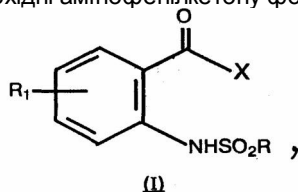


# 1. Похідні амінофенілкетону формули



де

R - нерозгалужений чи розгалужений C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкіл чи феніл, необов'язково заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, хлором або бромом;

R<sub>1</sub> - водень, ціано, нітро, галоген, форміл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілтіо, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфініл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами,

які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілкарбоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфінілом або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкілсульфонілом,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

ді(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл)аміно, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

ді(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл)амінокарбоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

ді(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл)аміносульфоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, або

гетероциклічне кільце, що має 2-6 атомів вуглецю та 1-3 атоми азоту, кисню чи сірки та необов'язково заміщене атомом вуглецю однією чи кількома групами, які є галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілом чи C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>галогеналкілом,

X - (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-Y, циклопропіл чи тетрагідро-2-оксо-3-фууроїл;

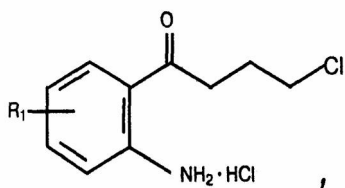
i

Y - хлор, бром чи гідрокси, або його кислотнo-аддитивна сіль.

2. Сполука за пунктом 1, в якій R<sub>1</sub> - водень та необов'язково R являє собою метил або п-толіл.

3. Сполука за пунктом 2, в якій X - циклопропіл, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-Y або тетрагідро-2-оксо-3-фууроїл.

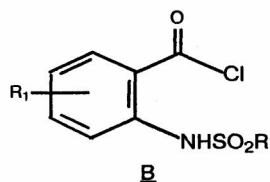
4. Спосіб отримання сполуки формули A



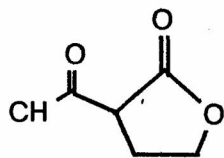
A

який відрізняється тим, що включає:

i) взаємодію сполуки формули B

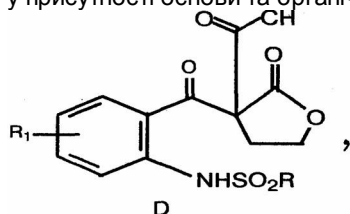


зі сполукою формули C

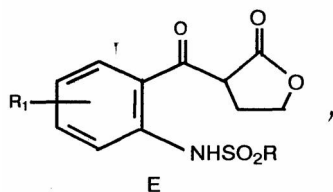


**C**

у присутності основи та органічного розчинника до утворення суміші сполук формули D і формули E



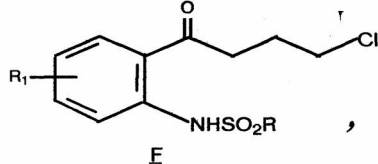
**D**



**E**

ii) виділення сполуки формули E внаслідок гідролізу або кристалізації,

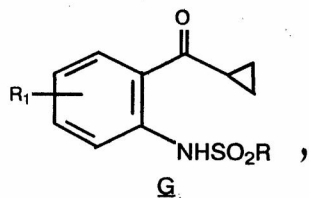
iii) взаємодію сполуки E з концентрованою HCl у присутності органічного розчинника до утворення сполуки формули F:



**F**

iv) обробку сполуки формули F водним розчином основи за підвищеної температури,

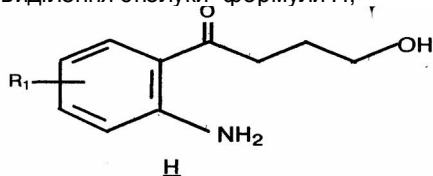
v) виділення сполуки формули G,



**G**

де у формулах E-G радикали R та R<sub>1</sub> - такі, як визначено в п. 1, vi) обробку сполуки формули G сильною кислотою;

vii) виділення сполуки формули H;



**H**

i

viii) взаємодія сполуки формули H і HCl до утворення сполуки формули A.

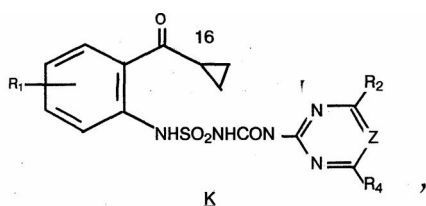
5. Спосіб за пунктом 4, в якому основою на етапі 1 є етилат магнію, а органічним розчинником - толуол, органічним розчинником на етапі 3 є толуол, основою на етапі 5 є NaOH, а сильною кислотою на етапі 6 є сірчана кислота.

6. Спосіб за пунктом 5, в якому використовується сполука формули B, в якій R<sub>1</sub> - водень.

7. Спосіб за пунктом 5, в якому використовується сполука формули B, де R - p-толіл або метил.

8. Спосіб за пунктом 6, який крім того містить взаємодію сполуки формули A з основою до отримання o-амінофенілциклопропілкетону.

9. Спосіб отримання сульфамойлсечовини формули K



де

Z - N або CR<sub>3</sub>,

R<sub>2</sub> - водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілтіо, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфініл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, або

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіламіно або ді(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл)аміно, де кожна алкільна група є необов'язково заміщеною однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

R<sub>3</sub> - водень або галоген, і

R<sub>4</sub> - водень, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

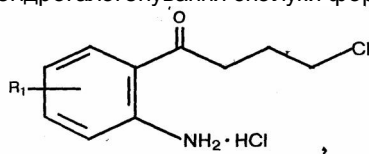
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілтіо, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфініл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

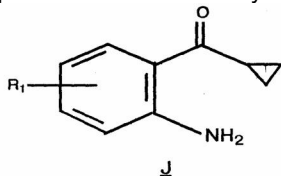
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкілсульфоніл, необов'язково заміщений однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси, або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіламіно або ді(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл)аміно, причому кожна алкільна група є необов'язково заміщеною однією чи кількома групами, які є галогеном або C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкокси,

який **відрізняється** тим, що містить:

i) дегідрогалогенування сполуки формули A

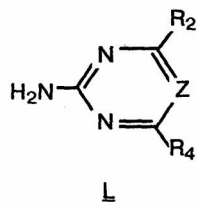


отриманої способом за пунктом 4, з утворенням о-(амінофеніл)-циклопропілкетону формули J



i

ii) взаємодію згаданого о-(амінофеніл)-циклопропілкетону з 2-аміноарилом формули L



та хлорсульфонізоціанатом в присутності триетиламіну та розчинника з одержанням потрібної сульфаміолсечовини формули K.

10. Спосіб за пунктом 9 отримання сполуки формули K, в якій Z це CR<sub>3</sub>,

R<sub>1</sub> і R<sub>3</sub> обидва є воднем, а R<sub>2</sub> і R<sub>4</sub> обидва є метокси.