



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

216447

(11)

(B1)

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

(22) Prihlášené 25 02 81

(21) (PV 1328-81)

(40) Zverejnené 31 12 81

(45) Vydané 01 06 85

(51) Int. Cl.³

C 07 C 87/00

C 07 C 87/30

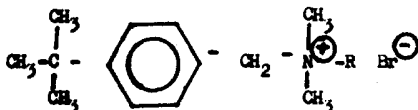
(75)

Autor vynálezu

CSIBA IMRICH RNDr., DEVÍNSKY FERDINAND ing., LACKO IVAN ing.,
KRASNEC LUDOVÍT prof. RNDr., BRATISLAVA

(54) Alkyldimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromidy a spôsob ich prípravy

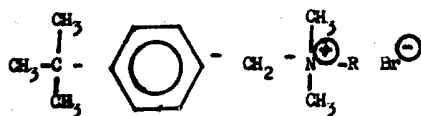
Vynález sa týka alkyldimetyl-p-terc.butylbenzylamóniumbromidov všeobecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 8 až 16 a spôsobu ich prípravy, ktorý spočíva v reakcii p-tercbutylbenzylbromidu s príslušným alkyldimetylaminom v polárnom prostredí.

Takto pripravené zlúčeniny vykazujú výrazné antimikrobiálne a povrchovoaktívne vlastnosti.

Vynález sa týka alkyl dimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromidov všeobecného vzorca



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

Organické amóniové soli s najmenej jedným dlhým alkylovým reťazcom sú známe ako zlúčeniny vykazujúce výrazné biologické účinky (napr. antimikrobiálne, muskarínové, kurareformné) ako i povrchovoaktívne vlastnosti. Preto nachádzajú použitie ako dezinficiencia, detergenty, liečivá, pomocné látky pre farmaceutický priemysel ale i v organickej syntéze napr. ako medzifázové katalyzátory alebo pri príprave nenasýtených zlúčenín.

Prevažná väčšina priemyselne používaných amóniových solí sa pripravuje reakciou príslušných terc. amínov s halogénalkánmi za rôznych reakčných podmienok s variabilným výťažkom. Spôsob podľa vynálezu využíva reakciu p-terc. butylbenzylbromidu s alkyl dimetylaminom v polárnom prostredí, pričom sa získajú produkty vysokej čistoty.

Zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu sú látky nové, doteraz v chemickej literatúre neopísané. Zistili sa u nich doteraz neznáme účinky na mikroorganizmy. V dezinfekčnej účinnosti sú tieto látky zrovnateľné s komerčne používanými dezinficienciami tohoto typu a najúčinnšie z nich v svojej aktivite predstihujú tieto látky (Ajatin, Septonex).

Príklady ilustrujú spôsob prípravy vybraných zlúčenín, ktoré sú predmetom vynálezu a ich charakterizáciu s uvedením ich antimikrobiálnej aktivity vyjadrenej ako minimálna inhibičná koncentrácia (MIC) v $\mu\text{g/ml}$ na kmene: *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli* a *Candida albicans*. Príklady neobmedzujú rozsah použitia tejto metódy.

Príklad 1

K 0,1 mol dimetyloktylamínu rozpusteného v 10 ml suchého metanolu sa za laboratórnej teploty pridá 0,1 mol p-terc. butylbenzylbromidu. Reakčná zmes sa zahrieva 4 hodiny pri teplote 100 °C. Po ochladení sa metanol oddestiluje a surový produkt, ktorým je oktyldimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromid sa prekryštalizuje do konštantnej teploty topenia zo suchého acetónu. Produkt má t. t. 89 až 91 °C; elementárna analýza (vypočítané/zistené): C=65,60/66,27 H=10,35/9,97 N=3,60/3,48; výťažok 57 % teórie; MIC: 10; 60; 20.

Príklad 2

Pracovný postup je ten istý ako je to uvedené v príklade 1 s tým rozdielom, že do reakcie sa použil dodecyldimetylamin a rozpúšťadlom bol etanol. Produkt, dodecyldimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromid, mal t. t. 109 až 111 °C; elementárna analýza (vypočítané/nájdene): C = 68,21/68,01 H=10,54/10,46 N=3,18/3,34; výťažok 66 % teórie; MIC: 5; 30; 2.

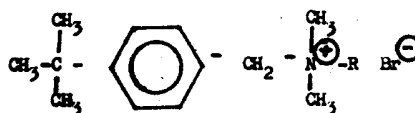
Príklad 3

Pracovný postup je zhodný s postupom príkladu 1, do reakcie sa použil hexadecyldimetylamin. Produkt, hexadecyldimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromid mal t. t. 70 až 72 °C; elementárna analýza (vypočítané/nájdene): C=70,23/69,97 H=10,97/10,92 N=2,82/3,03; výťažok 57 % teórie; MIC: 3; 90; 0,8.

Všetky takto pripravené zlúčeniny boli biele kryštalické, málo hygroskopické látky, rozpustné v polárnych a nerozpustné v nepolárnych rozpúšťadlách. Okrem analýzy boli identifikované aj spektrálnymi metódami.

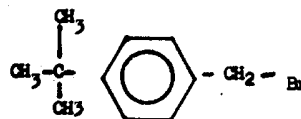
PREDMET VYNÁLEZU

1. Alkyl dimetyl-p-terc. butylbenzylamóniumbromid všeobecného vzorca

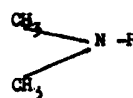


kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 8 až 16.

2. Spôsob prípravy zlúčenín všeobecného vzorca ako v bode 1, vyznačený tým, že sa nechá zreagovať p-terc. butylbenzylbromid vzorca



s alkyl dimetylaminom všeobecného vzorca



kde R značí to isté ako v bode 1, v prostredí suchého metanolu alebo etanolu v rozmedzí teplôt 20 až 100 °C.