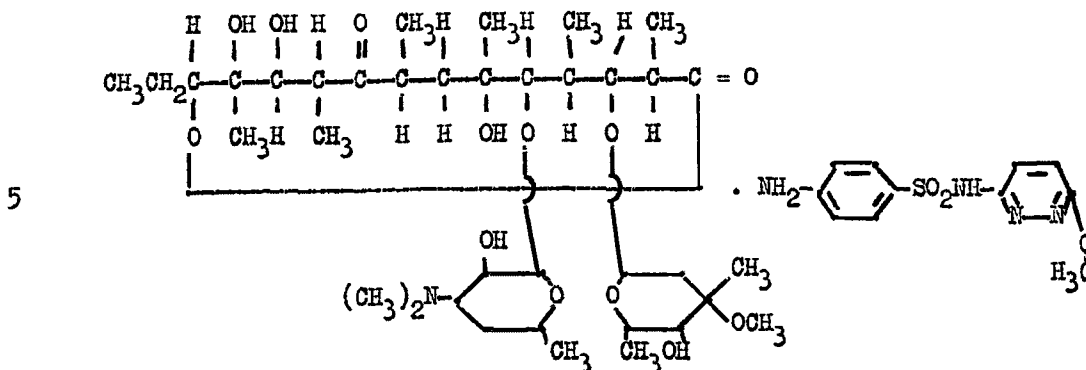
M e m o r i a d e s c r i p t i v a .

La presente patente de invención tiene por objeto la obten-
ción de sales de sulfonamidas, con fórmula general $R_1NHC_6H_4SO_2NR_2R_3$,
con el antibiótico eritromicina y sus derivados. La fórmula general

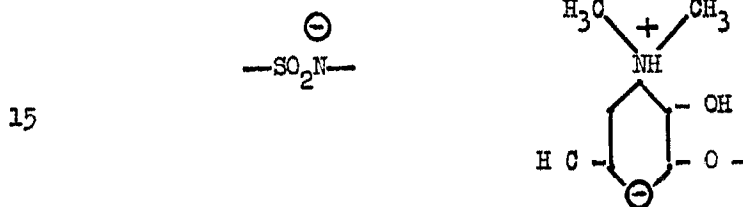
318901



es:



10 Estas sales se forman a través del grupo ácido $-SO_2NH-$ de la sulfonamida y el grupo desosamínico básico de la eritromicina y sus derivados.



20 La obtención de dichas sales se lleva a cabo con el concurso de diversos disolventes orgánicos, tales como acetona, metanol, anhídrido propiónico, solución de hidróxido sódico y otros, y la separación de las mismas se consigue por eliminación del disolvente, por adición de agua a la mezcla reaccionante ó por enfriamiento a baja temperatura de la mezcla orgánica-acuosa en que ha tenido lugar la reacción.

25 El objeto fundamental de la invención es obtener compuestos terapéuticamente activos, dotados de un amplio espectro de actividad antibacteriana.

A continuación se describen algunos ejemplos específicos :

EJEMPLO I

=====

30 280 gramos de sulfametoxipiridacina y 733 gramos de eritromi-



oína base, se disuelven en 2 litros de acetona, recientemente destilada. La solución resultante se filtra a través de un filtro poroso. A continuación, se añaden 2 litros de agua y se calienta a 48° durante unos 5 minutos. Se enfría a la temperatura ambiente y a los 10 minutos, se añaden 2 litros más de agua, despacio y agitando continuamente hasta que se separe la sal de sulfametoxipiridacina y eritromicina en forma de pasta. Se añaden 10 litros de agua y la mezcla resultante se filtra y se lava repetidas veces con agua. El producto obtenido se seca primero al aire y luego al vacío. Se obtienen 900 gramos de sal de sulfametoxipiridacina y eritromicina.

EJEMPLO II
=====

7,9 Kg. de eritromicina base se disuelven en 30 litros de metanol, mediante enérgica agitación. Se añaden 1,7 litros de anhídrido propiónico, se filtra y se dejan transcurrir 2 horas a la temperatura ambiente. Por otro lado 440 gramos de hidróxido sódico se disuelven en 25 litros de agua y se le añaden 3,02 Kg. de sulfametoxipiridacina, que se disuelve por formar la sal sódica. La solución resultante se filtra y se añade a la anteriormente preparada, con agitación y enfriando a muy baja temperatura. Se deja reposar a -12° durante 24 horas y se obtiene un precipitado, que se separa por filtración y se lava repetidas veces con agua. El producto resultante se seca al aire y luego al vacío. Se obtienen 10 Kg. de la sal de sulfametoxipiridacina y propionileritromicina.

EJEMPLO III
=====

Se disuelven 2,80 Kg. de sulfametoxipiridacina y 7,33 Kg. de eritromicina base en 30 litros de metanol. La solución resultante se filtra, se calienta a ebullición 5 minutos y se destila el metanol al vacío. El residuo resultante se lava suspendiéndolo repetidas ve-

16 OCT 1965



ces en agua. Así se obtienen 9,20 Kg. de la sal de sulfametoxipiridina y eritromicina.

N O T A
=====

5 Se reivindica como objeto de la presente Patente de Invención:

1. - Procedimiento de obtención de sales de sulfonamidas de fórmula general $R_1NHC_6H_4SO_2NR_2R_3$ con el antibiótico eritromicina y sus derivados, caracterizado esencialmente en que dichas sales se forman a través del grupo ácido $-SO_2NE-$ de las sulfonamidas y el grupo desosamínico básico de la eritromicina y sus derivados.

15 2. - Procedimiento según la reivindicación anterior caracterizado en que la obtención de las citadas sales se lleva a cabo con el concurso de disolventes orgánicos, tales como acetona, metanol, anhídrido propiónico, solución de hidróxido sódico y otros equivalentes y procediéndose a la separación de las sales del disolvente.

3. - Procedimiento según la reivindicación anterior, caracterizado en que la separación de los compuestos se obtiene por adición de agua a la mezcla reaccionante.

20 4. - Procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado en que la separación de los compuestos, se obtiene por destilación del disolvente en que ha tenido lugar la reacción.

5. - Procedimiento según la reivindicación 2, caracterizado en que la separación de la sal se obtiene por enfriamiento a baja temperatura del medio en que ha tenido lugar la reacción.

25 6. - Procedimiento de obtención de sales de sulfonamidas de fórmula general $R_1NHC_6H_4SO_2NR_2R_3$ con el antibiótico eritromicina y sus derivados.

Esta memoria consta de cuatro páginas, escritas por una sola cara.

BARCELONA, 16 OCT. 1965

P. A.