

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ OPIS PATENTOWY

Nr 45057

Kl. 12 o, 23/03

VEB Farbenfabrik Wolfen *)

Wolfen, Niemiecka Republika Demokratyczna

Sposób wytwarzania sulfonamidów

Patent trwa od dnia 29 lipca 1959 r.

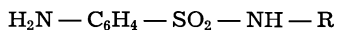
Pierwszeństwo: 10 stycznia 1959 r. (Niemiecka Republika Demokratyczna).

Wiadomo, iż z sulfonamidów albo ich związków acylowych i formaldehydu można wytwarzać produkty kondensacji posiadające dobre właściwości lecznicze.

Stwierdzono, iż otrzymuje się nowe produkty kondensacji o wzorze ogólnym:



w którym R oznacza — H, — C(=NH) — — NH₂, — CS — NH₂, — CO — NH₂ oraz niepodstawione i podstawione heterocykliczne układy pierścieniowe, jeśli formamidem działa się na sulfonamidy o wzorze ogólnym:



w którym R ma wyżej podane znaczenie.

Reakcję prowadzi się w kwaśnym środowisku. Przy stosowaniu rozcieńczonych kwasów wytrąca się po pewnym czasie z mieszaniny reakcyjnej produkt kondensacji. Stosując natomiast silne kwaśne roztwory, zadaje się mieszaninę reakcyjną bez względu na wydzielający się początkowo osad wodą, przez co wytrąca się żądany produkt kondensacji. Przy reakcji p-aminobenzenosulfonyloguanidyny z formamidem w obecności rozcieńczonych kwasów otrzymuje się wodzian produktu kondensacji, podczas gdy przy reakcji w obecności stężonych kwasów tworzy się bezwodna forma produktu kondensacji.

Przykład I. 100 g p-aminobenzenosulfonyloguanidyny rozpuszcza się w 1000 ml wody i 100 ml stężonego kwasu solnego, zadaje 100 g formamidu w temperaturze pokojowej i miesza w ciągu 24 godzin. Wytrącony produkt odsysa się, przemywa wodą destylowaną

*) Właściciel patentu oświadczył, że współtwórcami wynalazku są dr Erich Brand i dypl. chem. Kurt Rieckhoff.

do reakcji obojętnej i suszy. Wydajność 97,4 g. Temperatura topnienia 183—189° C.

Przykład II. 100 g p-aminobenzenosulfonyloguanidyny zawieszają się w 280 ml formamidu i mieszając dodaje powoli 400 ml stężonego kwasu solnego, przy czym występuje silnie egzotermiczna reakcja. Z otrzymanego roztworu wytrąca się natychmiast produkt reakcji. Mieszaninę reakcyjną miesza się dalej w ciągu 5 godzin, zadaje 1000 ml wody destylowanej i miesza jeszcze 12 godzin. Wytrącony produkt kondensacji odsysa się, przemywa wodą destylowaną do reakcji obojętnej i suszy. Wydajność 95,2 g. Temperatura topnienia 205 — 207,5° C.

Przykład III. 312 g 4-(p-aminobenzenosulfonamido)-2,6-dwumetylopirymidyny w 2400 ml destylowanej wody i 240 ml stężonego kwasu solnego zadaje się 254 g formamidu w temperaturze pokojowej i miesza w ciągu 3 dni. Wytrącony produkt kondensacji odsysa się, przemywa wodą destylowaną i suszy. Wydajność 301,8 g. Temperatura topnienia 248,5 — 250,5° C.

Przykład IV. 65 g 4-(p-aminobenzenosulfonamido)-2,6-dwumetylopirymidyny zawieszają się w 140 g formamidu i mieszając zadaje powoli 200 ml stężonego kwasu solnego, przy

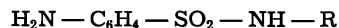
czym występuje silnie egzotermiczna reakcja. Z wytworzonego roztworu wytrąca się natychmiast produkt reakcji. Produkt reakcji miesza się jeszcze w ciągu 5 godzin, zadaje 500 ml wody destylowanej i dalej miesza 12 godzin. Otrzymany produkt kondensacji odsysa się, przemywa wodą destylowaną i suszy. Otrzymany produkt kondensacji jest identyczny z produktem z przykładu III.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania sulfonamidów o wzorze ogólnym:



w którym R oznacza — H , — $C(=NH)$ — NH_2 , — $CS - NH_2$, — $CO - NH_2$ oraz niepodstawione i podstawione heterocykliczne układy pierścieniowe, znamienny tym, że na sulfonamid o wzorze ogólnym:



w którym R ma wyżej podane znaczenie, działa się formamidem w kwaśnym środowisku.

VEB Farbenfabrik Wolfen

Zastępca: dr Andrzej Au
rzecznik patentowy