

220193

220193



MEMORIA DESCRIPTIVA  
=====

Correspondiente a una PATENTE DE INTRODUCCION, cuyo registro se solicita por diez años.

A favor de

D. Bernardo y D. Antonio MONASTERIO SANCHEZ, de nacionalidad española.

Residentes en BARCELONA.-P<sup>o</sup> General Mola, 12

por :

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN COMPUESTO DE CONDENSACION PARTIENDO DE TRES MOLECULAS DE SULFATIAZOL Y TRES DE FORMALDEHIDO\*.

- - - -



5.- Es sabido que los productos de condensación del formol con el sulfatiazol son demasiado complejos para darles una fórmula definitiva, debido a que no tan solo se provoca la condensación en la posición N<sup>4</sup> h N<sup>1</sup> sino que los productos de condensación más sencillos en cada una de estas posiciones reaccionan nuevamente en ciertas condiciones, para las cuales juega un papel primordial la temperatura, la concentración, la presión, los disolventes, el grado de PH, etc., etc., para conformar estructuras mucho más complejas y difíciles de determinar.

10.- Está comprobado que mientras los N<sup>1</sup> sus derivados y sus sales sódicas son poderosos agentes anti-bacterianos, los N<sup>4</sup> derivados tienen una escasa actividad anti-bacteriana.

15.- Es natural pues, que de este hecho se deduzca que el formaldehído por sí solo no confiere a los derivados del HCHO sus propiedades anti-bacterianas y por lo expuesto anteriormente, habría que dar un papel importante al grupo NH aromático y por lo tanto, y como consecuencia a la situación de los grupos metilén en la nueva molécula formada.

20.- Así como para la mayor parte de las sulfamidas, la concentración efectiva en la sangre se eleva de 7 a 10 miligramos por 100, en los N-formol derivados en general, y en particular para el derivado sulfotiazólico basta una concentración de 1 a 2 miligramos por ciento independiente de la dosis y su forma de administración.

25.- Por lo tanto, es evidente que en el caso de los derivados del formosulfatiazol existe un mecanismo de acción diferente.

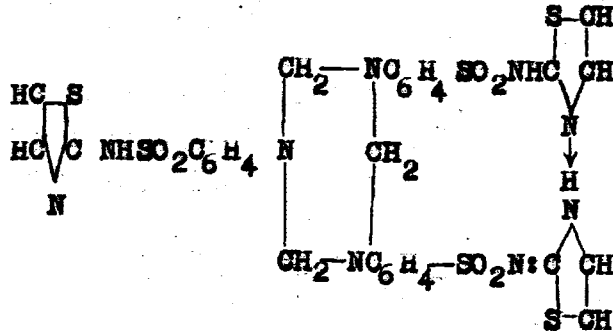
30.- Es muy posible que la posición del grupo formaldehído en la molécula, en donde su contenido oscila entre el 11 y el 12% y de esta en los tejidos, juega un papel importante a causa de sus interacciones con los aminoácidos de los te-



idos vivos de una parte, y por otra, con las endo y exo-  
toxinas de las proteínas bacterianas y el virus.

35.-

La estructura química que terapéuticamente resulta más  
activa corresponde a la formada por la condensación de tres  
moléculas de sulfatiazol con otras tantas de formol en la  
siguiente disposición:



40.-

De la fórmula anterior se deduce que el porcentaje de  
cada elemento es teóricamente el siguiente:

C 44,99 - H 3,37 - O 11,98 - N 15,73 - S 23,97  
correspondiendo al obtenido por análisis los siguientes va-  
lores:

C 45,12 - H 3,25 - O 11,52 - N 15,85 - S 24,15

45.-

Para la obtención de este compuesto es preciso hacer  
reaccionar bajo determinadas condiciones el sulfatiazol y el  
formaldehído siguiéndose el proceso técnico que se describe  
a continuación.

50.-

Se dispone en un autoclave de acero inoxidable y capa-  
cidad de 100 lts., provisto de agitador, de 25 Kgs. de sul-  
fatiazol, 50 lts. de agua y 15 lts. de una solución acuosa  
de formaldehído preparada al 40%. Se pueden utilizar tam-  
bién formaldehídos o sustancias que desprendan formaldehído.

55.-

Se cierra el autoclave y se eleva la temperatura hasta  
conseguir los 80° C. Para mantener la deseada concentración  
de formaldehído en la solución a dicha temperatura, se ele-

220193

17 FEB



va la presión hasta cinco atmósferas mediante aire o gas comprimido, con lo cual, la reacción es completa.

60.- El producto obtenido se lava por filtración y se secando al final un polvo blanco insípido, insoluble en el agua y los ácidos y soluble en los álcalis, por descomposición, con un punto de fusión con descomposición por encima de los 200° C.

65.- Es tan interesante la reacción y técnica del proceso anterior, así como las propiedades químicas y terapéuticas del compuesto formil-sulfotiazol, que no se ha dudado en elaborar este en nuestra patria, pensando en las grandes ventajas que el producto ha de aportar y como consecuencia, da origen a la patente de introducción que se ha desarrollado y cuyas reivindicaciones principales siguen a continuación.

R E I V I N D I C A C I O N E S

75.- 1).- "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN COMPUESTO DE CONDENSACION PARTIENDO DE TRES MOLECULAS DE SULFATIAZOL Y TRES DE FORMALDEHIDO" caracterizado por la obtención de un producto de condensación de sulfotiazol con formaldehido siguiendo un proceso químico en autoclave de acero inoxidable y capacidad de 100 litros correspondiente a una mezcla de 25 kilogramos de sulfatiazol, cincuenta litros de agua y quince litros de solución acuosa de formaldehido preparada al 40%, provisto de agitador para el movimiento de la mezcla.

85.- 2).- "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN COMPUESTO DE CONDENSACION PARTIENDO DE TRES MOLECULAS DE SULFATIAZOL Y TRES DE FORMALDEHIDO" según la reivindicación anterior, caracterizado por cerrarse el autoclave y elevar la tempera-

220193



90.-

tura mediante la elevación de la presión interna a cinco atmósferas, con auxilio de aire o gas comprimido, realizándose la reacción completa; pasándose el producto por un lavado de filtración y secado final.

3ª).- "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN COMPUESTO DE CONDENSACION PARTIENDO DE TRES MOLECULAS DE SULFATIAZOL Y TRES DE FORMALDEHIDO".

La presente memoria descriptiva consta de cinco hojas foliadas y mecanografiadas por una sola cara, componiendo un total de noventa y seis líneas, incluidas éstas.

Madrid, 17 de febrero de 1.955.-

ANTONIO ESCRIBA

E.F.

