



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

218187

(11)

(B1)

(22) Prihlášené 22 06 81
(21) (PV 4671-81)

(40) Zverejnené 28 05 82

(45) Vydané 15 09 84

(51) Int. Cl.³
C 07 D 491/147

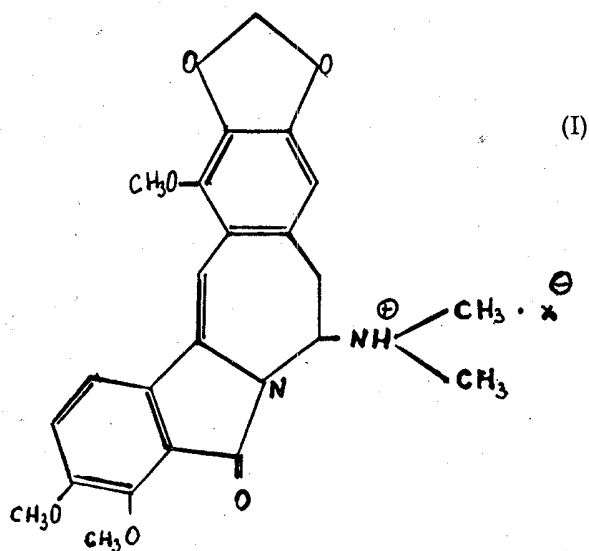
(75)

Autor vynálezu

FUSKA JÁN ing. CSc., BRATISLAVA, PROKSA BOHUMIL ing. CSc.,
HLOHOVEC

(54) Spôsob prípravy solí 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo(1,2-b) (3)benzazepin-5-on-7-yl-dimetylamónia

Vynález sa týka spôsobu prípravy solí 3,4,12-trimetoxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo(1,2-b) (3)benzazepin-5-on-7-yl-dimetylamónia obecného vzorca I



v ktorom x^- značí anión halogenovodíkovej kyseliny, alifatickej karboxylovej kyseliny s počtom uhlíkov 2 až 3 alebo arénsulfonovej kyseliny s počtom uhlíkov 6 až 8.

Spôsob prípravy látok vzorca I podľa vynálezu je taký, že 3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo(1,2-b) (3) benzazepin-5-on sa podrobí reakcii s ekvivalentným množstvom kyseliny halogenovodíkovej, alifatickej karboxylovej kyseliny s počtom uhlíkov 2 až 3 alebo arénsulfonovej kyseliny s počtom uhlíkov 6 až 8 rozpustenej v alkohole s počtom uhlíkov 1 až 3 a roztok sa zahustí ku kryštalizácii, alebo k roztoku sa pridá alifatický ketón s počtom uhlíkov 3 až 5, napríklad acetón alebo ester organickej kyseliny s alkanolom s počtom uhlíkov 3 až 5, napríklad octan etylnatý, v pomere 1:10 až 1:50 a roztok sa nechá kryštalizovať.

Látky uvedeného vzorca I, ktoré doteraz neboli popísané, sú cennými farmakodynamicky účinnými látkami. Napríklad látka vzorca I, kde X značí chloridový anión zvyšuje účinok tubercidínu na proliferáciu buniek lymfocytémie P-388 o 20 %.

Podrobnosti postupu vyplývajú z príkladov prevedenia.

Príklad 1

3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ón (7,90 g) sa zmieša s 25 cm³ metylalkoholu a 1,8 cm³ kyseliny chlorovodíkovej (o koncentrácii 11,3 mol . l⁻¹), k roztoku sa pridá acetón (300 cm³) a roztok sa nechá kryštalizovať pri teplote + 4 °C. Vylúčené kryštály sa odfiltrujú a vysušia. Týmto spôsobom sa získalo 5,2 g 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-on-7-yl-dimetylamóniumchloridu s teplotou topenia 200 °C za rozkladu. Pre C₂₃H₂₅N₂O₆Cl o molekulovej hmotnosti 460,9 je vypočítané: C 59,94 %, H 5,47 %, N 6,08 % a nájdené: C 59,82 %, H 5,53 %, N 6,02 %.

Príklad 2

3,0 g 3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ónu sa rozpustilo v zmesi 15 cm³ etanolu a 1,0 cm³ kyseliny octovej. Roztok sa vákuovo zahustil a zvyšok sa kryš-

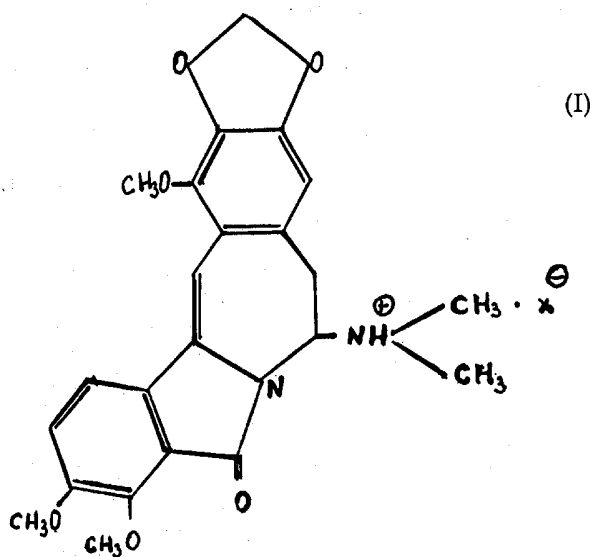
talizoval z octanu etylnatého. Získalo sa 2,8 g 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ón-7-yl-dimetylamónium acetátu s teplotou topenia 180 °C za rozkladu pre C₂₅H₂₈N₂O₈ o molekulovej hmotnosti 484,5 a vypočítané: C 61,97 %, H 5,83 %, N 5,78 % a nájdené: C 61,82 %, H 5,71 %, N 5,74 %.

Príklad 3

3,2 g 3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ónu sa zmiešalo s 1,44 g kyseliny p-toluénsulfonovej v 30 cm³ metanolu, roztok sa zahustil na objem 10 cm³, k zvyšku sa pridalo 100 cm³ acetónu a roztok sa nechal kryštalizovať. Získalo sa 2,6 g 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-on-7-yl-dimetylamónium -p-toluénsulfonátu s teplotou topenia 215 °C za rozkladu, pre C₃₀H₃₂N₂O₉S s molekulovou hmotnosťou 596,66 bolo vypočítané: C 60,39 %, H 5,41 %, N 4,69 % a nájdené: C 60,27 %, H 5,52 %, N 4,71 %.

PREDMET VYNÁLEZU

Spôsob prípravy solí 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ón-7-yl-dimetylamónia obecného vzorca I



v ktorom x⁻ značí anión halogenovodíkovej kyseliny, alifatickej karboxylovej kyseliny s počtom uhlíkov 2 až 3 alebo arénsulfonovej kyseliny s počtom uhlíkov 6 až 8 vyznačujúci sa tým, že 3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-7-dimetylamino-7,8-dihydro-5H-izoindolo (1,2-b) (3) benzazepin-5-ón sa podrobí reakcii s ekvivalentným množstvom kyseliny halogenovodíkovej, alifatickej karboxylovej kyseliny s počtom uhlíkov 2 až 3 alebo arénsulfonovej kyseliny s počtom uhlíkov 6 až 8 rozpustnej v alkanole s počtom uhlíkov 1 až 3 a roztok sa zahustí ku kryštalizácii, alebo k roztoku sa pridá alifatický ketón s počtom uhlíkov 3 až 5, s výhodou acetón, alebo ester organickej kyseliny s alkanolom s počtom uhlíkov 3 až 5, s výhodou octan etylnatý, v pomere 1:10 až 1:50 a roztok sa nechá kryštalizovať.