

C 07 D 413

Ans.nr.: 3758/82

Indleveret: 20 aug 1982

Løbedag: 20 aug 1982

Alm. tilgængelig: 27 feb 1983

Prioritet: 26 aug 1981 JP 134600/81

*DAINIPPON PHARMACEUTICAL CO. LTD.;

Osaka-fu, JP.

Opfinder: Haruki *Nishimura; JP, Shunsuke

*Naruto; JP, Hiroyuki *Mizuta; JP, Toshiaki

*Kadokawa; JP.

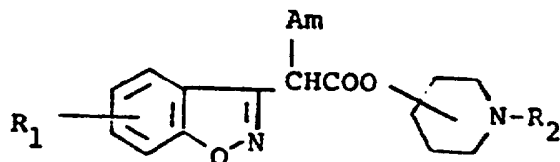
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbu-
reau

Fremgangsmåde til fremstilling af benzisoxazol-
derivater

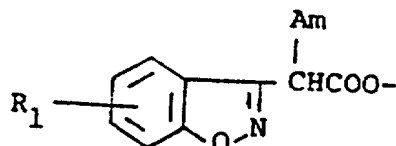
SAMMENDRAG

3758-82

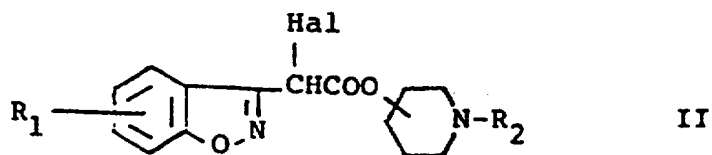
Hidtil ukendte 2-cyclisk amino-2-(1,2-benzisoxazol-3-yl)eddikesyre-
derivater med formlen I



hvor R₁ betegner hydrogen eller halogen, R₂ betegner lavere alkyl,
Am betegner en 5-9-leddet mættet cyclisk aminogruppe, som kan være
substitueret med lavere alkyl, og gruppen



er bundet til piperidindelen i dennes 3- eller 4-stilling, eller farma-
ceutisk tolerable syreadditionssalte eller kvaternære ammoniumsalte
fremstilles ved omsætning af en forbindelse II



hvor Hal betegner halogen, eller et syreadditionssalt deraf med en forbindelse III

H-AM

og påfølgende fakultativ omdannelse til et syreadditionssalt eller et kvaternært ammoniumsalt og eventuelt yderligere omdannelse af et kvaternært ammoniumsalt til et andet kvaternært ammoniumsalt.

Forbindelser I har kraftig anticholinerg antispasmodisk virkning, medens de kun har svage bivirkninger såsom mydriasis, inhibering af spytdannelsen og tachycardi.