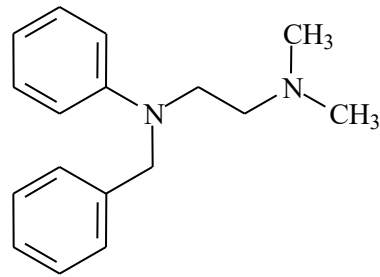
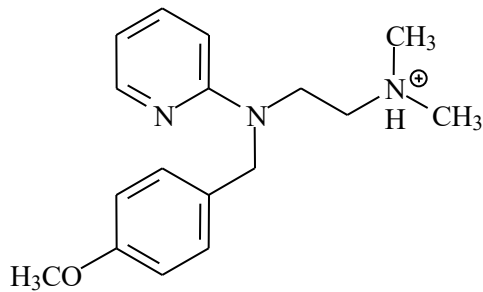
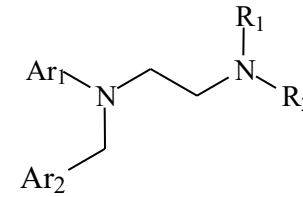


ΑΝΤΙΪΣΤΑΜΙΝΙΚΑ H1

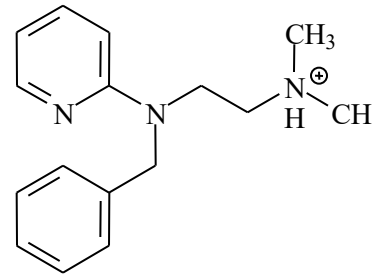
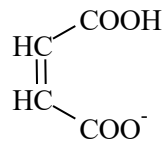
Αιθανοδιαμίνες



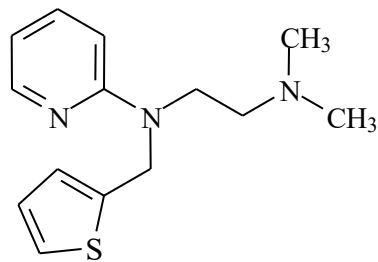
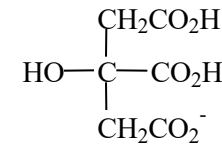
phenbenzamine



pyrilamine maleate

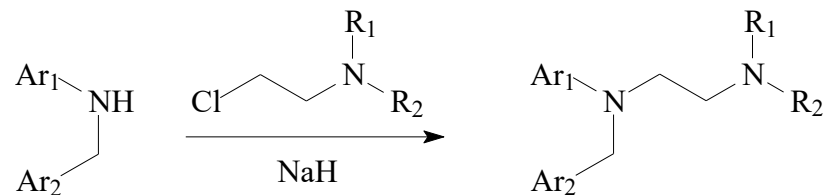


tripelemine citrate

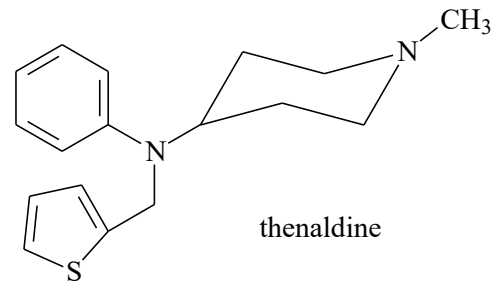
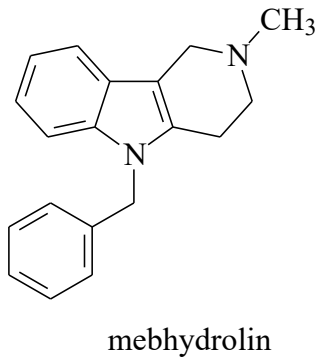
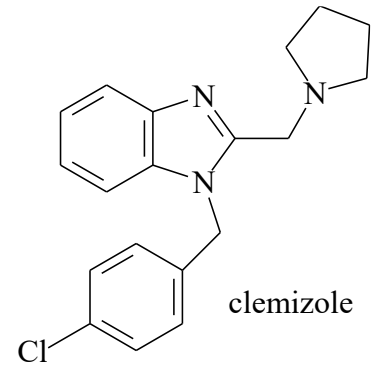
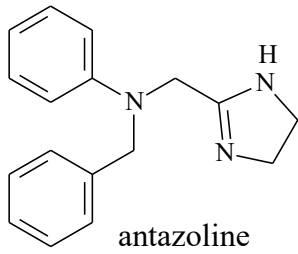


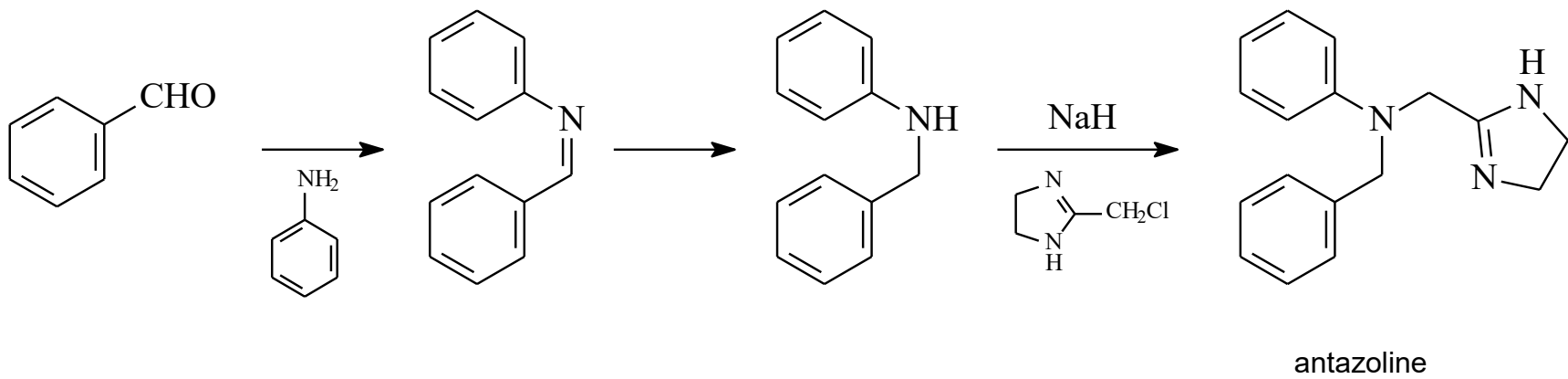
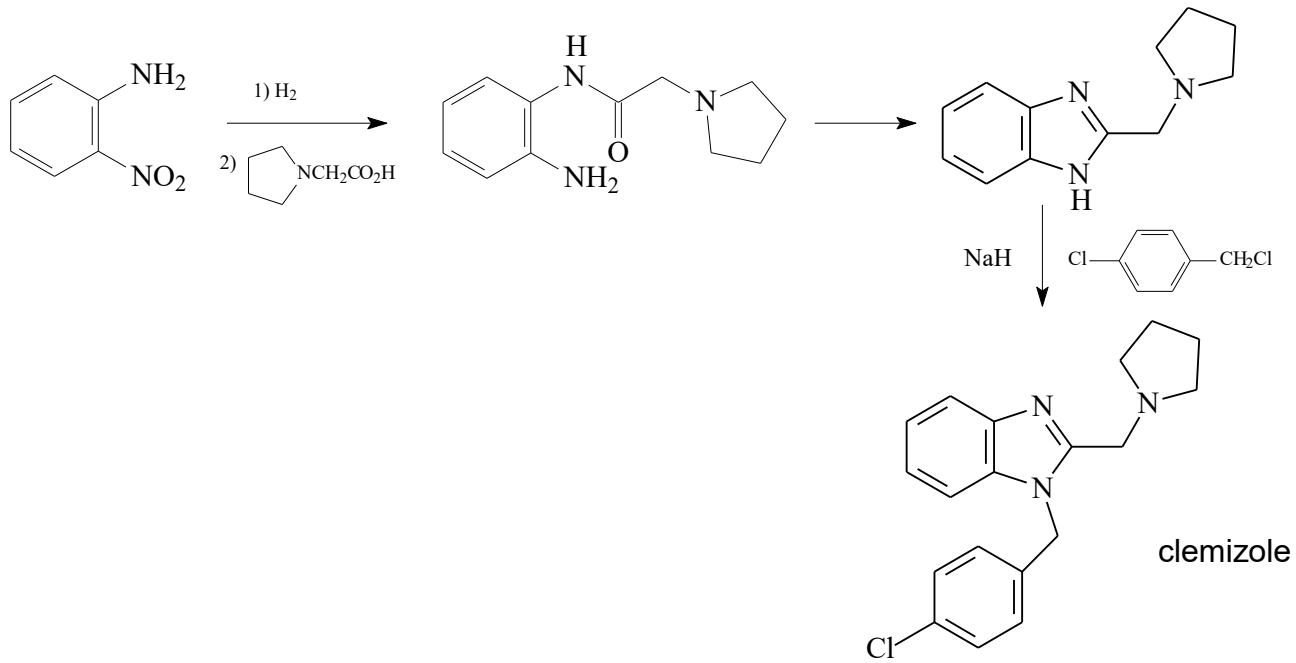
methapyrilene

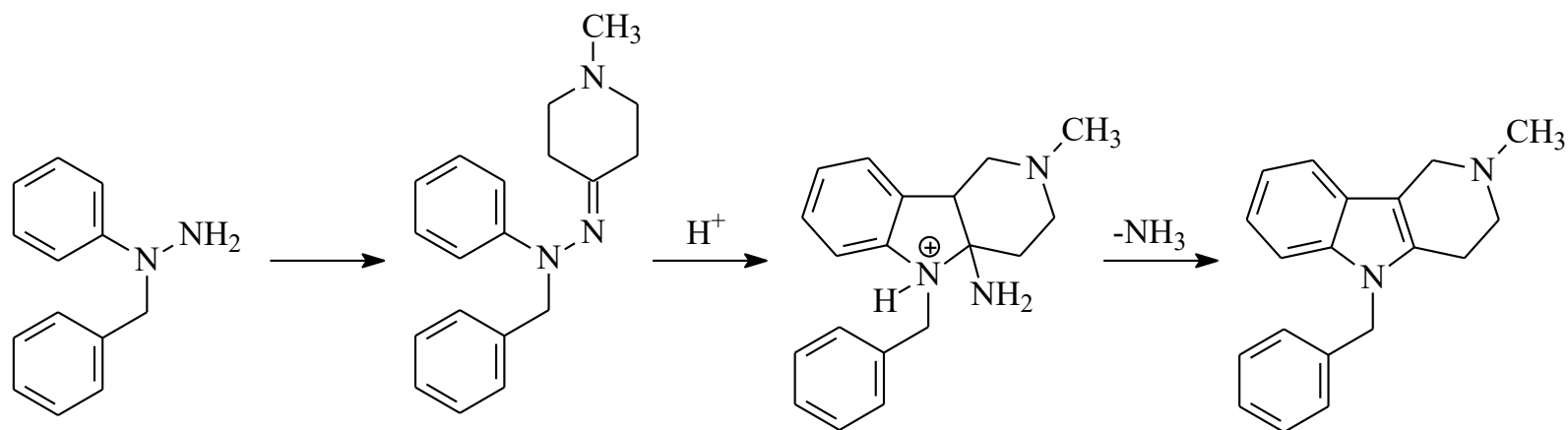
Γενικός τρόπος σύνθεσης



Αιθανοδιαμίνες με μη κλασική δομή

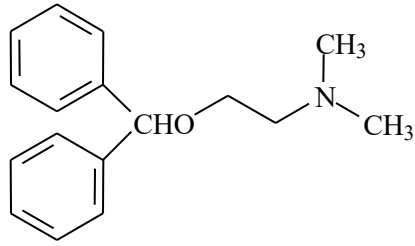






mebhydrolin

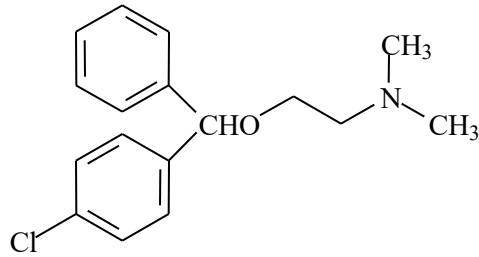
Αιθανολαμίνες



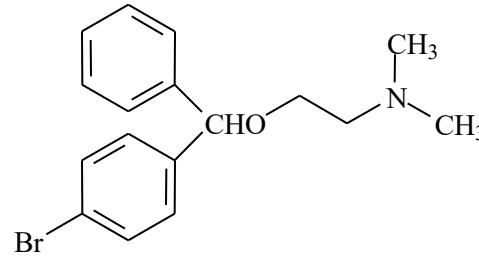
diphenhydramine

Τα περισσότερα παράγωγα εμφανίζουν ισχυρή κεντρική **αντιχολινεργική** δράση καθώς και **υπνωτική**

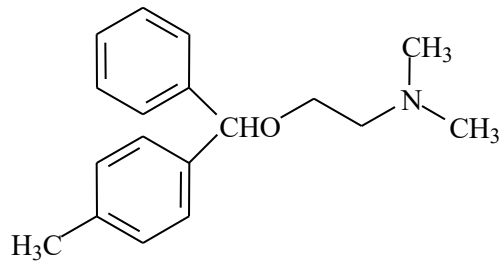
Τα **S-εναντιομερή** έχουν αυξημένη συγγένεια για τον H1-υποδοχέα.



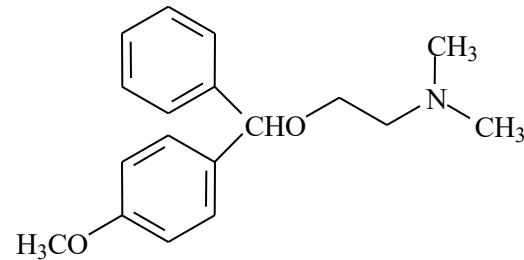
chlorodiphenhydramine



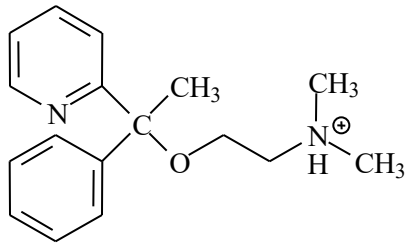
bromodiphenhydramine



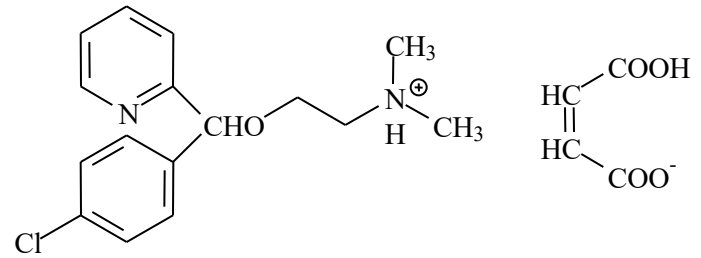
methyl diphenhydramine



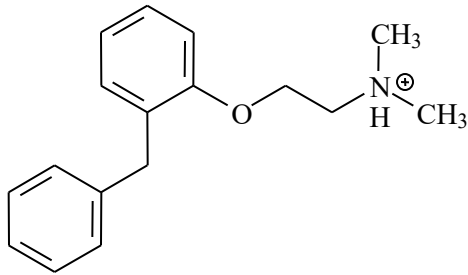
medrylamine



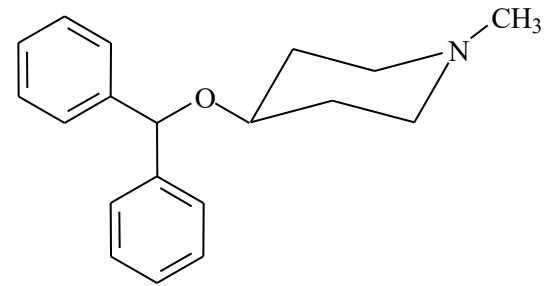
doxylamine succinate



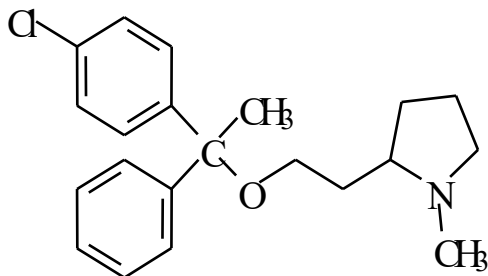
carbinoxamine maleate



phenyltoloxamine citrate



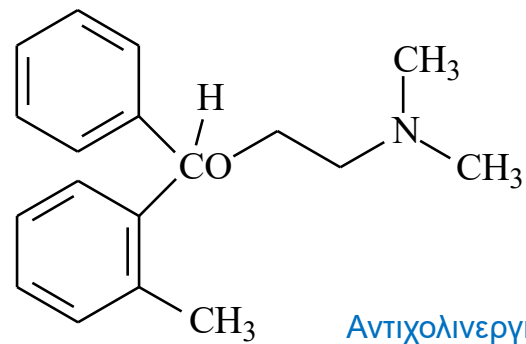
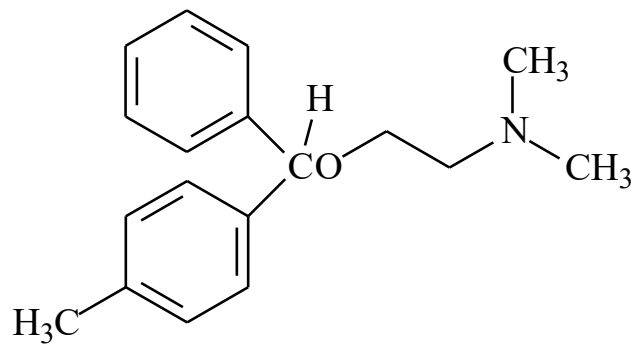
diphenylpyraline



clemastine

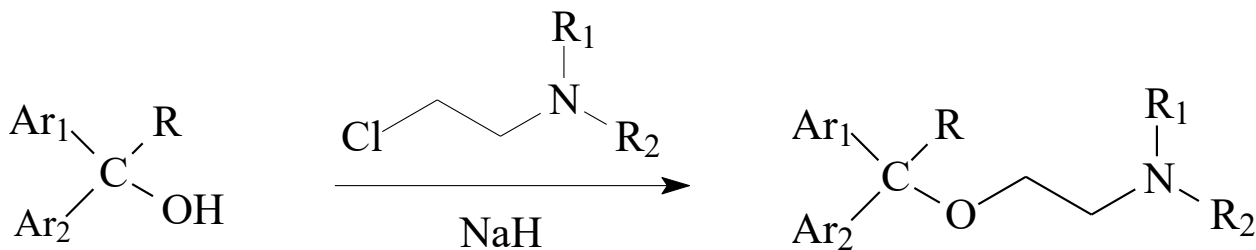
Ελάχιστη αντιχολινεργική και κατασταλτική του ΚΝΣ δράση συγκρινόμενο με τους ομόλογους αμινοαλκυλαιθέρες.

H1-αντιισταμινική δράση

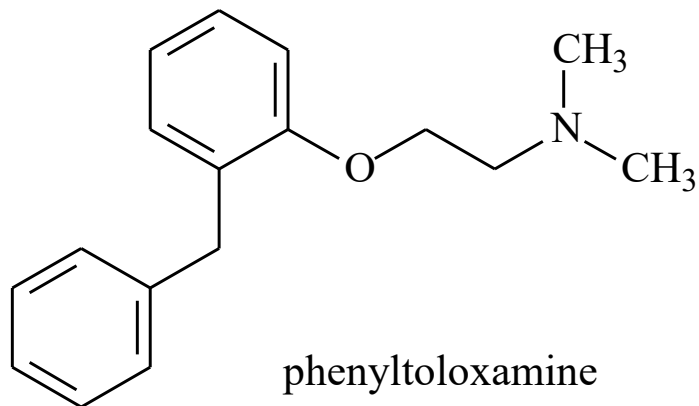


Αντιχολινεργική δράση
(μεγαλύτερη εκλεκτικότητα για
μουςκαρινικούς υποδοχείς)

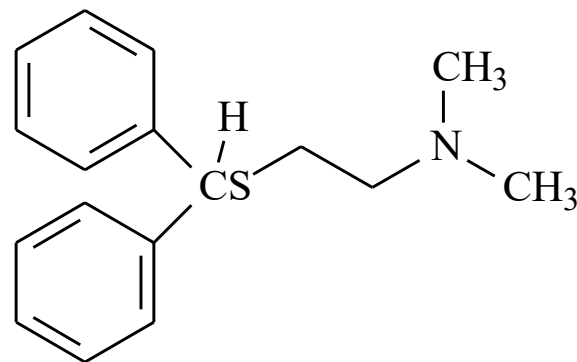
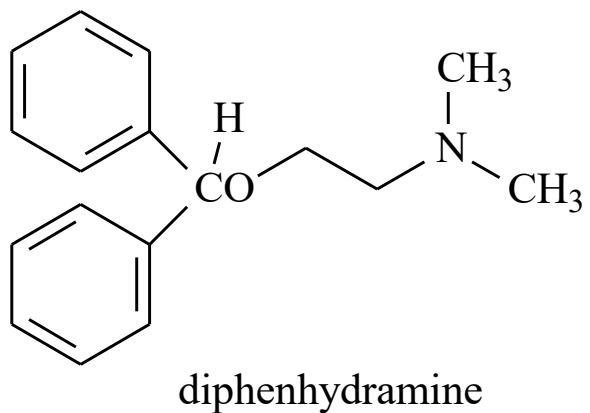
Γενικός τρόπος σύνθεσης



Σχέσεις δομής-δράσης
αιθανολαμινών

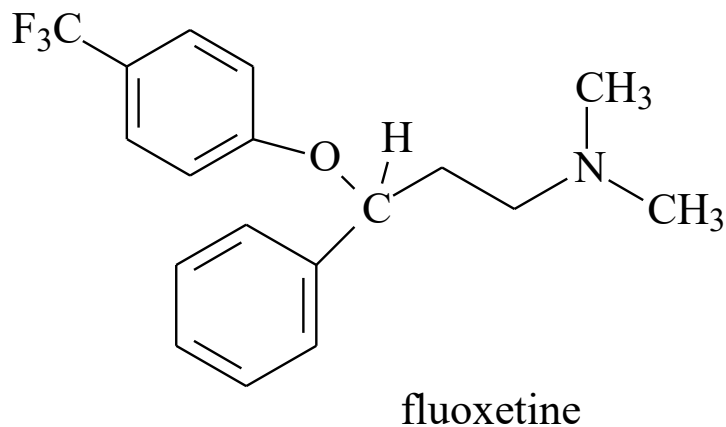


Καλή αντιισταμινική δράση

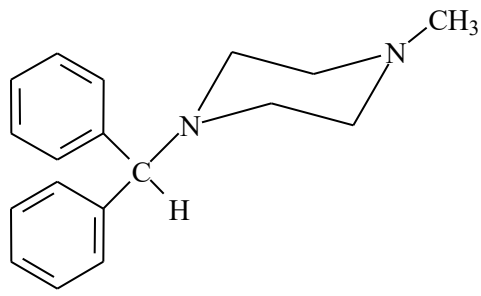


Πολύ ασθενής αντιισταμινική δράση

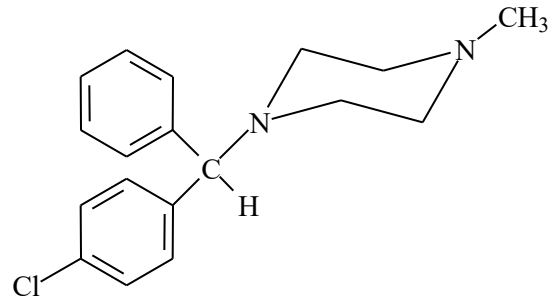
Αναστολέας επαναπρόσληψης
σεροτονίνης



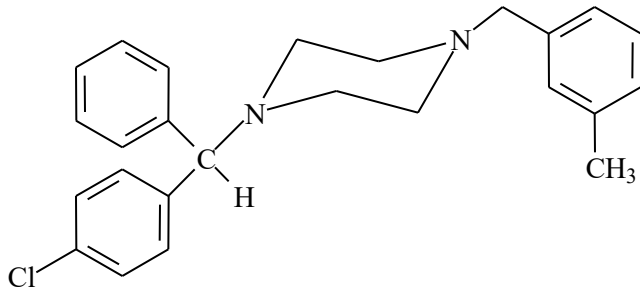
ΠΙΠΕΡΑΖΙΝΕΣ



cyclizine

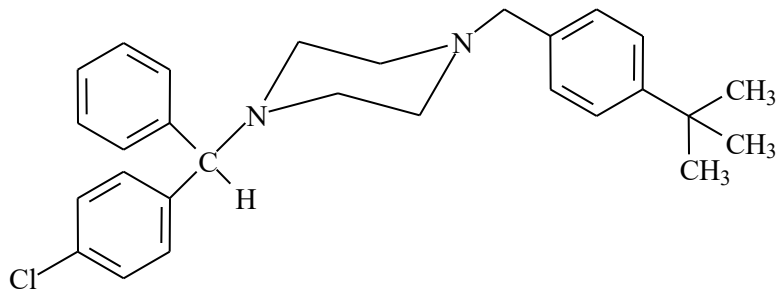


chlorcyclizine



meclizine

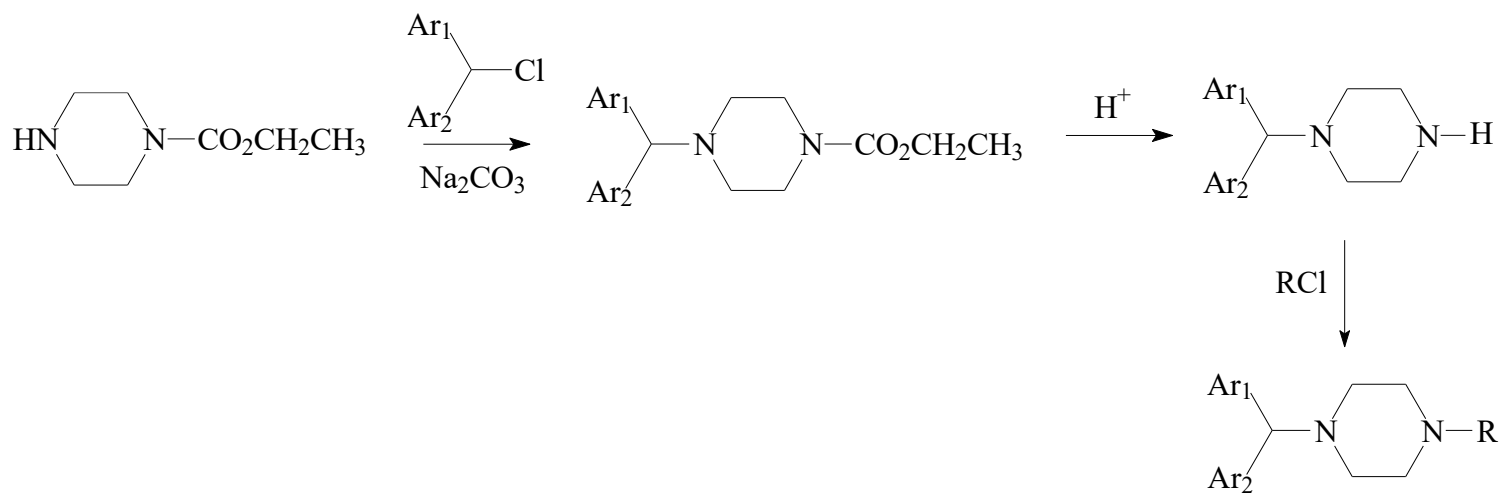
Χρησιμοποιείται κατά της ναυτίας



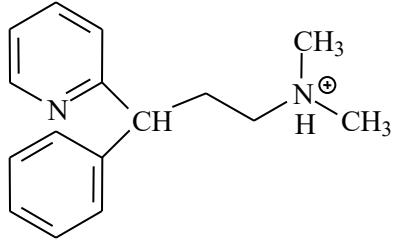
buclizine

Η εμφάνιση της δράσης των πιπεραζινικών αναλόγων καθυστερεί και είναι παρατεταμένης διάρκειας. Έχουν σημαντική καταπραυντική (πρόκληση υπνηλίας) και αντιχολινεργική δράση, καθώς και αντιεμετική

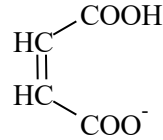
Μέθοδος σύνθεσης πιπεραζινικών παραγώγων



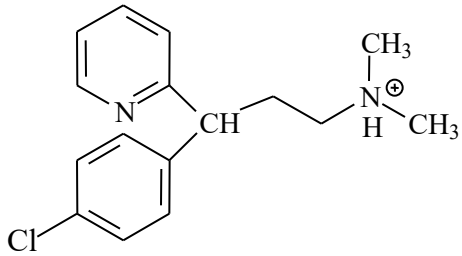
αλκυλαμίνες



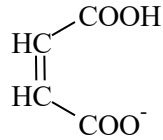
pheniramine maleate



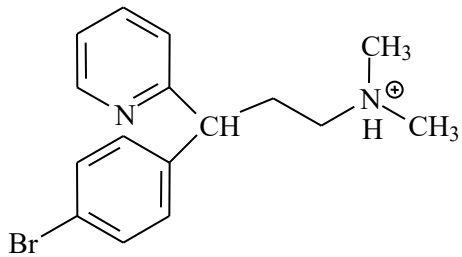
Μακρά διάρκεια δράσης
50 φορές δραστικότερο της tripeleennamine



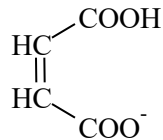
chlorpheniramine maleate



Οι αλκυλαμίνες:
Προκαλούν μικρότερης έκτασης κεντρική καταστολή από τα προηγούμενα
Έχουν μειωμένη αντιχολινεργική και αντιεμετική δράση, συγκρινόμενες με τις αιθανολαμίνες

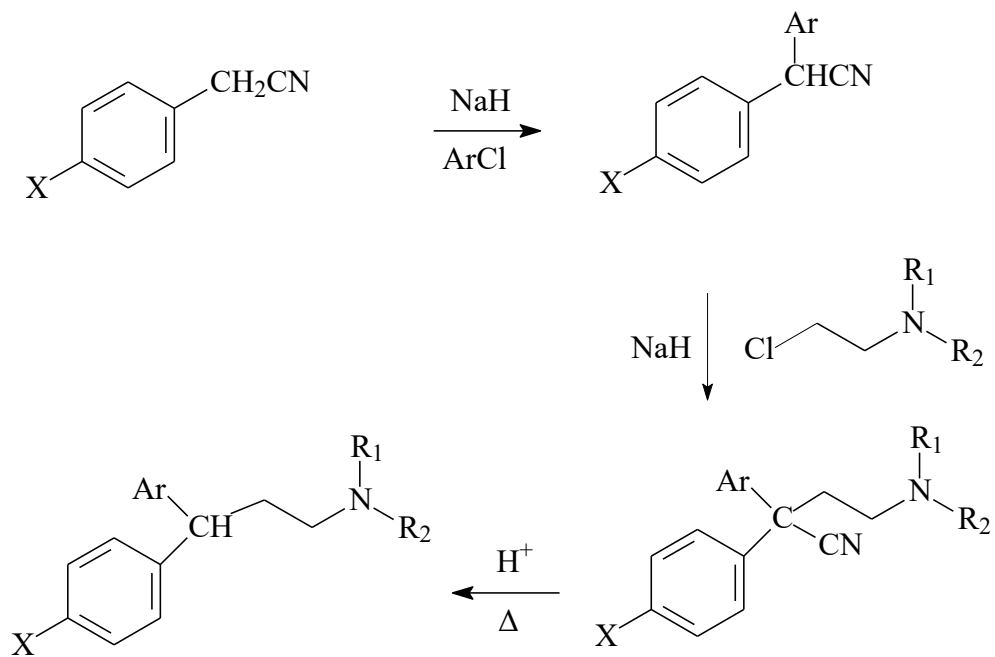


brompheniramine maleate

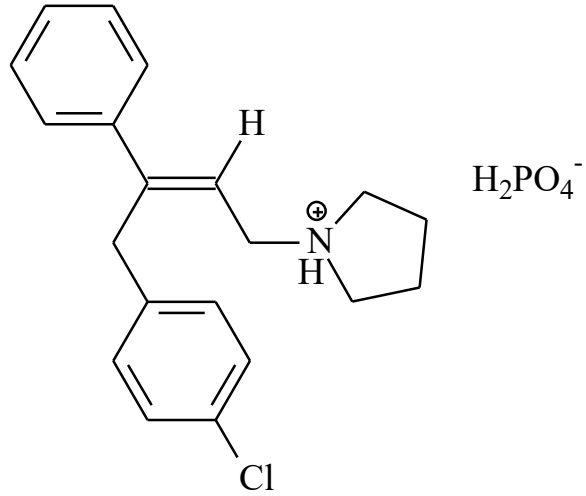


Το p-αλογόνο αυξάνει τη δράση
Τα δεξιόστροφα ισομερή είναι δραστικότερα [S-(+)-εναντιομερή]

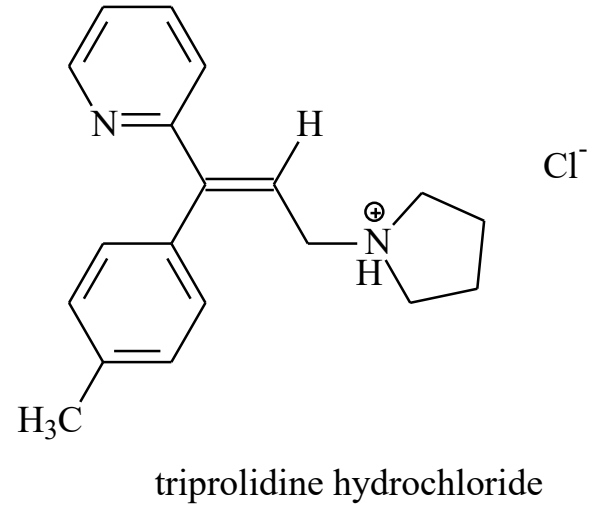
Μέθοδος σύνθεσης αλκυλαμινών



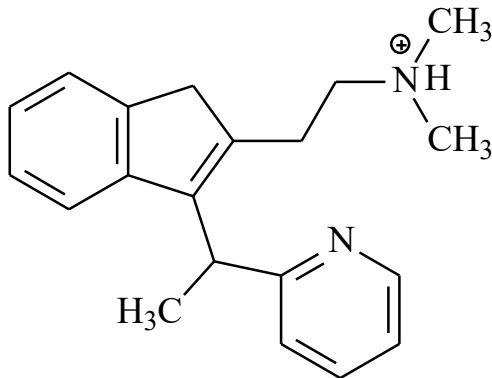
Ολεφινικές αλκυλαμίνες



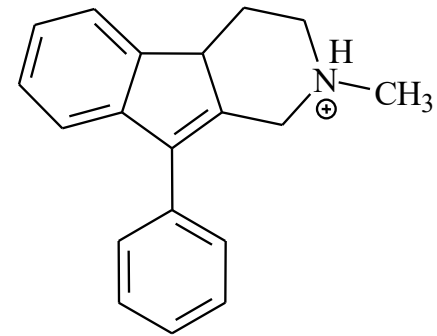
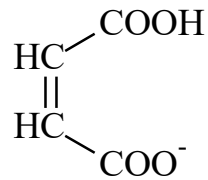
pyrrobutamine phosphate



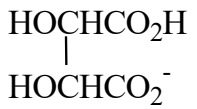
triprolidine hydrochloride



dimethindene maleate

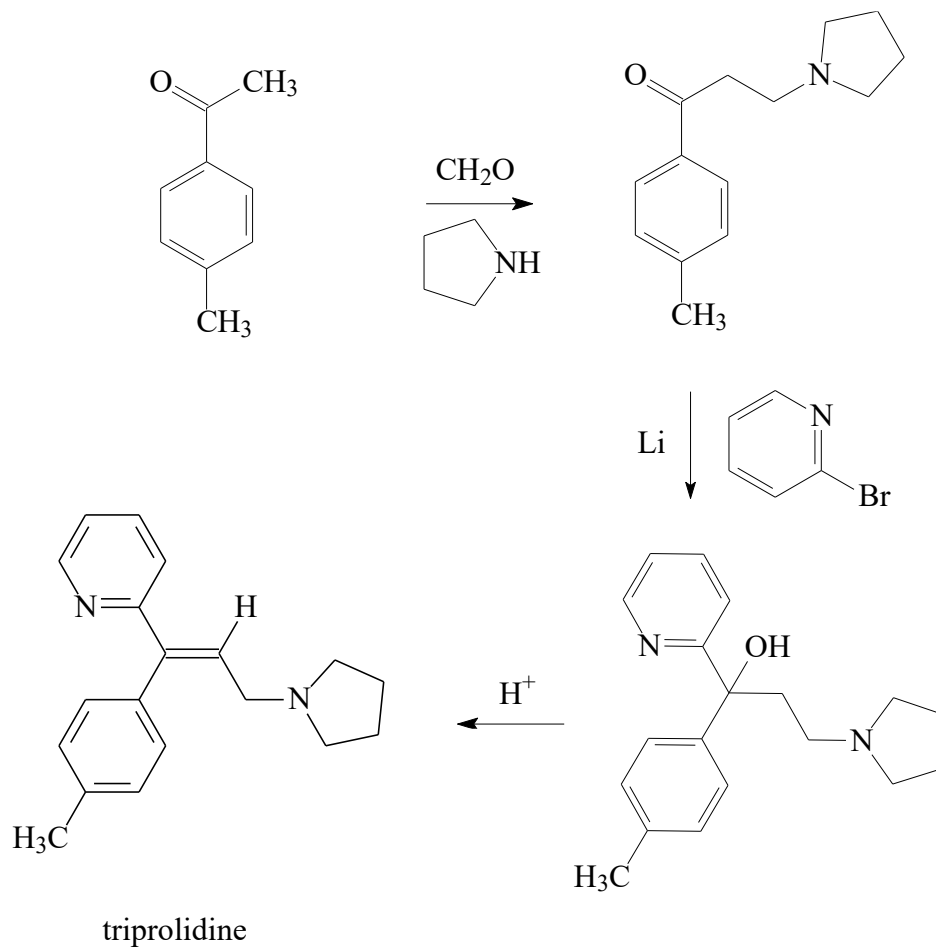


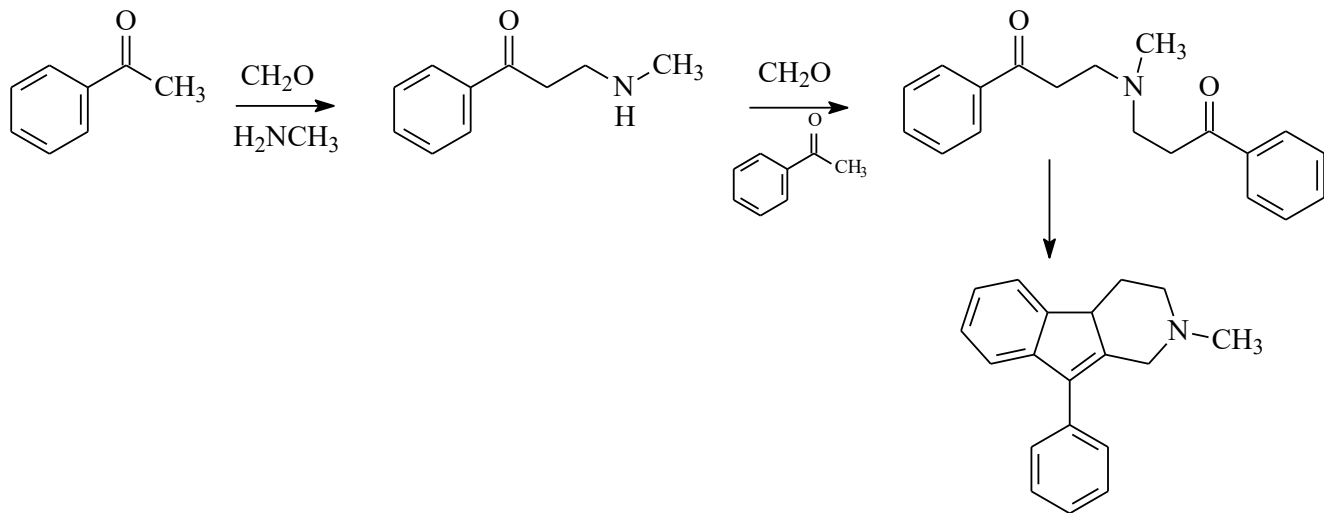
phenindamine tartrate



Το E- ισομερές είναι δραστικότερο

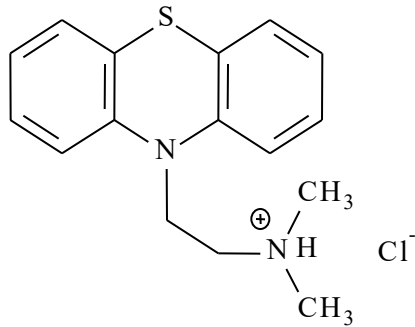
Μέθοδος σύνθεσης ολεφινικών παραγώγων



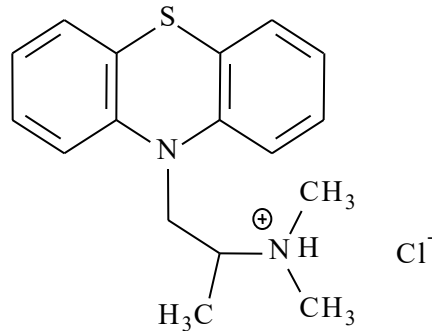


phenindamine

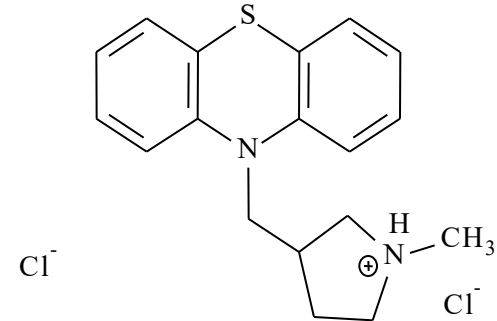
Τρικυκλικά αντιισταμινικά



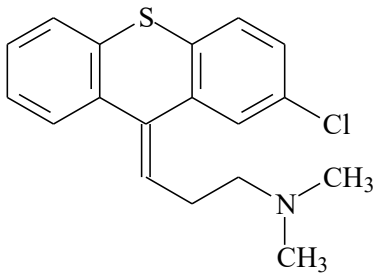
fenethazine hydrochloride



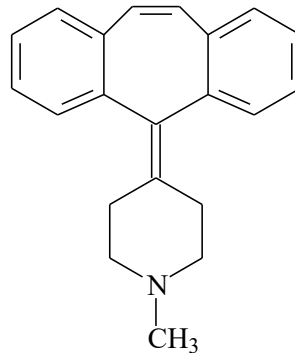
promethazine hydrochloride



methdilazine hydrochloride



chlorproxithene

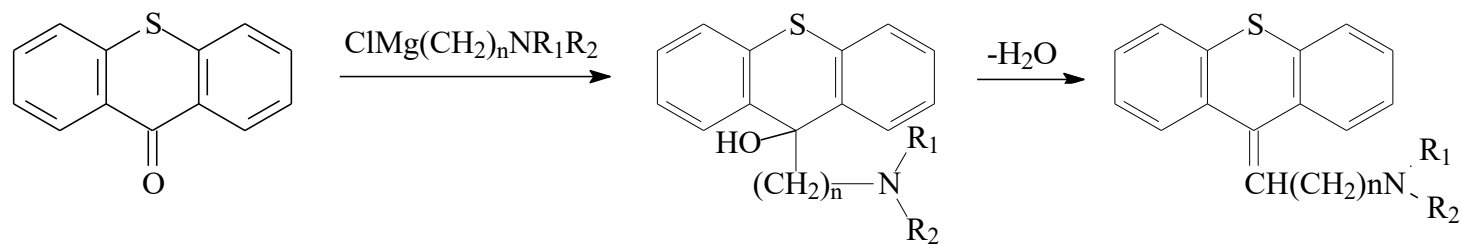
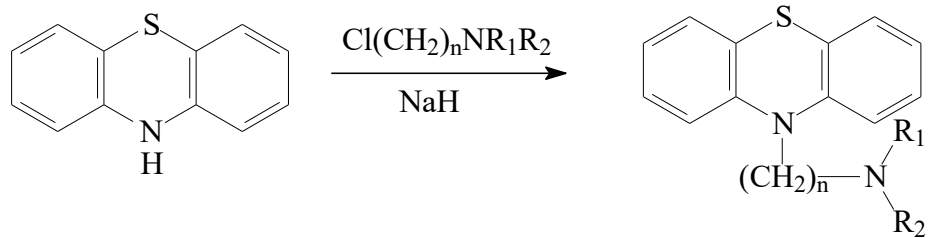


cyproheptadine

Το cyproheptadine διαθέτει επιπλέον αντιχολινεργική και αντισεροτονινεργική δράση. Διεγείρει την όρεξη ανταγωνιζόμενη τη σεροτονίνη στους ορεξιογόνους υποδοχείς του υποθαλάμου (χρήση σε περιπτώσεις ανορεξίας)

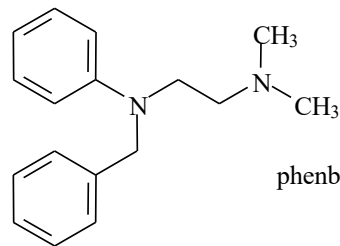
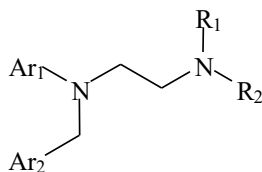
Έχουν επίσης ηρεμιστική, υπνωτική, αναλγητική, αντιεμετική δράση. Διακλάδωση της πλευρικής αλυσίδας βελτιώνει την **αντιισταμινική δράση**. Ενώ ανάλογα με **καταπραϋντική δράση** έχουν πλέον επιμήκεις πλευρικές αλυσίδες και συνήθως δεν φέρουν υποκατάσταση επί των αρωματικών δακτυλίων.

Γενική μέθοδος σύνθεσης τρικυκλικών
παραγώγων από αντίστοιχες πρώτες ύλες



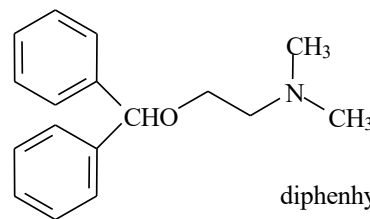
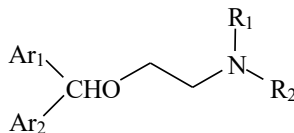
Κατηγορίες αντιισταμινικών α' γενιάς

αιθυλενοδιαμίνες



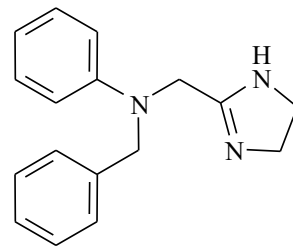
phenbenzamine

αιθανολαμίνες

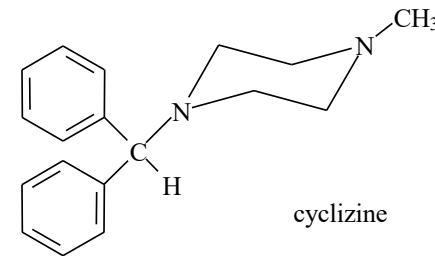


diphenhydramine

κυκλικά βασικά ανάλογα

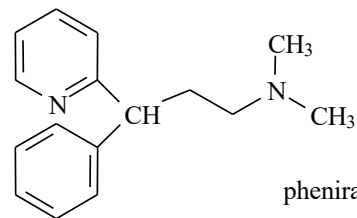
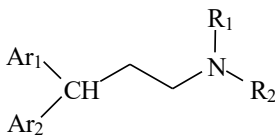


antazoline



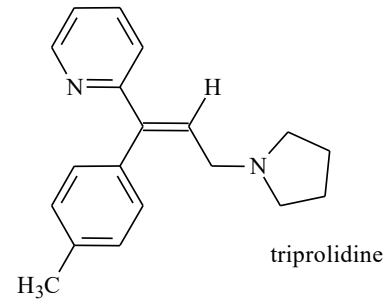
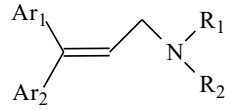
cyclizine

αλκυλαμίνες



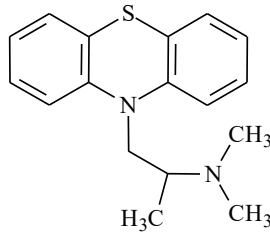
pheniramine

ολεφινικές αλκυλαμίνες



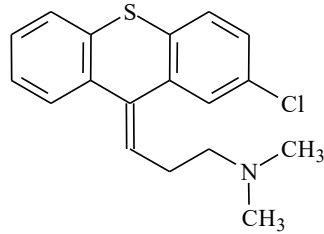
τρικυκλικά παράγωγα

φαινοθειαζίνες



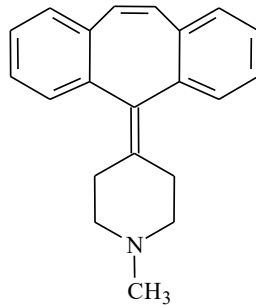
promethazine

θειοξανθένια



chloroproxithene

διβενζοκυκλοεπτατρίενια



cyproheptadine