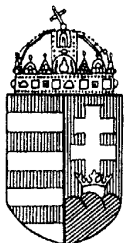


(19) Országkód:

HU



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

SZOLGÁLATI TALÁLMÁNY

(22) Bejelentés napja: 1987.10.02.

(21) 4437/87

(41) (42) Közzététel napja: 1989.07.28.

(45) Megadás meghirdetésének dátuma
a Szabadalmi Közlönyben: 1991.03.28. SZKV 91/03.

(11) Lajstromszám:

202 516 B

(51) Int Cl⁵

C 07 D 333/22

C 07 D 409/12

A 61 K 31/38

A 61 K 31/44

(72) Feltalálók:

dr. Rátné Simonek Ildikó, 35%

Berényi Dánielné dr., 20%

dr. Benkó Pál, 10%

dr. Bózsing Dániel, 10%

dr. Magyar Károly, 25%

Budapest (HU)

(73) Szabadalmaz:

EGIS Gyógyszergyár, Budapest (HU)

(54) ELJÁRÁS 2-TENIL-TIOKARBAMID-SZÁRMAZÉKOK ÉS E VEGYÜLETEKET TARTALMAZÓ SÚLYHOZAMNÖVELŐ SZEREK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

A találmány tárgya eljárás az új, (I) általános képletű 2-tenil-tiokarbamid-származékok – ahol a képletben

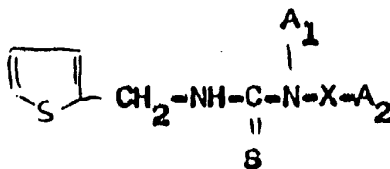
A₁ jelentése hidrogénatom vagy 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport;

A₂ jelentése 3–10 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 4–8 szénatomos cikloalkil-, fenil- (1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(2–4 szénatomos alkenil)-, naftil-, furfural-, adott esetben 1–4 szénatomos alkoxi-, hidroxil- vagy 1–4 szénatomos alkilcso-

porttal egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, vagy adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített piridilcsoport;

X jelentése vegyértékkötés vagy –CO-csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X jelentése vegyértékkötés, A₂ jelentése fenilcsoporttól eltérő – előállítására.

A találmány az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó súlyhozamfokozó takarmányadalékok előállítására is vonatkozik.



(I)

A leírás terjedelme: 7 oldal, 1 ábra

HU 202 516 B

A találmány új (I) általános képletű 2-tenil-tiokarbamid-származékok és e vegyületeket tartalmazó súlyhozamnövelő szerek előállítására vonatkozik.

A találmány tárgya közelebről eljárás (I) általános képletű 2-tenil-tiokarbamid-származékok előállítására, amely képletben

A₁ jelentése hidrogénatom vagy 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport;

A₂ jelentése 3–10 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 4–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(2–4 szénatomos alkenil)-, naftil-, furfuril-, adott esetben 1–4 szénatomos alkoxi-, hidroxil- vagy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, vagy adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített piridilcsoport;

X jelentése vegyértékkötés vagy =CO-csoport; azzal a megkötéssel, hogy ha X jelentése vegyértékkötés, A₂ jelentése fenilcsoporttól eltérő.

A 0207358 sz. európai szabadalmi leírásban mindenféle állatra (házi-, vad-, hulló- hobbiállatok) hozamfokozó hatású vegyületeket – többek közt 2-tenil-tiokarbamidokat – írnak le. A leírásban egyik állatfajra vonatkozó tételes hatását sem szerepel.

A 4 267 191 és 4 313 885 sz. USA szabadalmi leírásban (2-furfuril)-tiokarbamid származékokat írnak le bárány, sertés és csirke hozamfokozóként, ezek hatása azonban elmarad az (I) általános képletű vegyületekétől.

Találmányunk szerint az (I) általános képletű vegyületeknek előállítására úgy járhatunk el, hogy

a) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése vegyértékkötés, A₁ jelentése hidrogénatom, A₂ jelentése pedig a fent megadott, valamely (II) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – izotiocianátot (III) képletű 2-tenil-aminnal reagáltatunk; vagy

b) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése vegyértékkötés, A₁ jelentése hidrogénatom vagy 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport, A₂ jelentése a fenti (V) képletű 2-tenil-izotiocianátot valamely (VI) általános képletű – a képletben A₁ és A₂ jelentése a fenti – aminnal reagáltatunk; vagy

c) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése =CO-csoport és A₁ hidrogénatomot jelent, A₂ jelentése pedig a fent megadott, (III) képletű 2-tenil-amint valamely (IV) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – acil-izotiocianáttal reagáltatunk; vagy

d) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése =CO-csoport és A₁ hidrogénatomot jelent, A₂ jelentése pedig a fent megadott, (VII) képletű N-(2-tenil)-tiokarbamidot valamely (VIII) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – karbonsavval vagy aktív származékával reagáltatunk.

A leírásban használt alkilcsoport kifejezésen egyenes vagy elágazó szénláncú, a megadott számú szénatomot tartalmazó alkilcsoportok értendők (pl. metil, etil, terc, butil, n-butil, n-decil stb.). A „alkoxicsoport” kifejezés egyenes vagy elágazó láncú, a megadott számú szénatomot tartalmazó alkoxicsop-

portokra vonatkozik (pl. metoxi, etoxi, izopropoxi, terc, butoxi stb.). Az „alkenilcsoport” kifejezésen a megadott számú szénatomot tartalmazó alkenilcsoportok (allil, butenil stb.) a „fenil-alkil-csoport” kifejezésen a megadott számú szénatomot tartalmazó fenil-alkil-csoportok (pl. benzil, béta-fenil-etil, 4-fenil-butil-stb.), a „fenil-alkenil-csoport” kifejezésen a megadott számú szénatomot tartalmazó fenil-alkenil-csoportok (pl. fenil-vinil, fenil-propenil stb.) értendők.

Az (I) általános képletű vegyületek előnyös képviselői az alábbi származékok:

N-benzoil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid

N-benzil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid

15 N-(p-metoxi-benzoil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid

N-ciklohexil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid

N-(2,6-dimetil-fenil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid

N-(béta-fenil-akrilolil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid.

20 A találmány szerint előállítható vegyületek különösen előnyös képviselője az N,N-diciklohexil-N'-2-tenil-tiokarbamid.

25 A találmány tárgyát képező a) eljárás szerint valamely (II) általános képletű izotiocianátot (III) képletű 2-tenil-aminnal reagáltatunk.

30 A reagenseket előnyösen ekvimoláris mennyiségben alkalmazzuk. A reakciót oldószeres közegben végezhetjük. E célra alkalmasak a reakciószempontjából inert oldószerek, így pl. etanol, benzín, éter, diklórmétán, tetrahidrofuran stb. Előnyösen benzínben vagy etanolban dolgozunk. A reakciót 0–100 °C közötti hőmérsékleten, előnyösen szobahőmérsékleten végezzük. Az (I) általános képletű vegyületeket a reakcióelegyből szűréssel és/vagy bepárlással izolálhatjuk.

35 A találmány szerinti b) eljárás során valamely (VI) általános képletű amint reagáltatunk (V) képletű 2-tenil-izotiocianáttal. A reakciót az a) eljárásnál leírt oldószerek egyikében, előnyösen benzínben vagy etanolban végezzük, előnyösen szobahőmérsékleten. Az (I) általános képletű vegyületeket szűréssel és/vagy bepárlással izoláljuk.

40 A találmány szerinti c) eljárás előnyös fogantatási módja szerint valamely (IV) általános képletű acil-izotiocianátot megfelelő inert oldószerben, előnyösen acetonban reagáltatjuk a (III) képletű 2-tenil-aminnal. A reakciót melegítés közben, 40 °C és az elegy forráspontja közötti hőmérsékleten végezzük, előnyösen az elegy forráspontján dolgozunk. Az (I) általános képletű vegyületeket adott esetben vízreöntéssel izoláljuk.

45 A találmány szerinti d) eljárás során (VII) képletű N-(2-tenil)-tiokarbamidot valamely (VIII) általános képletű karbonsavval vagy annak aktív származékával – előnyösen a megfelelő savhalogeniddel, különösen előnyösen savkloriddal – reagáltatjuk a megfelelő inert oldószerben (acetonitril, metilénklorid, aromás szénhidrogének stb), célszerűen benzolban. A reakciót melegítés közben 40 °C és az elegy forráspontja közötti hőmérsékleten végezhetjük, előnyösen az elegy forráspontján dolgozunk.

60 A (II), (III), (VI), (VIII) képletű vegyületek a kereskedelmi forgalomban kaphatók ill. a (II) általános képletű vegyületek a Houben-Weyl: Methoden der Organischen Chemie IX. 867-878 oldalon talál-

ható módszerek szerint előállíthatók. A (IV) általános képletű acil-izotiocianátok a Houben-Weyl: Methoden der Organischen Chemie IX. 878-879. oldalon található módszer szerint előállíthatók.

Az (V) képletű 2-tenil-izotiocianát a J. Chem. Soc. Perkin I. (1976) 139. oldalon levő recept analógiájára állítható elő. A (VII) képletű 2-tenil-tiokarbamid Houben-Weyl: Methoden der Organischen Chemie, Bd. E4, 484-505, Georg Thieme Verlag, 1983 módszer szerint állítható elő.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó szerek használatokon – különösen sertésen, szárnyasokon, kérődzőkök – előnyösen bárányon, csirkén – súlyhozamnövelő hatással rendelkeznek, amelyhez igen kedvező takarmányértékesülés is társul.

Az (I) általános képletű vegyületek fenti hatását az alábbi kísérletekkel igazoljuk:

1. Pecsényebárány súlygyarapodása

A kísérletet 40 napos etetési idővel végeztük el. Az állatokat az alábbi összetételű takarmánykeverékkel etettük:

Komponens	Mennyiség
Kukoricadara	70,0%
II. oszt. forrólevegős lucernaliszt	24,0%
Karbamid	3,0%
Takarmánymész	0,5%
Monokalciumfoszfát	1,0%
Krist. nátriumsulfát	0,5%
Takarmánysó	0,5%
Báránypremix IXI (Phylaxia)	0,5%
	100,00%

A kísérleteti anyagból 50 ppm-et kevertünk a standard granulátumhoz.

A bárányok kizárólag választott magyar merinkosok. Egy-egy csoportba 12-12 bárány került, egy-egy kezelésben 3 csoport szerepelt. A bárányokat a 40 napig tartó kísérlet során öt ízben egyedileg mérjük, beállításkor, 10 naponként, utolsó alkalommal a negyvenedik napon, mindig azonos időben. A valószínű testtömeg szerepel az értékelésekben, levonást nem végeztünk. Az elfogyasztott takarmány tömegét dekádanként és csoportonként állapítottuk meg.

Az eredményeket az I. táblázatban foglaljuk össze. A súlyhozamnövekedést és takarmány-hasznosítást három kísérlet átlagos eredményeinek segítségével határoztuk meg.

I. táblázat

Kezelés	Kontroll	4. példa vegyülete	5. példa vegyülete	3. példa vegyülete	1. példa vegyülete	2. példa vegyülete	6. példa vegyület
Átl. napi testtömeg- gyarapodás g	254,3	287,9	283,9	279,6	266,7	275,2	276,2
%	100	113,6	112,0	110,3	105,2	108,2	108,9
Fajlagos takarmány- fogyasztás kg/kg	3,95	3,57	3,57	3,66	3,79	3,72	3,68
%	100	90,4	90,4	92,7	95,9	94,9	93,2

2. Broiler csirke súlygyarapodása

A kísérletet mindkét nemű broiler csirkével vé-

geztük. Az eredményeket a II. táblázatban összegezzük.

II. táblázat

Vegyület	Dózis mg/takarmány kg	Élőtömeg	Eltérés a kontrollhoz viszonyítva	
			g	%
		28 napos kor		
12. példa szerinti	50	827	+52	106,7
Zn bacitracin	20	796	+31	103,9
Kontroll	0	775	–	100,0
		42 napos kor		
12. példa szerinti	50	1545	+91	106,3
Zn bacitracin	20	1510	+56	103,9
Kontroll	0	1454	–	100,0
		49 napos kor		
12. példa szerinti	50	1979	+154	108,4
Zn bacitracin	20	1878	+53	102,9
Kontroll	0	1825	–	100,0

49 napos korban 1 kg élő tömegre számolva a kontroll csoporthoz viszonyítva 2,3% takarmány-takarítható meg.

A fenti kísérletekből kitűnik, hogy a találmányunk szerinti eljárással előállítható (I) általános képletű vegyületek a takarmányhasznosulást javítják.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek antibiotikus hatással nem rendelkeznek, és ezért az antibiotikumok alkalmazásakor jelentkező hátrányokat sem mutatják.

Az (I) általános képletű vegyületek igen komoly előnye, hogy mutagén hatást nem mutatnak. Ez a körülmény az állattartásban való alkalmazás szempontjából igen jelentős előnyt jelent, minthogy az ismert súlyhozamnövelő szerek számos képviselője mutagén hatás miatt takarmányadalékként csupán korlátozott mértékben vagy egyáltalán nem alkalmazható.

Találmányunk tárgya továbbá eljárás súlyhozamnövelő takarmányadalék előállítására oly módon, hogy valamely találmányunk szerint előállított (I) általános képletű vegyületet inert, szilárd vagy folyékony hígító- vagy hordozóanyagokkal és adott esetben segédanyagokkal összekeverünk.

Hordozó- vagy hígítóanyagként bármely takarmányozásra alkalmas, ehető, növényi vagy állati eredetű anyagot felhasználhatunk. Hordozóanyagként előnyösen búzát, árpat, korpát, kukoricát, szóját, kukorica-sikértakarmányt, zabot, rozst, lucernát – szem, dara vagy liszt alakjában – húslisztet, hallisztet, soványtejport, tapiokalisztet stb. alkalmazhatunk. Igen előnyösen használható egy származékos nagy fehérjetartalmú zöldnövény takarmánykoncentrátum (VEPEX[®]). Segédanyagként például szilícium-dioxidot, antioxidánsokat, keményítőt, dikalcium-foszfátot, kalcium-karbonátot, szorbinsavat stb. alkalmazhatunk. Nedvesítőszerként nem-toxikus olajokat, előnyösen szójaolajat, kukoricaolajat vagy ásványolajat alkalmazhatunk. E célra továbbá alkilén-glikolok is használhatók. A hordozóanyagként felhasznált keményítő, kukorica-, búza vagy burgonyakeményítő lehet.

A találmányunk szerinti takarmány-adalékok hatóanyagtartalma tág határokon belül változhat. A takarmányadalékok előnyösen nagy hatóanyag-tartalmú koncentrátumok, melyek általában körülbelül 5–80 tömeg%, előnyösen körülbelül 10–50 tömeg%, különösen körülbelül 20–50 tömeg% (I) általános képletű hatóanyagot tartalmazhatnak. A felhasználásra kész hígított takarmányok hatóanyag-tartalma általában körülbelül 10–400 ppm, előnyösen körülbelül 10–100 ppm lehet. A takarmányadalékok, illetve koncentrátumok az e célra használatos vitaminokat (például: A-, B₁-, B₃-, B₆-, B₁₂-, E- és K-vitamin) és nyomelemeket (például: mangán, vas, cink, réz, jód) tartalmazhatnak.

A takarmány-koncentrátumokat szokásos takarmányozó anyagokkal történő hígítás után használhatjuk fel az állatok etetésére.

A találmányunk szerinti súlyhozamnövelő takarmány-adalékokat különböző haszonállatok (például: sertés, szárnyasok, kérődzők, különösen bárány és csirke) etetésére használhatjuk.

Találmányunk további részleteit az alábbi pél-

dákban ismertetjük anélkül, hogy találmányunkat a példákra korlátoznánk:

1. példa
5 N-benzoil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítása
38,08 g (0,5 mól) ammóniumrodanid 500 ml forró acetonos oldatához 10 perc alatt 70,08 g (0,5 mól) benzoilkloridot csepegtetünk kevertetés és forralás közben. Fehér kristálykiválás észlelhető.
- 10 56,6 g (0,5 mól) 2-tenil-amin 300 ml forró acetonos oldatát csepegtetjük az előző szuszpenzióhoz, majd a teljes becsepegtetés után még 20 percig forraljuk a reakcióelegyet. Hűtés után 4 liter jeges vízre öntjük, a kiváló kristályokat szűrjük, mossuk vízzel. 103,8 g (75,1%) halványdrapp kristályokat kapunk. Op.: 118–119 °C (metanolból).
- 15 2. példa
N-benzil-N-(2-tenil)-tiokarbamid előállítása
20 97,0 g (0,65 mól) benzil-izotiocianátot adunk cseppenként kevertetés közben 73,56 g (0,65 mól) 2-tenilamin 500 ml benzines emulziójához.
A reakcióelegyet szobahőmérsékleten kevertetjük 4 óra hosszat, majd szűrjük, mossuk benzinnel.
25 152,75 g (89,6%) terméket kapunk. Op.: 108–109 °C (metanolból).
3. példa
N-(p-metoxi-benzoil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítása
30 38,08 g (0,5 mól) ammóniumrodanid 85,3 g (0,5 mól) anizoilklorid és 56,6 g (0,5 mól) 2-tenilamin reakciójával az 1. példában leírt módon 118,5 g (77,3%) termékhez jutunk. Op.: 124–125 °C (metanol: benzol=3:1 elegyből).
- 35 4. példa
N-ciklohexil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
40 82,46 g (0,7 mól) 2-tenil-amin és 98,86 g (0,7 mól) ciklohexil-izotiocianát reagáltatásával a 2. példában leírt módon 171,6 g (96,4%) termékhez jutunk. Op.: 112–113 °C (metanolból).
- 45 5. példa
N-(2,6-dimetil-fenil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
50 15,5 g (0,1 mól) (2-tenil)-izotiocianát 200 ml benzines oldatát 12,1 g (0,1 mól) 2,6-dimetil-anilin 100 ml benzines oldatához csepegtetjük szobahőmérsékleten, kevertetés közben 4 óra hosszat kevertetjük, majd a kiváló kristályokat leszűrjük, mossuk benzinnel. 22,55 g (81,7%) terméket kapunk, melynek olvadáspontja 147–148 °C.
- 55 6. példa
N-(béta-fenil-akrilolil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
60 76,1 g (1 mól) ammóniumrodanid, 166,6 g (1 mól) fahéjsavklorid és 113,2 g (1 mól) 2-tenil-amin reakciójával az 1. példában leírt módon 210 g (69,5%) terméket kapunk, melynek olvadáspontja 181–182 °C (metilcelloszolvból).
- 65

7. példa
N-(1-naftil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

2,26 g (0,02 mól) 2-tenil-amin és 3,7 g (0,02 mól) 1-naftil-izotiocianát reakciójával a 2. példában leírt módon 5,85 g (98%) terméket állítunk elő. Op.: 147–148 °C (etanolból).

8. példa
N-(béta-fenil-etil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

15,5 g (0,1 mól) (2-tenil)-izotiocianát és 12,1 g (0,1 mól) fenil-etil-amin reakciójával az 5. példában leírt módon 22,4 (81%) terméket állítunk elő. Op.: 88–89 °C (etanolból).

9. példa
N-pivaloil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
38 g (0,5 mól) ammóniumrodanid, 60,3 g (0,5 mól) pivaloilklorid és 58,5 g (0,5 mól) 2-tenil-amin reakciójával az 1-es példában leírt módon 91,5 g (71,3%) terméket állítunk elő. Op.: 90–91 °C (etanolból)

10. példa
N-(2-piridinil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

27,0 g (0,29 mól) 2-amino-piridin 300 ml benzines szuszpenziójához 45 g (0,29 mól) (2-tenil)-izotiocianátot csepegtetünk. Szobahőmérsékleten kevertetjük 5 óra hosszat, miközben a kezdeti olajos kiválásból kristály lesz. Másnap szűrjük. 66,74 g (92,3%) terméket kapunk, amelynek olvadáspontja 115 °C (etanolból).

11. példa
N-(4-metil-2-piridinil)-N-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

10,8 g (0,1 mól) 2-amino-4-metil-piridin és 15,5 g (0,1 mól) (2-tenil)-izotiocianátból a 10. példában leírt módon 17,1 g (65,2%) terméket állítunk elő, melynek olvadáspontja 139–140 °C.

12. példa
N,N-diciklohexil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

18,13 g (0,1 mól) diciklohexilamin és 15,5 g (0,1 mól) (2-tenil)-izotiocianátból a 10. példában leírt módon 25,5 g (75,8%) terméket állítunk elő. Op.: 119–120 °C.

13. példa
N-allil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
17,1 g (0,3 mól) allilamin és 46,5 g (0,3 mól) (2-tenil)-izotiocianát reakciójával a 10. példában leírt módon 47,1 g (73,8%) terméket kapunk, melynek olvadáspontja 88 °C (benzolból).

14. példa
N-(3-hidroxi-fenil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás

7,76 g (0,05 mól) (2-tenil)-izotiocianát 50 ml tetrahidrofuranos oldatához 5,46 g (0,05 mól) m-amino-fenolt adunk, szobahőmérsékleten kevertetjük 5 óra hosszat, miközben drapp, porszerű kristályok

válnak ki. Szűrjük, 8,83 g (66,9%) terméket kapunk. Op.: 175–176 °C.

15. példa
N-benzoil-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
1,7 g (0,01 mól) (2-tenil)-tiokarbamid 30 ml benzoilos szuszpenziójához 1,4 g (0,01 mól) benzoilkloridot csepegtetünk. 16 óra kevertetés és reflux után az oldatot derítjük és bepároljuk. A keletkezett oldatot 3 ml hideg izoprpanollal kezelve 1,57 g (56,7%) kristályos terméket kapunk, melynek olvadáspontja 118 °C.

16. példa
N-(n-butil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
3,88 g (0,025 mól) (2-tenil)-izotiocianátot csepegtetünk 1,82 g (0,025 mól) n-butilamin 50 ml etanolos oldatához. A reakcióelegy hőmérséklete ezalatt 25 °C-ról 40 °C-ra emelkedik. 5 óra szobahőmérsékleten való kevertetés után a kiváló kristályokat szűrjük. 4,4 g (77,1%) terméket kapunk, melynek olvadáspontja 55–56 °C (metanol-víz-ből).

17. példa
N-(n-decil)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
3,88 g (0,025 mól) (2-tenil)-izotiocianát és 3,93 g (0,025 mól) decilaminból a 16. példában leírt módon 7,25 g (92,8%) terméket állítunk elő, melynek olvadáspontja 77–78 °C (etanolból).

18. példa
N-(2-furfuril)-N'-(2-tenil)-tiokarbamid előállítás
9,72 g (0,1 mól) furfurilamin és 15,5 g (0,1 mól) (2-tenil)-izotiocianátból a 16. példában leírt módon 17,46 g (69,2%) 89 °C olvadáspontú terméket állítunk elő (etanol-vízből).

19. példa
A komponensek összekeverésével az alábbi összetételű malac-premixet készítünk:

Komponens	Mennyiség
A-vitamin	3.000.000 NE
D3-vitamin	600.000 NE
E-vitamin	4.000 NE
K3-vitamin	400 mg
B1-vitamin	600 mg
B2-vitamin	800 mg
B3-vitamin	2.000 mg
B6-vitamin	800 mg
B12-vitamin	10 mg
Niacin	4.000 mg
Kolin-klorid	60.000 mg
12. példa szerint előállított vegyület	10.000 mg
Butil-hidroxi-toluol (antioxidáns)	30.000 mg
Aroma-anyagok	8.000 mg
Nátrium-szacharát	30.000 mg
Nyomelemek	
mangén	8.000 mg
vas	30.000 mg
cink	20.000 mg
réz	6.000 mg
jód	100 mg
Kétszer őrölt korpa ad	1.000 mg

A fenti vitamin- és nyomelem-premixet 0,5 kg/100 kg koncentrációban keverjük az alaptakarmányhoz.

20. példa

A komponensek összekeverésével az alábbi összetételű süldő-premixet készítünk:

Komponens	Mennyiség
A-vitamin	1.200.000 NE
D ₃ -vitamin	300.000 NE
E-vitamin	2.000 NE
B ₂ -vitamins	6.000 mg
B ₃ -vitamin	2.000 mg
B ₁₂ -vitamin	5 mg
Niacin	3.000 mg
Kolin-klorid	40.000 mg
12. példa szerint előállított vegyület	10.000 mg
Butil-hidroxi-toluol (antioxidáns)	30.000 mg
Nyomelemek mangán	6.000 mg
vas	10.000 mg
cink	15.000 mg
réz	30.000 mg
jód	100 mg
Kétszer őrölt korpa ad	1.000 mg

A fenti vitamin- és nyomelem premixet 0,5 kg/100 kg koncentrációban keverjük az alaptakarmányhoz.

21. példa

A 19. példa szerint előállított premix 0,5 kg-os mennyiségét 100,0 kg alábbi összetételű alaptakarmányhoz keverve készítünk malac-takarmányt.

Komponens	Mennyiség
Kukorica	37,6 kg
Árpa	25,4 kg
Búza	6,0 kg
Zab	5,0 kg
Szója	13,0 kg
Halliszt	6,0 kg
Korpa	2,4 kg
Zsírpor	1,5 kg
Ásványi premix ^x	1,0 kg
Takarmánymész	1,0 kg
Takarmánysó	0,5 kg
Biolisin	0,1 kg
A 19. példa szerint előállított premix	0,5 kg
Összsúly	100,0 kg

A fentiek szerint előállított malac-premix hatóanyagtartalma 50 ppm.

^xAz ásványi premix összetétele a következő:

Komponens	Mennyiség
Dikalcium-foszfát	55,0 tömeg%
Monokalcium-foszfát	40,0 tömeg%
Kalcium-karbonát	5,0 tömeg%

22. példa

A 20. példa szerint előállított premix 0,5 kg-os mennyiségét 100,0 kg alábbi összetételű alaptakarmányhoz keverve készítünk süldő-takarmányt.

Komponens	Mennyiség
Kukorica	25,0 kg
Búza	34,0 kg
Extrahált szója	18,0 kg
Tejpor	9,9 kg
Halliszt	4,0 kg
Takarmányélesztő	2,0 kg
Zsírpor	3,4 kg
A 20. példa szerinti ásványi premix	1,8 kg
Takarmánymész	1,0 kg
Takarmánysó	0,4 kg
A 20. példa szerinti premix	0,5 kg
Összsúly	100 kg

A fentiek szerint előállított süldő-premix hatóanyagtartalma 50 ppm

23. példa

400 kg előre őrölt szójalisztet megfelelő keverőberendezésbe mérünk be, majd keverés közben 3,1 kg szójaolajat adunk hozzá és a keverést addig folytatjuk, míg az örleményt olajréteg vonja be. Ezután 9,1 kg, 1. példa szerint előállított vegyületet adunk hozzá és a keverést a homogenizálódás teljesítéséig folytatjuk. A keveréket 9,0 kg szójaolaj hozzáadása után homogenizáljuk.

24. példa

40 kg kukoricaliszthez keverés közben 0,5 kg 2. példa szerint előállított vegyületet adunk, miközben a rendszerbe folyamatosan 3 kg propilénlikolt permetezünk. A keverékhez 1,4 dikalcium-foszfátot adunk, majd homogenizáljuk.

25. példa

10 kg lucernaliszt és 15 kg Vepex^R keveréket 20 órán át keverjük, majd 1 kg kukoricaolajat permetezünk be egyenletesen olyan sebességgel, hogy az adagolás az alábbi komponensek hozzáadásának teljes ideje alatt tartson:

2,5 kg 3. példa szerint előállított vegyület, 10 kg kukoricakeményítő, 2,5 kg fenti hatóanyag, 0,3 kg szilícium-dioxid, 0,6 kg aszkorbinsav, 9 kg kukoricakeményítő és 2,5 kg fenti hatóanyag. A kapott keveréket további 5 percen át keverjük.

26. példa

A 23. példa szerinti eljárást azzal a változtatással végezzük el, hogy nedvesítőszerként szójaolaj helyett butilénlikolt alkalmazunk.

27. példa

A) 3,5 kg burgonyakeményítőt 2,9 kg, 5. példa szerint előállított vegyülettel összekeverünk. A keverékbe 0,05 kg ásványolajat porlasztunk, majd 0,2 kg szorbinsavat, 0,4 kg szilíciumdioxidot és 0,1 kg kalcium-propionátot adunk hozzá és a keveréket további 2 percen át keverjük.

B) 4,2 kg húslisztet és 22 kg rozskorpát összekeverünk, majd 0,6 kg ásványolajat porlasztunk be és

keverés közben 4 kg, azaz A) pont szerint előállított keveréket, 10 kg kukoricalisztet, 4 kg A) pont szerint előállított keveréket és 9 kg kukoricalisztet adunk egymás után hozzá, végül 0,6 kg ásványolajat porlasztunk be.

28. példa

100 kg búzazorpát, 10 kg, 6. példa szerint előállított vegyületet, 2,5 kg kalcium-karbonátot, 0,15 kg alfa-tokoferolt és 0,4 kg kalcium-propionátot, 4 kg propilénlikollal homogenizálunk.

29. példa

10 kg szójalisztet és 0,6 kg, 8. példa szerint előállított vegyületet 2,5 kg butilénlikollal homogenizálunk.

30. példa

50 kg szójalisztet, 6 kg 12. példa szerint előállított vegyületet, 0,5 kg szilícium-dioxidot, 1,6 kg szójaolajat és 0,2 kg kalcium-propionátot homogenizálunk.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás az (I) általános képletű 2-tenil-tiokarbamid-származékok előállítására, amely képletben

A₁ jelentése hidrogénatom vagy 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport;

A₂ jelentése 3–10 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 4–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(2–4 szénatomos alkenil)-, naftil-, furfuril-, adott esetben 1–4 szénatomos alkoxi-, hidroxil- vagy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal egyszeresen vagy kétszeresen helyettesített fenilcsoport, vagy adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített piridilcsoport;

X jelentése vegyértékkötés vagy –CO-csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X jelentése vegyértékkötés, A₂ jelentése fenilcsoporttól eltérő,

azzal jellemezve, hogy

a) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése vegyértékkötés, A₁ jelentése hidrogénatom, A₂ jelentése pedig a fent megadott, valamely (II) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – izotiocianátot (III) képletű 2-tenil-aminnal reagáltatunk; vagy

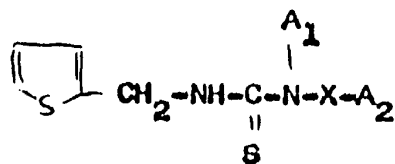
b) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése vegyértékkötés, A₁ jelentése hidrogénatom vagy 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport, A₂ jelentése pedig a fent megadott (V) képletű 2-tenil-izotiocianátot valamely (VI) általános képletű – a képletben A₁ és A₂ jelentése a fenti – aminnal reagáltatunk; vagy

c) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése –CO-csoport és A₁ hidrogénatomot jelent, A₂ jelentése pedig a fent megadott, (III) képletű 2-tenil-amint valamely (IV) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – acil-izotiocianáttal reagáltatunk; vagy

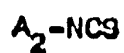
d) azon (I) általános képletű vegyületek előállítására céljából, amelyek képletében X jelentése –CO-csoport és A₁ hidrogénatomot jelent, A₂ jelentése pedig a fent megadott, (VII) képletű N-(2-tenil)-tiokarbamidot valamely (VIII) általános képletű – a képletben A₂ jelentése a fenti – karbonsavval vagy aktív származékával reagáltatunk.

2. Eljárás súlyhozam-növelő takarmány-adalék előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely 1. igénypont szerint előállított (I) általános képletű vegyületet (mely képletben A₁, A₂ és X jelentése a fent megadott) a takarmány adalékok előállításánál szokásosan használt inert szilárd vagy folyékony hígító- vagy hordozóanyagokkal és adott esetben adalékanyagokkal összekeverünk.

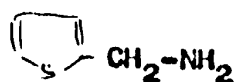
3. A 2. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hordozóanyagként takarmányozásra használatos, növényi vagy állati eredetű anyagokat – előnyösen búzát, árpát, kukoricát, szóját, babot, rozst vagy lucernát – szem, dara vagy liszt alakjában – vagy hallisztet vagy húslisztet alkalmazunk.



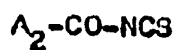
I



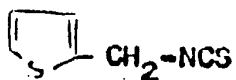
II



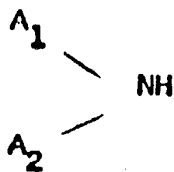
III



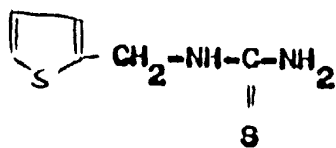
IV



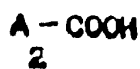
V



VI



VII



VIII

Kiadja: Országos Találmányi Hivatal, Budapest
 Felelős kiadó: dr. Szvoboda Gabriella

KÓDEX