

153779



Expediente 9563.-

153779

EB/. -

MEMORIA DESCRIPTIVA

para una patente de Invencion, por veinte años, por: "Procedimien -  
to de obtencion industrial de cuerpos formados por sustitucion del  
hidrogeno de la funcion aminica por radicales aromaticos en cuerpos  
que poseen ademas la funcion sulfonamida" a favor de la firma  
ZELTIA S/A, residente en Porriño (Pontevedra). -

-----

Las sulfonamidas presentan con frecuencia efectos toxi -  
cos, aunque el numero de muertes producidas haya sido muy pequeño.  
Por ello los investigadores se dirigieron a buscar compuestos sul -  
famidicos que con una gran actividad antiestreptococica tuviesen  
efectos toxicos minimos.

Habiendo demostrado Englehert, hace ya cincuenta años,  
que el cuerpo animal se protege el mismo contra la anilina acetilan -  
dola y transformandola en sustancia menos dañosa, como la antife -  
brina, se ha utilizado el proceso de acetilacion para disminuir la  
toxicidad de algunos derivados. Asi se hizo en el caso de la fena -  
tina y de la arsacetina. Este proceso, sin embargo, no ha dado buen  
resultado en el caso de las sulfamidas, pues acetilando su grupo  
aminico se ha encontrado una disminucion de suma accion antiestrep -  
toccica.

153779

2 -



Por ello pensando en otros procedimientos de bloqueo de la función amínica se llegó a preparar cuerpos de menor toxicidad sustituyendo los hidrógenos amínicos por radicales aromáticos con la ventaja de que no se disminuye su acción antiestreptocócica.

5 El tener estos cuerpos menos efectos tóxicos permite emplearlos en tratamientos de larga duración, así como en medicación profiláctica, cuando se está en inminente peligro de contraer una estreptococia (partos o abortos asistidos en medios defectuosos). También su lenta eliminación, producto de la propia modificación de su estructura molecular les permite desplegar una acción bacteriostática más mantenida, propiedad que contribuye a aumentar su eficacia en el tratamiento de estreptococias de marcha menos tumultuosa.

15 Muchos de estos preparados se utilizan con éxito en las enfermedades en las que el estreptococo es el agente productor o asociado y en este sentido se emplean para combatir las erisipelas, linfagitis, afecciones faríngeas, otitis, artritis, accidentes post-parto o post-abortum. Domarus (deu. Med. Meschfr 1940 pag. 197) ha obtenido también buenos resultados en el tratamiento de los reumatismos estreptocócicos. Se emplean también por su escasa toxicidad en las sepsis focales, endocarditis lentas, etc., en donde hay que contar con plazos largos de administración del fármaco, así como para la profilaxis sistemática de la sepsis puerperal, etc. etc.

25 Todas las aplicaciones enunciadas anteriormente indican la importancia terapéutica de estos fármacos y ello ha hecho que nos dedicáramos a preparar cuerpos de esta serie. De los trabajos realizados en nuestros laboratorios de investigación hemos llegado al siguiente procedimiento:

30 Se suspende la sulfonamida en agua bicarbonatada y se calienta hasta disolución completa de la misma. Con una buena agi -

153779<sup>3</sup> -

tacion se deja caer entonces gota a gota una disolucion alcoholica del halogenuro cuyo radical queremos introducir, manteniendo el liquido caliente. El hidracido formado queda anulado por el exceso de bicarbonato y el producto sustituido insoluble en agua, se precipita con lo que no hay mas que recogerlo y cristalizarlo en disolvente apropiado segun el caso.

N O T A

Se reivindica pues como objeto de esta patente de invencion un procedimiento industrial de obtencion de cuerpos formados, por sustitucion del hidrogeno de la funcion aminica por radicales aromaticos, en cuerpos que posean ademas la funcion sulfonamida, consistente en:

1/Dejar caer gota a gota una disolucion alcoholica del halogenuro cuyo radical se quiera introducir sobre una disolucion alcalina de la sulfonamida, en presencia de bicarbonato sodico en exceso, para neutralizar el hidracido que se desprende. La reaccion se hace con agitacion continua y el producto sustituido resultante, insoluble en el agua se recoge y cristaliza en disolvente apropiado.

2/ "Procedimiento de obtencion industrial de cuerpos formados por sustitucion del hidrogeno de la funcion aminica por radicales aromaticos en cuerpos que poseen ademas la funcion sulfonamida" segun se describe y reivindica en esta memoria descriptiva.

Consta esta descripcion de tres hojas foliadas y escritas a maquina por una sola de sus caras.

Madrid, 17 de Julio de 1941. -

*[Handwritten signature]*

153779