

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

А. Л. Мнджоян, действ. чл. АН Армянской ССР,  
 О. Л. Мнджоян и Н. А. Бабян

Исследования в области синтеза производных двухосновных  
 карбоновых кислот

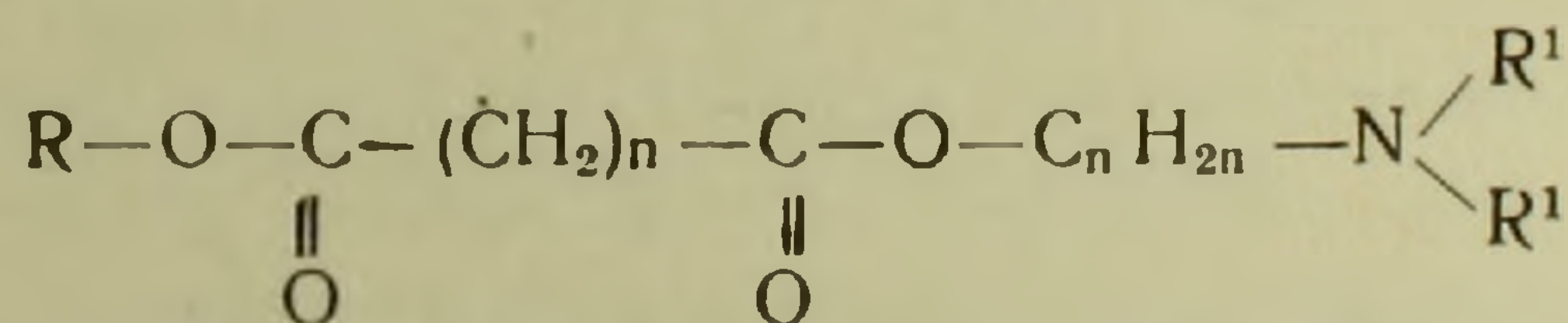
Сообщение VI. Смешанные этил, диалкиламиноэтиловые эфиры  
 некоторых двухосновных карбоновых кислот

(Представлено 15 X 1953)

В одном из предыдущих сообщений<sup>(1)</sup> нами описаны смешанные алкил, аралкил, циклогексил, диалкиламиноэтиловые эфиры янтарной кислоты.

Синтез и изучение фармакологических свойств этих соединений проводились с целью выяснения вопроса необходимости наличия двух четвертичных азотов для сохранения курареподобных свойств четвертичных солей диалкиламино-алкиловых эфиров янтарной кислоты, а также для выяснения механизма их действия в связи с гидролизом под действием холиноэстеразы.

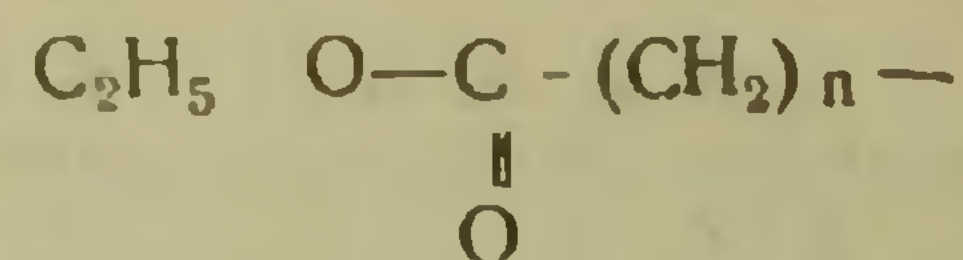
Результаты исследований курареподобных свойств четвертичных солей смешанных аминоэфиров янтарной кислоты побудили нас заняться синтезом аналогичных производных других двухосновных карбоновых кислот, со следующей общей формулой:



Ранее было также отмечено, что изменение числа метиленовых групп в кислотных остатках имеет существенное влияние на биологические свойства препаратов, часто меняя при этом направление и характер их действия. Так, например, по мере увеличения числа метиленовых групп в бисчетвертичных солях аминоэфиров двухосновных карбоновых кислот, курареподобные свойства постепенно убывают, сменяясь возбуждающим действием на дыхательный центр.

Учитывая, что продолжительность и характер действия препаратов этой группы также тесно связаны со скоростью их гидролиза и продуктами, образующимися после гидролиза, нам представилось интересным изучить свойства смешанных аминоэфиров тех двухосновных





R	n	Выход в %	Температура кипения	Давление в мм	M	d <sub>4</sub> <sup>20</sup>	n <sub>D</sub> <sup>20</sup>	MR <sub>D</sub>	
								вычислено	найдено
CH <sub>3</sub> --	3	39,2	135—137°	2	231,3	1,0322	1,4399	60,246	59,013
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	3	71,4	155—157°	7	262,0	0,9978	1,435	72,948	68,278
CH <sub>3</sub> —	4	60,0	149—151°	3	245,3	1,017	1,434	63,68	64,864
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	4	50,0	175—178°	5	273,4	0,988	1,4398	72,77	74,094
CH <sub>3</sub> —	5	68,7	145—147°	1	262,0	0,9984	1,4342	69,492	68,229
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	5	73,1	148—149°	0,5	290,1	0,993	1,437	78,718	77,548
CH <sub>3</sub> —	6	58,1	143°	0,5	273,4	0,9884	1,4377	74,10	72,461
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	6	55,5	170—173°	0,5	304,1	0,9654	1,4367	83,336	82,442
CH <sub>3</sub> —	7	58,0	154—155°	0,5	287,4	0,983	1,438	76,744	78,718
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	7	65,0	188—190°	0,5	314,5	0,972	1,439	85,349	88,054
CH <sub>3</sub> —	8	50,0	175—178°	0,5	301,4	0,9671	1,437	81,624	83,336
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> —	8	35,0	180—184°	0,5	329,5	0,9599	1,443	90,960	92,572

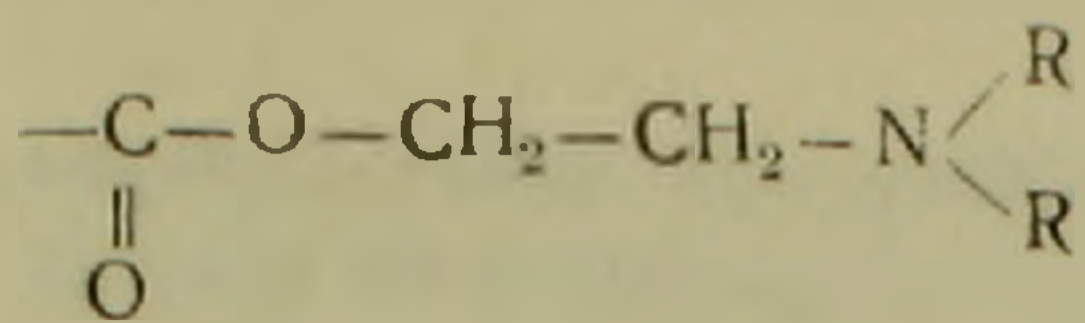
карбоновых кислот, производные которых обладали, подобно лобелину и цититону, возбуждающим действием на дыхательный центр.

В настоящей работе описан ряд синтезированных нами этил-, диметил- и диэтиламиноэтиловых эфиров глutarовой, адипиновой, пимелиновой, пробковой, азелаиновой и себациновой кислот. Получены их хлоргидраты, оксалаты, иодметилаты и иодэтилаты.

Физикохимические константы синтезированных соединений приведены в таблице. Данные, касающиеся способов получения этих соединений, и результаты фармакологических испытаний будут опубликованы отдельно.

Лаборатория фармацевтической химии Академии наук Армянской ССР





Общая формула	Анализ в %						Температура плавления солей			
	С		Н		N		х.лоридрат	оксалат	иодметилат	иодэтилат
	вычи-слено	найдено	вычи-слено	найдено	вычи-слено	найдено				
C <sub>11</sub> H <sub>21</sub> O <sub>4</sub> N	57,14	56,88	9,09	8,96	6,06	5,94	—	95—96°	57—58°	—
C <sub>13</sub> H <sub>25</sub> O <sub>4</sub> N	59,54	59,67	9,54	9,59	5,34	5,47	—	54—57°	—	71—73°
C <sub>12</sub> H <sub>23</sub> O <sub>4</sub> N	59,30	58,94	9,38	9,35	5,71	5,98	88—93°	120—122°	52—54°	60—62°
C <sub>14</sub> H <sub>27</sub> O <sub>4</sub> N	61,53	61,56	9,88	9,77	5,12	5,05	59—63°	64—67°	—	78—81°
C <sub>13</sub> H <sub>25</sub> O <sub>4</sub> N	59,54	59,48	9,54	9,59	5,03	4,71	—	102—103°	45—47°	—
C <sub>15</sub> H <sub>29</sub> O <sub>4</sub> N	62,06	61,95	10,00	10,05	4,82	5,14	—	67—70°	—	95—96°
C <sub>14</sub> H <sub>27</sub> O <sub>4</sub> N	61,53	61,28	9,89	9,74	5,12	4,93	—	109—110°	87—89°	—
C <sub>16</sub> H <sub>31</sub> O <sub>4</sub> N	63,15	62,69	10,01	9,84	4,60	4,16	—	—	—	85—87°
C <sub>15</sub> H <sub>29</sub> O <sub>4</sub> N	62,78	62,65	10,10	9,95	4,98	5,03	—	107—110°	85—87°	—
C <sub>17</sub> H <sub>33</sub> O <sub>4</sub> N	64,94	64,64	10,50	10,10	4,45	4,32	59—63°	77—80°	—	88—92°
C <sub>16</sub> H <sub>31</sub> O <sub>4</sub> N	63,78	64,00	10,29	10,47	4,65	4,90	63—67°	69—72°	107—110°	52—54°
C <sub>18</sub> H <sub>35</sub> O <sub>4</sub> N	65,45	65,72	10,60	10,38	4,24	4,48	74—77°	84—88°	54—55°	101—104°

Ա. Լ. ՄՆՋՈՅԱՆ, Շ. Լ. ՄՆՋՈՅԱՆ ԵՎ Ն. Ա. ԲԱԲԻՅԱՆ

**Հետազոտություններ կրկինբրանի կարբոնաթթուների ածանցյալների բնագավառում**

Հաղորդում VI. մի բանի երկինբրանի կարբոնաթթուների, էրիլ, դիալկիլամինոէթանոլային խառն էսթերները

Նախորդ հաղորդումներից մեկում <sup>(1)</sup> որոշ ավյալներ էին բերված սաթթվի ալկիլ, ցիկլոհեքսիլ, արիլ դիալկիլամինոէթիլ էսթերների մասին: Այդ միացությունների սինթեզն իրականացված էր կուրարենման հատկությունների ապահովման գործում երկու շորքորդական ամոնիակային խմբերի անհրաժեշտությունն ուսումնասիրելու նպատակով:

Միաժամանակ այս միացությունները հնարավորություն տվեցին պարզելու նշված խառն էսթերների հիդրոլիզի ընթացքը խոլինէսթերազայի ազդեցության տակ:

Օրգանիզմում, երկհիմքանի թթուների էսթերների հետ խոլինէսթերազայի ազդեցության տակ կատարվող հիդրոլիզը կարևոր էր նշ միայն նրանց կուրարենման ազդեցության մեխանիզմը հասկանալու, այլև շնչական կենտրոնները (լորելինի ու ցիտիտոնի նման) գրգռելու հատկությունն ուսումնասիրելու տեսակետից:

Այս կապակցությամբ անհրաժեշտ էր սինթեզել և ուսումնասիրել երկհիմքանի թթուներից գլաուտարաթթվի, ադիպինաթթվի, պիմելինաթթվի, խցանաթթվի, ադելաինաթթվի



և սերացինաթթվի խառն էսթերներ, որոնց կառուցվածքը կարելի է արտահայտել հիմնական տեքստում արդեն նույն տրված բնդհանուր ֆորմուլայով:

Տվյալ հաղորդման մեջ բերված են հակիրճ տեղեկություններ այն խառն էսթերների մասին, որոնց սինթեզի ժամանակ իրրև ամինոսպիրտներ օգտագործված են եղել դիմեթիլ և դիէթիլամինոէթիլ ալկոհոլները:

Ստացված են նաև որոշ էսթերների մի քանի կրիստալական աղերը: Ստացված միացությունների ֆիզիկո-քիմիական հատկությունները բնորոշող մի քանի տվյալները բերված են աղյուսակում:

Նկարագրված միացությունների ստացմանը վերաբերող մանրամասն տվյալները, ինչպես նաև նրանց բիոլոգիական հատկությունների ուսումնասիրության արդյունքները կհրապարակվեն առանձին:

#### ЛИТЕРАТУРА—ԳՐԱԿԱՆՈՒԹՅՈՒՆ

<sup>1</sup> ДАН АрмССР, т. XVIII, № 2, 45 (1954).

