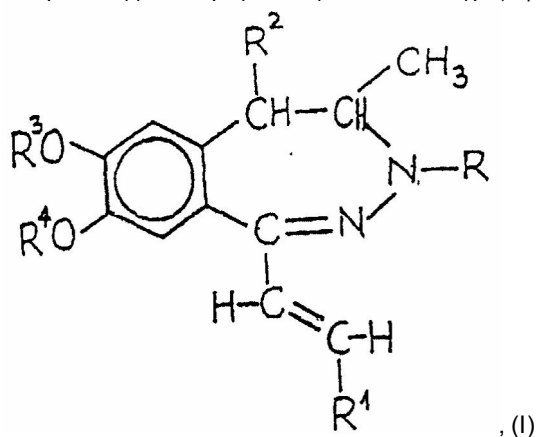


1. Производные 1-[2-(замещенный винил)]-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (I)



где R представляет собой водород или C<sub>1-4</sub> алканоил,

R<sup>1</sup> представляет собой фенил, который может содержать от 1 до 3 одинаковых или различных заместителей, выбранных из группы, включающей галоген, нитро-, amino-, C<sub>1-4</sub> алкиламино-, ди(C<sub>1-4</sub> алкил)амино-, C<sub>1-4</sub> алканоиламиногруппу, C<sub>1-4</sub> алкил, C<sub>1-4</sub> алкоксигруппу, метилendiокси и гидроксил, либо нафтил, который может содержать заместитель, выбранный из группы, включающей гидроксил, C<sub>1-4</sub> алкил и C<sub>1-4</sub> алкокси,

R<sup>2</sup> представляет собой водород или C<sub>1-4</sub> алкил,

R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> независимо друг от друга представляют собой C<sub>1-4</sub> алкил, или

R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> вместе образуют метилен,

их стереоизомеры, возможные смеси и фармацевтически приемлемые кислотно-аддитивные соли.

2. Производные по п. 1, **отличающиеся** тем, что R представляет собой C<sub>1-4</sub> алканоил, R<sup>1</sup> представляет собой фенил или нафтил, содержащий в качестве заместителя C<sub>1-4</sub> алканоиламиногруппу или C<sub>1-4</sub> алкоксигруппу, R<sup>2</sup> представляет собой водород или этил, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> независимо представляют собой C<sub>1-4</sub> алкил.

3. Соединения общей формулы (I) по п. 1, представляющие собой:

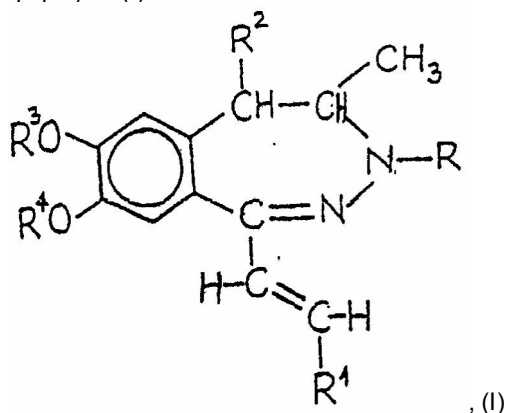
1-(4-ацетиламиностирил)-3-ацетил-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин,

1-[2-(1-нафтил)винил]-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин,

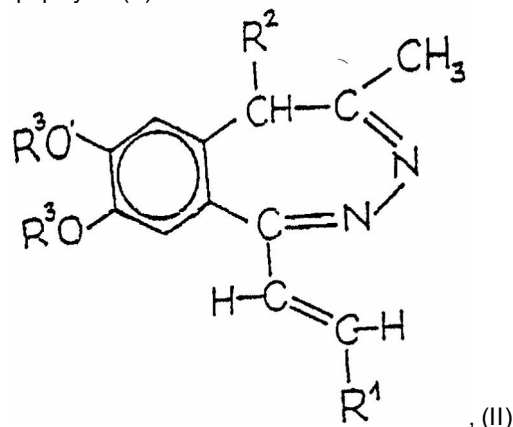
1-(2,3-диметоксистирил)-3-ацетил-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин,

их стереоизомеры, возможные смеси и фармацевтически приемлемые кислотно-аддитивные соли.

4. Способ получения производных 1-[2-(замещенный винил)]-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (I)

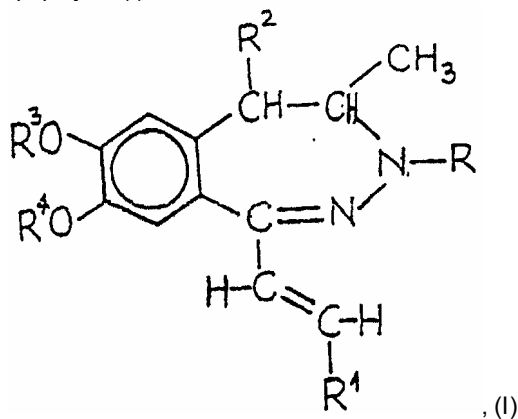


где R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> такие же, как указано в п. 1, включающий восстановление 5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (II)

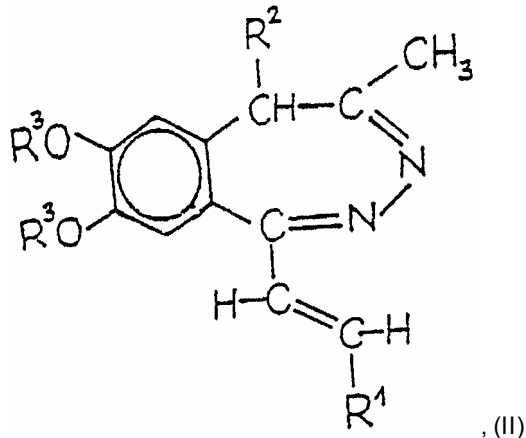


где R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> - такие же, как указано выше, комплексным гидридом металла и/или комплексом борана и, при необходимости, последующее ацилирование полученного таким образом соединения общей формулы (I), где R-водород, а R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> такие же, как указано выше.

5. Способ по п. 4, **отличающийся** тем, что при восстановлении 5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (II), комплексным гидридом металла и/или комплексом борана реакцию осуществляют в растворителе.
6. Способ по п. 5, **отличающийся** тем, что в качестве растворителя используют растворитель или смесь растворителей, которые не взаимодействуют с применяемым восстановительным агентом или взаимодействуют с ним очень медленно.
7. Способ по любому из пп. 4 или 6, **отличающийся** тем, что при восстановлении 5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (II) комплексным гидридом металла и/или комплексом борана в качестве восстановительного агента используют борогидрид натрия, гидрид лития-алюминия или комплекс борана с триметиламином.
8. Способ по любому из пп. 4-7, **отличающийся** тем, что реакцию проводят при температуре от 0°C до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно в интервале от +10°C до 100°C.
9. Способ получения производных 1-[2-(замещенный винил)]-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (I)



где R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> такие же, как указано в п. 1, включающий восстановление соединения общей формулы (II)



где R<sup>1</sup> представляет собой нитрофенил, который может содержать 1 или 2 одинаковых или различных заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, нитро-, amino-, метилendiокси-, гидроксид-, C<sub>1-4</sub> алкил- и C<sub>1-4</sub> алкоксигруппу,

а R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> такие же, как указано выше,

гидратом гидразина в присутствии катализатора с получением 1-[2-(замещенный винил)]-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепина общей формулы (I), где R представляет собой аминифенил, (C<sub>1-4</sub> алкил)аминифенил, ди(C<sub>1-4</sub> алкил)аминифенил или (C<sub>1-4</sub> алканойл)аминифенил, при этом указанные группы могут иметь один или два одинаковых или различных заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, нитро-, amino-, метилendiокси-, C<sub>1-4</sub> алкил- и C<sub>1-4</sub> алкоксигруппу, а R, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> - такие же, как указано выше, и, при необходимости, ацилирование полученного таким образом аминосоединения, а также, при желании, растворение полученного таким образом соединения общей формулы (I) или превращение полученного основания общей формулы (I) в фармацевтически приемлемую кислотно-аддитивную соль.

10. Способ по п. 9, **отличающийся** тем, что при восстановлении соединения общей формулы (I) гидратом гидразина в присутствии катализатора в качестве катализатора используют палладий, платину или никель Ренея.

11. Способ по п. 9, **отличающийся** тем, что восстановление соединения общей формулы (I) гидратом гидразина проводят в органическом растворителе.

12. Способ по п. 11, **отличающийся** тем, что в качестве растворителя используют растворитель или смесь растворителей, которые не взаимодействуют с применяемым восстановительным агентом или взаимодействуют с ним очень медленно.

13. Способ по п. 12, **отличающийся** тем, что в качестве растворителя используют растворитель, выбранный из группы, включающей низшие спирты, диоксан, тетрагидрофуран, бензол, диметилформамид, дихлорметан и их смеси.

14. Способ по любому из пп. 9-13, **отличающийся** тем, что реакцию проводят при температуре от 0°C до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно в интервале от +10°C до 100°C.

15. Фармацевтическая композиция для лечения заболеваний центральной нервной системы, содержащая в качестве активного компонента эффективное количество по меньшей мере одного соединения общей формулы (I), охарактеризованного в п. 1, его стереоизомера или фармацевтически приемлемой соли, полученной

присоединением кислоты, в смеси с подходящим инертным твердым или жидким фармацевтическим носителем.  
16. Фармацевтическая композиция, по п. 15, **отличающаяся** тем, что в качестве активного компонента она содержит:

1-(4-ацетиламиностирил)-3-ацетил-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин,

1-[2-(1-нафтил)винил]-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин,

1-(2,3-диметоксистирил)-3-ацетил-4-метил-7,8-диметокси-3,4-дигидро-5Н-2,3-бензодиазепин, или их фармацевтически приемлемые кислотно-аддитивные соли.

17. Способ получения фармацевтической композиции, **отличающийся** тем, что используют соединение общей формулы (I), его стереоизомеры или фармацевтически приемлемые кислотно-аддитивные соли.

18. Способ лечения заболеваний центральной нервной системы, **отличающийся** тем, что пациенту назначают эффективное количество соединения общей формулы (I) или его фармацевтически приемлемой соли, полученной присоединением кислоты.