

阿司咪唑合成路线图解

张珩 杨建设 (武汉化工学院, 武汉 430073)

阿司咪唑(Astemizole)(1), 化学名为1-[(4-氟苯基)甲基]-N-[1-[2-(4-甲氧苯基)乙基]-4-哌啶基]-1H-苯并咪唑-2-胺, 是由比利时的Janssen开发, 并于1983年在国外首次上市的新型抗组胺药, 对组织胺H-1受体有拮抗作用, 具有口服生物利用度高, 作用持久, 毒性较小, 且无中枢神经系统副作用等优点。对慢性和季节性过敏性鼻炎, 过敏性

结膜炎, 慢性荨麻疹和其它过敏症状, 均有较好疗效。

阿司咪唑可以邻硝基氯苯、2-(4-甲氧基)乙醇, 2-羟基苯并咪唑等许多化合物作为原料, 经缩合、还原等一系列反应制得。现将其众多的合成路线用图解方式表达如下:

