

156775

156775

P - 1768.

Cas II.

MALA REPRODUCCION
POR DEFECTO DEL ORIGINAL

156775



18

18 ABR. 1942

MEMORIA DESCRIPTIVA
para solicitar
P A T E N T E D E I N V E N C I O N
en
E S P A Ñ A
por VEINTE años

a nombre de Deutsche Hydrierwerke Aktiengesellschaft,
entidad alemana, establecida en Rodleben bei Dessau-
Rosslau, Alemania, por:

"UN PROCEDIMIENTO PARA OBTENER
DERIVADOS DE SULFAMIDAS CICLICAS".

=====

Se ha descubierto que se consiguen valio-
sas combinaciones de sulfamidas ciclicas si se preparan
derivados de sulfamidas ciclicas de la fórmula general



18A

156775

156775

(H₂N.R.SO₂.NH.R'.SO₂.NX)_n-R", - en la cual R y R' significan un residuo aromático, heterocíclico o aromático-heterocíclico mixto, , R" un sistema anular heterocíclico, X hidrógeno o un residuo de hidrocarburo y n los números 1-3, - haciendo influir sobre ácidos sulfónicos de la fórmula general G.R.SO₂.NX.R'.SO₂N o sobre sus derivados de ácido sulfónico capaces de reacción, combinaciones heterocíclicas amino-sustituídas, o si se tratan combinaciones amínicas de la fórmula general (H₂N.R.SO₂.NX)_n-R" con ácidos sulfónicos de la fórmula general G.R.SO₂H o con sus derivados de ácidos sulfónicos capaces de reacción, - indicando G un residuo que se puede convertir en un grupo amínico-, y se forma después el grupo amínico.

Como sustancias de partida de la fórmula general G.R.SO₂.NH.R'.SO₂H o sus derivados puede emplearse, por ejemplo el cloruro 4-(4'-acetilaminobenzolsulfonamino)-benzolsulfónico, que se obtiene en la forma conocida por la acción de ácido clorsulfónico sobre anilida del ácido 4-acetilamino-benzolsulfónico. En lugar de los halogenuros de ácido sulfónico pueden emplearse también los mismos ácidos sulfónicos o sus correspondientes ésteres, por ejemplo, éster fenólico. Además, en lugar del grupo acetilamínico, puede emplearse también otro grupo que se pueda convertir en grupo amínico, como, por ejemplo un átomo de halógeno combinado en núcleo,



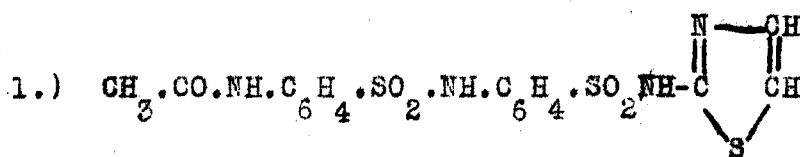
156775

156775

amino-piridacinas, 1-amino-ftalacina, 1,4-diamino-ftalacina, 4-amino-quinazolina, 2,4-diamino-quinazolina, 6,7-benzo-4-amino-quinazolina, 4-amino-5,8-diaza-quinazolina, 5,6,7,8-tetrahidro-2-amino-4-metil-quinazolina, amino-qui-
 5 noxalinas, 2-amino-pirimidina, amino-1,3,5- y 1,2,4-triacinas, como aminocianidina, triaminocianidina, 2-metil-4,6-diamino-1,3,5-triacina, 2,4-difenil-6-amino-1,3,5-triacina, 2-metil-4-amino-6-oxi-1,3,5-triacina, aminotiadiacinas, como 4-fenil 2--amino-5-oxi-tiadiacina, 2-ari-
 10 no-5-metil-tiadiacina-1,3,4, 3-amino-1,5-naftiridina etc.

La transformación entre los ácidos sulfónicos o sus derivados y los derivados amínicos heterocíclicos se hace en forma ya conocida. En la transformación se pueden emplear, si es necesario, agentes de condensación, por ejemplo, sustancias combinadoras de áci-
 15 dos, catalizadores, o ambos. Además, en su caso pueden también emplearse disolventes y diluyentes. La elaboración de los productos de condensación se hace en la forma habitual.

20 Combinaciones que se obtienen por este procedimiento son, por ejemplo:

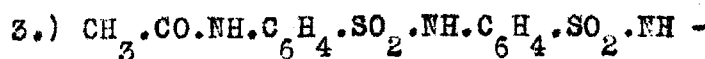
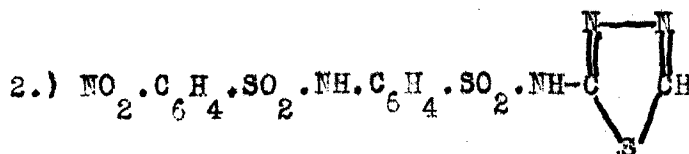




156775

18
1942

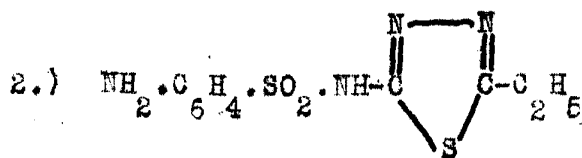
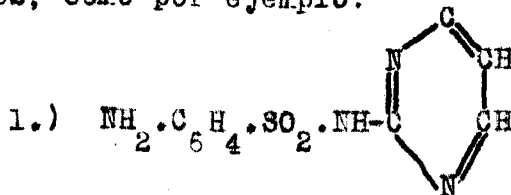
156775




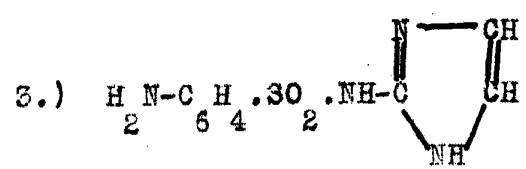
etc.

Según otra forma de ejecución del procedimiento, puede llegarse a las mismas combinaciones partiendo de combinaciones amínicas de la fórmula general $(\text{H}_2 \text{N} \cdot \text{R}' \cdot \text{SO}_2 \cdot \text{NX})_n - \text{R}''$, y transformándolas con ácidos sulfónicos de la fórmula general $\text{G} \cdot \text{R} \cdot \text{SO}_3 \text{H}$ o con sus derivados.

Las mencionadas combinaciones amínicas de la fórmula general $(\text{H}_2 \text{N} \cdot \text{R}' \cdot \text{SO}_2 \cdot \text{NX})_n - \text{R}''$ se pueden obtener, por ejemplo, por la acción de cloruro 4-acetil-amino-benzolsulfónico sobre derivados amínicos de combinaciones heterocíclicas, por ejemplo, 2-amino-5-metil-tiodiazol, y formación posterior del grupo amínico. Se describen combinaciones de esta clase en la solicitud de Patente No. 155.552, como por ejemplo:



18 A

 156775



156775

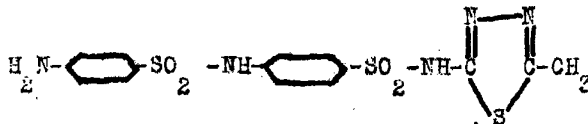
Según el invento, sobre estas combinaciones amínicas se hacen influir ácidos sulfónicos de la fórmula general G.R.SO₃H o sus derivados, fórmula en la cual G es un grupo que se puede convertir en grupo amínico, de la significación arriba indicada. Como ejemplos de estos ácidos sulfónicos citaremos: cloruro del ácido 4-acetil-amino-benzol-sulfónico, cloruro del ácido 4-nitro-benzol-sulfónico, cloruro del ácido 5-amino-quinolin-8-sulfónico etc. La condensación se hace en la forma arriba indicada y ya conocida.

Luego, en los productos de condensación obtenidos según esta forma de realización del procedimiento, se transforman en grupos amínicos los grupos que sean capaces de convertirse en ellos. De estos grupos, los grupos acilamínicos y azometínicos pueden transformarse por hidrólisis en el grupo amínico, el grupo ácido-amídico y el grupo ácido-hidracídico por la descomposición de Hoffman o Curtius, al paso que el grupo nitro, nitroso, azo, azoxi, o hidrazo puede transformarse por reducción en el grupo amínico. Finalmente el halógeno puede convertirse en un grupo amínico por tratamiento con amoníaco a presión. Así se obtienen por este procedimiento, por ejemplo, las siguientes combinaciones finales.



15677a

El producto bruto de acoplamiento se lava con agua y se disuelve en 250 partes de volumen de lejía sódica 2-n. Después de una hora de ebullición en reflujo se ha terminado la disociación del grupo acetílico, se decolora con carbón animal, se filtra y el filtrado se hace débilmente ácido-mineral, con lo cual precipita el 2-(sulfanilil-sulfanilamino)-5-metil-tiadiazol de la fórmula



A la misma sustancia final se llega si el 2-sulfanilamino-5-metil-tiadiazol, que puede obtenerse según la solicitud de Patente No. 156.552, se transforma en presencia de sustancias combinadoras de ácidos con cloruro del ácido acetyl-sulfanílico o cloruro 4-nitro-benzolsulfónico, y en el producto de transformación se forma el grupo amínico libre por saponificación o reducción.

Esta solicitud que corresponde a la presentada en Alemania, el 28 de Junio de 1941, bajo el número D. 85.361 IVc/12q, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

----- N O T A -----

----- oOo -----

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de In-

156775

18 ABR 1942



15677a

vención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

10. Un procedimiento para obtener derivados de sulfamidas cíclicas, caracterizado porque se obtienen derivados de sulfamidas cíclicas de la fórmula general $(H \underset{2}{N} . R . SO_2 . NX . R' . SO_2 . NX)_n - R''$, - en la cual R y R' designan un residuo aromático, heterocíclico o aromático-heterocíclico mixto, R'' un sistema anular heterocíclico, X hidrógeno o un residuo de hidrocarburo y n los números 1-3, - haciendo influir sobre ácidos sulfónicos de la fórmula general $G . R . SO_2 . NX . R' . SO_2 H$, o sobre sus derivados capaces de reacción, derivados amínicos de combinaciones heterocíclicas, o tratando combinaciones amínicas de la fórmula general $(H \underset{2}{N} . R' . SO_2 . NX)_n - R''$ con ácidos sulfónicos de la fórmula general $G . R . SO_3 H$ o sus derivados capaces de reacción, - indicando G un residuo que se puede convertir en un grupo amínico-, y formando luego el grupo amínico en los productos de transformación obtenidos.

20. Un procedimiento para obtener derivados de sulfamidas cíclicas.

Tal y como se ha descrito en la memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

Esta memoria consta de nueve hojas escritas a máquina por una sola cara.

25

18 ABR. 1942
 Madrid, Alberta de Elizaburu
 For Rodet