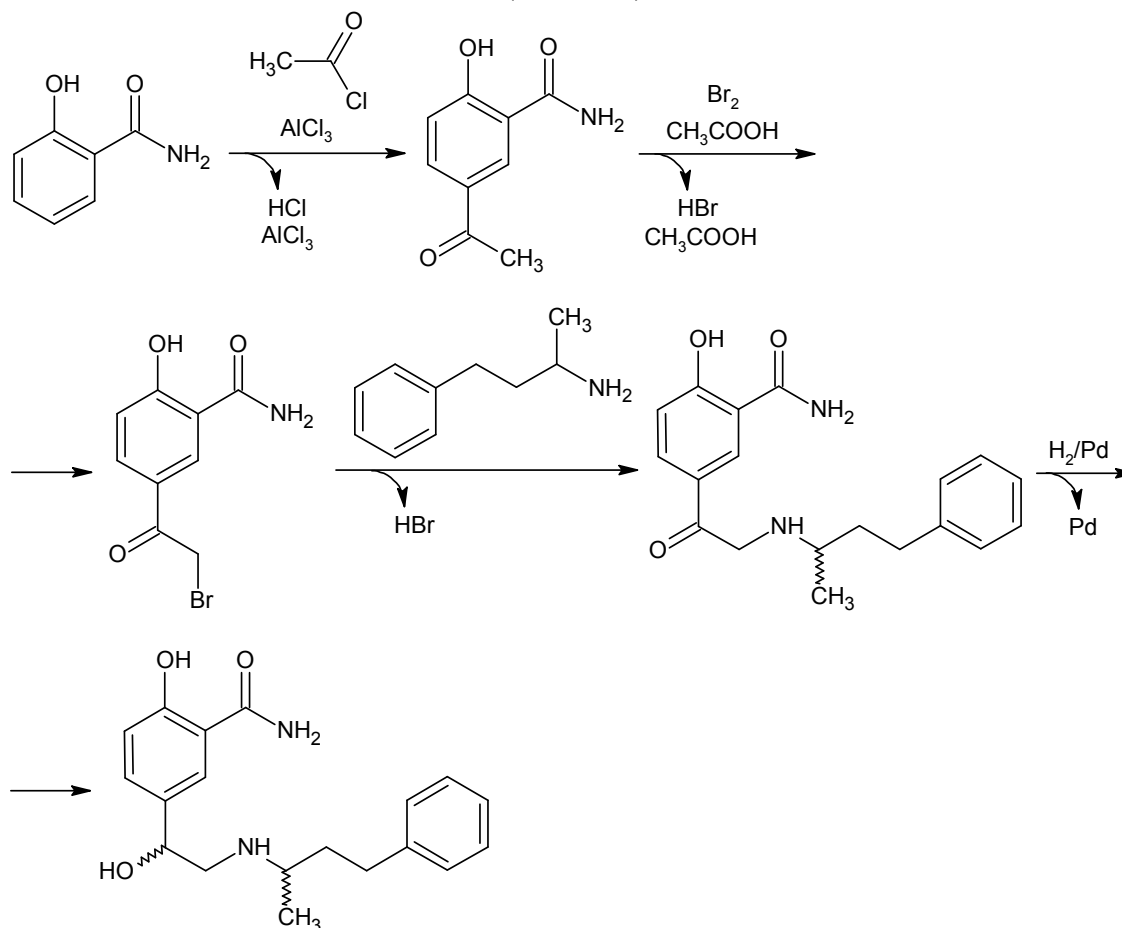


Labetalol
(Labetalol)



Labetalol patrí medzi antiadrenergiká, ktoré sú antagonistami neurotransmiterov katecholamínového typu. Ako liečivo sa používa jeho racemická zmes štyroch stereoizomérov. Stereoizoméry S,S- a R,S- sú takmer úplne neúčinné, stereoizomér R,R- je β -adrenolytikom a S,R- je α -adrenolytikom. Z uvedeného vyplýva, že sa jedná o antihypertenzívum s vyváženou α - , β -adrenolytickou aktivitou.

Syntéza labetalolu začína Friedel-Craftsovou acyláciou (viď Friedel-Craftsova acylácia) amidu kyseliny salicylovej s chloridom kyseliny octovej. Po bromácii dochádza k reakcii s 4-fenylbután-2-amínom za vzniku aduktu, ktorý sa redukuje vodíkom za vzniku labetalolu s dvoma stereogénnymi centrami.

Poznámka:

Amid kyseliny salicylovej sa pripravuje z metylesteru kyseliny salicylovej (viď Kyselina acetylsalicylová) v reakcii s amoniakom.