

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ

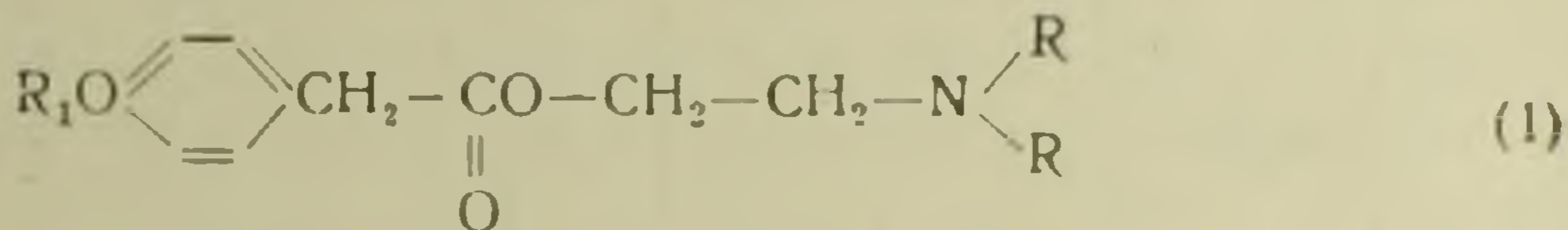
А. Л. Мнджоян, действ. чл. АН Армянской ССР,
 О. Л. Мнджоян и О. Е. Гаспарян

Исследование в области производных замещенных
 уксусных кислот

Сообщение VI. 1,3-ди (диалкиламино) пропиловые эфиры п-алкоксифенил
 уксусных кислот

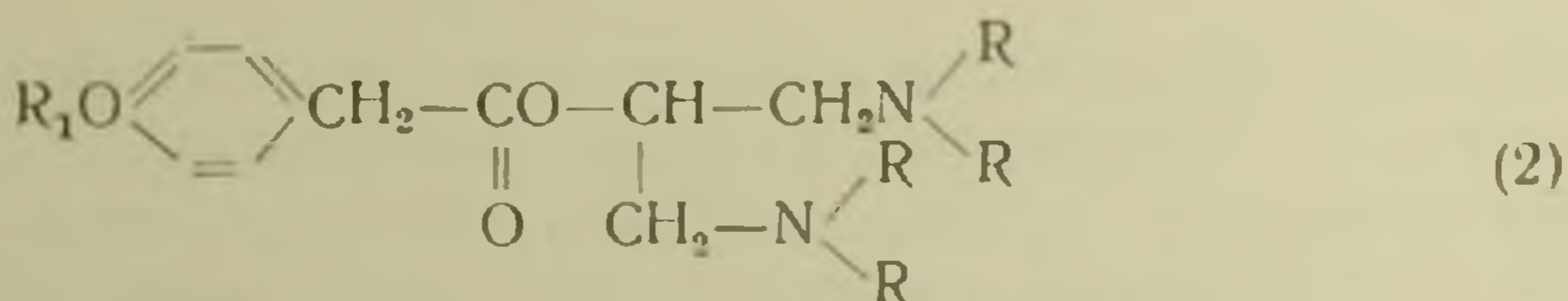
(Представлено 24 VIII 1953)

Изучение фармакологических свойств диалкиламиноэтиловых эфи-
 ров п-алкоксифенилуксусных кислот (1), описанных



в предыдущем сообщении (1), показало, что эта серия препаратов по
 аналогии с аминоэфирами двузамещенных уксусных кислот обладает
 холинолитическими свойствами.

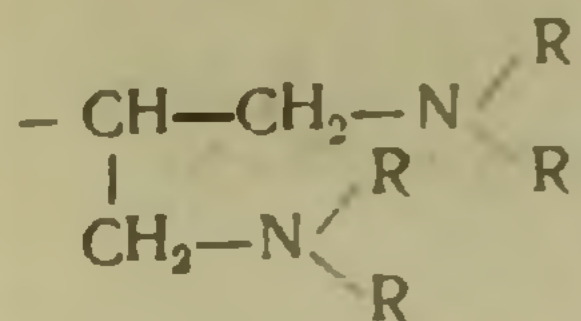
Руководствуясь принципом изыскания селективно действующих
 холинолитических соединений, мы предприняли синтез группы 1,3-ди
 (диалкиламино) пропиловых эфиров п-алкоксифенилуксусных кислот (2)



в которых в качестве аминоспиртов были использованы 1,3-ди (ди-
 метиламино)- и 1,3-ди (диэтиламино)-пропанола.

Применение этих аминоспиртов диктовалось результатами испы-
 таний 1,3-ди (диалкиламино) пропиловых эфиров п-алкоксибензойных (2),
 двузамещенных уксусных (3) и ряда других кислот.

На примере этих соединений нами было установлено, что 1,3-ди
 (диалкиламино)-пропанола способствуют появлению у этих аминоэфи-
 ров избирательного действия на никотиновые рецепторы холинер-
 гических систем. Следует отметить, что аминоэфиры тех же кислот
 и обычно применяемых диметил- и диэтиламино-этанола действуют в



MRD		Общая формула	Анализ в %				Температура плавления оксалатов в °С
вычислено	найдено		С		Н		
			вычислено	найдено	вычислено	найдено	
83,67	84,33	C ₁₆ H ₂₆ O ₃ N ₂	65,30	65,12	9,51	9,38	133—134
88,29	89,12	C ₁₇ H ₂₈ O ₃ N ₂	66,20	66,44	9,99	10,08	159—160
92,91	91,69	C ₁₇ H ₃₀ O ₃ N ₂	67,08	66,91	9,62	9,45	154—155
92,91	94,26	C ₁₈ H ₃₂ O ₃ N ₂	67,08	67,21	9,62	9,84	149—150
97,53	98,19	C ₁₉ H ₃₂ O ₃ N ₂	67,85	68,00	9,52	9,38	156—157
97,53	103,80	C ₁₉ H ₃₂ O ₃ N ₂	67,85	68,11	9,52	9,64	150—151
102,15	100,30	C ₂₀ H ₃₄ O ₃ N ₂	67,71	67,78	9,71	9,85	153—154
106,77	104,70	C ₂₁ H ₃₆ O ₃ N ₂	69,23	69,34	9,89	10,00	152—153
111,38	111,05	C ₂₂ H ₃₈ O ₃ N ₂	69,84	69,81	10,05	9,89	133—134
111,38	109,62	C ₂₂ H ₃₈ O ₃ N ₂	69,84	69,76	10,05	9,91	146—147
116,00	117,06	C ₂₃ H ₄₀ O ₃ N ₂	70,40	70,58	10,20	10,43	143—144
116,00	117,86	C ₂₃ H ₄₀ O ₃ N ₂	70,40	70,31	10,20	10,38	146—147

нений, что состав и строение аминспиртов имеет решающее значение при получении селективнодействующих холинолитиков.

Физикохимические константы синтезированных аминоэфиров сведены в таблицу. Приведены также температуры плавления их оксалатов.

Данные о способах получения, а также результаты фармакологических испытаний, будут опубликованы отдельно.

Лаборатория фармацевтической химии Академии наук Армянской ССР

Հետազոտությունը փոխարկված քաղախարքուների ածանցյալների բնագավառում

Հաղորդում VI ք-ալկոբսիֆենիլ բացախարքուների

1,3-դի-(դիալկիլամինո) սլրոսլիլ էսթերները

Նախորդ հաղորդումներից մեկում¹ նկարագրված ք-ալկոբսիֆենիլ քաղախարքուների դիալկիլամինո էթանոլային էսթերների (1) ֆարմակոլոգիական հատկությունների ուսումնասիրություններից օլարգված էր, որ նրանք երկրորդարկված քաղախարքուների էսթերների նման հանդես են բերում խոլինոլիտիկ հատկությունների:

Մի շարք անդամներ արդեն առիթ են ունեցել նշելու, որ այս կարգի միացությունների բնագավառում մեր կատարած հետազոտություններն ունեն մեկ նպատակ՝ ստեղծել միացությունների այնպիսի կառուցվածքներ, որոնք օժտված լինեն ընտրողական ազդեցությամբ ոչ միայն դեպի մուսկլարինային կամ նիկոտինային ռեցեպտորները, այլ որ ամենակարևորն է, նշված կարգի ռեցեպտորների, տարբեր հյուսվածքներում և օրգաններում հանդիպող խոլինէրգիկ սիստեմների վրա: Իյս տեսակետից հետաքրքրական էր ուսումնասիրել ք-ալկոբսիֆենիլ քաղախարքուների-1,3-դի-(դիալկիլամինո) սլրոսլիլ էսթերները⁽²⁾, որովհետև սրանց կառուցվածքի մեջ մտնող ամինոսպիրտները, մի շարք այլ միացությունների^{2,3} կազմում հանդես են այնպիսի խոլինոլիտիկների, որոնց ազդեցությունը կենտրոնացվում է միայն նիկոտինային ռեցեպտորների վրա: Մի հանգամանք, որն արժանի է հատուկ ուշադրության, թեկուզ միայն այն պատճառով, որ մինչև օրս դոյություն ունեցող և կիրառվող խոլինոլիտիկները, ինչպես ատրոպինը, նույնպես և նրան փոխարինող սինթետիկ սլրեպարատները առավել չափով ազդում են մուսկլարինային ռեցեպտորների վրա:

Եթե սրա հետ մեկտեղ հիշելու լինենք նաև այն հանգամանքը, որ մարդու մոտ ներվային սիստեմի ֆիզիոլոգիական վիճակի բազմաթիվ խանգարումները հաճախ արդյունք են համապատասխան հյուսվածքներում և օրգաններում առավելապես նիկոտինային խոլինէրգիկ սիստեմների ֆունկցիայի խանգարման, ապա սլարդ կլինի, թե որքան կարեւոր են որոնումները մուսկլարինոլիտիկների բնագավառում:

1,3-դի-(դիալկիլամինո) սլրոսլիլ ալկոհոլների յուրահատուկ դերը խոլինոլիտիկ ամինոէսթերների ստրուկտուրաներում մի հավելյալ անգամ ստուգելու և ակտիվ մուսկլարինոլիտիկներ ստանալու համար ձեռնարկեցինք ազդուսակում բերված միացությունների սինթեզի աշխատանքներին:

Իդյուսակում բերված առանձին միացությունների ստացման եղանակները, ինչպես նաև բիոլոգիական ուսումնասիրությունների արդյունքները կհրատարակվեն առանձին:

ЛИТЕРАТУРА — Գ Ր Ա Ն Ո Ւ Թ Յ Ո Ւ Ն

¹ Ա. Լ. Մնճոյան, Օ. Լ. Մնճոյան և Ն. Մ. Օգանճանյան, ДАН АрмССР, XX, 5 (1955). ² Ա. Լ. Մնճոյան, Ն. Ա. Բաբյան, „Известия“ АН АрмССР, серия физ.-мат., естеств. и техн. наук, т. VII, 6 (1954). ³ Ա. Լ. Մնճոյան, Օ. Լ. Մնճոյան, ДАН АрмССР, XX, 1 (1955).