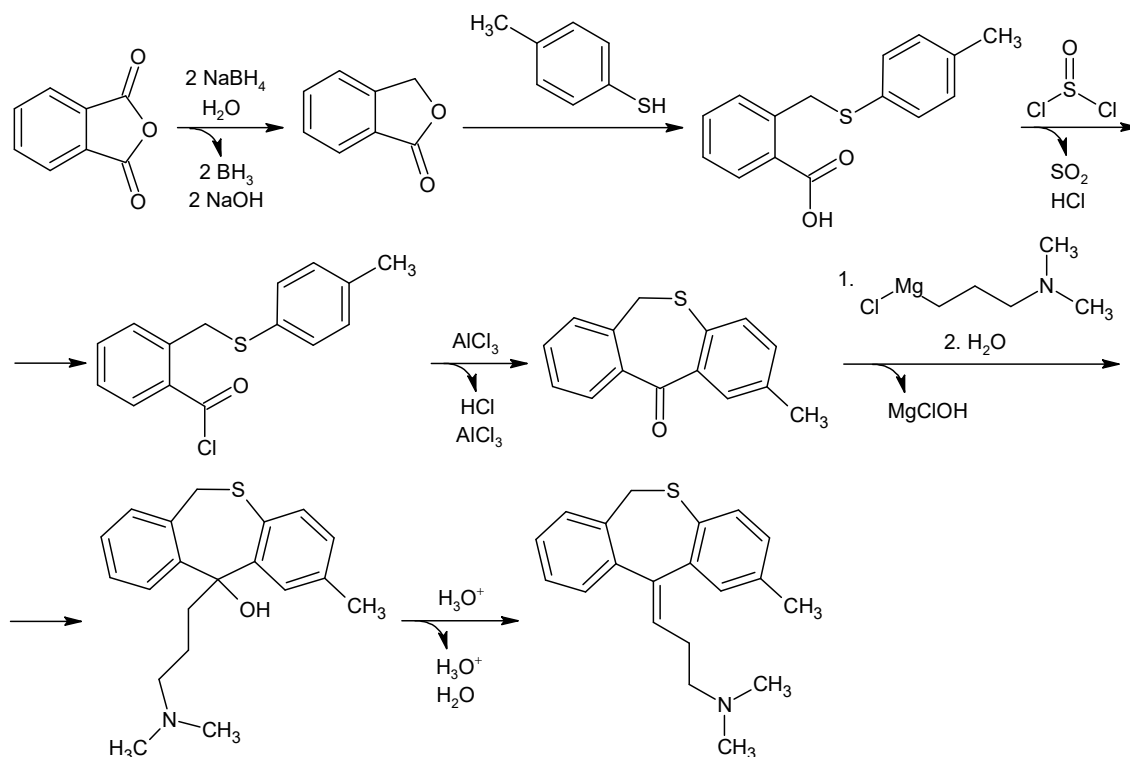


Medosulepín (Medosulepin, Methiadene)



Medosulepín patrí medzi antihistaminiká, kedy je antagonistom histamínu na H_1 receptore. Štruktúrne ho môžeme zaradiť medzi alkylarylamíny. Najčastejšie sa využíva pri alergickej nádche a po bodnutí hmyzom.

Syntéza medosulepinu začína redukciou ftalanhydridu tetrahydroboritanom sodným za vzniku ftalidu. Na tento je nukleofilne adovaný 4-metyltiofenolom. Vzniknutá karboxylová kyselina je prevedená na jej chlorid, kedy v asistencii chloridu hlinitého vzniká sedemčlánkový heterocyklus. Po adícii Grignardovho činidla (vid' Grignardova reakcia) a kyslej hydrolyzy vzniká medosulepín.

Poznámka:

Cyklizácia chloridu karboxylovej kyseliny môže byť uskutočnená aj pomocou kyseliny polyfosforečnej (PPA).

Medosulepín je jedným z 26-tich liečiv zosyntetizovanými českým chemikom Miroslavom Protivom (1921 – 1998).

Analóg medosulepinu zosyntetizovaný rovnako Miroslavom Protivom dosulepín je stále využívané antidepresívum. Od medosulepinu sa líši iba nesubstituovanými aromatickými cyklami.