



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU 215487

(11) (B1)

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

(22) Prihlášené 16 02 81
(21) (PV 1057-81)

(40) Zverejnené 30 10 81
(45) Vydané 01 01 85

(51) Int. Cl.³
C 07 C 135/02
A 61 K 31/13

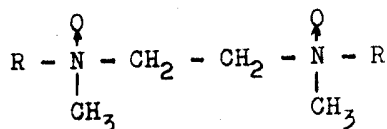
(75)

Autor vynálezu

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

(54) N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamíndi oxidy a spôsob ich prípravy

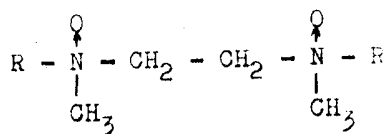
Vynález sa týka N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamíndi oxidov všeobecného vzorca



kde R značí 8 až 14 atómov uhlíka v alkylovom reťazci a spôsobu prípravy týchto zlúčenín z N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamínov oxidáciou vodným roztokom peroxidu vodíka.

Finálne zlúčeniny majú výrazný antimikrobiálny účinok ako i povrchovoaktívne vlastnosti.

Vynález sa týka N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamíndioxidov všeobecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec s počtom atómov uhlíka 8 až 14.

Z hľadiska antimikrobiálnej účinnosti patria nearomatické aminosoxidy, ktoré vo svojej molekule obsahujú najmenej jeden dlhý alkylový reťazec medzi účinné zlúčeniny. Okrem biologického účinku vykazujú tieto látky aj povrchovoaktívne vlastnosti.

Doteraz sú známe aminosoxidy odvodené od 1,2-etándiamínu typu N,N'-bisdiálkyl, kde alkylový reťazec obsahuje 1 alebo 2 atómy uhlíka. Tieto zlúčeniny sú však antimikrobiálne ako i z hľadiska povrchovej aktivity neúčinné.

Zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu, sú látky nové, doteraz v chemickej literatúre neopísané, u ktorých sa zistili doteraz neznáme účinky na mikroorganizmy.

V príkladoch sú uvedené vybrané zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu a metóda ich prípravy ako i ich charakterizácia spolu s uvedením ich antimikrobiálnej účinnosti (udanej ako minimálna

inhibičná koncentrácia – MIC – v µg/ml na kmeňoch *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli* a *Candida albicans*).

Príklad 1

0,1 mol N,N'-bis(metylnonyl)-1,2-etándiamínu sa rozpustí v metanole a pri teplote 40 až 50 °C sa pridá 0,3 mol 20 až 30 % vodného roztoku peroxidu vodíka. Zmes sa nechá reagovať 4 hodiny pri teplote 60 až 70 °C. Po ochladení sa nadbytočný peroxid vodíka rozloží, rozpúšťadlo a voda sa odparí a suchý zvyšok sa prekryštalizuje zo suchého acetónu. Vzniká N,N'-bis(metylnonyl)-1,2-etándiamíndioxid s t. t. 128. až 130 °C; $R_f = 0,85$ (Silufol; sústava acetón : 1 N HCl (1 : 1), detekcia Dragendorfovým činidlom); výťažok 84 % teórie; MIC 50; 200; 90; IČ-spektrálna charakteristika: $\nu_{\text{NO}} : 939$ a 947 cm^{-1} (nujol).

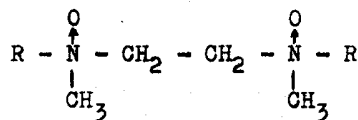
Príklad 2

Pracovný postup ako i navážky sú zhodné s postupom uvedeným v príklade 1, do reakcie sa použil N,N'-bis(metyltridecyl)-1,2-etándiamín. Produkt N,N'-bis(metyltridecyl)-1,2-etándiamíndioxid má t. t. 107 až 110 °C; $R_f = 0,45$; výťažok 84 % teórie; MIC 70; 800; 70; IČ-spektrálna charakteristika: $\nu_{\text{NO}} : 918$ a 936 cm^{-1} (nujol).

Všetky zlúčeniny, ktoré sú predmetom vynálezu sa identifikovali elementárnou analýzou a spektrálnymi metódami.

PREDMET VYNÁLEZU

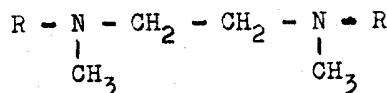
1. N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamíndioxidov všeobecného vzorca



kde R značí alkylový reťazec obsahujúci 8 až 14 atómov uhlíka.

2. Spôsob prípravy zlúčenín všeobecného vzorca

ca ako v bode 1, vyznačený tým, že sa nechá oxidovať N,N'-bis(alkylmetyl)-1,2-etándiamín všeobecného vzorca



kde R má ten istý význam ako v bode 1, 20 až 30 % vodným roztokom peroxidu vodíka pri teplotách 40 až 70 °C.