



Государственный комитет
Совета Министров СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ

К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(11) 484873

(61) Дополнительное к авт. свид-ву -

(22) Заявлено 23.01.74 (21) 1992344/28-13

с присоединением заявки № -

(23) Приоритет -

(43) Опубликовано 25.09.75, Бюллетень № 35

(45) Дата опубликования описания 20.11.75

(51) М. Кл.

A 61k 27/00

(53) УДК 615.782
(088.8)

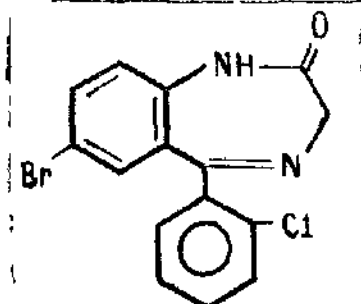
(72) Авторы изобретения А. В. Богатский, С. А. Андронати, Ю. И. Вихляев, Т. А. Клыгуль,
О. П. Руденко, В. В. Закусов и Л. Н. Якубовская

(71) Заявитель Одесский ордена Трудового Красного Знамени государственный
университет им. И. И. Мечникова

(54) ВЕЩЕСТВО, ОБЛАДАЮЩЕЕ ТРАНКВИЛИЗИРУЮЩЕЙ,
СНОТВОРНОЙ И ПРОТИВОСУДОРОЖНОЙ АКТИВНОСТЬЮ

Известно использование в качестве транквилизирующих, снотворных и противосудорожных средств веществ из ряда 1,4-бензодиазепина /хлордiazепоксид, diaзепам и натразепам/.

Предлагаемое вещество, обладающее транквилизирующей, снотворной и противосудорожной активностью, ранее в литературе не описано и представляет собой 7-бром-5-О-хлорфенид/-1,2-дигидро-3Н-1,4-бензодиазепин-2-ОН формулы:



Вещество получают конденсацией 5-бром-2'-хлор 2-аминобензофенола с хлоргидратом хлорангидрида глицина в хлорформе.

Вещество представляет собой порошок белого цвета с желтоватым оттенком, без запаха; не растворимо в воде, мало растворимо в 95%-ном этиловом спирте /0,3%/
5 Температура плавления - 225-228°C.

В ИК = спектре вещества /0,01 м раствор в CCl_4 / имеются полосы поглощения карбонильной группы в области примерно 1690 cm^{-1} , C=N связи - примерно 1615 cm^{-1} . NH - группы 3380, 3330 и 3190 cm^{-1} .

УФ = спектр соединения в эталоне характеризуется наличием двух полос поглощения при λ_{max} 230-2321 нм / $lg \epsilon$ - 4,5/ и 320-321 нм / $lg \epsilon$ - 3,3/.

15 В ЯМР-спектре вещества /10%-ный раствор в ДМСО- d_6 / сигнал метиленовых протонов при 4,46 м.д.

20 В масс-спектре - пики ионов M^+ (m/e 350), $M-H$ (m/e 349), $M-CO$ (m/e 322) и др.

Установлено, что вещество обладает способностью устранения проявлений внешнего торможения, нормализует поведение в условиях конфликтной ситуации, угнетает

ориентировочные реакции и двигательную активность, потенцирует эффекты гексенала и мексала, устраняет судорожные припадки, вызванные проведением максимального электрошока или введением коразола.

По транквилизирующему, седативному и противосудорожному видам действия вещество превосходит наиболее известные транквилизаторы бензодиазепинового ряда с подобным типом действия, например клордiazепоксид, diaзепам, медазепам, оксазепам, нитрозепам, и не уступает по активности синтезированным препаратам лоразепаму и клоназепаму.

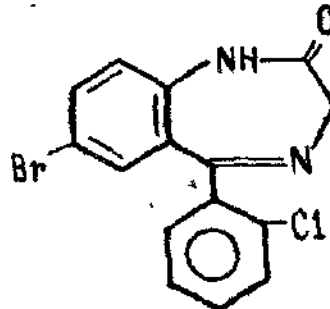
Побочные явления нарушения координации движений, атаксии и бокового положения наблюдаются в меньшей степени, чем у известных транквилизаторов, токсичность также меньше.

Терапевтическая широта вещества как транквилизирующего, снотворного и проти-

восудорожного средства больше, чем нитрозепама и клордiazепоксида.

Предмет изобретения

7-Бром-5-(4-хлорфенил)-1,2-дигидро-3Н-1,4-бензодиазепин-2-ОН формулы:



обладющее транквилизирующей, снотворной и противосудорожной активностью.

Составитель А.Бражникова

Редактор А. Бер

Техред Т.Курилко

Корректор Е.Хмелева

Заказ 3159

Изд. № 1024

Тираж 559

Подписное

ЦНИИПИ Государственного комитета Совета Министров СССР
по делам изобретений и открытий
Москва, 113035, Раушская наб., 4

Предприятие «Патент», Москва, Г 59, Бережковская наб., 24

ли и в то же время, что, с целью повышения твердости и износостойкости, он содержит в качестве карбида металла карбид титана при следующем соотношении указанных компонентов (в вес. %):

Нитрид кремния	55-90
Карбид титана	5-30
Оксид магния или	

оксид алюминия

5-15

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе изобретения:

1. Авторское свидетельство СССР № 285243, кл. C04 в 35/04, 1965 г.

2. Авторское свидетельство СССР № 346289, кл. C 04 в 35/58, 1970 г.

Составитель Г. Куприянова

Редактор И. Квачадзе Техред М. Левицкая Корректор В. Салка

Заказ 5663/14

Тираж 729

Подписное

ЦНИИПИ Государственного комитета Совета Министров СССР
по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Филиал ППП "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4

