

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

А. Л. Мнджоян, действ. чл АН АрмССР, В. Г. Африкян,
 А. А. Дохикян и Г. Л. Папаян

Исследование в области производных фурана

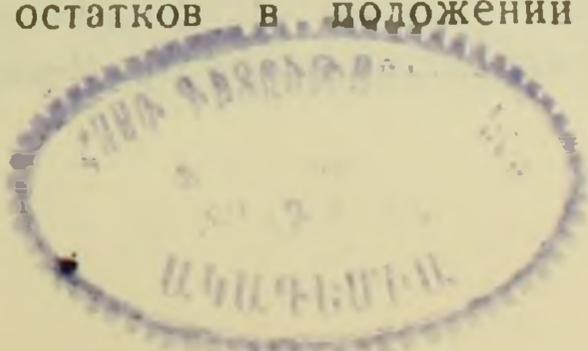
Сообщение VI. Некоторые диалкиламиноалкиловые эфиры
 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновой кислоты

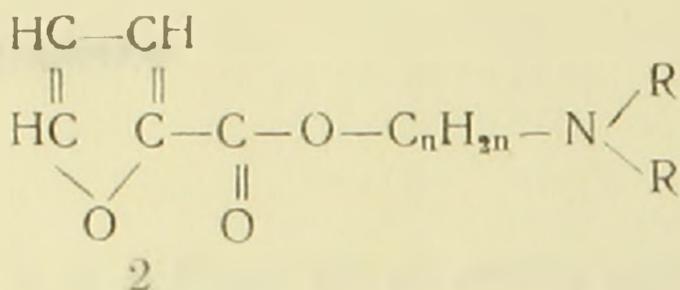
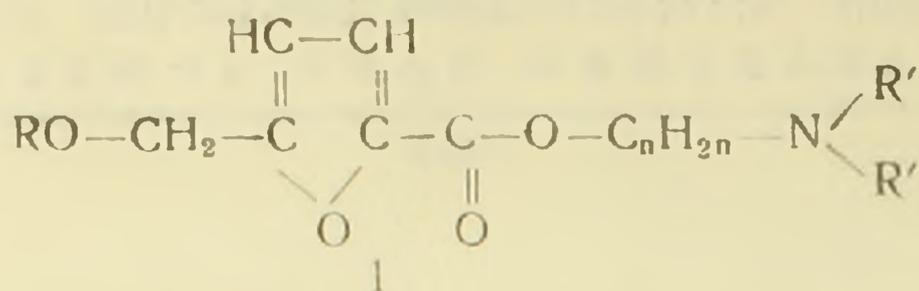
(Представлено 10. III. 1953)

В исследованиях физиологически активных веществ из алкоксибензойных кислот наиболее широко были использованы пара изомеры. Первые представители этого ряда кислот и некоторые их аминоэфиры описаны Вильдманом⁽¹⁾ еще в 1916 году, но все возрастающий в своем значении интерес к ним пробудился несколько позже⁽²⁾. Однако исследования носили односторонний характер и полученные вещества преимущественно испытывались на местноанестетическую активность. Несмотря на это проведенные работы представляют значительную ценность как с точки зрения интересных теоретических выводов, так и по ряду практических результатов. Так, например, из группы аминоэфиров были отобраны для применения в практической хирургии эффективные анестетики: интракаин⁽³⁾, сурфокаин⁽⁴⁾ и многие другие.

По аналогии с п-алкоксибензойными кислотами полученный нами небольшой гомологический ряд 5-R-оксиметилфуран-2-карбоновых кислот⁽⁵⁾ представлял возможность использования их в органическом синтезе. В литературе до настоящего времени описаны только 5-метокси и 5-этоксиметилфуран-2-карбоновые кислоты, причем методика их синтеза, предложенная Миддендорп⁽⁶⁾ и Гавортом⁽⁷⁾ основана на многостадийных превращениях сложных природных продуктов. Разработанный же нами доступный метод получения 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновых кислот значительно облегчал задачу применения их в качестве исходных продуктов в дальнейших стадиях синтеза.

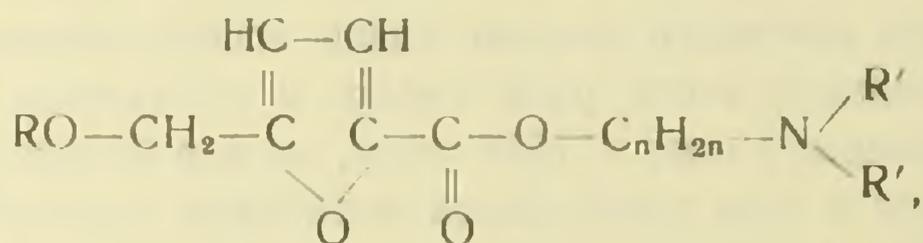
В связи с этим мы предприняли синтез аминоэфиров (1), которые по сравнению с ранее описанными диалкиламиноалкиловыми эфирами фуран-2-карбоновой кислоты (2), названными фурокаинами, отличались наличием алкоксиметильных остатков в положении 5-фуранового кольца.





Данные фармакологических исследований этой группы веществ позволили бы выяснить влияние алкоксиметильных остатков на анестетическую активность фуурокаинов, а также изменение характера и направления действия, в зависимости от строения кислотных компонентов, идентично построенных двух групп аминоэфиров: п-алкоксибензойных и 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновых кислот.

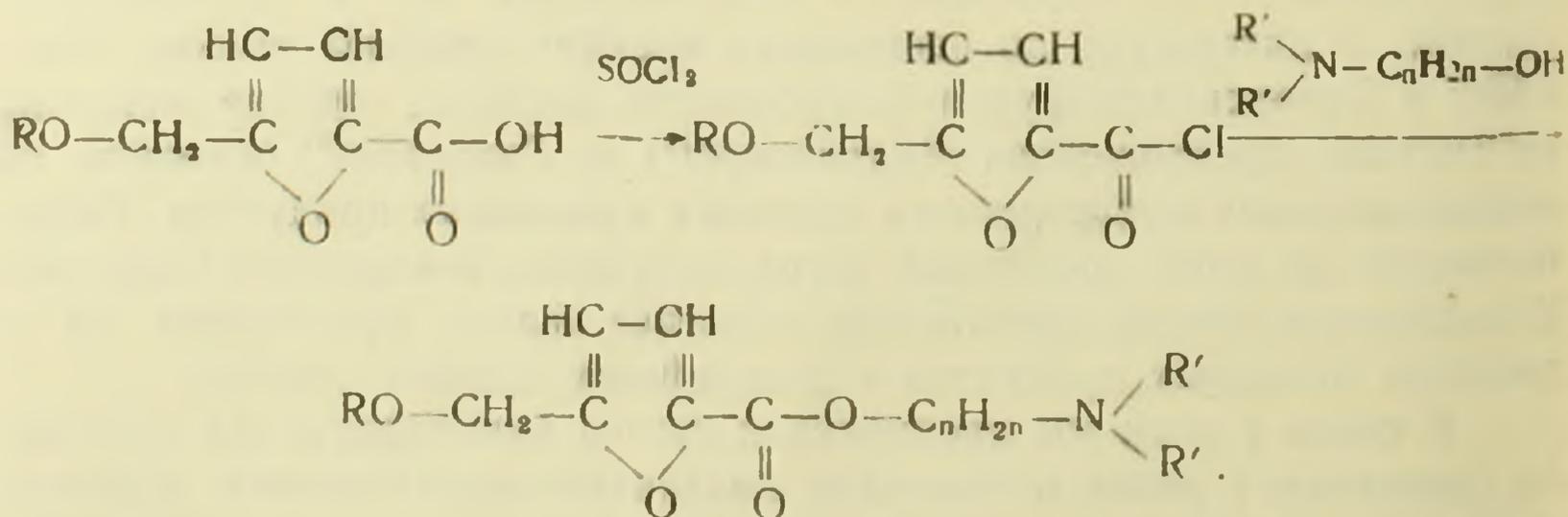
Полученные соединения соответствуют следующей общей формуле



где R = метилу-н-амилу, включая и радикалы изостроения;
R' = метилу, этилу;

$\text{C}_n\text{H}_{2n}\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{R}' \\ \diagdown \text{R}' \end{array}$ = -диалкиламиноэтиловому, α-метил-γ-диалкиламинопропиловому, α, β — диметил-γ-диалкиламинопропиловому, β, β -диметил-γ-диалкиламинопропиловому и тетраалкилдиаминоизопропиловому остаткам.

Синтез был осуществлен по схеме



В экспериментальной части описывается общий метод получения аминоэфиров 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновых кислот. Для иден-

тификации, а также изучения физиологических свойств приготовлены растворимые в воде хлоргидраты, иодметилаты, иодэтиллаты.

Некоторые физико-химические данные хлорангидридов 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновых кислот, а также аминоэфиров и их кристаллических солей приведены в табл. 1—6.

Экспериментальная часть. Хлорангидрид 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновой кислоты: В круглодонную колбу, снабженную обратным холодильником, помещают 0,1 моля 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновой кислоты в 100 мл абсолютного бензола и приливают 0,12 моля хлористого тионила, растворенного в 40—50 мл абсолютного бензола. Смесь нагревают на водяной бане в течение 6 часов, отгоняют избыток хлористого тионила, бензол и остаток перегоняют в вакууме.

Аминоэфир 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновой кислоты: В круглодонную колбу, снабженную обратным холодильником, помещают раствор 0,1 моля хлорангидрида 5-алкоксиметилфуран-2-карбоновой кислоты в 60—70 мл абсолютного бензола и при перемешивании и охлаждении приливают 0,1 моля диалкиламино- или тетраалкилдиаминоалкалонола в 50—60 мл абсолютного бензола. Смесь нагревают на водяной бане в течение 4—5 часов и по охлаждении обрабатывают 10% соляной кислотой до кислой реакции на конго. Отделив бензольный слой, промывают его водой и присоединяют к водному слою. Последний насыщают карбонатом натрия, приливают 3—5 мл раствора едкого натра и выделившееся основание экстрагируют 2—3 раза эфиром. Соединенные эфирные экстракты высушивают над прокаленным сульфатом натрия, отгоняют растворитель и остаток перегоняют в вакууме.

Лаборатория фармацевтической химии
Академии наук Армянской ССР

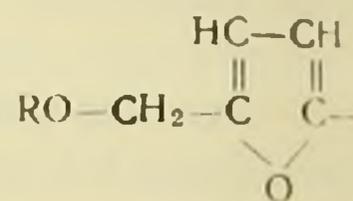
Ա. Լ. ՄՆՋՈՅԱՆ, Վ. Գ. ԱՅՐԻԿՅԱՆ, Ա. Ա. ԴՈՆԻԿՅԱՆ ԵՎ Լ. Լ. ՊԱՊՍՅԱՆ

Հետազոտությունն Ֆուրանի ածանցյալների բնագավառում

Հաղորդում VI: 5-ալկիլիոֆսիմերիլ ֆուրան—2—կարբոնաթթուների մի քանի դիալկիլամինոալկիլ էսթերները:

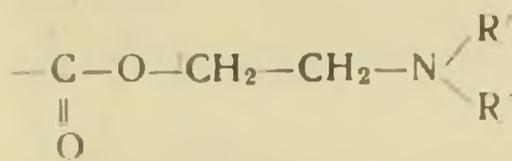
Ալկոքսիրենդոական թթուներից իրրև ֆիզիոլոգիական ակտիվ միացություններ միայն պարաիդոմերներն են ենթարկվել մանրազննին ուսումնասիրության: Այս շարքի, ինչպես թթուների, նույնպես և նրանց մի շարք ալկիլ և ամինոալկիլ էսթերների առաջին ֆիզիոլոգիական ուսումնասիրությունները կատարված են Վիլյամանի⁽¹⁾ կողմից 1916 թ.:

Այդ նախնական տխատանքները վերսկսվեցին մոտ 20 տարի հետո⁽²⁾, սակայն անզամ այդ շրջանում նրանք կրում էին պատահական, ոչ սիստեմատիկ բնույթ, ընդ որում այդ միացություններն ուսումնասիրվում էին միակողմանի կերպով, մեծ մասամբ իրրև անենթեպիա առաջացնող պրոդուկտներ: Այնուամենայնիվ նույնիսկ այդ անբարենպաստ

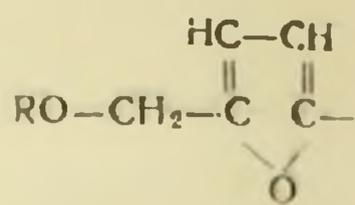


R	R'	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	M	d ₄ ²⁰	n _D ²⁰	MRD	
								вычислено	найдено
CH ₃ —	CH ₃ —	77,7	143—144	4	227	1,0930	1,4820	58,74	59,25
CH ₃ —	C ₂ H ₅ —	74,2	154—155	4	255	1,0487	1,4770	67,98	68,77
CH ₃ —CH ₂ —	CH ₃ —	71,0	145—146	3	241	1,0793	1,4775	63,56	63,21
CH ₃ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	72,0	156—157	3	269	1,0361	1,4770	72,59	73,43
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	76,0	182—183	4	255	1,0605	1,4745	67,98	67,71
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	74,0	191—192	4	283	1,0343	1,4730	77,22	76,88
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	78,0	160—161	6	255	1,0518	1,4740	67,98	68,20
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	75,3	168—169	6	283	1,0583	1,4840	77,22	76,89
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	75,7	169—170	3	269	1,0413	1,4751	72,59	72,83
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	73,0	179—180	3	297	1,0207	1,4745	81,83	81,87
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	80,5	171—172	2	269	1,0379	1,4730	72,59	72,79
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	81,2	182—183	2	297	1,0182	1,4720	81,83	81,78
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	85,7	197—198	2	283	1,0213	1,4725	77,22	77,75
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	81,9	201—202	2	311	1,0052	1,4695	86,45	86,34
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	90,9	202	4	283	1,0227	1,4725	77,22	76,70
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	87,4	172—173	4	311	1,0014	1,4690	86,45	86,57

Таблица 1

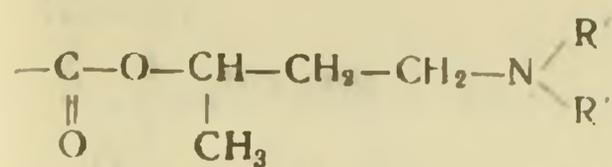


Эмпирическая формула	Анализ в %						Температура плавления солей в °С		
	С		Н		N		иодметилатов	иодэтилатов	хлоргидратов
	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено			
C ₁₁ H ₁₇ O ₄ N	58,10	57,89	7,48	7,72	6,16	6,21	153	126	65—66
C ₁₃ H ₂₁ O ₄ N	61,17	60,83	8,23	8,47	5,49	5,38	91—92	93—94	124 $\frac{1}{2}$
C ₁₂ H ₁₉ O ₄ N	59,75	59,56	7,88	7,96	5,80	5,81	195	84—85	102—103
C ₁₄ H ₂₃ O ₄ N	62,08	62,28	8,55	8,59	4,71	5,02	—	—	106
C ₁₃ H ₂₁ O ₄ N	61,17	61,12	8,23	8,26	5,49	5,38	163	135	77
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,41	8,83	8,80	4,80	5,18	59—60	—	85
C ₁₃ H ₂₁ O ₄ N	60,78	60,40	8,23	8,56	5,49	5,36	—	—	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,38	8,83	9,09	4,94	4,88	—	—	—
C ₁₄ H ₂₃ O ₄ N	62,08	62,13	8,55	8,45	5,20	5,34	130	117—118	63—64
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,43	9,09	8,77	4,71	5,01	53—54	—	—
C ₁₄ H ₂₃ O ₄ N	62,45	62,16	8,55	8,48	5,20	4,99	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,75	9,09	9,30	4,71	4,80	—	—	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,61	8,83	8,72	4,94	4,93	77—78	52—53	97—98
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,45	9,32	9,32	4,50	4,67	64—65	—	77—78
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,89	8,83	9,05	4,94	4,77	78	—	90
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,72	9,32	9,60	4,50	4,77	—	92	63

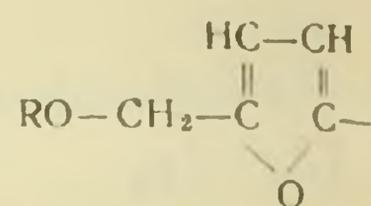


R	R'	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	M	d ₄ ²⁰	n _D ²⁰	MRD	
								вычислено	найдено
CH ₃ —	CH ₃ —	70,0	150—151	4	255	1,0514	1,4760	67,98	68,48
CH ₃ —	C ₂ H ₅ —	71,4	160	4	283	1,0289	1,4760	78,31	77,64
CH ₃ —CH ₂ —	CH ₃ —	76,5	153—154	3	269	1,0379	1,4732	72,59	73,02
CH ₃ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	160—161	3	297	1,0165	1,4732	81,83	82,08
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	72,0	174—175	3	283	1,0235	1,4730	77,21	77,65
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	178—179	3	311	1,0011	1,4723	86,45	86,89
CH ₃ \ CH— CH ₃	CH ₃ —	82,5	168—169	6	283	1,0366	1,4730	77,22	76,69
CH ₃ \ CH— CH ₃	C ₂ H ₅ —	79,0	176—178	6	311	1,0328	1,4785	86,45	85,24
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	75,2	178—179	3	297	1,0148	1,4721	81,83	82,05
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	187—188	3	325	1,0002	1,4720	91,07	91,10
CH ₃ \ CH—CH ₂ — CH ₃	CH ₂ —	80,0	170—171	2	297	1,0100	1,4690	81,83	81,97
CH ₃ \ CH—CH ₂ — CH ₂	C ₂ H ₅ —	70,0	177—178	2	325	0,9942	1,4695	91,07	91,23
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	97,8	188—189	2	311	1,0014	1,4687	85,45	85,54
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	92,0	207—208	2	339	0,9851	1,4670	95,68	95,59
CH ₃ \ CH—CH ₂ —CH ₂ — CH ₃	CH ₃ —	89,5	187	2	311	0,9940	1,4635	86,45	86,68
CH ₃ \ CH—CH ₂ —CH ₂ — CH ₂	C ₂ H ₅ —	80,9	198	2	339	0,9870	1,4630	91,06	91,81

Таблица 2

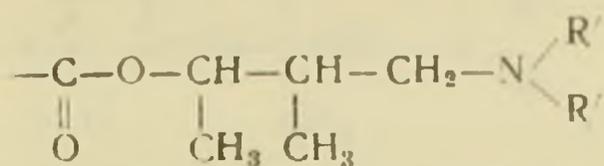


Эмпириче- ская формула	А н а л и з в ‰						Температура плавления солей в °С		
	С		Н		N		иодмети- латов	исдэти- латов	хлоргидра- тов
	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено			
C ₁₃ H ₂₁ O ₄ N	61,17	60,97	8,23	8,51	5,49	5,63	128—129	108—109	64—65
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,55	8,83	8,90	4,80	4,78	—	78	—
C ₁₄ H ₂₃ O ₄ N	62,03	62,17	8,55	8,52	4,72	5,27	130—131	68—69	98—99
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,41	9,09	9,05	4,74	4,77	84—85	114	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,34	8,83	8,58	4,80	4,56	86—87	—	126
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,88	9,32	9,40	4,50	4,68	—	—	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,50	8,83	8,90	4,94	5,08	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,86	9,32	9,26	4,50	4,42	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,42	9,09	8,94	4,71	4,82	58—59	—	117—118
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,35	9,53	9,74	4,30	4,34	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,70	9,09	9,34	4,71	4,68	—	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,75	9,53	9,46	4,20	4,50	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,64	9,32	9,25	4,50	4,65	90—95	72—73	126—127
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,28	67,28	9,73	9,88	4,12	3,95	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,65	9,32	9,53	4,50	4,60	102	60	137
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,28	67,53	9,73	9,94	4,12	4,05	—	—	—

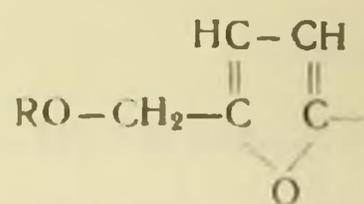


R	R'	Выход в %	Температура кипения в °С	Давление в мм	M	d ₄ ²⁰	n _D ²⁰	MRD	
								вычислено	най-дено
CH ₃ —	CH ₃ —	75,0	152—153	4	263	1,0382	1,4760	72,59	73,18
CH ₃ —	C ₂ H ₅ —	70,0	155—156	3	297	1,0198	1,4740	81,83	81,94
CH ₃ —CH ₂ —	CH ₃ —	76,5	164—165	4	283	1,0281	1,4741	77,21	77,55
CH ₃ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	188—189	4	311	1,0038	1,4710	86,45	86,27
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	168—169	4	297	1,0122	1,4710	81,83	82,12
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	73,8	178—180	4	325	1,0045	1,4712	91,07	90,59
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	80,5	162—163	6	297	1,0136	1,4680	81,83	81,54
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C ₂ H ₅ —	81,8	185—186	2	325	1,0019	1,4690	91,06	90,45
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	77,5	181—182	3	311	1,0090	1,4712	86,45	86,11
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	197—198	3	339	0,9919	1,4700	95,68	95,48
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	70,0	166—167	2	311	0,9973	1,4680	86,45	86,71
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C ₂ H ₅ —	75,0	174—175	2	339	0,9956	1,4680	95,68	94,69
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	96,6	181—182	2	325	0,9928	1,4680	91,06	91,12
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	82,1	186—187	2	353	0,9846	1,4680	100,23	99,83
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	92,7	205	4	325	0,9899	1,4670	91,06	91,27
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C ₂ H ₅ —	83,1	193	2	353	0,9791	1,4670	100,23	100,15

Таблица 3

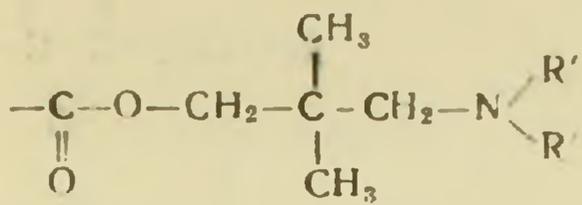


Эмпириче- ская формула	А н а л и з в ‰						Температура плавления солей в °С		
	С		Н		N		иодме- тилатов	иодэти- латов	хлоргид- ратов
	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено			
C ₁₄ H ₂₃ O ₄ N	62,08	61,99	8,55	8,65	5,20	5,09	98—99	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,74	9,09	9,23	4,71	4,74	—	—	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,31	8,83	8,62	4,94	5,13	144—145	91—92	100
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,37	9,32	9,15	4,50	4,60	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,51	9,09	9,18	4,71	4,70	83	—	101—1
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,26	9,63	9,86	4,30	4,23	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,52	9,09	9,10	4,71	4,54	—	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,72	9,53	9,41	4,30	4,56	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,26	9,32	9,21	4,50	4,64	—	—	—
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,22	67,24	9,73	9,51	4,13	4,34	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,87	9,32	9,57	4,50	4,58	—	—	—
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,25	67,02	9,73	10,00	4,13	4,28	—	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,26	9,53	9,40	4,30	4,07	—	—	101—103
C ₂₀ H ₃₅ O ₄ N	67,98	68,00	9,91	9,80	3,96	3,96	—	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,43	66,68	9,53	9,76	4,30	4,24	88	90	114
C ₂₀ H ₃₅ O ₄ N	67,98	68,26	9,91	10,16	3,96	4,10	—	—	—

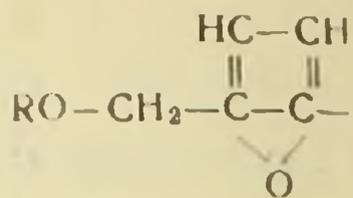


R	R'	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	M	d ₄ ²⁰	n _D ²⁰	MR _D	
								вычислено	найдено
CH ₃ —	CH ₃ —	70,7	153—154	4	259	1,0506	1,4790	72,59	72,67
CH ₃ --	C ₂ H ₅ --	70,0	162—163	4	297	1,0171	1,4730	81,83	82,01
CH ₃ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	169—170	4	283	1,0281	1,4740	77,21	77,46
CH ₃ —CH ₂ --	C ₂ H ₅ —	70,0	180—182	4	311	1,0078	1,4720	86,45	86,51
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	163—164	3	297	1,0030	1,4704	81,83	82,37
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ --	C ₂ H ₅ —	70,0	177—178	3	325	0,9982	1,4700	91,07	91,18
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	80,3	162—163	6	297	1,0163	1,4700	81,83	81,64
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}— \\ \diagup \\ \text{CH}_2 \end{array}$	C ₂ H ₅ --	72,5	177—178	6	325	1,0000	1,4670	91,03	90,29
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	174—175	3	311	1,0072	1,4710	86,45	86,42
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ --	C ₂ H ₅ —	72,0	187—188	3	339	0,9936	1,4708	95,68	95,46
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	70,0	162—163	2	311	0,9947	1,4650	86,45	85,53
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	C ₂ H ₅ —	70,0	176—177	2	339	0,9851	1,4650	95,68	95,25
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	78,3	176—177	2	325	0,9992	1,4690	91,06	90,69
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ --	C ₂ H ₅ —	70,0	180—181	2	353	0,9987	1,4660	100,23	99,00
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2— \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃ —	82,2	176	2	325	0,9834	1,4639	91,06	91,32
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3— \\ \diagup \\ \text{CH}_2 \end{array}$	C ₂ H ₅ —	76,4	185	2	353	0,9776	1,4655	100,25	100,05

Таблица 4

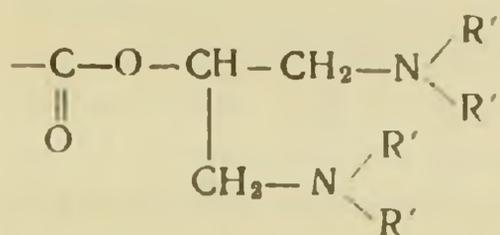


Эмпириче- ская формула	А н а л и з в %						Температура плавления солей в °С		
	С		Н		N		иодме- тилатов	иодэти- латов	хлоргид- ратов
	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено	вы- чис- лено	най- дено			
C ₁₄ H ₂₈ O ₄ N	62,08	61,81	8,55	8,55	5,20	5,25	104	—	83—85
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,87	9,09	9,19	4,71	4,80	97—98	—	—
C ₁₅ H ₂₅ O ₄ N	63,60	63,36	8,83	8,72	4,94	5,20	131—132	103—104	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,29	9,32	9,23	4,50	4,71	—	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,50	9,09	9,19	4,71	4,69	120—121	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,39	9,53	9,78	4,30	4,17	104—105	—	—
C ₁₆ H ₂₇ O ₄ N	64,64	64,61	9,09	8,96	4,71	4,98	—	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,13	9,53	10,13	4,30	4,50	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	65,69	9,32	9,29	4,50	4,77	115—117	—	61—62
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,22	67,26	9,73	9,71	4,13	4,40	—	—	—
C ₁₇ H ₂₉ O ₄ N	65,59	66,50	9,32	9,43	4,50	4,66	—	—	—
C ₁₉ H ₃₃ O ₄ N	67,25	67,08	9,73	9,51	4,13	4,28	117—118	—	—
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,46	66,63	9,53	9,77	4,30	4,58	—	—	—
C ₂₀ H ₃₅ O ₄ N	67,98	66,66	9,91	9,66	3,96	3,97	126—127	—	91—93
C ₁₈ H ₃₁ O ₄ N	66,43	66,22	9,53	9,65	4,30	4,12	107	—	85
C ₂₀ H ₃₅ O ₄ N	67,98	67,69	9,91	10,11	3,96	4,00	125	—	—



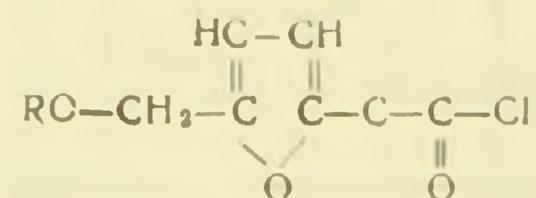
R	R'	Выход в %	Температура кипения в °C	Давление в мм	M	d ₄ ²⁰	n _D ²⁰	MR _D	
								вычислено	найдено
CH ₃ —	CH ₃ —	72,0	155—156	3	284	1,0560	1,4780	76,54	76,19
CH ₃ —	C ₂ H ₅ —	74,5	174—175	3	340	1,0086	1,4750	95,01	95,09
CH ₃ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	159—160	3	298	1,0324	1,4770	81,15	81,64
CH ₃ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	70,0	180—181	3	354	1,0026	1,4730	99,62	99,17
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	70,0	168—169	3	312	1,0226	1,4730	85,73	85,73
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	74,8	191—192	3	368	0,9950	1,4720	104,24	103,70
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH} \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	73,2	194—195	2	312	1,0275	1,4770	85,77	85,89
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH} \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	76,0	190—191	1	368	0,9930	1,4678	104,25	103,10
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	71,0	180—181	3	326	1,0349	1,4782	90,39	89,29
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	71,4	203—204	3	382	0,9882	1,4715	108,86	108,01
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	72,0	176—177	2	326	1,0227	1,4730	90,38	89,54
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	66,0	186—187	2	382	0,9884	1,4700	108,86	107,98
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	CH ₃ —	74,1	200—201	2	340	0,9904	1,4690	95,03	95,88
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	C ₂ H ₅ —	66,2	205—206	2	396	0,9832	1,4700	112,50	113,06
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	CH ₃ —	61,2	210	2	340	0,9748	1,4668	95,03	96,89
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \quad \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2- \\ \quad \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	C ₂ H ₅ —	86,0	210	2	396	0,9750	1,4678	113,48	113,00

Таблица 5



Эмпирическая формула	А н а л и з в %						Температура плавления солей в °С		
	С		Н		N		иодметилатов	иодэтилатов	хлоргидратов
	вычислено	найдено	вычислено	найдено	вычислено	найдено			
C ₁₄ H ₂₄ O ₄ N ₂	59,15	59,39	8,45	8,47	9,85	9,40	83—84	103—104	65—66
C ₁₈ H ₃₂ O ₄ N ₂	63,52	63,66	9,41	9,49	8,23	8,10	179	99—100	139—140
C ₁₅ H ₂₆ O ₄ N ₂	60,40	60,28	8,72	8,65	9,39	9,70	—	—	—
C ₁₉ H ₃₄ O ₄ N ₂	64,40	64,46	9,60	9,53	7,90	7,83	—	—	—
C ₁₆ H ₂₈ O ₄ N ₂	61,53	61,38	8,97	8,99	8,97	8,67	67—68	62—63	—
C ₂₀ H ₃₆ O ₄ N ₂	65,21	65,59	9,78	10,02	7,60	7,60	154—155	84—85	—
C ₁₆ H ₂₈ O ₄ N ₂	61,53	61,33	9,00	9,10	8,97	9,24	81—82	—	—
C ₂₀ H ₃₆ O ₄ N ₂	65,21	65,09	9,78	9,78	7,60	7,84	85	—	—
C ₁₇ H ₃₀ O ₄ N ₂	62,57	62,53	9,20	8,97	8,97	8,55	67—68	—	—
C ₂₁ H ₃₈ O ₄ N ₂	65,96	65,70	9,94	9,80	7,33	8,12	—	—	—
C ₁₇ H ₃₀ O ₄ N ₂	62,57	62,71	9,20	9,28	8,58	8,88	66—67	—	—
C ₂₁ H ₃₈ O ₄ N ₂	65,94	65,93	9,94	9,90	7,33	7,40	—	—	—
C ₁₈ C ₃₂ O ₄ N ₂	63,53	63,71	9,41	9,20	8,23	8,39	—	—	—
C ₂₂ H ₄₀ O ₄ N ₂	66,66	66,39	10,10	10,07	7,07	7,20	—	—	—
C ₁₈ H ₃₂ O ₄ N ₂	63,52	63,75	9,41	9,60	8,23	7,99	—	—	136
C ₂₂ H ₄₀ O ₄ N ₃	66,55	66,85	10,09	9,86	7,06	7,20	—	—	144

Таблица 6



R	Выход в %	Темпера- тура кипе- ния в °С	Давление в мм	M	d_4^{20}	n_D^{20}	MRD		Эмпири- ческая формула	Анализ в %	
							вычис- лено	найдено		Cl	
										вычислено	найдено
CH ₃ —	86,0	120—122	7	174,5	1,2707	1,5190	39,92	42,01	C ₇ H ₇ O ₃ Cl	20,34	20,60
CH ₃ —CH ₂ —	82,1	104—105	4	188,5	1,2820	1,5020	44,54	44,08	C ₈ H ₉ O ₃ Cl	18,83	18,68
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —	88,8	113—114	3	202,5	1,1710	1,5000	49,16	50,89	C ₉ H ₁₁ O ₃ Cl	17,53	17,28
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH} \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	80,0	112—113	3	202,5	1,2094	1,5070	49,16	49,84	C ₉ H ₁₁ O ₃ Cl	17,53	17,72
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	87,5	134—135	5	216,5	1,1128	1,4990	53,77	55,34	C ₁₀ H ₁₃ O ₃ Cl	16,39	16,67
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2 \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	81,2	126—127	3	216,5	1,1375	1,4957	53,77	55,59	C ₁₀ H ₁₃ O ₃ Cl	16,39	16,32
CH ₃ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —CH ₂ —	80,0	155	7	230,5	1,1139	1,4930	58,40	60,18	C ₁₁ H ₁₅ O ₃ Cl	15,40	15,38
$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2 \\ \diagup \\ \text{CH}_3 \end{array}$ —	85,0	145—147	7	230,5	1,1209	1,4930	58,40	59,83	C ₁₁ H ₁₅ O ₃ Cl	15,40	15,51

ձևով կատարված ուսումնասիրությունները հետաքրքրական են ոչ միայն իրենց թեորո-
տիկ տվյալներով, այլ նաև մի շարք պրակտիկ արդյունքներով:

Հայտնի է, որ մինչև այժմ ստացված P-ալկոբսիրենդոական թթուների ամինոէս-
թերներից իրրև անէսթետիկներ պրակտիկ կիրառություն են ստացել Ինտրակաինը⁽³⁾,
սուրֆոկաինը⁽⁴⁾ և շատ ուրիշները:

P-ալկոբսիրենդոական թթուների մոտ նկատված հետաքրքրական հատկությունները
դրդապատճառ էին հանդիսացել զրադվելու 5-R-օբսիմեթիլֆուրան -2-կարրոնաթթուների⁽⁵⁾
սինթեզով: Այս թթուների ստացման համար մշակված մատչելի ճանապարհը ապա-
հովեց նրանց լայն օգտագործումը դանազան սինթեզների համար:

Այս հաղորդման մեջ նկարագրվում են 5-ալկոբսի ֆուրան-2-կարրոնաթթուների մի
շարք ամինոէսթերներ (1), որոնք տարբերվում են նախորդ աշխատանքներից մեկում
բերված ֆուրոկաիններից⁽⁶⁾ (2), նրանով, որ ֆուրանի օդակում ունեն դանազան ալկոբ-
սիմեթիլ ռադիկալներ:

Այս նոր խումբ միացությունների ֆարմակոլոգիական ուսումնասիրությունները
հնարավորություն կտան պարզելու ֆուրոկալինների անէսթետիկ հատկությունների ուղ-
ղության և ուժի փոփոխությունը կապված ալկոբսիմեթիլ խմբի մուտքի հետ:

Այդ ուսումնասիրությունները հնարավորություն կտան նաև պարզելու նշված հատ-
կությունների կախումը թթվային կոմպոնենտի կառուցվածքից, մասնավորապես համե
մատելու միօրինակ կառուցվածք ունեցող 5-ալկիլօբսիմեթիլ ֆուրան-2-կարրոնաթթու-
ների և P-ալկոբսիրենդոական թթուների ամինոէսթերների հատկությունները միմյանց
հետ:

Ստացված միացությունների ֆորմուլաները, ինչպես և նրանց բնորոշող մի բանի
ֆիզիկական և բիմիական տվյալներ բերված են 1—6 աղյուսակներում:

ЛИТЕРАТУРА — ԿՐԱԿԱՆՍԻՅՈՒՆ

- ¹ И. Вильдман, Ам. Пат. 1, 193, 649; 1, 193, 650, С А. 10, 2387, 1916. ² С. Ро-
ман, Б. Шорле, Arch. Pharm. 274, 110, 1936. ³ С. Грей, Pharm. pharmacol. 2, 89, 1954.
⁴ Д. Каванна, Minerva Med. 40, 1, 615, 1949, С. А. 43, 8100, 1949. ⁵ А. Мнджоян, В.
Африкян, А. Оганесян, Г. Папаян, ДАН АрмССР XVII, № 4, 1953. ⁶ И. Миддендорп,
Rec. trav. chim. 38, 1, 1919. ⁷ В. Гаворт, Е. Гирст, chem. Soc. 1513, 1927. ⁸ А. Мнд-
жоян, ЖОХ XVI, вып. 4—5, 750, 1946.