



(51) МПК<sup>7</sup> C07D273/01, A61K31/357,  
A61K31/395, A61P9/06, A61P23/02,  
A61P25/16, A61P25/22, A61P25/24

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ  
СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ  
к патенту

Статус: по данным на 19.07.2010 - прекратил действие

(21), (22) Заявка: 4203954, 30.12.1987

(46) Опубликовано: 30.06.1990

(56) Список документов, цитированных в  
отчете о  
поиске: Патент США. № 4208410, кл.  
424-244, опублик. 1980. Патент СССР  
№ 1470187, кл. С 07 D 273/01, 1985.

(71) Заявитель(и):  
Эгиш Дьё дьсердьяр (НУ)

(72) Автор(ы):  
ЛАСЛО РОЖА,  
ЛУИЗА ПЕТЕЦ,  
МАРТОН ФЕКЕТЕ,  
ЕЛИКЕ СИРТ,  
МАРИЯ ХЕГЕДЮШ,  
ИШТВАН ГАЧАЛЫИ

(73) Патентообладатель(и):  
ЭГИШ ДЬЕДЬСЕРДЬЯР  
(ИНОПРЕДПРИЯТИЕ)

(54) Способ получения производных аминоканонилдибензо ( @ , @ ) (1,3,6) диоксазоцина  
или их фармацевтически приемлемых аддитивных солей с кислотами

(57) Реферат:

Изобретение касается гетероциклических веществ, в частности получения соединений общей ф-лы @ ,  
где Х=Н или галоген

R<SB POS="POST">1</SB>=H,C<SB POS="POST">1</SB>-C<SB POS="POST">4</SB>-алкил

R<SB POS="POST">2</SB>=C<SB POS="POST">1</SB>-C<SB POS="POST">4</SB>-алкил

C<SB POS="POST">3</SB>-C<SB POS="POST">6</SB>-циклоалкил или N,R<SB  
POS="POST">1</SB>R<SB POS="POST">2</SB> = пирролидиновый, пиперидиновый, морфолиновый  
радикал (он может быть замещен CH<SB POS="POST">3</SB>)

A=H-или изо-C<SB POS="POST">1</SB>-C<SB POS="POST">3</SB>-алкилен, или их фармацевтически  
приемлемых солей с кислотами, которые обладают местно-анестезирующим, транквилиседативным  
и/или антидепрессивным, антипаркинсоновским, антиаритмическим и антиангиозным действием, что  
может быть использовано в медицине. Цель - создание новых более активных в широком спектре и  
менее токсичных веществ указанного класса. Синтез ведут ацилированием дибензо[D,G]  
[1,3,6]диоксазоцина с помощью соединения Гал-C(O)-А-Гал<SB POS="POST">1</SB>, где Гал и Гал<SB  
POS="POST">1</SB> независимы и равны галогену

А указано выше, в среде ароматического углеводорода с последующей обработкой полученного продукта  
соответствующим амином HNR<SB POS="POST">1</SB>R<SB POS="POST">2</SB>, в среде  
ароматического углеводорода. Целевой продукт выделяют или переводят в необходимую соль. Новые  
вещества малотоксичны (LD<SB POS="POST">50</SB> = 160-2000 мг/кг) и более активны, чем Лидокаин  
(местная анестезия и антиаритмия), Амитриптилин (антогонизм к тетрабеназиновым птозам у мышей),  
Тригексифенидил(антиникотиновое и антитремориновое действие). 8 табл.