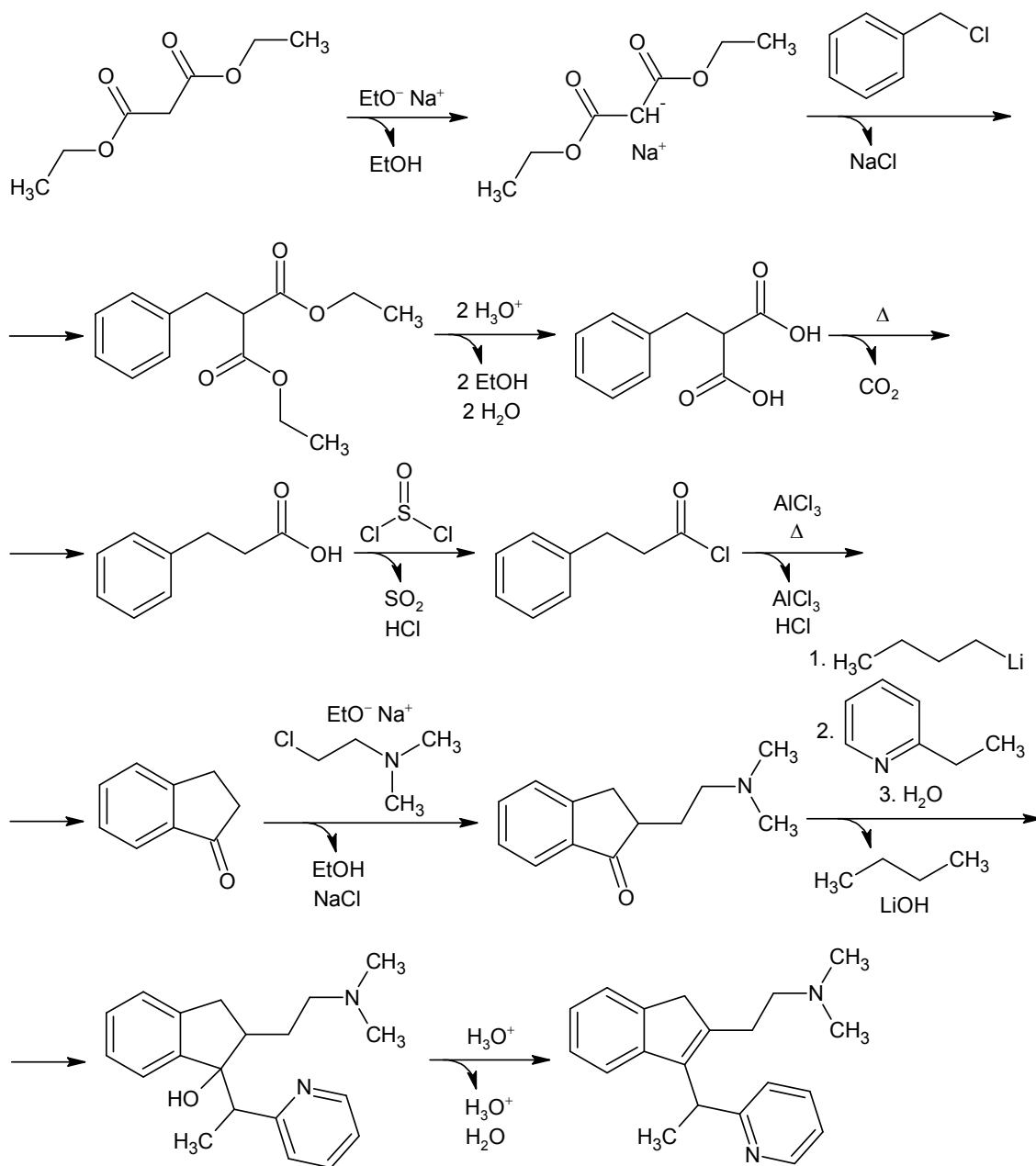


**Dimetindén, Fenistil**  
(Dimetindene, Dimethindene)



Dimetindén, známy aj pod svojim obchodným názvom fenistil, patrí medzi antihistaminiká. Pri jeho aplikácii dochádza ku kompetitívnej inhibícii H<sub>1</sub> receptorov, čo bráni k naviazaniu histamínu, ktorý by inak vyvolal alergickú reakciu.

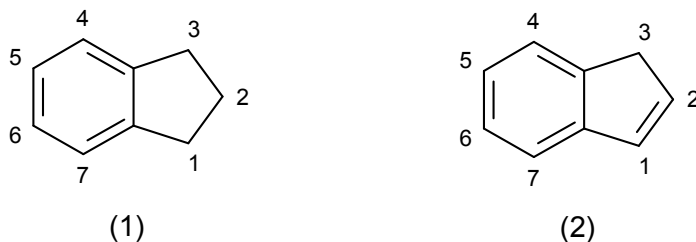
Jeho syntéza začína reakciou malónanu etylového s etanolátom sodným. Takto sa získa karbanión stabilizovaný okolitými karboxylovými skupinami. Ten následne reaguje s benzylchloridom za vzniku dietylbenzylmalonátu. Ďalším krokom je kyslá hydrolýza, kedy dochádza ku vzniku dvoch karboxylových skupín. Po miernom zahriatí dochádza k spontánnej decarboxylácii za súčasného odchodu oxidu uhličitého a vzniku kyseliny 3-fenylpropánovej. Pôsobením tionylchloridu získame chlorid tejto

kyseliny. Pomocou intramolekulovej Friedel-Craftsovej acylácie (viď Friedel-Craftsova acylácia) dochádza k vytvoreniu 1-indanónu. Tento po reakcii s 2-chlór-N,N-dimetyletánamínom v bázičkom prostredí poskytuje adukt, ktorý vzniká v polohe 2. Nasleduje reakcia s butyllítom, ďalej s 2-etylpyridínom a napokon s vodou za vzniku aduktu, ktorý obsahuje hydroxyskupinu na indáne – indanol. Po jej protonácii dochádza k jej odchodu vo forme vody a k vzniku indénu so substituentmi v polohách 1 a 2 a teda k vytvoreniu dimetindénu.

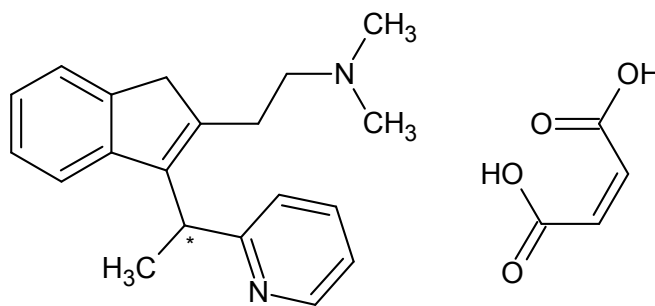
*Poznámka:*

*2-(2-dimetylaminoetyl)-1-indanón možno pripraviť aj reakciou dietylbenzylmalonátu s hydridom sodným a 2-(dimetylamino)etyl chloridom a následnou reakciou s kyselinou polyfosforečnou.*

*Číslovanie indánu (1) a indénu (2) začína vždy najprv na alifatickom päťčlankovom cykle a pokračuje voľnými polohami na aromatickom jadre.*



*Dimetindén sa používa v humánnej medicíne ako racemát (obsahuje stereogénne centrum) spolu s kyselinou maleínovou v pomere 1:1.*



*Kutschy P., Vinšová J., Berkeš D., Török M.: Základy farmaceutickej chémie. Univerzita P.J. Šafárika v Košiciach, Košice, 2004, s. 92-94. ISBN 978-80-7097-544-2.*

*Klemann A., Engel J., Kutscher B., Reichert D.: Pharmaceutical Substances. 4. vyd. Thieme Medical Publishers, Stuttgart, 2001, s. 668-669. ISBN 3-13558-404-6.*