

Schéma 8.4 Syntéza noradrenalinu (norepinefrinu)

Působení uvedených endoadrenergik (dopaminu, noradrenalinu a adrenalinu) není selektivní, neboť jde o univerzální neurotransmitéry, stimulující všechny typy adrenergických receptorů. Na rozdíl od nich **α -exoadrenergika** (syntetická analoga přirozených adrenergik) vykazují vyšší selektivitu vůči α -receptorům. Jejich vasokonstrikčního účinku se využívá v případech hypotenze a překrvení sliznic. V očním lékařství se používají k vyvolání mydriázy (rozšíření zornice) pro diagnostické účely. Jako příklady uvádíme **metaraminol (8-5)**, (1*R*,2*S*)-2-amino-1-(3-hydroxyfenyl)propan-1-ol, PRESSONEX), **methoxamin (8-6)**, 2-amino-1-(2,5-dimethoxyfenyl)propan-1-ol, ROLINEX, VASOXINE) a **fenylefrin (8-7)**, (*R*)-(-)-1-(3-hydroxyfenyl)-2-methylaminoethanol, NEO-SYNEPHRIN, součást kombinovaných přípravků COLDREX, RHINOPRONT, RHINOTUSSAL).

Metaraminol **8-5** lze připravit z propiofenonu, který se převede obvyklým způsobem na 1-(3-hydroxyfenyl)propan-1-on (**8-8**). Po benzylaci hydroxylové skupiny se nitrosuje methylenová skupiny v α -poloze ke karbonylu a vzniklý α -isonitrosoketon **8-9** se zredukuje na α -aminoalkohol. Následuje hydrogenolýza chránící benzylové skupiny a rezoluce pomocí kyseliny L-(+)-vinné. Alternativní postup využívá fermentačního způsobu přípravy ketolu **8-10**, při kterém vzniká stereoisomer s požadovanou konfigurací *R* (jde o analogii se syntézou (-)-efedrinu **7-125a** - viz odst. 7.4.4, schéma 7.48). Následuje redukční aminace a separace vzniklých diastereoisomerů krystalizací (schéma 8.5).

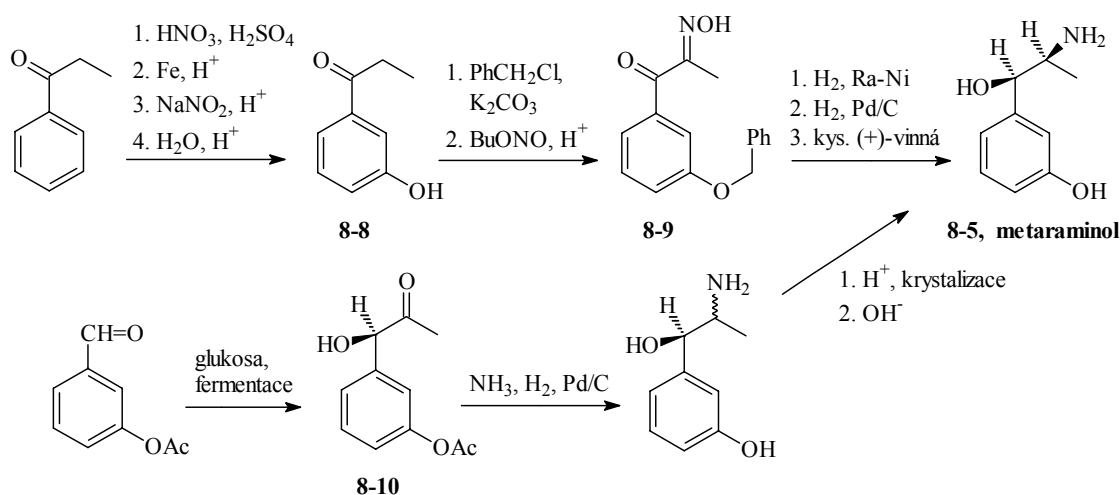


Schéma 8.5 Syntéza metaraminolu **8-5**