



ESPAÑA

447.811

19 ES	11 NUMERO	10 A1
	21	
	22 FECHA DE PRESENTACION	
	11-5-76	

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		
64 901	12-3-76	PORTUGAL
14 MAR. 1977		

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07D//A61K	

54 TITULO DE LA INVENCION
UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE SALES DE ACIDOS AMINADOS

71 SOLICITANTE (ES)
INSTITUTO LUSO-FARMACO S.A.R.L.

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
Rua do Quelhas, 8 Lisboa Portugal

72 INVENTOR (ES)
Dr. Joao Carlos Leal de Matos, el cual ha cedido sus derechos a la entidad solicitante.

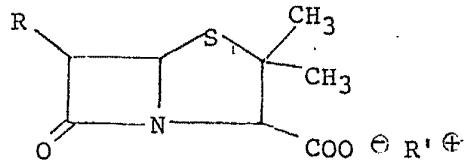
73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU.

1

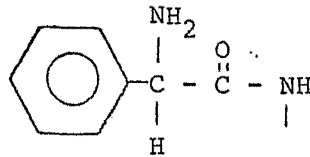
Esta invención se refiere a un procedimiento de preparación de compuestos de fórmula general:

5

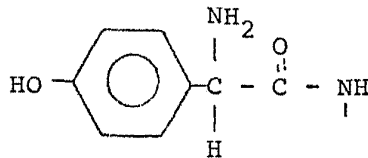


donde R representa un grupo

10

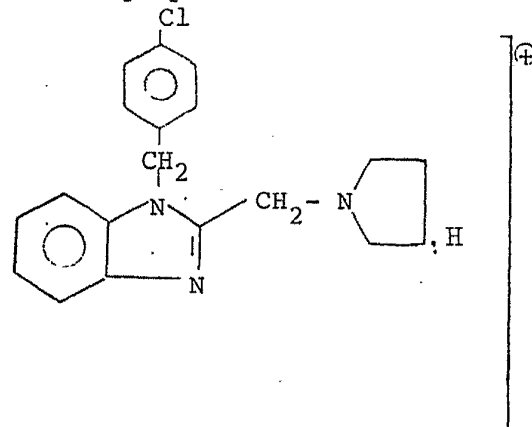


15



y R' representa un grupo

20

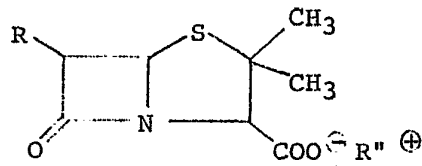


25

por reacción de un compuesto de fórmula general:

30

1



5

donde R tiene el mismo significado dado anteriormente y R'' representa un grupo amino, con una sal de 1-p-clorobencil-2-(1-pirrolidinilmetil)bencimidazol y un ácido fuerte, en el seno de disolventes próticos dipolares.

10

Estos compuestos tienen acción antibiótica y acción "retardante" en forma inyectable.

EJEMPLO

15

Se disuelven 72,4 g de hidrocioruro de 1-p-clorobencil-2-(1-pirrolidinilmetil)bencimidazol en una mezcla de 200 ml de agua destilada y 300 ml de isopropanol y se calienta a 35°C.

Se disuelven 96 g de ampicilinato de trietilamina en 800 ml de agua destilada y se calienta a 35°C.

20

Lentamente se agrega la solución de ampicilinato a la solución de 1-p-clorobencil-2-(1-pirrolidinilmetil)bencimidazol, siempre a 35°C. Se enfría lentamente a 5°C a lo largo de un periodo de 2,5 horas. Se filtra y se lava el producto cristalino resultante con 200 ml de agua/isopropanol en una relación 5:1, a 0°C. Se seca a vacío, obteniéndose 105 g de producto.

25

Análisis para $C_{35}H_{39}O_4N_6SCl$:

Calculado : C, 62,22; H, 5,78; N, 12,44; S, 4,74 Cl,5,26

Encontrado: C, 62,1; H, 5,82; N, 12,47; S, 4,75 Cl,5,29.

Potencia yodométrica: 534 mcg/mg.

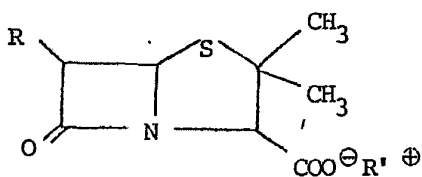
30

Potencia biológica: 100 %.

1 En resumen, la Patente de Invención que se solicita
deberá recaer sobre las siguientes:

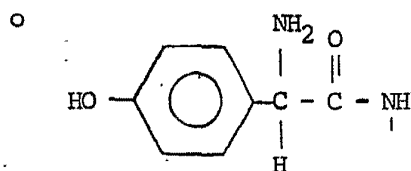
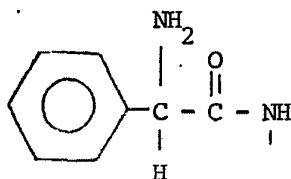
REIVINDICACIONES

5 1. Un procedimiento de preparación de sales de áci-
dos aminados de fórmula general:

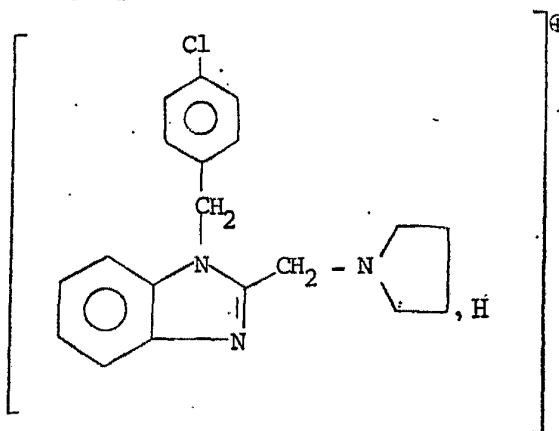


I

10 donde R representa un grupo de fórmula:



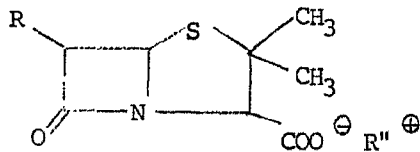
20 y R' representa un grupo de fórmula



25

30 cuyo procedimiento se caracteriza por hacer reaccionar un
compuesto de fórmula general:

1



5

donde R tiene el significado dado anteriormente y R'' representa un grupo amino, con una sal de 1-p-clorobencil-2-(1-pirrolidinilmetil)bencimidazol y un ácido fuerte.

10

2. Un procedimiento según la Reivindicación 1, caracterizado por efectuar la reacción en el seno de una mezcla de disolventes próticos dipolares.

3. Un procedimiento según las Reivindicaciones 1 y 2, caracterizado por efectuar la reacción a una temperatura comprendida entre 5 y 50°C.

15

4. Un procedimiento según las Reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque los compuestos de fórmula general I cristalizan directamente en el medio reaccionante.

5. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE SALES DE ACIDOS AMINADOS.

20

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de cinco páginas mecanografiadas.

25

Madrid, 11 de Mayo de 1976
BERNARDO UNGRIA
P.P.

30