



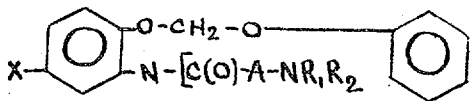
ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ  
ПО ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ОТКРЫТИЯМ  
ПРИ ГИИТ СССР

# ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

ВСЕСОЮЗНАЯ  
ПАТЕНТНО-ТЕХНИЧЕСКАЯ  
БИБЛИОТЕКА

- 1
- (21) 4203954/23-04
  - (22) 30.12.87
  - (31) 5513/86
  - (32) 30.12.86
  - (33) HU
  - (46) 30.06.90. Бюл. № 24
  - (71) Эгиш Дьедьсердьяр (HU)
  - (72) Ласло Рожа, Луиза Петёц, Мартон Фекете, Еликё Сирт, Мария Хегедюш и Иштван Гачальи (HU)
  - (53) 547.895.07(088.8)
  - (56) Патент США № 4208410, кл. 424-244, опублик. 1980.  
Патент СССР № 1470187, кл. C 07 D 273/01, 1985.

- (54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ АМИНОАЛКАНОИЛДИБЕНЗО(d,g)(1,3,6)ДИОКСАЗОЦИНА ИЛИ ИХ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИ ПРИЕМЛЕМЫХ АДДИТИВНЫХ СОЛЕЙ С КИСЛОТАМИ
- (57) Изобретение касается гетероциклических веществ, в частности получения соединений общей ф-лы



где X=H или галоген; R<sub>1</sub>=H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил; R<sub>2</sub>=C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил; C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкил

2

или NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>=пирролидиновый, пиперидиновый, морфолиновый радикал (он может быть замещен CH<sub>3</sub>); A=H- или изо-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкилен, или их фармацевтически приемлемых солей с кислотами, которые обладают местно-анестезирующим, транквилоседативным и/или антидепрессивным, антипаркинсонским, антиаритмическим и антиангинозным действием, что может быть использовано в медицине. Цель - создание новых более активных веществ указанного класса. Синтез ведут ацилированием дибензо[d, g][1,3,6]-диоксазона с помощью соединения Гал-C(O)-A-Гал', где Гал и Гал' независимы и равны галогену; A указано выше, в среде ароматического углеводорода с последующей обработкой полученного продукта соответствующим амином HNR<sub>1</sub>R<sub>2</sub> в среде ароматического углеводорода. Целевой продукт выделяют или переводят в необходимую соль. Новые вещества малотоксичны [LD<sub>50</sub>=160-2000 мг/кг] и более активны, чем Лидокаин (местная анестезия и антиаритмия), Амитриптилин (антагонизм к тетрабеназиновым птозам у мышей), Тригексифенидил (антиникотиновое и анти-тремориновое действие). 7 табл.

Изобретение относится к способу получения производных аминоканоилдибензо(d, g)(1,3,6)диоксазона или их фармацевтически приемлемых аддитивных солей с кислотами, обладающих местно-анестезирующим, транквилоседативным

и/или антидепрессивным, антипаркинсонским, антиаритмическим и антиангинозным действием, что может быть использовано в медицине.

Цель изобретения - получение новых соединений ряда дибензо(d, g)

(19) SU (11) 1575938 A3