

152807



P A T E N T E
D E
I N T R O D U C C I Ó N

152807

por "UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE COMPUESTOS SULDAMIDICOS SOLUBLES Y QUE SON TERAPEUTICAMENTE ACTIVOS Y CASI ATOXICOS", a favor de la razón social española SOCIEDAD GENERAL DE FARMACIA, S.A., domiciliada en Esplugas (Barcelona).

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

Los derivados de la para amino fenil sulfamida y demás medicamentos del grupo de las sulfamidas, que conservan libre el grupo amino situado en posición para con respecto al sulfamídico, se preparan en el extranjero en forma tal que, sin perder las propiedades terapéuticas de los productos iniciales, se consigue en ellos un considerable aumento de solubilidad con paralela disminución de la toxicidad propia de dichos compuestos.

5. Según el procedimiento practicado en el extranjero, estos compuestos se preparan por la introducción de un grupo metilen-sulfónico o metilen-sulfoxílico en substitución de uno de los hidrógenos del grupo amino, libre en situación para.

10. Esta introducción puede conseguirse haciendo actuar el oximetam bisulfito sódico o el oximetan sulfoxilato sódico.

15.



152807

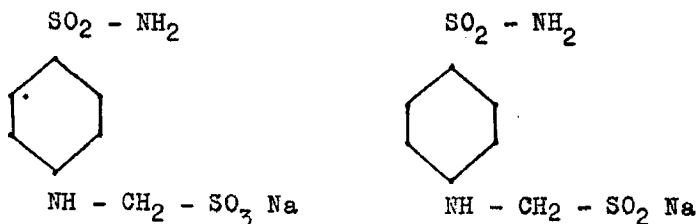
o sobre la substancia que se trata de solubilizar disuelta en un vehiculo apropiado.

Otro método de ejecución consiste en hacer actuar simultáneamente el metanal y el bisulfito o hidrosulfito sódico sobre la substancia a solubilizar.

5.

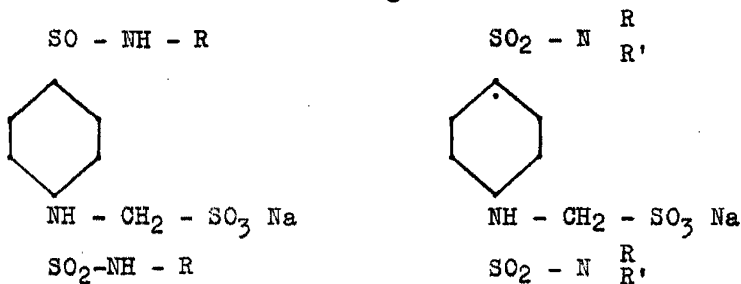
Además de los derivados de la p. amino fenil sulfamida

10.

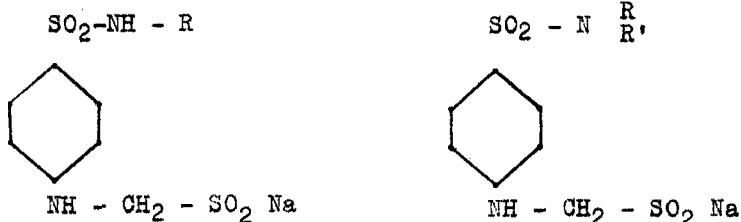


la presente invención comprende también la preparación de derivados acil, aril y alquil sulfamidados correspondientes de derivados a las fórmulas siguientes:

15.



20.



25.

en las que R y R' pueden representar un radical acil, aril, alquil u otro semejante, pudiendo en cada caso en que existan, representar R y R' iguales o distintos radicales.

Los ejemplos siguientes muestran cómo puede ser llevada a la práctica la invención. Queda, sin embargo, bien

30.

entendido, que no se limita de ningún modo a los detalles

152807



referidos en estos ejemplos.

Ejemplo 1.-

5. Se disuelven 8,83 gramos de oximetan bisulfito sódico en 65 cc. de agua destilada. Se calienta a 80° y se le añaden 10 gr. de para amino fenil sulfamida manteniendo la agitación y el calor hasta disolución completa. Se concentra regulando la temperatura y deja enfriar. Cristaliza el para sulfamido-fenil-amino-metilen sulfonato sódico.

10. Cristales solubles al 15 % en agua fría y que se carbonizan sin fundir.

Ejemplo 2.-

15. Se disuelven 12 gramos de oximetan sulfoxilato sódico en 100 cc. de agua. Se calienta a 60° y se le añaden 15 gr. de para amino fenil sulfamida. Se continúa calentando y agitando hasta disolución completa. Se concentra regulando la temperatura y deja enfriar. Cristaliza el para sulfamido-fenil-amino-metilen sulfoxilato sódico en forma de agujas solubles en agua y que se carbonizan sin fundir.

Ejemplo 3.-

20. Se disuelven 2'33 gramos de bisulfito sódico anhidro en 100 cc. de agua a 50°. Se añaden 6,41 gr. de p. amino fenil sulfamida agitando hasta disolución completa y una vez disuelta 4'65 gr. de solución de metanal al 40 %. .Se mantiene la temperatura y la agitación durante una hora. Se concentra y deja enfriar. Cristaliza el para-sulfamido-amino-metilen sulfonado sódico.

Ejemplo 4.-

30. Se disuelven 2'01 gr. de hidrosulfito sódico en 100 cc. de agua a 50°. Se añaden 7'00 gr. de para amino fenil sulfamida agitando hasta disolución completa y una vez di-



152807

suelta 5 gr. de metanal al 40 %. Se mantiene la temperatura y la agitación durante una hora. Se concentra y deja enfriar. Cristaliza primeramente el p. sulfamido fenil amino metilen sulfonato sódico y de las agujas madres concentradas nuevamente cristaliza el para sulfamido-fenil-amino-metilen-sulfoxilato sódico.

- 5.
- Como ya se ha dicho, la presente patente no queda limitada estrictamente a los ejemplos expuestos como casos de ejecución, ya que aquél se extiende a todas las posibilidades de realización, siempre dentro de la esencialidad de la invención.
- 10.

- . -

N O T A

Hecha la descripción del presente invento, se declara como no practicadas ni puestas en ejecución en España, las siguientes reivindicaciones:

- 15.
1. Un procedimiento para la preparación de compuestos solubles y menos tóxicos de la p. amino fenil sulfamida y demás cuerpos de ella derivados, en los que se conserva libre el grupo amino situado en posición para con respecto al sulfamídico, tratándolos por el oximetan bisulfito sódico o el oximetan sulfoxilato o por el metanal conjuntamente con el bisulfito o el hidrosulfito sódico según los casos, con-
- 20.

152807



centrando bajo agitación y dejando cristalizar.

2. Un procedimiento de preparación de compuestos sulfamídicos solubles y que son terapéuticamente activos y casi atóxicos.

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

Madrid, a 16 de mayo de 1941.

SOCIEDAD GENERAL DE FARMACIA, S.A.

p.a.

152807