

180162

PATENTE DE INVENCION

CIBA. Case 2408.



180162

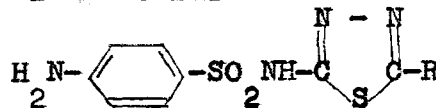
MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

"Procedimiento para la obtención de nuevos productos
"de condensación sulfanilamidotiodiazólicos".

Solicitantes: C I B A, Soci t  Anonyme, domiciliados
en BASILEA, Suiza.

La presente invenci n se refiere a la obtenci n de
productos de condensaci n del formaldehido con sulfanilami-
dotiodiazoles de la f rmula



5. donde R representa un grupo bajo de alquilo, como metilo, etilo o propilo. Los nuevos compuestos muestran en comparaci n con los citados sulfanilamidotiodiazoles propiedades terap uticas m s valiosas.

10. Se obtienen los productos de condensaci n de sulfanilami-
dotiodiazoles, si se ponen en reacci n sulfanilamidotiodiazo-

180162

- 2 -

180162



15. les de la fórmula arriba citada, con formaldehido. En lugar de formaldehido propiamente dicho pueden emplearse tambien agentes que desdoblan formaldehido, como paraformaldehido o hexametenotetramina. Se realiza ventajosamente la reaccion en presencia de agentes diluyentes, como agua, ácidos diluidos o disolventes orgánicos, por ejemplo alcohol.

20. La obtención de los nuevos productos de condensación, así como particularmente la posibilidad de su aislamiento en una forma adecuada para su aplicación terapéutica, no es de ningun modo un hecho natural, pues ciertas sulfanilamidas de la serie heterocíclica dan con formaldehido solamente productos untosos de reaccion.

25. Los compuestos preparados segun el procedimiento de la invención tienen aplicación como medicamentos.

En los siguientes ejemplos se describe la invención más detalladamente, existiendo entre las partes en peso y volumétricas la misma relación que rige entre gramo y centímetro cúbico.

30. EJEMPLO 1.

A 9 partes en peso de 2-sulfanilamido-5-etilo-tio-diazol-(1,3,4) disueltos en 100 partes vol. de un ácido clorhídrico aproximadamente 2'5 normal, se agregan a la temperatura del ambiente, gota a gota y agitando, 4'8 partes vol. de una solución de formaldehido al 40%. A partir de la primera gota se precipita el producto de condensación en forma de precipitado fino, blanco. Una vez adicionada la totalidad de la solución de formaldehido, se aspira, se lava con agua, se suspende en agua, se neutralizan los últimos residuos de ácido clorhídrico con sosa y se vuelve a aspirar. Después del secado a 50° C. se obtiene el nuevo producto de condensación en forma de un polvo blanco muy fino. Resulta muy poco soluble en el agua y

180162

180162

- 3 -



45. en los ácidos. Con lejía de sosa cáustica diluida se presenta la disolución ,después de haber agitado durante algun tiempo.

EJEMPLO 2.

50. En forma idéntica como en el ejemplo 1, se puede obtener el producto de condensación,partiendo de 2-sulfanilamido-5-metilo-tiodiazol-(1,3,4). Pero, tambien podrá obtenerse del siguiente modo:

55. A 27 partes en peso de 2-sulfanilamido -5-metilo-tiodiazol-(1,3,4), suspendidas en 250 partes vol. de alcohol etílico al 95%, se adiciona, agitando y a 75º C. una mezcla previamente calentada de 15 partes vol. de formaldehído al 40% y 100 partes vol. de alcohol etílico al 95%. Durante breve tiempo se forma en este caso una solución clara, comenzando a precipitarse muy pronto el producto de condensación. Se deja reposar durante 24
60. horas, se recoge el precipitado sobre un aspirador, se lava con alcohol, se seca y se pulveriza. El rendimiento será de 27 - 28 partes en peso.

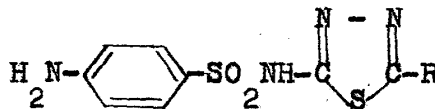
N O T A

65. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indica-
70. das son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no altere su principio fundamental. Tambien se hace cons-
tar que dicho invento corresponde a una patente presentada en Suiza, con fecha 18 de diciembre de 1946, nº 18260,
acogiéndose, por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor y siendo lo que cons-
tituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita patente de invención,por veinte años en España:
75. "Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación sulfanilamidotiodiazólicos"; caracterizándose



por lo siguiente:

- 1º.= Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación sulfanilamidotiodiazólicos, caracterizados porque se ponen en reacción sulfanilamidotiodiazoles de la fórmula



- con formaldehído, representando en dicha fórmula R un grupo alquílico bajo.

- 2º.= Procedimiento según reivindicación 1ª, caracterizándose porque se obtiene un nuevo producto de condensación, poniendo en reacción el 2-sulfanilamido-5-metilotiodiazol-(1,3,4) con formaldehído.

- 3º.= Procedimiento según reivindicación 1ª, caracterizándose porque se obtiene un nuevo producto de condensación, poniendo en reacción el 2-sulfanilamido-5-etilo-tiodiazol-(1,3,4) con formaldehído.

- 4º.= Procedimiento según reivindicaciones anteriores, caracterizándose porque se realiza la reacción en presencia de ácidos diluidos.

- 5º.= Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación sulfanilamidotiodiazólicos; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria que consta de cuatro hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 17 de octubre de 1947.

C I B A, Société Anonyme
Por Poder de J. GOMEZ