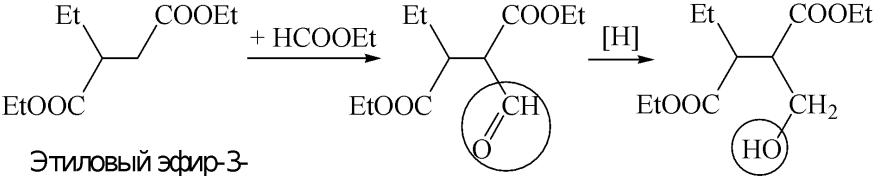
Пилокарпин

Синтез (Преображенский, 1933)

1. Формилирование



Этиловый эфир-3этоксикарбонилпентановой к-ты

2-формилпроиз-е

2-гидроксиметилпроиз-е

2. Циклизация

Et COOEt 1. HCl, 20°C Et COOH 1. SOCl₂ Et
$$CH_2$$
 - EtOH, - EtCl CH_2 - EtCl CH_2

2-гидроксиметилпроиз-е

Цис-пилоповая к-та

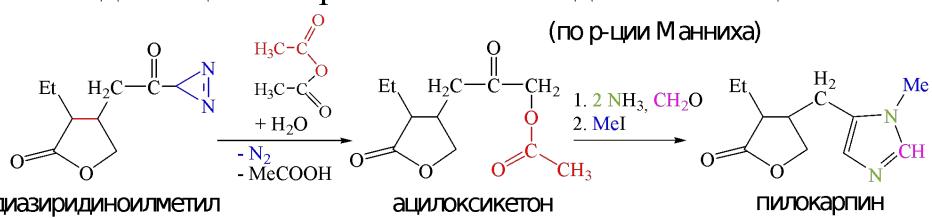
4-диазириноиллактон

Пилокарпин

Синтез (Преображенский, 1933)

3. Прививка эфирной группы в положении С

4. Конденсация с образованием имидазольного цикла



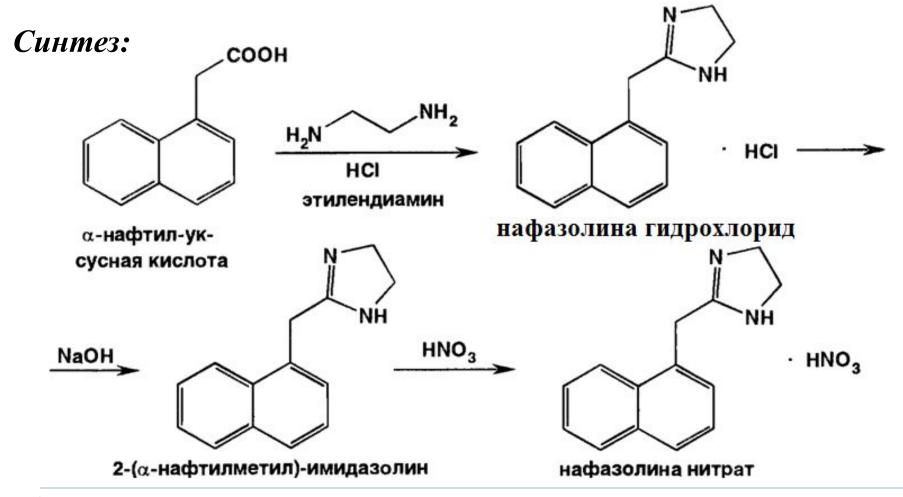
диазиридиноилметил

произ-е

2-производные 1Н-имидазола

Препараты

2. Нафазолин (Naphazoline)



2-производные 1Н-имидазола

Препараты

3. Ксилометазолин (Xylometazoline)

Синтез:

Циклоконденсация с этилендиамином

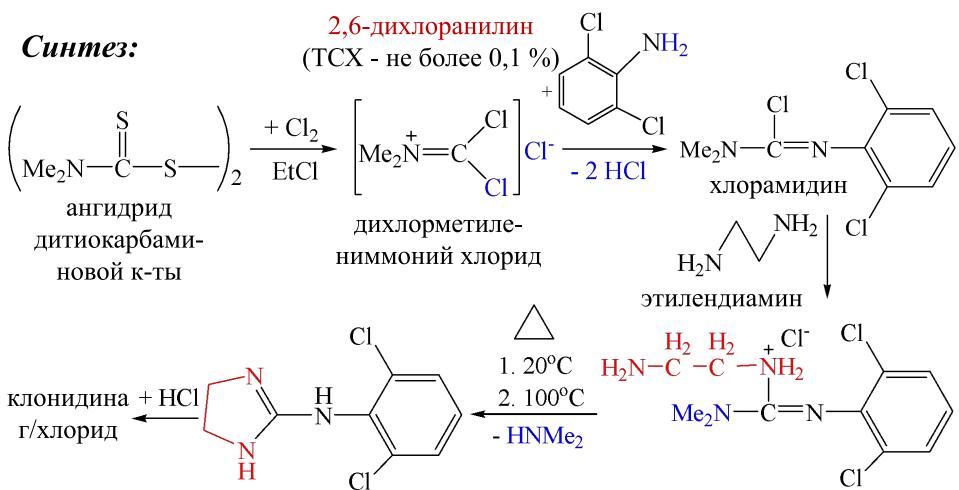
$$\begin{array}{c} H_3C \\ H_3C \\ H_3C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} CH_3 \\ \\ CH_2CN \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} NH_2CH_2CH_2NH_2 \\ \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_3C \\ \\ H_3C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} CH_3 \\ \\ H_3C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} CH_3 \\ \\ CH_3 \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} CH_3 \\ \\ CH_3 \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ C \\ \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} H_2 \\ \\ \\ C \\ \\ \end{array}$$

4-*трет*-бутил-2,6диметилбензилцианид 2-(4-*трет*-бутил-2,6диметилбензил)-имидазолин

2-производные 1H-имидазола *Препараты*

5

4. Клонидина гидрохлорид (Clonidine hydrochloride)



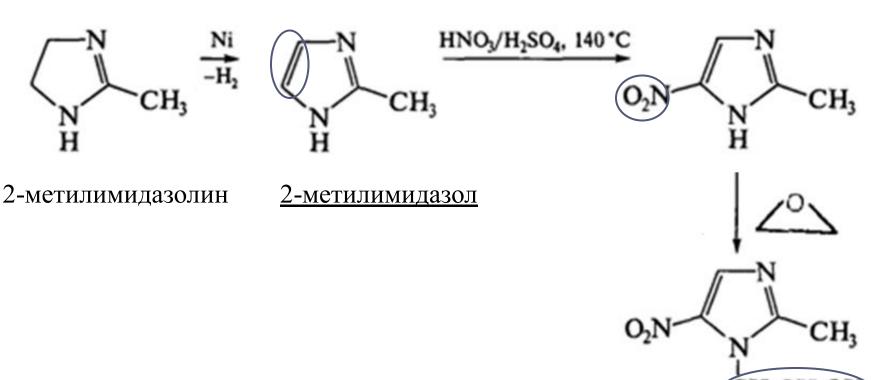
1,2,5-производные 1Н-имидазола

Препараты

6. Метронидазол (Metronidazole)

Синтез:

2-метил-5-нитроимидазол

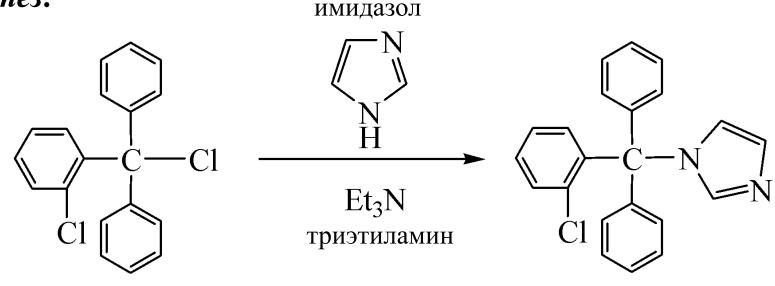


1-производные 1Н-имидазола

Препараты

7. Клотримазол (Clotrimazole)

Синтез:



2-хлортрифенилметилхлорид

Клотримазол (1-[о-хлор-α,α-дифенилбензил]имидазол)

2-производные бензимидазола

Препараты

9. Бендазола гидрохлорид (Bendazol hydrochloride)

Синтез:

$$NH_2$$
 О H_2 — $H_$

Чистота:

$$\begin{array}{c|c} & & & & \\ & & & \\ & & & \\ NH_2 & & & \\ NH_2 & & & \\ NH_2 & & & \\ \end{array}$$

8 о-фенилендиамин

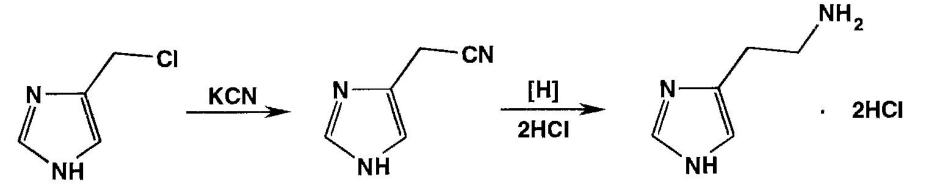
хинондиимин (розовое окр-е)

Препараты

1. Гистамин (Histamine)

Синтез:

EuPh 6.0 - 01/2008:0143



3-хлорэтилидимидазол

гистамина дигидрохлорид

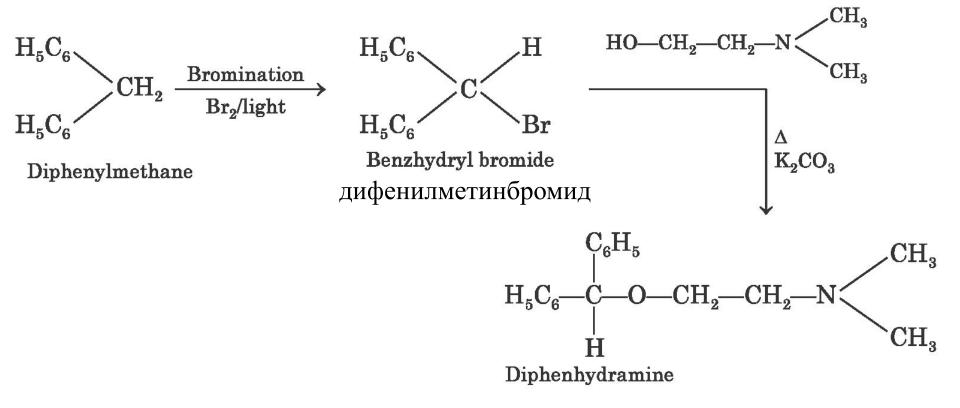
3-цианоэтилидимидазол

Антигистаминные средства *Производные алкиламиноэфиров*

2. Дифенгидрамина гидрохлорид (Diphenhydramine)

Синтез:

<u>ГФ XII, ч.1, ФС 42-0232-07</u>



Производные этилендиамина

3. Хлоропирамина гидрохлорид (Chloropyramine)

Синтез:

ГФ ХІІ, ч.1, ФС 42-0289-07

$$CI$$
 CI
 H_2N
 H_2H_2
 H_2N
 CH_3
 H_2/Ni
 CH_3

4-хлорбензальдегид N,N-диметилэтилендиамин

$$H_2$$
 H_2 H_2 H_2 H_3 H_4 H_5 H_5 H_5 H_5 H_5 H_5 H_5 H_5 H_6 H_8 H_8

N-(4-хлорбензил)-N`,N`-диметилэтилендиамин

Классификация. Н2-антагонисты.

7. Ранитидина гидрохлорид (Ranitidine hydrochloride) <u>гф XII, ч.1, ФС 42-0274-07</u>

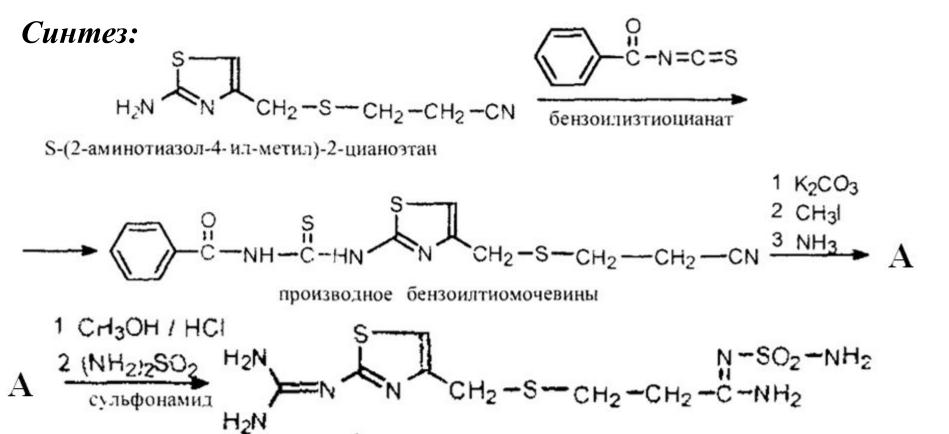
Синтез:

5-(Dimethylamino) methyl-2-furan methanol

Ranitidine

Классификация. Н2-антагонисты.

8. Фамотидин (Famotidine)



фамотидин

3-[[(2-((аминометил)амино-4-тиазолил)метил]тио]-N-(аминосульфонил)пропанимидамид