



# PATENTNI SPIS BR. 13726

**Kaštel tvornica kemijsko-farmaceutskih proizvoda d. d. i Dr. Ing. Prelog Vlado, Zagreb, Jugoslavija.**

Postupak za spravljanje rastvora p-amino-benzol-sulfamida, podesnog za injekciju.

Prijava od 20 februara 1937.

Važi od 1 avgusta 1937.

Već je poznat p-amino-benzol-sulfamid odn. njegovi na azotu supstituisani derivati. Ovi imaju dobre osobine za lečenje streptokoknih infekcija. Ovi p-amino-benzol-sulfamidi su baze, koje su u vodi vrlo slabo rastvorljive, te se ih iz tog razloga ne može upotrebljavati u vidu injekcija, već samo per os.

Usled dobrih osobina za pobijanje streptokoknih infekcija postoji veliki interes, da se ova jedinjenja učine rastvorljivim u vodi, za omogućavanje davanja u vidu injekcije.

Pokušaj, da se iz p-amino-benzol-sulfamida spravljaју lako rastvorljive soli, nisu vodili do cilja, pošto soli imaju intenzivno kisele reakcije i zbog toga su nepodesne za injekciju. Soli sa slabim kiselinama isto tako ne odgovaraju cilju, pošto se u vodi raspadaju i izlučuju u vodi nerastvorljivu slobodnu bazu. Radi toga se p-amino-benzol-sulfamidi do sada nisu upotrebljavali u formi injekcije.

Kako je potrebno u mnogim slučajevima davati ovaj lek u formi injekcije, to je svrha ovog pronalaska, da se nađe način kako bi se mogli p-amino-benzol-sulfamidi prevesti u rastvorljivu formu.

Na osnovu raznih mnogobrojnih eksperimenata utvrđeno je, da se dodatkom nekih organskih supstancija mogu i slobodne baze p-amino-benzol-sulfamida prevesti u vodeni rastvor, pogodan za injekciju. Utvrđeno je u smislu ovog pronalaska, da za taj cilj odgovara dietilamid dietilamino-

sirćetne kiseline ili 1-fenil — 2, 3-dimetil-piracolon-5.

Primer izvođenja:

100 g p-amino-benzol-sulfamida i 500 g 1-fenil-2, 3-dimetil-piracolona-5 rastvaraju se u vodi i rastvor se dopuni vodom na 1 litar. Ovaj rastvor može se sterilizirati i isti je podesan za intrevenozne i intramuskularne injekcije.

Današnje stanje tehnike nije sasvim u stanju, da tačno objašnjenje, zašto prisustvo ovih organskih supstancija prouzrokuje rastvorljivost u vodi, inače slabe baze p-amino-benzol-sulfamida. Pri tome se ne stvara novo jedinjenje, dakle se u ovom slučaju radi o pojavi fizikalno-hemijske prirode, verovatno nastaje rastvor usled pojave t.zv. hidrotropije.

### Patentni zahtevi:

1.) Postupak za spravljanje rastvora p-amino-benzol-sulfamida i njegovih derivata podesnih za injekcije, naznačen time, što se ova u vodi inače vrlo slabo rastvorljiva jedinjenja, učine rastvorljivim u vodi, dodatkom nekih drugih organskih supstancija.

2.) Postupak po zahtevu 1, naznačen time, što se kao organska supstanca upotrebljava dietilamid dietilamino-sirćetne kiseline.

3.) Postupak po zahtevu 1, naznačen time, što se kao organska supstanca upotrebljava 1-fenil-2, 3-dimetil-piracolon-5.

