



URAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

226944
(11) (B1)

(51) Int. Cl.³
C 07 C 135/02

(22) Prihlásené 21 07 82
(21) [PV 5563-82]

(40) Zverejnené 24 06 83

(45) Vydané 15 05 86

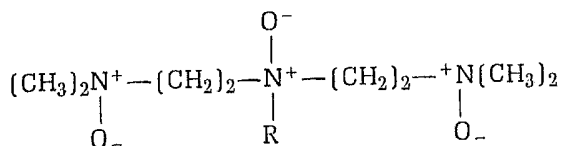
(75)
Autor vynálezu

BITTEREROVÁ FABIOLA pharm. dr., DEVÍNSKY FERDINAND ing. CSc.,
LACKO IVAN ing., BRATISLAVA

(54) Tris-N-oxidy bis(2-dimetylaminoetyl)alkylamínov a spôsob ich prípravy

1

Vynález se týka tris-N-oxidov bis(2-dimetylaminoetyl)alkylamínov všeobecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 8 až 16 a spôsobu ich prípravy.

Je známe, že niektoré nearomatické mono a bis amínoxidy našli využitie v priemysle na základe svojich dobrých povrchovoaktívnych vlastností, výhodných biologických účinkoch, nízkej toxicite a nízkej dráždivosti, biodegradabilite ako i v dôsledku pomerne jednoduchej prípravy. N-oxidy polyamínov však ešte pripravené neboli.

Zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu sú látky nové, doteraz v chemickej literatúre neopísané a zistili sa u nich doteraz neznáme biologické účinky. Sú vysoko selektívne účinné na grampozitívne baktérie a kvasinky, zatiaľ čo na gramnegatívne baktérie neúčinkujú.

Spôsob prípravy týchto zlúčenín podľa vynálezu spočíva v oxidácii bis(2-dimetylaminoetyl)alkylamínov 10 až 30 %-ným vodným

2

roztokom peroxidu vodíka pri teplotách 35 až 65 °C. Po izolácii vznikajú amínoxidy vo vysokom výťažku vysokej čistoty.

V príkladoch, ktoré ilustrujú ale neobmedzujú metódu prípravy je uvedený spôsob podľa vynálezu a sú charakterizované vybrané zlúčeniny. Je uvedená aj antimikróbna aktivita vyjadrená ako minimálna inhibičná koncentrácia (MIC) v µg/ml na kmene Staphylococcus aureus a Candida albicans. V zrovnaní s Ajatínom (benzylododecyldimetylamóniumbromid), ktorý je však organickou amóniovou soľou (v ČSSR sa v súčasnosti žiaden N-oxid na dezinfekciu nepoužíva) sú najúčinnnejšie tris-N-oxidy, ktoré sú predmetom vynálezu, účinnejšie tak na S. aureus ako i na C. albicans. Ajatín je účinnejší na E. coli.

Príklad 1

V 30 ml metanolu sa rozpustí 0,1 mol bis(2-dimetylaminoetyl)oktylamínu a pridá sa 1 mol 10 % vodného roztoku peroxidu vodíka tak, aby teplota bola 35 až 40 °C. Po 2 hodinách sa teplota zvýši na 65 °C a udržuje sa 2 hodiny. Po ochladení sa prebytočný peroxid vodíka rozloží napr. Pt-čeriou, prchavé podiely sa odparia vo vákuu vodnej výevy, produkt sa zbaví reziduálnej vo-

dy azeotropickou destiláciou so suchým benzénom alebo toluénom a prekryštalizuje sa do konštantnej teploty topenia z acetónu. Vzniká tris-N-oxid bis(2-dimetylaminoetyl)-oktylamínu s t. t. 124 až 125 °C; R_f (sústava acetón : 1 N HCl 1 : 1, Silufol, detekcia Dragendorfovým činidlom v Munièrovej modifikácii) = 0,68; výťažok 85 % teórie; $I\check{C}$ ν_{N-O} dublet 955 a 941 cm^{-1} ; MIC 800; 900.

Príklad 2

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1 s tým rozdielom, že do reakcie sa použil bis(2-dimetylaminoetyl)undecylamín a

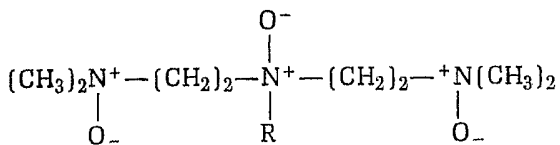
20 %-ný peroxid vodíka. Vznikal tris-N-oxid bis(2-dimetylaminoetyl)undecylamínu s t. t. 115 až 116 °C; R_f = 0,63; výťažok 84 % teórie; $I\check{C}$ ν_{N-O} dublet 958 až 936 cm^{-1} ; MIC 500; 600.

Príklad 3

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1 s tým rozdielom, že do reakcie sa použil bis(2-dimetylaminoetyl)pentadecylamín a 30 %-ný peroxid vodíka. Vznikal tris-N-oxid bis(2-dimetylaminoetyl)pentadecylamínu s t. t. 112 až 113 °C; R_f = 0,47; výťažok 89 % teórie; $I\check{C}$ ν_{N-O} dublet 962 až 932 cm^{-1} ; MIC 9; 9.

PREDMET VYNÁLEZU

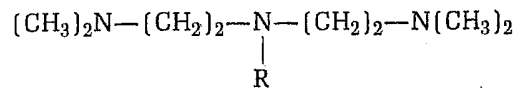
1. Tris-N-oxidy bis(2-dimetylaminoetyl)alkylamínov všeobecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 8 až 16.

2. Spôsob prípravy zlúčenín všeobecné-

ho vzorca ako v bode 1, vyznačený tým, že sa oxiduje bis(2-dimetylaminoetyl)alkylamín všeobecného vzorca



kde R značí to isté ako v bode 1, 10 až 30 %-ným vodným roztokom peroxidu vodíka pri teplote 35 až 65 °C.