



ÚRAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

199 163

(11) (B1)

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

(61)

(23) Výstavná priorita
(22) Prihlásené 22 06 78
(21) PV 4109-78

(40) Zverejnené 17 09 79
(45) Vydané 15 06 82

(51) Int. Cl.³ C 07 D 295/22

(75)

Autor vynálezu DEVINSKY FERDINAND ing.,

LACKO IVAN ing. a

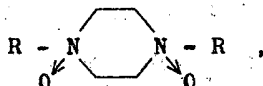
KRASNEC ĽUDOVÍT prof. RNDr., BRATISLAVA

(54)

N,N'-dialkylpiperazín-N,N'-dioxidy

1

Vynález sa týka N,N'-dialkylpiperazín-N,N'-dioxidov obecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec obsahujúci 3 až 16 atómov uhlíka. Diamindioxidy, ktoré obsahujú vo svojej molekule dlhší alkylový reťazec, vykazujú dobré povrchovoaktívne ale aj antimikrobiálne vlastnosti, ktoré sa využívajú v mnohých oblastiach. V porovnaní s podobnými zlúčeninami typu organických amóniových solí sú amínoxidy napríklad podstatne menej dráždivé a toxické.

Niektoré N,N'-dialkylpiperazíny sa používajú ako anthelmintiká a zistila sa u nich aj nešpecifická antimikrobiálna aktivita.

U zlúčenín, ktoré sú predmetom tohoto vynálezu sa zistili doteraz neznáme účinky na grampozitívne baktérie *Staphylococcus aureus*. Účinnosť, zistená difúznym testom a vyjadrená geometrickým priemerom inhibičných zón v mm je ilustrovaná príkladmi vybratých zlúčenín v tabuľke 1.

Tab.1

R	etyl	butyl	hexyl	nonyl	tetradecyl
S.aureus	14	18	18	14	11

Zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu, sa pripravujú oxidáciou príslušných N,N'-dialkylpiperazínov 30% vodným roztokom peroxidu vodíka v prostredí metanolu pri teplote 65 až 70 °C.

V príkladoch sú uvedené typické metódy prípravy zlúčenín, ktoré sú predmetom vynálezu.

Príklad 1

K 17,0 g (0,1 mol) N,N'-dipropylpiperazínu rozpusteného v 30 ml metanolu zahriateho na 40 °C sa pridá 0,4 mol 30% vodného roztoku peroxidu vodíka. Reakčná zmes sa zahreje na 65 až 70 °C a mieša sa pri tejto teplote 4 hodiny. Po ochladení sa pridá platínová čerň (0,1 g/100 ml reakčnej zmesi). Po rozložení prebytočného peroxidu vodíka sa rozpúšťadlo a voda oddestiluje pri 50 °C a tlaku 1,6 kPa. Surový produkt sa prekryštalizuje zo zmesi suchého acetónu a suchého etanolu (10:1) až do konštantnej teploty topenia. Získa sa dihydrát N,N'-dipropylpiperazín-N,N'-dioxidu s t.t. 202 až 203 °C /rozklad/ v 79% výťažku; $R_f=0,09$; \checkmark (NO) dublet pásov 972,923 cm^{-1} .

Príklad 2

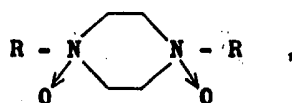
Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1; namiesto N,N'-dipropylpiperazínu sa oxidoval N,N'-dinonylpiperazín. Získal sa dihydrát N,N'-dinonylpiperazín-N,N'-dioxidu s t.t. 190 až 191 °C vo výťažku 80 %; $R_f=0,37$; \checkmark (NO) triplet pásov 976,960,922 cm^{-1} .

Príklad 3

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1, oxidoval sa však N,N'-dipentadecylpiperazín. Získal sa bezvodý N,N'-dipentadecylpiperazín-N,N'-dioxid s t.t. 166 až 168 °C /etanol/; $R_f=0,55$; \checkmark (NO) dublet pásov 968,921 cm^{-1} ; výťažok 90 %.

P R E D M E T V Y N Á L E Z U

N,N'-dialkylpiperazín-N,N'-dioxidy obecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 3 až 16.