

Les sulfamides bactériostatiques

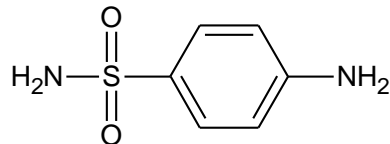
Introduction:

-Les Sulfamides étaient largement utilisés dans le traitement des infections bactériennes.

-leur usage a régressé après apparition de nouvelles molécules ATB.

-l'introduction en thérapeutique des associations sulfamide + diaminopyridine (sulfaméthoxazole + trimétoprime) a augmenté leur usage dans le traitement des infections bactériennes .

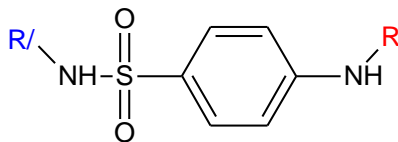
-Structure et dénomination



4-aminobenzenesulfonamide (Nom chimique)
Sulfanilamide (DCI)

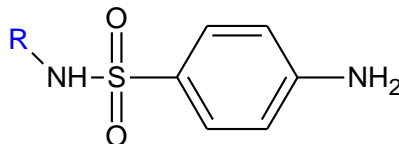
-Structure des sulfamides bactériostatiques

R/: radical acyle ou aryle



Les sulfamides bactériostatiques

-Classification des sulfamides bactériostatiques



R : Radical aliphatique : Sulfacétamide (DCI)

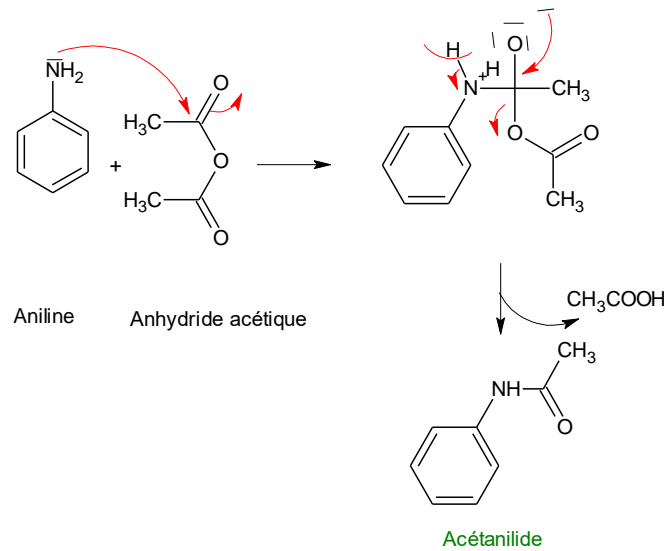
Radical hétérocyclique substitué : Sulfadiazine (DCI)

Radical hétérocyclique : Sulfaméthoxazole (DCI)

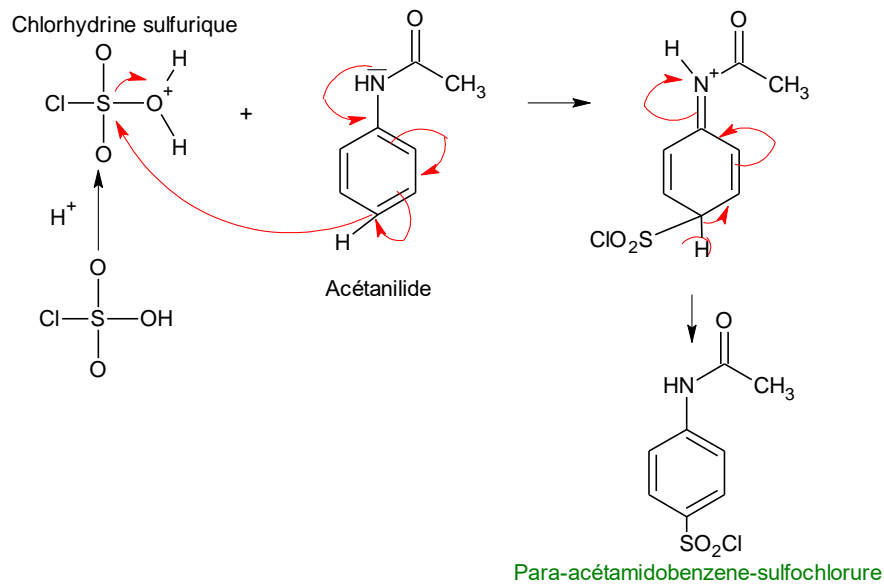
Préparation des sulfamides bactériostatiques

A/Préparation du sulfanilamide

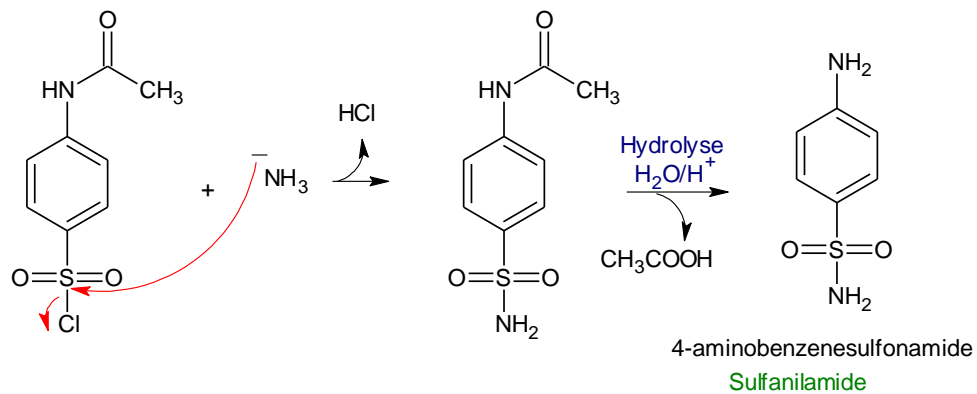
1. Acétylation de l'aniline



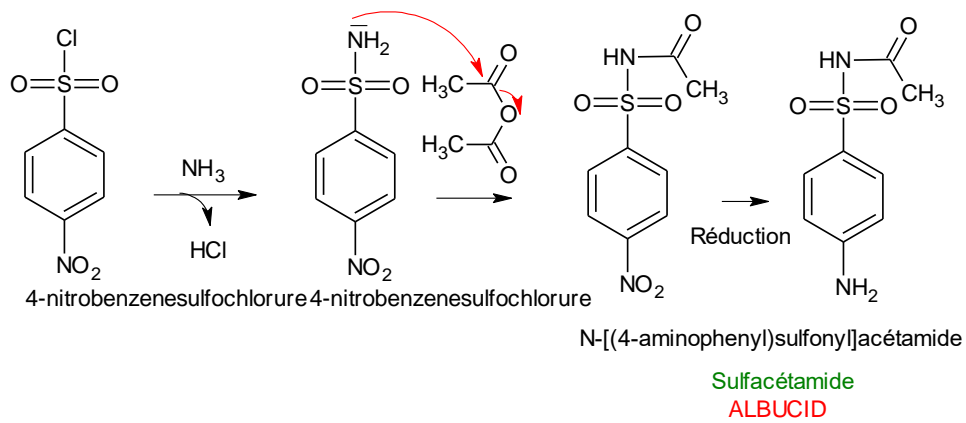
2. Action de chlorhydrique sulfurique



3. Action de l'ammoniaque et hydrolyse

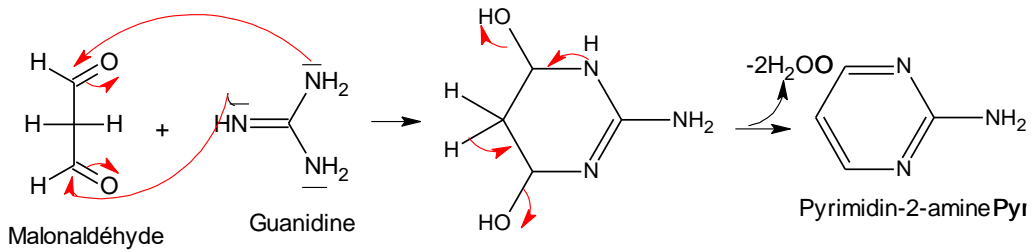


B/Préparation du Sulfacétamide

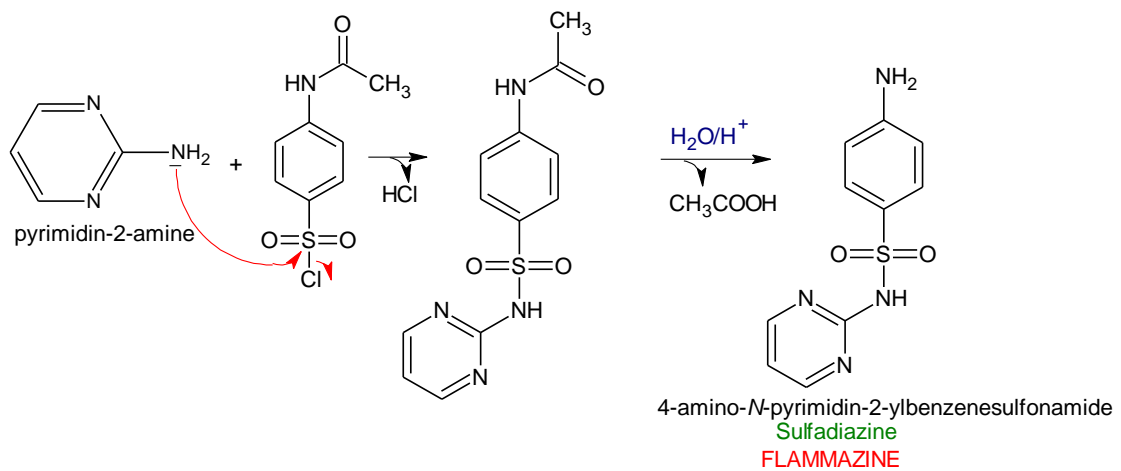


C/Préparation de la sulfadiazine

1. Préparation de l'hétérocycle

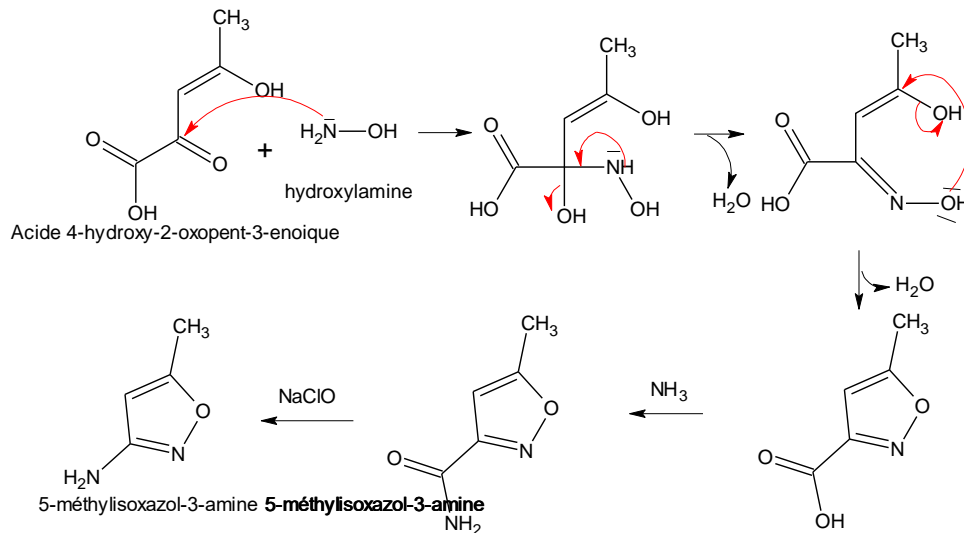


2. Condensation avec le para-acétamidobenzène-sulfochlorure

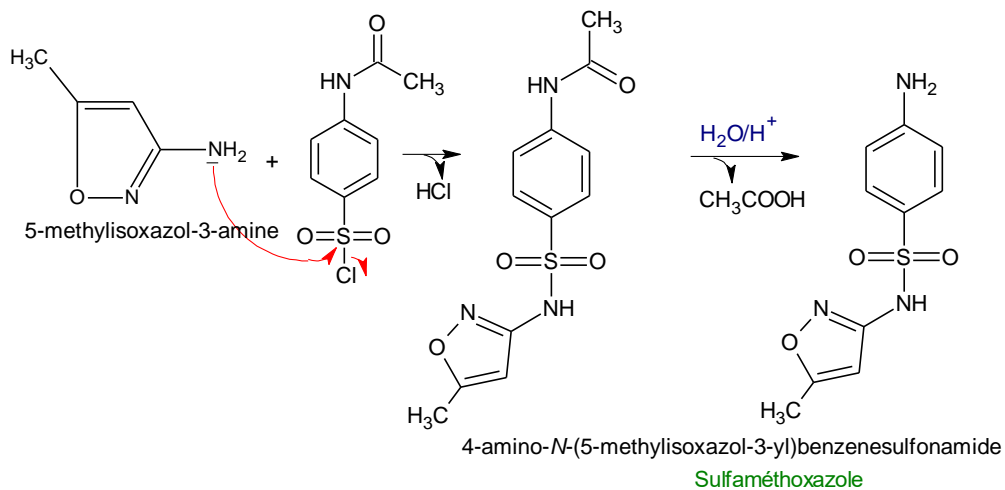


D/Préparation du sulfaméthoxazole

1. Préparation de l'hétérocycle



2. Condensation avec le para-acétamidobenzène-sulfochlorure



Mode d'action et relation structure/activité des sulfamides bactériostatiques

- Les structures minimales requises pour une action antibactérienne sont contenues dans le sulfanilamide.
- Le point important du groupe $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ est que le soufre soit directement lié au noyau benzénique.
- Le groupe $-\text{NH}_2$ en para est essentiel à l'activité.
- La substitution sur le NH_2 du groupe sulfamide par un noyau hétérocyclique aromatique fournit des composés hautement efficaces.
- Analogues structuraux et antagonistes compétitifs du PABA \longrightarrow S'opposent à l'utilisation normale de cet acide pour la synthèse de l'acide folique \longrightarrow s'opposent ainsi à la fermeture du noyau purique et l'édification des protéines microbiennes

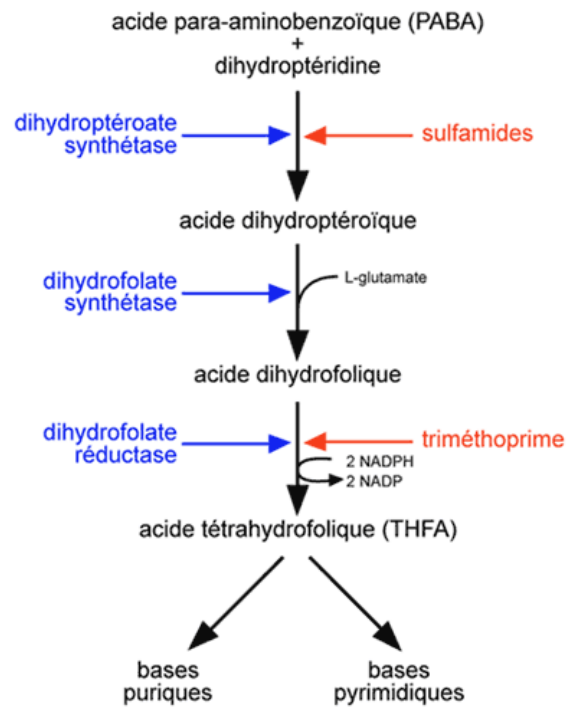


Figure.1. Influence des sulfamides sur la synthèse de l'acide folique