



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

(61)

(23) Výstavná priorita

(22) Prihlášené 8 08 80

(21) PV 357-79

(40) Zverejnené 27 02 81

(45) Vydané 30 11 81

209 321

(11)

(B 1)

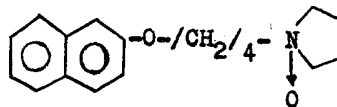
(51) Int. Cl. ³ C 07 D 295/08

(75)

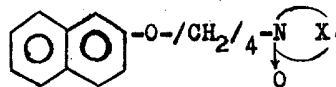
Autor vynálezu DEVÍNSKY FERDINAND ing.,
LACKO IVAN ing.,
KRASNEC LUDOVÍT prof. RNDr., BRATISLAVA

(54) N-(4/2-naftyloxy/butyl)amín-N-oxidy a spôsob ich prípravy

- a. N-(4-/2-naftyloxy/butyl)amín-N-oxidy a spôsob ich prípravy
- b. Organická chémia
- c. Syntéza
- d. Syntéza N-(4-/2-naftyloxy/butyl)amín-N-oxidov z príslušných terciárnych amínov oxidáciou pomocou vodných roztokov peroxidu vodíka v koncentrácii 5 až 50 %. Zlúčeniny sú biologicky aktívne látky, predovšetkým s antimikrobiálnym účinkom.
- e. Farmaceutický, chemický, potravinársky, vláknařský priemysel, petrochémia, kozmetika.



Vynález sa týka N-(4-/2-naftyloxy/butyl)amín-N-oxidov obecného vzorca



kde X značí $/CH_2/4$ až 7 a $/CH_2CH_2/2^0$ a spôsobu ich prípravy. Ako je známe, niektoré amín-oxidy, obsahujúce vo svojej molekule nasýtený heterocyklický amínový zvyšok, vykazujú výrazné biologické účinky. Okrem toho, v dôsledku svojej štruktúry majú medzi iným aj povrchovoaktívne vlastnosti. Aminoxidy, ktorých nepolárnu časť tvorí aromatický uhlíkovodík, pripojený éterickou väzbou na alifatický reťazec však doteraz ešte pripravené neboli. Zlúčeniny, ktoré sú podstatou vynálezu, sú látky nové a zistili sa u nich doteraz neznáme účinky na rôzne kmene mikroorganizmov.

Uvedené zlúčeniny sa pripravujú pôsobením 30 % vodného roztoku peroxidu vodíka na N-(4-/2-naftyloxy/butyl)amíny v prostredí metanolu počas 3 hodín pri teplote 60 až 70 °C.

Výhodou spôsobu prípravy, ktorý je predmetom vynálezu je relatívne veľmi krátka reakčná doba, pričom sa získajú produkty vysokej čistoty.

Na ilustráciu zlúčenín ako i spôsobu ich prípravy sú uvedené nasledovné príklady.

Príklad 1

Zmes 26,9 g N-(4-/2-naftyloxy/butyl)pyrolidínu, 60 ml metanolu a 0,14 mol 30 % vodného roztoku peroxidu vodíka sa nechá reagovať 3 hodiny pri teplote 60 až 70 °C. Po ochladení, rozložení prebytočného oxidačného činidla, odparení vody a rozpúšťadla a prekryštalizovaní sa získa N-(4-/2-naftyloxy/butyl)pyrolidín-N-oxid vo výťažku 84 %; t.t. 87 až 89 °C $R_F = 0,24$; elementárna analýza /vypočítané/nájdene %/: C=75,76/75,57, H=8,12/8,19, N=4,91/4,81; $\nu_{NO} = 923 \text{ cm}^{-1}$; $\lambda_{max} = 227,261,271,282,328 \text{ nm}$.

Príklad 2

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1, namiesto derivátu pyrolidínu sa na oxidáciu použil N-(4-/2-naftyloxy/butyl)morfolín, z ktorého vzniká príslušný N-oxid v 89 % výťažku; t.t. 49 až 50 °C; $R_F = 0,16$; elementárna analýza /vypočítané/nájdene %/: C=71, 73/71,44; H=7,69/7,63, N=4,65/4,42; $\nu_{NO} = 931 \text{ cm}^{-1}$; $\lambda_{max} = 227,261,271,282,328 \text{ nm}$.

Príklad 3

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1 s tým rozdielom, že na oxidáciu amínu sa použije peroxid vodíka v koncentrácii 5 %. Produkt vzniká vo výťažku 80 %. Hodnoty teploty topenia, elementárnej analýzy, IČ a UV spektrálnych meraní sú totožné s hodnotami finálnej zlúčeniny uvedenej v príklade 1.

Príklad 4

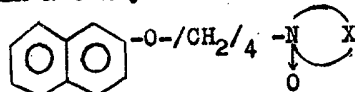
Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1 s tým rozdielom, že na oxidáciu amínu sa použije peroxid vodíka v koncentrácii 50 %. Produkt vzniká vo výťažku 88 %. Hodnoty teploty topenia, elementárnej analýzy, IČ a UV spektrálnych meraní sú totožné s hodnotami finálnej zlúčeniny uvedenej v príklade 1.

Reakčná teplota je výhodná z ekonomického hľadiska, pretože reakcia je exotermická a na zníženie teploty, čo nie je ani z hľadiska výťažkov ani z hľadiska čistoty produktov

potrebné, je nutné reakčnú zmes chladiť.

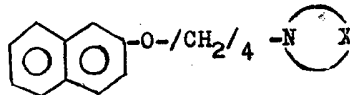
P R E D M E T V Y N Á L E Z U

1. N- 4-/2-naftyloxy/butyl amín-N-oxidy obecného vzorca



kde X značí $/CH_2/4$ až 7 a $/CH_2CH_2/2^0$.

2. Spôsob prípravy zlúčenín podľa bodu 1, vyznačujúci sa tým, že sa môže reagovať 5 až 50 % vodný roztok peroxidu vodíka, s výhodou 30 %, s N-(4-/2-naftyloxy/butyl)amínom obecného vzorca



kde X má ten istý význam ako v bode 1, v prostredí metanolu pri teplote 60 až 70 °C počas 3 hodín.