

386964

SECCION TECNICA
COMUNICACION
CI. 07 961
SUBCLASE D K



Memoria descriptiva

386964

para solicitar PATENTE DE INVENCION en ESPAÑA por 20 años

a nombre de LABORATORIOS MADE, S. A.

entidad / ~~de nacionalidad~~ española

con domicilio en Avenida de Burgos Km. 5,850, Madrid

por: "UN METODO DE OBTENCION DE DERIVADOS DEL ACIDO
/D(-)-ALFA-AMINOFENILACETAMIDO/PENICILANICO"
(Clase Internacional CO7d)

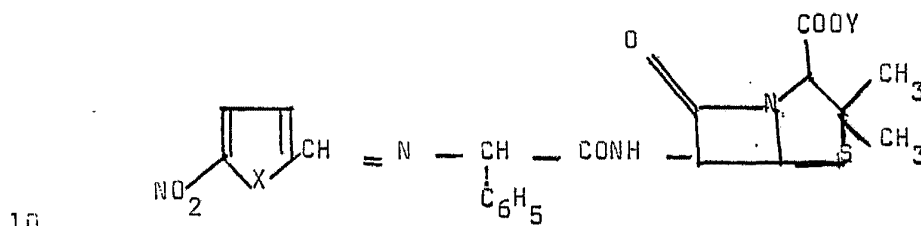
8.12.70

386964



El presente invento tiene por objeto la producción industrial de compuestos con marcada actividad antibiótica, derivados del ácido $\Delta^0(-)$ -alfa-aminofenilacetamido Δ^7 penicilánico.

5 Estos compuestos tienen por fórmula general:



15 en donde X puede ser un átomo de nitrógeno, oxígeno o azufre e Y puede ser hidrógeno, metales o bases orgánicas.

El método general de síntesis de estos compuestos está fundamentado en la disolución en un disolvente apropiado del ácido $\Delta^0(-)$ -alfa-aminofenilacetamido Δ^7 penicilánico o una de sus sales, agregando a esta disolución, previamente enfriada, otra disolución en el mismo disolvente del correspondiente nitroaldehido heterocíclico. La mezcla de reacción se agita durante un tiempo determinado y el producto se aísla por precipitación, cristalización o liofilización.

25 EJEMPLO :

37,1 g (0,1 mol) de $\Delta^0(-)$ -alfa-aminofenilacetamido Δ^7 penicilinato sódico se disuelven en 200 ml. de metanol. La disolución se enfría a 0°C y se comienza a agregar poco a poco y con agitación una disolución de 14,1 g (0,1 mol) de 5-nitrofurfuraldehido en 30 ml. de metanol.

386964



5 Durante la adición, la disolución va pasando de incolora a un rojo obscuro. Una vez terminada la adición, se agita durante veinte minutos y al cabo de este tiempo se agregan 500 ml. de éter y precipita el α (-)-alfa-(5-nitro-2 furilmetilen) aminofenilacetamido penicilanoato sódico:

Análisis:

Calculado para $C_{21}H_{19}N_4O_7SNa$

C: 51,00; H: 3,87; N: 11,33; S: 6,47

10

Encontrado:

C: 50,78; H: 4,24; N: 11,12; S: 6,43

15

Los datos espectroscópicos están de acuerdo con la estructura asignada.

El producto es un sólido cristalino de color pardo, que descompone a 225-226°C. soluble en agua y metanol e insoluble en éter.

20

El producto obtenido por este método es nuevo a juicio de la solicitante, y en las aplicaciones específicas a que está destinado tiene las ventajas de su gran tolerancia, su baja toxicidad aguda y crónica y elevado poder antibiótico.

25

- REIVINDICACIONES -

30

Los puntos de invención, propia y nueva, que

22.12.70

- 3 -

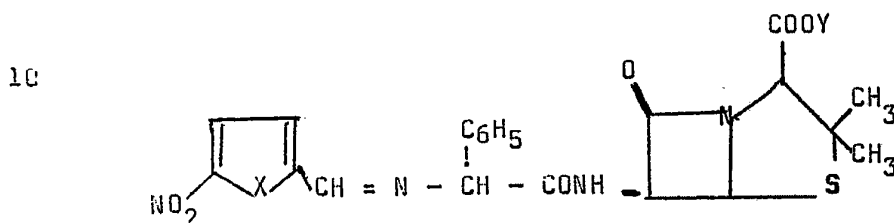
POOR
QUALITY

386964



se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

1.- Un método de obtención de derivados del ácido α (-)-alfa-aminofenilacetamido/penicilánico de fórmula general



15

en donde X puede ser un átomo de nitrógeno, oxígeno o azufre e Y puede ser hidrógeno, metales o bases orgánicas, caracterizado por la disolución en un disolvente apropiado del ácido α (-)-alfa-aminofenilacetamido/penicilánico o una de sus sales y posterior adición en frío de una disolución en el mismo disolvente del correspondiente nitro aldehído heterocíclico, aislando posteriormente el producto de reacción por cristalización, precipitación o liofilización.

20

2.- Un método según la reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente empleado es metanol.

3.- Un método de obtención de derivados del ácido α (-)-alfa-aminofenilacetamido/penicilánico.

25

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

22.12.70

386964



Esta Memoria consta de cinco hojas escritas
a máquina por una sola de sus caras.

Madrid,

P.A.

Alberto de Eizola
Por Poder

22.12.70/RTA.-

hoy