

258913



258913

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a  
la solicitud de

una PATENTE DE INVENCION por VEINTE AÑOS en ESPAÑA  
a favor de

Abbott Laboratories, residente en 14th Street and  
Sheridan Road - NORTH CHICAGO - Illinois - EE.UU.

p o r

"UN METODO PARA LA PREPARACION DE 2-METIL-3-CLOROMETIL  
-6-CLORO-7-SULFAMIL-3,4-DIHI-DRO-1,2,4-BENZOTIADIAZINA-  
1,1-DIOXIDO."

Inventor: Leo Ralph Swett, de nacionalidad norteamericana.

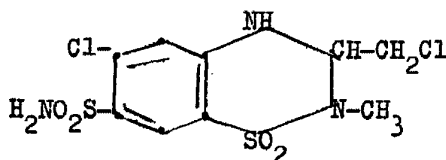
Prioridad: Sol. norteamericana Ser. 842.219 del 25 de Sep-  
tiembre de 1959.-

///MC///

258913



Esta invención se refiere al 1,1-dióxido de 2-metil-3-cloro-  
metil-6-cloro-7-sulfamil-3,4-dihidro-1,2,4-benzotiadiazina, corres-  
pondiente a la fórmula:



que es un potente agente diurético cuando se administra oralmente  
o por inyección. Este compuesto es un sólido cristalino soluble en  
disolventes orgánicos polares, pero sólo ligeramente soluble en  
agua.

Este nuevo compuesto puede prepararse convenientemente median-  
te la reacción de una proporción molecular de 4-amino-6-cloro-3-  
(metilsulfamil)-bencenosulfonamida con una proporción molecular por  
lo menos de cloroacetaldehído en un disolvente inerte tal como agua,  
acetona o dimetilformamida a una temperatura de 20 a 100°C. En un  
método preferido de operación, se emplea agua como disolvente y la  
reacción se lleva a cabo a la temperatura de ebullición de la mezcla  
reactiva y bajo condiciones de reflujo. Al completarse la reacción  
se enfría la mezcla reactiva para precipitar el producto deseado,  
que es separado y purificado mediante recristalización a partir de  
un adecuado disolvente, tal como agua o metanol.

El siguiente ejemplo ilustra detalladamente la invención  
pero no ha de considerarse como limitativo de la misma.

EJEMPLO

Se calentó a la temperatura de ebullición y bajo condiciones  
de reflujo durante una hora una mezcla de 18 gramos (0,06 molécula  
gramo) de 4-amino-6cloro-3-(metilsulfamil)-bencenosulfonamida, con  
punto de fusión a 170°C, y 15 gramos (0,07 molécula-gramo) de clo-  
roacetaldehído acuoso al 40% en 250 ml de agua. Luego se enfrió  
la mezcla reactiva para precipitar el deseado 1,1-dióxido de 2-

258913



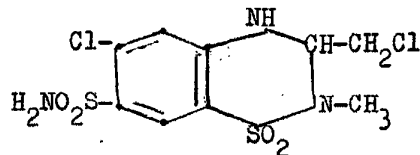
metil-3-clorometil-6-cloro-7-sulfamil-3,4-dihidro-1,2,4-benzotiadiazina, que fué separada por filtración y que, después de su recristalización a partir de metanol acuoso, fundió a 224 - 225°C con descomposición. Análisis calculado para el  $C_9H_{11}Cl_2N_3O_4S_2$ : C = 30,00%; H = 3,07%; N = 11,66%. Observado: C = 30,31%; H = 3,19%; N = 11,80%.

Esta es una solicitud divisional de mi solicitud co-pendiente con número de serie 842.219, depositada el 25 de septiembre de 1959.

N O T A

En resumen: La Patente de Invención que se solicita, recaerá sobre las siguientes reivindicaciones:

1ª.- Método de preparación de un compuesto de la fórmula:



que comprende la reacción de una proporción molecular de 4-amino-6-cloro-3-(metilsulfamil)-bencenosulfonamida con una proporción molecular por lo menos de cloroacetaldehído en presencia de un disolvente inerte seleccionado del grupo consistente en agua, acetona y dimetilformamida a una temperatura de 20 a 100°C.

2ª.- Método según la reivindicación 1, en el que el disolvente empleado es agua y la reacción es llevada a cabo a la temperatura de ebullición de la mezcla reactiva y bajo condiciones de reflujo.

3ª.- Se reivindica por último, como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: "UN METODO PARA LA PREPARACION DE 2-METIL-3-CLOROMETIL-6-CLORO-7-SULFAMIL-3,4-DIHI-DRO-1,2,4-BENZOTIADIAZINA 1,1-DIOXIDO".

Todo conforme queda descrito en la presente memoria que consta de tres páginas escritas a máquina.

Madrid, 13 junio 1960

ALFONSO UNGRIA