



153777 2. -

grupos alquílicos se pueden emplear dosis más reducidas para conseguir el máximo efecto útil, con lo cual se disminuyen los riesgos tóxicos que acompañan a la administración de todas las sulfonamidas.

5 Especiales resultados se han obtenido con algunos de estos cuerpos en el tratamiento de la blenorragia aguda y sus complicaciones, así como en la gonococia crónica y en particular en el tratamiento ambulatorio Loeche y Wawersig (deut. Med. Wschr 1940 nº II p. 283) que trabajaron sobre un vastísimo material, empleando la técnica de "choques" encuentran con alguno de estos preparados que el número de curaciones absolutas después del primer choque, incluyendo la gonococia masculina y la femenina es de 84,3 % y llega a alcanzar el 95,7 % después del segundo porcentaje no rebasado, ni aun alcanzado, hasta ahora, por ninguno de los demás procedimientos terapéuticos empleados.

15 Ningún otro grupo de las sulfonamidas hoy existentes en el comercio garantiza de manera absoluta las tan temidas complicaciones de la gonococia, pero en cambio los autores antes citados, y con ellos coinciden en general todos los técnicos competentes, han visto lograda la desaparición de las molestias agudas en la epidemitis en dos o tres días, empleando sulfonamidas del tipo que nos ocupa.

20 También en la prostatitis tanto folicular como parenquimatosa se logra en un período de tiempo inferior a las cuarenta y ocho horas la desaparición de los dolores y de la poliuria con el empleo de estos cuerpos.

25 Por todos los datos anteriores se comprenderá la grandísima importancia que para la terapéutica moderna, tiene la fabricación de este tipo de sulfonamidas y por ello los "Laboratorios Españoles Deltia" no han escatimado esfuerzo alguno hasta conseguir
30 un método propio de preparación industrial de estos medicamentos.



El procedimiento hasta ahora patentado para la obtencion de estos cuerpos consiste en condensar los derivados aminicos aromaticos acetilados, de sal sulfonamidas, con halogenuros de sulfamidas alquiladas, en presencia de cloruro de aluminio. Este procedimiento como todos los que utilizan condensaciones con cloruro de aluminio es sumamente engorroso de realizar, sobre todo en escala industrial, y solo los paises que tienen una industria quimica muy adelantada pueden realizarlos con exito.

Despues de varias investigaciones, llevadas a cabo en nuestros laboratorios, hemos conseguido encontrar un metodo mas asequible a los medios de que dispone hoy dia la industria quimica española. El procedimiento es el que a continuacion se describe: Se prepara en primer lugar la amina alquilada por los procedimientos generales de quimica organica. Esta amina generalmente gaseosa se hace reaccionar directamente con halogenuros sulfamidicos de aminas aromaticas acetiladas, unas veces en disolventes hidroxilicos y otras no hidroxilicos, segun los casos, verificandose el desprendimiento de hidrácido, formado por la union del halogeno de una molecula con el hidrogeno aminico que ha quedado libre de la alquilacion de la otra. El derivado acetilamino asi obtenido se hidroliza por los medios generales y disponiendo nuevamente de grupos aminicos puede verificarse una nueva condensacion con un halogenuro sulfamidico. Este procedimiento puede repetirse nuevamente con lo que se llegan a obtener distintos tipos de amino-sulfamidas en las que los hidrogenos de la funcion sulfamidica se encuentran mas o menos alquilados por distintos grupos.

N O T A

Se reivindica como objeto de esta patente de invencion, un procedimiento industrial de alquilacion de la funcion sulfonamido consistente en la sustitucion del halogeno de un halogenuro sul-

153777



153777 4 -

famidico de aminas aromaticas acetiladas, por un radical aminico
alquilado, verificandose esta sustitucion simplemente por contacto
directo de los cuerpos en disolventes hidroxilicos o no hidroxili -
cos, segun los casos, sin necesidad de agente intermedio alguno y
5 tan solo favorecida por la accion del calor. El derivado acetilami -
nico asi obtenido se hidroliza y la amina que resulta puede conden -
sarse nuevamente con un halogenuro sulfamidico de amina aromatica
acetilada y asi sucesivamente. Se consigue pues obtener por este me -
todo, sumamente sencillo, cuerpos mas o menos complejos que posean
10 al mismo tiempo la funcion aminica y una o varias sulfamidicas al -
quiladas.

2/ - " Procedimiento industrial de alquilacion de la fun -
cion sulfonamida " segun se describe y reivindica en esta memoria
descriptiva.

Consta esta descripcion de cuatro hojas foliadas y escri -
15 tas a maquina por una sola de sus caras.

Madrid, 17 de Julio de 1941. -

[Handwritten signature]
153777