



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

(22) Prihlášené 17 01 79
(21) (PV 359-79)

(40) Zverejnené 27 02 81

(45) Vydané 01 07 83

209355

(11)

(B1)

(51) Int. Cl.³
C 07 D 295/08
C 07 D 265/30
C 07 C 15/24

(75)

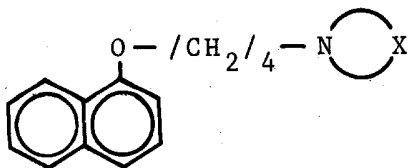
Autor vynálezu

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

(54) N-(4-[1-naftyloxy]butyl)amíny a spôsob ich prípravy

Syntéza N-(4-[1-naftyloxy]butyl)amínov z 1-brom-4-(1-naftyloxy)butánu z nasýteného heterocyklického sekundárneho amínu za pomoci bezvodého uhličitanu draselného. Finálne zlúčeniny slúžia ako medziprodukty pre prípravu biologicky účinných zlúčenín.

Vynález sa týka N-(4-[1-naftyloxy]butyl)amínov obecného vzorca



kde X značí $(\text{CH}_2)_4$ až 7 a $(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{O}$ a spôsobu ich prípravy. Ako je známe, mnohé deriváty nasýtených heterocyklických amínov vykazujú výrazné biologické vlastnosti. Zlúčeniny, ktorých molekula obsahuje amínovú zložku a súčasne cez éterickú väzbu viazaný naftalénový skelet však doteraz neboli ani pripravené ani sledované z hľadiska ich biologických účinkov. Zlúčeniny, ktoré sú podstatou vynálezu, sú látky nové, doteraz v literatúre neopísané a slúžia ako východiskové suroviny pri príprave nových antimikrobiálne účinných zlúčenín.

Nové zlúčeniny sa pripravujú spôsobom podľa vynálezu, ktorého podstatou je reakcia 1-bróm-4-(1-naftyloxy)butánu s príslušným nasýteným heterocyklickým amínom za prítomnosti bezvodého uhličitanu draselného pri teplote 150°C počas 1,5 hodiny. Výhodou tejto metódy prípravy oproti

iným spôsobom syntézy je vysoká výťažkovosť a čistota vznikajúcich produktov.

Na ilustráciu vyššie uvedených zlúčenín a spôsobu ich prípravy sú uvedené nasledovné príklady.

Príklad 1

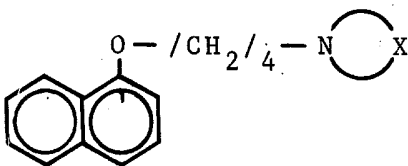
Zmes 19 g bezvodého uhličitanu draselného, 41,9 g 1-bróm-4-(1-naftyloxy)butánu a 21,3 g pyrolidínu sa nechá reagovať 1,5 h pri teplote 150°C . Po ochladení a rozpustení pevných podielov vo vode sa produkt extrahuje. Extrakty sa vysušia, rozpúšťadlo sa oddestiluje a produkt sa predestiluje. N-(4-[1-naftyloxy]butyl)pyrolidín vzniká vo výťažku 84 %; t. v. $187^\circ\text{C}/0,08\text{ kPa}$; $n_D^{20} = 1,5772$; elementárna analýza (vypočítané/nájdene %): C = 80,26/80,00, H = 8,61/8,82, N = 5,20/5,29; $\lambda_{\text{max}} = 212, 233, 296, 308, 322\text{ nm}$.

Príklad 2

Pracovný postup je ten istý ako v príklade 1, namiesto pyrolidínu sa však použil perhydroazepín. Výťažok N-(4-[1-naftyloxy]butyl)perhydroazepínu je 80 %; t. v. $210^\circ\text{C}/0,08\text{ kPa}$; $n_D^{20} = 1,5550$; elementárna analýza (vypočítané/nájdene %): C = 80,76/80,85, H = 9,15/9,03, N = 4,71/4,60; $\lambda_{\text{max}} = 211, 233, 295, 306, 322\text{ nm}$.

PREDMET VYNÁLEZU

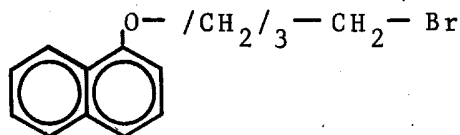
1. N-(4-[1-naftyloxy]butyl)amíny obecného vzorca



kde X značí $(\text{CH}_2)_4$ až 7 a $(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{O}$.

2. Spôsob prípravy zlúčenín podľa bodu 1, vyznačujúci sa tým, že sa nechá reagovať nasýtený heterocyklický sekundárny amín s počtom atómov

uhlíka v kruhu 4 až 7 alebo morfolín s 1-bróm-4-(1-naftyloxy)butánom vzorca



pri teplote 150°C počas 1,5 hodiny za prítomnosti bezvodého uhličitanu draselného v prostredí bez rozpúšťadla.