

321558



321558

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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE DERIVADOS DE NEOMICINA", a favor de la razóñ social española ANTONIO GALLARDO, S.A., residente en BARCELONA, calle Cardener, nº 72-74.

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se trata de la preparación de derivados de la Neomicina con interesante actividad antibiótica. El estudio farmacológico está en curso.

- Los nuevos derivados de la Neomicina se han obtenido tratando una disolución acuosa de Sulfato de Neomicina con un exceso de carbonato de bario durante un período oscilante entre 2 y 4 horas a una temperatura de 45 - 55°. De la masa de reacción filtrada, se obtiene la disolución de carbonato de neomicina, la cual se trata con el correspondiente ácido orgánico, obteniéndose así, la nueva sal.
- 5.
- 10.



321558

Las disoluciones acuosas de estas sales se liofilizan.

La actividad microbiológica de estos compuestos se ha determinado por el método en placa según U.S.P. XVI utilizando *S. Aureus* A.T.C.C. nº 6538 P.

5. EJEMPLO I

10. A una disolución acuosa al 10% aproximadamente de sulfato de neomicina (contenido de ion $SO_4 = 25\%$) se añade una cantidad de carbonato de bario correspondiente a 0'8 veces la de sulfato de neomicina. La masa se agita durante 3-4 horas a la temperatura de cerca de 45°C. y después de este tiempo se enfría y se filtra. La disolución transparente se trata con una cantidad de ácido fosfórico 85% equivalente al contenido de ion SO_4 -. La disolución de la sal de neomicina se liofiliza, obteniéndose un producto de color blanco y punto de fusión 228-290° C.

15.

EJEMPLO II

20. A una disolución de sulfato de neomicina tratada según el ejemplo I se añade una cantidad de ácido ftálico equivalente al contenido de ion SO_4 -. La disolución, igual que en el caso anterior, se liofiliza obteniéndose un producto de color blanco y punto de fusión 120 - 125°C.



EJEMPLO III

321558

5. A una disolución de sulfato de neomicina tratada según el ejemplo I se añade una cantidad de ácido succínico equivalente al contenido de ion SO_4 -. La disolución se liofiliza obteniéndose un producto de color blanco y punto de fusión $240^{\circ}C$.

EJEMPLO IV

10. A una disolución de sulfato de neomicina tratada como en el ejemplo I se añade una cantidad de ácido salicílico equivalente al contenido de ion sulfato. La disolución se liofiliza obteniéndose un producto de color blanco y punto de fusión $75 - 80^{\circ}$.

EJEMPLO V

15. A una disolución de sulfato de neomicina tratada como en el ejemplo I se añade una cantidad de E.D.T.A. disódico equivalente al contenido de ion sulfato. La disolución se liofiliza obteniéndose así un producto de color blanco y punto de fusión $105-107^{\circ}C$.

N O T A

321558

8 ENE



Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención, las siguientes reivindicaciones:

5. 1. Procedimiento para la preparación de derivados de neomicina, caracterizado esencialmente por el hecho de que comprende tratar una disolución acuosa de sulfato de neomicina con un exceso de carbonato de bario, de donde se filtra una disolución de carbonato de neomicina, que se trata a su vez con un ácido orgánico equivalente al contenido de ión $SO_4 =$, obteniéndose la sal de neomicina correspondiente al ácido.
10. 2. Procedimiento para la preparación de derivados de neomicina.

15. Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de cuatro hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras, acompañadas de la documentación reglamentaria.

Madrid, a 8 ENE 1966

p. a. JAIME ISERN