

181029

PATENTE DE INVENCIÓN

CIBA. Case 2407

181029



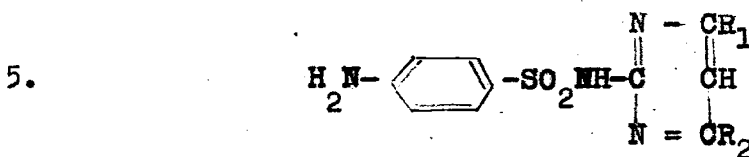
MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

"Procedimiento para la obtención de nuevos productos
"de condensación sulfanilamido-pirimidínicos".

Solicitante: C I B A, Sociéte Anonyme,
con domicilio en Basilea, Suiza.

La presente invención tiene por objeto la
obtención de productos de condensación del formaldehído
con sulfanilamidopirimidinas de la fórmula



en la que R_1 y R_2 representan átomos de hidrógeno o
grupos metílicos. Los nuevos compuestos muestran, en
comparación con las citadas sulfanilamidopirimidinas,
10. propiedades terapéuticas más valiosas.

Se obtienen los productos de condensación de
sulfanilamidopirimidinas, poniendo en reacción

181029

- 2 -



- sulfanilamidopirimidinas de la fórmula arriba citada, con formaldehído. En lugar de formaldehído propiamente
15. dicho, pueden emplearse también agentes que desprendan formaldehído, tales como paraformaldehído o hexametileno-tetramina. La reacción se realiza ventajosamente en presencia de diluyentes, tales 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 ningún modo un hecho natural, pues ciertas sulfanilamidas de la serie heterocíclica
25. dan con formaldehído solamente productos untosos de reacción.
- Los compuestos preparados según el procedimiento de la invención tienen aplicación como medicamentos.
- En los siguientes ejemplos se describe la
30. invención más detalladamente, rigiendo entre las partes en peso y volumétricas la misma relación que rige entre gramo y centímetro cúbico.
- EJEMPLO 1.
35. 26'4 partes en peso de 2-sulfanilamido-4-metilopirimidina se suspenden en 260 partes volumétricas de agua, disolviendo mediante adición de 40 partes vol. de ácido clorhídrico concentrado. A continuación se introducen paulatinamente, gota a gota y agitando bien, 15 partes vol. de solución de formaldehído al 40%.
40. Pronto empieza a precipitarse el producto de la reacción en forma fina. Una vez adicionada toda la solución de formaldehído, se deja reposar durante una hora, se aspira, se lava bien con agua, se suspende en agua, neutralizando los últimos restos de ácido con
45. solución de sosa, se aspira y se seca a 50° C.



De esta manera se obtienen 28 partes en peso de un polvo ligeramente amarillo que es insoluble en ácidos, pero que resulta soluble en álcalis diluidos.

EJEMPLO 2.

50. 27'8 partes en peso de 2-sulfanilamido-4,6-dimetilopirimidina se disuelven en 300 partes vol. de un ácido clorhídrico aproximadamente 1'5 normal, introduciendo, gota a gota, y agitando la solución, un total de 15 partes vol. de una solución de formaldehído al 40%. Al cabo de poco tiempo se enturbia la solución de reacción y se precipita paulatinamente el producto de reacción en forma de copos. Después de breve reposo se aspira. El producto de condensación así obtenido se somete a una ulterior elaboración en igual forma como se describe en el ejemplo 1. Resulta un polvo fino, casi blanco, que se disuelve en lejía de sosa cáustica.

EJEMPLO 3.

65. 25 partes en peso de 2-sulfanilamido-pirimidina se suspenden en 350 partes vol. de alcohol etílico al 50%, se calientan, agitando a 70° C. y se adiciona una mezcla caliente de 22'5 partes vol. de solución de formaldehído al 40% y 100 partes vol. de alcohol etílico al 50%. Siempre agitando, se agregan después paulatinamente otras 22'5 partes vol. de solución de formaldehído produciéndose una solución clara. Al enfriar se precipita el producto de condensación en forma fina. Se obtienen 28 partes en peso de un polvo casi blanco soluble en lejía de sosa cáustica diluida y que funde a unos 75. 192° C. descomponiéndose.
-

181029

- 4 -

N O T A .-



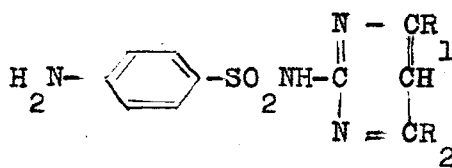
80. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que dicho invento corresponde a una patente presentada en Suiza con fecha 19 de diciembre de 1946, nº 18259, acogiéndose, por lo tanto, a los

85. beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor y siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita patente de invención, por 20 años en España: " Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación

90. sulfanilamido-pirimidínicos"; caracterizándose por lo siguiente:

1ª. = Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación sulfanilamido-pirimidínicos", caracterizándose porque se ponen en reacción con

95. formaldehído, las sulfanilamido-pirimidinas de la fórmula



100. donde R₁ y R₂ representan átomos de hidrógeno o grupos metílicos.

2ª. = Procedimiento según reivindicación 1ª, caracterizándose porque se pone en reacción la 2-sulfanilamido-pirimidina con formaldehído.

105. 3ª. = Procedimiento según reivindicación 1ª, caracterizándose porque se pone en reacción la 2-sulfanilamido-4-metilo-pirimidina con formaldehído.

4ª. = Procedimiento según reivindicación 1ª,

181029

- 5 -



110. caracterizado porque se pone en reacción la 2-sulfanil-amido-4,6-dimetilo-pirimidina con formaldehido.

5ª.= Procedimiento según reivindicaciones 1ª - 4ª, caracterizado porque se realiza la reacción en presencia de ácidos diluidos.

115. 6ª.= Procedimiento para la obtención de nuevos productos de condensación sulfanilamido-pirimidínicos"; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria, que consta de cinco hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 19 de diciembre de 1947.

C I B A, Société Anonyme.

Por Poder de J. GÓMEZ ACEBO

