



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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE CANFOSULFONADOS DE TETRACICLINA Y SUS DERIVADOS", a favor de la razón social española ANTONIO GALLARDO, S.A., domiciliada en BARCELONA, calle Cardoner, 72-74.

= . =

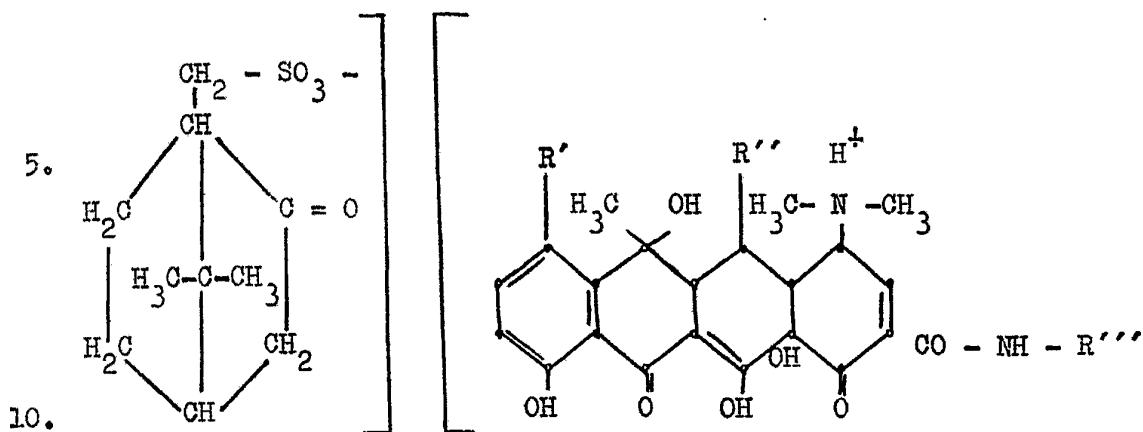
MEMORIA DESCRIPTIVA

5. La presente patente de invención trata de la preparación de canfosulfonados de Tetraciclina y de sus derivados, con una interesante actividad antibiótica y analéptica, principalmente sobre el aparato respiratorio, mejorando la ventilación pulmonar y la circulación bronco-pulmonar.

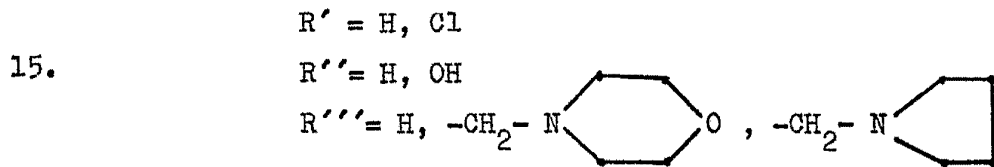
Por otra parte, el radical canfosulfónico confiere cierta selectividad pulmonar al radical Tetraciclínico.



Estas sales que responden a la siguiente fórmula:



donde:



20. se han obtenido haciendo reaccionar la Tetraciclina base o uno de sus derivados disuelta en un disolvente orgánico idóneo con el ácido 10-canfosulfónico.

E J E M P L O I

25. A una suspensión de 4'4 gr. de Tetraciclina base anhidra en 40 c.c. de isopropanol, se añade a 50º una disolución de 2'3 gr. de ácido 10-canfosulfónico en 20 c.c. de iso-



propanol. Se calienta hasta disolución completa y después se enfría y se deja cristalizar. Se recoge el producto que se lava con un poco de isopropanol.

5. Se obtienen 5'6 gr. de producto, con un punto de fusión de 135 - 139° C.

E J E M P L O II

10. A una suspensión de 4'5 gr. de oxitetraciclina base anhidra en 60 c.c. de alcohol isopropílico, se añade a 50°, una disolución de 2'3 gr. de ácido 10-canfosulfónico en 20 c.c. de alcohol isopropílico.

15. Se calienta hasta disolución completa, se enfría y se deja cristalizar, obteniéndose 5 gr. de producto con un punto de fusión de 140 - 142° C.

E J E M P L O III

20. A una suspensión de 5'43 gr. de Morfolino Metil Tetraciclina en 50 c.c. de isopropanol, se añaden a 50°, una disolución de 2'3 gr. de ácido 10-canfosulfónico en 20 c.c. de isopropanol.

Se calienta hasta disolución, se enfría y se deja cristalizar.

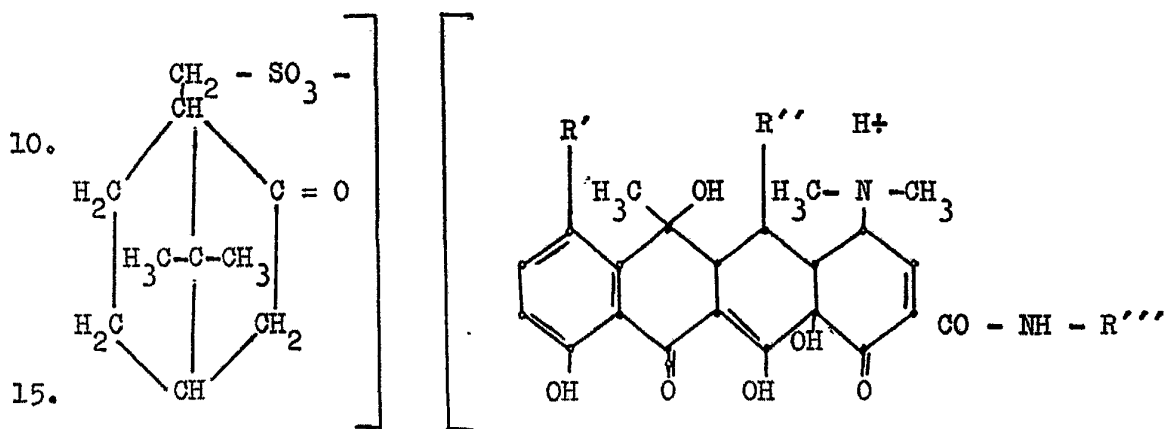
25. Se obtienen 6'5 gr. de producto con un punto de fusión de 160 - 163° C.



N O T A

Hecha la descripción del presente invento, lo que se declara como nuevo y de propia invención comprende las reivindicaciones siguientes:

5. 1.- Procedimiento para la preparación de canfosulfonados de tetraciclina y sus derivados, que corresponden a la fórmula general:



donde:

R' = H, Cl

R'' = H, OH

20.

R''' = H, ,

caracterizado porque se obtienen haciendo reaccionar la tetraciclina base o uno de sus derivados disuelta en un disolvente orgánico idóneo, con el ácido 10-canfosulfónico.

20 MAR 1936



2.- Procedimiento para la preparación de canfosulfonados de tetraciclina y sus derivados.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 5 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

5.

Madrid, a

20 MAR. 1936

p. a.

REPUBLICA DE ESPAÑA

MINISTERIO DE HACIENDA

