

Resolución Racémica y Evaluación Farmacológica del Clorhidrato del (\pm)1,2-bis(p-Metoxifenil)Etilamino Acetato de Etilo

AMALIA G. de VAZQUEZ

*Cátedra de Farmacoquímica, Departamento de Ciencias Biológicas,
Facultad de Ciencias Exactas, Universidad Nacional de La Plata,
calle 47 y 115, La Plata 1900, Argentina*

y JUAN P. ROSSI

*Departamento de Química Orgánica, Facultad de Farmacia y Bioquímica,
Universidad de Buenos Aires, Junín 956, Buenos Aires 1113, Argentina*

RESUMEN. El clorhidrato de (\pm)1,2-bis(p-metoxifenil)etilamino) acetato de etilo demostró poseer actividad espasmolítica *in vitro* frente a la histamina y la acetilcolina. Sus derivados ópticamente activos se separaron para comparar la actividad farmacológica con la del racemato. El (+)isómero incrementa la acción antiespasmódica y disminuye la acción antihistamínica con relación al racemato.

SUMMARY. "Racemic Resolution and Pharmacological Evaluation of ethyl(\pm)1,2-bis(p-methoxyphenyl)ethylamine acetate". Biological evaluation of ethyl(\pm)1,2 bis-(p-methoxyphenyl)ethylamine acetate, monohydrochloride, shows *in vitro* spasmolytic activity on histamine and acetylcholine. The optical resolution of the two enantiomers has been done in order to compare its pharmacological action with the racemic. More spasmolytic and less antihistaminic action is found in (+)isomer.

En el estudio de la acción a nivel molecular, se considera que uno de los factores responsables de las propiedades farmacológicas de un compuesto es la manera en que distintos átomos o grupos de átomos se distribuyen en el espacio alrededor de otro átomo, llamado centro quiral, dando lugar a la existencia de estereoisómeros. La diferencia en la actividad de muchos estereoisómeros es la mejor evidencia de la existencia de un requerimiento estructural previo para lograr la máxima actividad de una sustancia.

La relación clásica estructura-actividad para drogas que inhiben el espasmo producido por la histamina y la acetilcolina requieren que el centro quiral se localice en posición *alfa* con respecto al anillo aromático y dentro de éstos, aquellos derivados que posean sustituciones en posición *para* en relación al carbono $\alpha^{1, 2}$.

Extendiendo estudios previos concernientes a la síntesis y evaluación farmacológicas de drogas, que inhiben el espasmo producido por la histamina y la ace-

PALABRAS CLAVE: Resolución óptica; Actividad espasmolítica; (\pm)1,2-bis(p-metoxifenil)-etilamino acetato de etilo; Clorhidrato.

KEY WORDS: *Optical Resolution; Spasmolytic activity; ethyl(\pm)1,2-bis(p-methoxyphenyl)-ethylamine acetate; Monohydrochloride.*