

Warszawa, 17 września 1937 r.

URZĄD PATENTOWY



C 07c 143/80

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 25197.

Kl. 12 q, 6/03.

Société des Usines Chimiques Rhône-Poulenc
(Paryż, Francja).

Sposób wytwarzania pochodnych p-amino-benzeno-sulfamidu o właściwościach bakteriobójczych.

Zgłoszono 13 czerwca 1936 r.

Udzielono 7 lipca 1937 r.

Pierwszeństwo: 18 lutego 1936 r. (Wielka Brytania).

Wynalazek niniejszy dotyczy wytwarzania nowej grupy związków szeregu aromatycznego, wyróżniających się właściwościami bakteriobójczymi.

Związki te są pochodnymi p - amino - benzeno - sulfamidu, podstawionego w grupie aminowej resztą aralkylową, mogącą zawierać w rdzeniu różne podstawniki, jak np. grupy wodorotlenowe lub sulfonowe; w ostatnio podanym przypadku otrzymuje się związki rozpuszczalne w wodzie. Wskutek podstawienia p - amino - benzeno - sulfamidu w grupie aminowej znacznie potęguje się jego działanie bakteriobójcze i otrzymuje się związki trwałe o dobrych właściwościach leczniczych.

Wykryto, że związki te można wytwarzać bądź przez działanie haloidków aralkylowych, podstawionych lub niepodstawionych w rdzeniu, na p - amino - benzeno - sulfamid, bądź też przez uwodornianie znanymi metodami, np. w obecności odpowiednich katalizatorów, zasad Schiffa, otrzymywanych przez kondensację p - amino - benzeno - sulfamidu z aldehydem aromatycznym.

Przykład I. 130 g p - benzylieno - amino - benzeno - sulfamidu rozpuszcza się w 1,300 cm³ dwuoksanu i uwodornia w temperaturze 50°C w obecności niklu aktywnego. Gdy pochłanianie wodoru zostanie zakończone, oddziela się katalizator przez

odsączenie, a przesącz odparowuje do sucha. Pozostałość przekrystalizowuje się z alkoholu. Otrzymuje się w ten sposób z wydajnością prawie teoretyczną *p* - benzyloamino - benzenosulfamid w postaci prawie bezbarwnych kryształów, topniejących w temperaturze 175°C.

Przykład II. 34,4 g *p* - amino - benzeno - sulfamidu rozpuszcza się w 500 cm³ wrzącej wody, po czym dodaje się 20 g węglanu wapniowego i 12,7 g chlorku benzyli. Mieszaninę reakcyjną ogrzewa się mieszając do wrzenia w ciągu 3 godzin, a następnie zakwasza się kwasem solnym.

Strącony *p* - benzyloamino - benzeno - sulfamid oddziela się przez sączenie. Po przekrystalizowaniu z acetonu otrzymuje się z wydajnością prawie teoretyczną taki sam produkt, jak w przykładzie I.

Przykład III. 10 g *p* - (*o* - oksy - benzyli - deno - amino) - benzeno - sulfamidu rozpuszcza się w 200 cm³ dwuoksanu i uwodornia w temperaturze zwykłej w obecności platyny aktywnej. Po pochłonięciu teoretycznej ilości wodoru oddziela się katalizator przez odsączenie, a przesącz odparowuje do sucha. Pozostałość przekrystalizowuje się z alkoholu 50%-owego; otrzymuje się *p* - (*o* - oksy - benzylo - amino -) - benzeno - sulfamid z wydajnością bardzo dobrą w postaci białych igieł, topniejących w temperaturze 183°C.

Przykład IV. 13,8 g *p* - (*p* - oksy - benzyli - deno - amino) - benzeno - sulfamidu rozpuszcza się w 300 cm³ dwuoksanu i uwodornia w obecności niklu aktywnego w zwykłej temperaturze. Po pochłonięciu teoretycznej ilości wodoru oddziela się katalizator przez odsączenie. Przesącz odpa-

rowuje się do sucha, a pozostałość przekrystalizowuje z acetonu.

Otrzymuje się w ten sposób z wydajnością prawie teoretyczną *p* - (*p* - oksy - benzylo - amino) - benzeno - sulfamid w postaci bezbarwnych kryształów, topniejących w temperaturze 206°C.

Przykład V. 20,8 g soli sodowej *m* - sulfo - benzaldehydu i 20,85 g chlorowodoru *p* - amino - benzeno - sulfamidu rozpuszcza się w 500 cm³ wody. Roztwór ten uwodornia się w zwykłej temperaturze w obecności platyny. Po odsączeniu katalizatora otrzymuje się przez odparowanie sól sodową *p* - (*m* - sulfo - benzylo - amino) - benzeno - sulfamidu.

Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób wytwarzania pochodnych *p* - amino - benzeno - sulfamidu o właściwościach bakteriobójczych, znamienny tym, że grupę aminową *p* - amino - benzeno - sulfamidu podstawia się grupą aralkylową znanymi metodami.

2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że grupa aralkylowa stosowana do podstawienia zawiera w rdzeniu różne podstawniki takie, jak grupy wodorotlenowe lub sulfonowe.

3. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że na *p* - amino - benzeno - sulfamid działa się chlorkiem aralkylowym.

Société des Usines
Chimiques Rhône — Poulenc.
Zastępca: M. Skrzypkowski,
rzecznik patentowy.