



432135

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

por "UN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE SALES DE ALUMI-  
NIO DE PENICILINAS SEMISINTETICAS", a favor de D. Melchor  
Mallasen Ornat, de nacionalidad española, domiciliado en  
BARCELONA.— C/ Vico, 30

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

Es conocido que todas las penicilinas semisintéticas y derivados existentes actualmente en el mercado, poseen una valiosa actividad antibiótica, sin embargo presentan un sabor amargo difícil de enmascarar y desagradable en su aplicación oral.

5.

El objeto de la presente invención es la obtención de sales aluminicas de penicilinas semisintéticas, particularmente de los alfaamido bencilpenicilinas, y más especialmente la preparación de la p-clorofenoxiisobutil ampicilina aluminica, que no posee sabor amargo y constituye un producto de óptima aplicación, por sus favorables condiciones galénicas, mejorando al propio tiempo su pureza y estabilidad pero manteniendo su amplio aspecto antimicro-

10.



crobiano.

5. En su aplicación las concentraciones tisulares y hemáticas encontradas, tanto por vía intramuscular como oral, presentan una curva muy prolongada, equivalente a otras formas de alfa-amido bencilpenicilina debido al efecto moderador de la eliminación de sus acumulos en tejidos por lo que permite administraciones de hasta 12 grs. y mayores.

10. El procedimiento de la presente invención se basa en la reacción que se produce al tratar la solución alcalina del alfa-amidobencil penicilina con una sal de aluminio, y del seno reaccional por precipitación, o evaporación del disolvente, se obtiene la sal aluminica de sabor no amargo. El proceso es análogo si se trata la alfa-amidobencil penicilina, en disolventes orgánicos, con un alcoholato de aluminio..

.15.

Los siguientes ejemplos ilustran, sin carácter limitativo el procedimiento objeto de la invención.

EJEMPLO 1

20.

5,9 grs. de p-clorofenoxilisobutilampicilina sódica se disuelven en 100 ml. de agua en frío, sobre la cual, en agitación, se vierte un equivalente de solución de cloruro de aluminio precipitándose la sal aluminica que se filtra, y lava, y seca finalmente.

25.

EJEMPLO 2

8,2 grs. de p-clorofenoxilisobutilampicilina se disuelven en 25 ml. de cloruro de metileno, al que se añade 10,2 grs. de isopropil aluminato disuelto en 10 ml. de cloroformo. Por desecación de la solución se obtiene un residuo que es la substancia desecada.



EJEMPLO 3

5. 8,3 grs. de trimetoxibenzoilampicilina ácido se disuelven en 30 ml. de cloroformo. Se añade una solución de metilato de aluminio. Al igual que el ejemplo 2, se obtiene el producto deseado.

EJEMPLO 4

10. 8,3 grs. de p-clorofenoxisobutilampicilina ácida se disuelven en 25 ml. de isopropanol y 10,3 grs. de isopropilaluminato disueltos en 10 ml. de tetracloruro de carbono. Precipita la sal aluminica que se filtra y lava y despues se seca. La adición de hexano acelera la precipitación.

EJEMPLO 5

15. 8,2 grs. de p-clorofenoxisobutilampicilina ácida se disuelve en 25 ml. de éter y se trata la solución con el mismo reactivo que en el ejemplo 4. Se obtiene la p-clorofenoxisobutilampicilina aluminica.

20. La invención, dentro de sus oscencialidad, se puede llevar a la práctica en otras formas de realización que difieren en detalle de las expresadas en los ejemplos a título ilustrativo y a las cuales alcanzará las mismas ventajas, por quedar comprendidas en el espíritu de las reivindicaciones.

25.

= . =

N O T A

Descrito el objeto del presente invento, lo que se declara nuevo y de propia invención, comprende las siguientes reivindicaciones.

1.- Un procedimiento para la obtención de sales



5. de aluminio de penicilinas semisintéticas, especialmente dotadas de sabor no amargo, caracterizado porque se hace reaccionar una disolución acuosa de una sal alcalina de una alfa bencil-penicilina con una sal de aluminio, preferentemente en proporciones equivalentes, separándose la sal aluminica de penicilina formada, del seno de la reacción, en forma sólida por medios conocidos.

10. 2.- Un procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque, en una variante del mismo, la reacción tiene lugar en un medio disolvente orgánico, tipo cloroformo, cloruro de metileno, ó un compuesto alifático halogenado similar separándose la sal de aluminio penicilánico por cristalización ó evaporación del disolvente.

15. 3.- Un procedimiento, según la reivindicación 2, caracterizado en que el disolvente orgánico es también un éter o éster ó un alcohol.

20. 4.- Un procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado en que se selecciona preferentemente como penicilia semisintética de partida la p-clorofenoxiisobutilampicilina.

25. 5.- Un procedimiento, según las reivindicaciones 2 a 4, caracterizado en que se selecciona como sal de aluminio un alcoholato, un fenato o la sal de aluminio de un ácido orgánico con 6 a 8 átomos de carbono.

6.- Un procedimiento para la obtención de sales de aluminio de penicilinas semisintéticas.

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



Madrid, a 21 NOV. 1974.

p.a.

JAIME ISENA

p. p.

Firmado: JOSE L. MORA

dv.