



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

220093

(11)

(B1)

[22] Přihlášeno 03 09 81
[21] (PV 6496-81)

[40] Zveřejněno 27 08 82

[45] Vydáno 15 10 85

(51) Int. Cl.³
C 07 D 241/52

(75)
Autor vynálezu

NOVÁČEK LIBOR RNDr. CSc., BRNO, PICKA KAREL RNDr., NOVÁ
VČELNICE, POLÁŠEK LUBOMÍR ing., PRAHA, BOHUMÍNSKÝ
LADISLAV, BRNO

(54) Způsob přípravy derivátů 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methyl-
chinoxalin-2-karboxamidu

1

2

Uvedená látka je používána v zemědělství — její deriváty při aplikaci v krmných směsích podstatně zvyšují hmotnostní přírůstky drůbeže a selat a působí proti řadě patogen-
ních mikrobů, které mohou vyvolat závažná onemocnění hospodářských zvířat. Dosavad-
ní způsob přípravy byl zdlouhavý a nevý-
hodný vzhledem k manipulaci s amoniakem
a aminy v provozních podmínkách.

Podle vynálezu se 1,4-dioxidokyanalkyl-
amidy kyseliny 3-methylchinoxalin-2-karbo-
xylové připravují reakcí benzofurazan-1-
-oxidu s kyanalkylamidem kyseliny acet-
octové v přítomnosti bazického katalyzátoru
daného druhu a množství.

Předmětem vynálezu je způsob přípravy derivátů 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methylchinoxalin-2-karboxamidu, které stimulují růst hospodářských zvířat.

Deriváty 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methylchinoxalin-2-karboxamidu při aplikaci v krmných směsích podstatně zvyšují hmotnostní přírůstky u drůbeže, selat, prasat a telat. Aplikují se prostřednictvím kompletních krmných směsí, premixů nebo medikovaných krmných přípravků v dávce 10 až 200 mg.kg⁻¹ sušiny krmiva. Kromě růstově stimulačních vlastností působí proti řadě patogenních mikrobů, které mohou vyvolávat závažná onemocnění u hospodářských zvířat.

Deriváty 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methylchinoxalin-2-karboxamidu se nejvýhodněji dusud připravovaly kondenzací benzofurazan-1-oxidu a kyanalkylamidů kyseliny acetocetové. Východí kyanalkylamid se získává reakcí diketenu a aminoalkylkyanidu (NSR pat. zveřej. spis 2 701 707). Kondenzace benzofurazan-1-oxidu a kyanalkylamidů kyseliny acetocetové se katalyzuje amoniakem nebo aminy, především primárními. K dobrému průběhu reakce je nutné déletrvající zavádění plynného amoniaku, přičemž celková doba reakce je značně dlouhá. V provozních podmínkách je manipulace s amoniakem a aminy nevýhodná.

Nevýhodu tohoto postupu odstraňuje způsob přípravy 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methylchinoxalin-2-karboxamidu podle vynálezu, jehož podstata spočívá v tom, že na kyanalkylamid kyseliny acetocetové se působí benzofurazan-1-oxidem za přítomnosti bazického katalyzátoru obsahujícího prvky alkalických kovů nebo alkalických zemin, například fosforečnanu nebo uhličitanu alkalického kovu, hydroxidu nebo kysličníku kovu alkalických zemin v množství 0,05 až 1 mol vztaženo na kyanalkylamid kyseliny acetocetové. Zvláště výhodné je použití snadno dostupných kysličníků kovů alkalických zemin, například kysličníku vápenatého.

Katalyzátor se používá v množství 0,05 až 1 mol vztaženo na mol kyanalkylamidů kyseliny acetocetové.

Jako reakční prostředí lze použít většiny běžných rozpouštědel nebo jejich směsí, pokud za reakčních podmínek nereagují s výchozími látkami nebo s výsledným produktem. Zvláště výhodné jsou alkoholy, étery a chlorované uhlovodíky.

Reakce probíhá mezi 30 až 80 °C, optimální rozmezí je mezi 50 až 65 °C.

Reakci kyanalkylamidů kyseliny acetocetové s benzofurazan-1-oxidem je možné uskutečnit též tak, že kyanalkylamid se použije pro kondenzaci bez předchozí izolace přímo v reakčním médiu.

Postup podle vynálezu významně zkracuje reakční dobu a zlepšuje pracovní prostředí.

Příklad 1

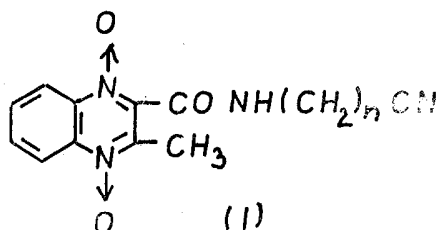
K roztoku 118 g kyanmethyramidu kyseliny acetocetové v 500 ml methanolu se přidá 121 g benzofurazan-1-oxidu a 3 g kysličníku vápenatého. Reakční směs se zahřeje na 60 stupňů Celsia. Po třech hodinách se reakční produkt odfiltruje a promyje methanolem. Získaný produkt se překrystaluje z vroucí vody za přidavku aktivního uhlí. Získaná sloučenina taje při 221 až 223 °C. Výtěžek je 86 %.

Příklad 2

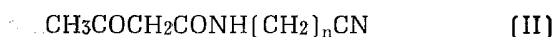
K roztoku 129,8 g kyanethyramidu kyseliny acetocetové v 500 ml methanolu se přidá 121 g benzofurazan-1-oxidu a 10,6 g uhličitanu sodného. Reakční směs se zahřeje na 60 °C. Po třech hodinách se reakční produkt odfiltruje a promyje methanolem. Získaný produkt se překrystaluje z vroucí vody za přidavku aktivního uhlí. Získaná sloučenina taje při 201 až 202 °C. Výtěžek je 86,5 %.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob přípravy derivátů 1,4-dioxido-N-(kyanalkyl)-3-methylchinoxalin-2-karboxamidu vzorce I



kde n značí počet methylenových skupin 1 až 8, reakcí benzofurazan-1-oxidu s kyanalkylamidem kyseliny acetocetové vzorce II



kde n má výše uvedený význam, vyznačený tím, že reakce se provádí v přítomnosti bazického katalyzátoru obsahujícího prvky alkalických kovů nebo alkalických zemin, například fosforečnanu nebo uhličitanu alkalického kovu, hydroxidu nebo kysličníku kovu alkalických zemin v množství 0,05 až 1 mol vztaženo na kyanalkylamid kyseliny acetocetové.

2. Způsob podle bodu 1 vyznačený tím, že se jako katalyzátor použije kysličník nebo hydroxid vápenatý v množství 0,05 až 1 mol vztaženo na kyanalkylamid kyseliny acetocetové.