

-60



P.- 61.853

**443288**

HOE 74/F 372

ACYLAMINO-  
PENICILLANSAUREN"

Int. Cl.: <u>C07D//A61K</u>

MEMORIA DESCRIPTIVA.

para solicitar PATENTE DE INVENCION por 20 años

a nombre de HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT

entidad alemana

establecida en 6230 Frankfurt/Main 80, República Federal  
Alemana

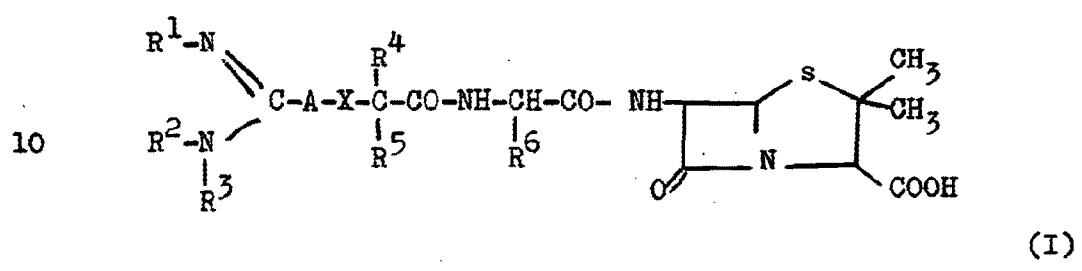
por: "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE PENICILINAS"

**ANULADO**

PROHIBIDA LA CONSULTA  
Y LA ENTREGA DE COPIAS  
Y CERTIFICACIONES.



Objeto del invento son nuevas penicilinas  
 5 de la fórmula general I



en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  significan hidrógeno o radicales  
 alcoholo inferiores eventualmente sustituidos, pudiendo  
 15 formar  $R^1$  y  $R^2$  o bien  $R^2$  y  $R^3$  también, en cada caso de  
 modo conjunto, un radical alcoholeno eventualmente susti-  
 tuído;  $R^4$  y  $R^5$  significan hidrógeno o radicales alcoholo  
 inferiores;  $R^6$  significa fenilo eventualmente sustituido  
 20 un heterociclo aromático monocíclico eventualmente sus-  
 tituido o dihidrofenilo; A significa un anillo benceno o  
 tiofeno eventualmente sustituido; y X significa oxígeno  
 o un enlace simple.

Objeto del invento es además un procedimien-  
 to para la preparación de penicilinas de la fórmula gene-  
 25 ral I, en la que  $R^1$  hasta  $R^6$ , A y X poseen los significa-



describió en el Ejemplo 1b, fue tratado con una mezcla de cloruro de metileno y trietilamina.

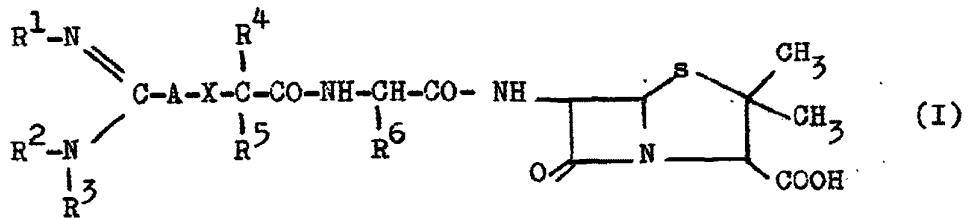
Se obtuvieron 3,4 g de la penicilina antes mencionada. Punto de descomposición 198 a 200°C; valor Rf = 0,53.

Esta solicitud que corresponde a la presentada en República Federal Alemana, el 13 de Diciembre de 1974, con el nº P 24 58 973.9, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

#### REIVINDICACIONES

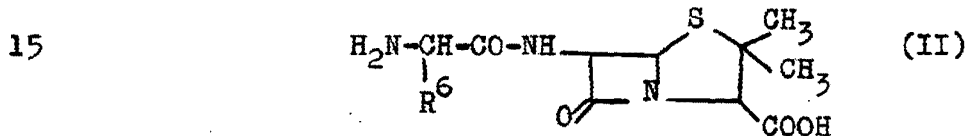
Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España por VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

1ª.- Procedimiento para la preparación de penicilinas de la fórmula general I

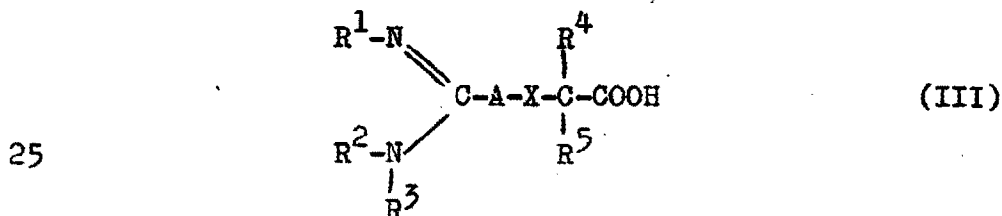




en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  significan hidrógeno o radicales al-  
cohilo inferiores eventualmente sustituidos, pudiendo for-  
mar  $R^1$  y  $R^2$  o bien  $R^2$  y  $R^3$  también en cada caso, de modo  
conjunto, un radical alcohileno eventualmente sustituido;  
5  $R^4$  y  $R^5$  significan hidrógeno o radicales alcohilo infe-  
riores;  $R^6$  significa fenilo eventualmente sustituido, un  
heterociclo aromático monocíclico eventualmente sustitui-  
do o dihidrofenilo; A significa un anillo benceno o tio-  
feno eventualmente sustituido; y X significa oxígeno o  
10 un enlace simple, caracterizado porque a) se hacen reac-  
cionar aminopenicilinas de la fórmula general II



en la que  $R^6$  posee los significados ya indicados, o sa-  
les o derivados de los mismos protegidos en el grupo  
20 carboxilo, con ácidos carboxílicos de la fórmula general  
III,

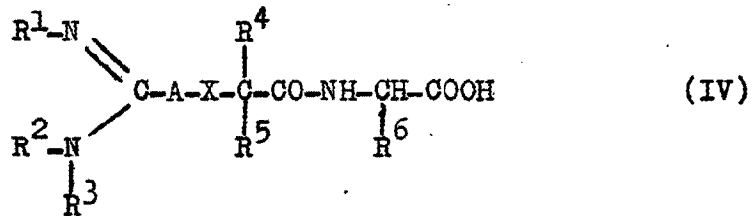




en la que R<sup>1</sup> a R<sup>5</sup>, A y X tienen los significados antes mencionados, o con derivados capaces de reaccionar de dichos ácidos; o b) se hace reaccionar ácido 6-aminopenicilánico o una sal o un derivado protegido en el grupo carboxilo del mismo, con un ácido de la fórmula general IV,

5

10  
15



en la que R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>, A y X poseen los significados arriba indicados, o con un derivado capaz de reaccionar de dicho ácido, y se separan grupos protectores eventualmente presentes.

20

2ª.- Procedimiento para la preparación de penicilinas.

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



Esta Memoria consta de treinta y cinco hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

29 DIC. 1975

P.A.

Alberto de Elizola

Por Poder

A handwritten signature in black ink, appearing to be 'A. de Elizola', written over a horizontal line.

SECRETARIA

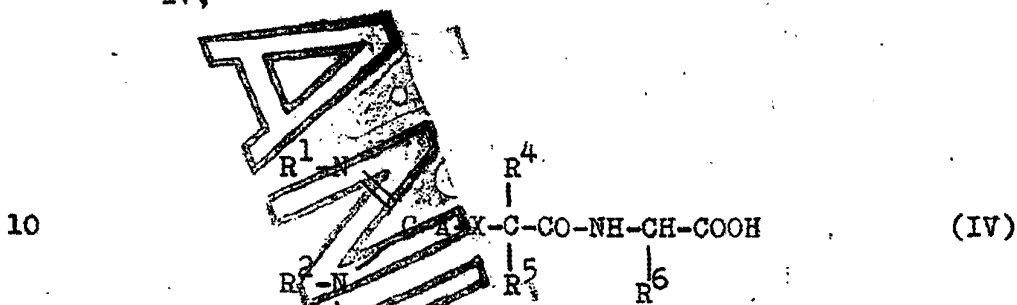
18-12-75  
VGD.

- 35 -

A handwritten mark or signature in black ink, possibly 'VGD'.



en la que R<sup>1</sup> a R<sup>5</sup>, A y X tienen los significados antes  
 mencionados, o con derivados capaces de reaccionar de  
 dichos ácidos; o b) se hace reaccionar ácido 6-aminope-  
 nicilánico o una sal o un derivado protegido en el grupo  
 5 carboxilo del mismo, con un ácido de la fórmula general  
 IV,



15 en la que R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>, A y X poseen los significados arriba  
 indicados, o con un derivado capaz de reaccionar de dicho  
 ácido, y se separan grupos protectores eventualmente pre-  
 sentes.

20 2a.- Las penicilinas de la fórmula general I  
 obtenidas de acuerdo con el procedimiento especificado  
 en la reivindicación I.

3a.- Procedimiento para la preparación de pe-  
 nicilinas.

25



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

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

Madrid,

P.A.

- 6 DIC. 1975

Adolfo de Elizaburu  
Por Poderes