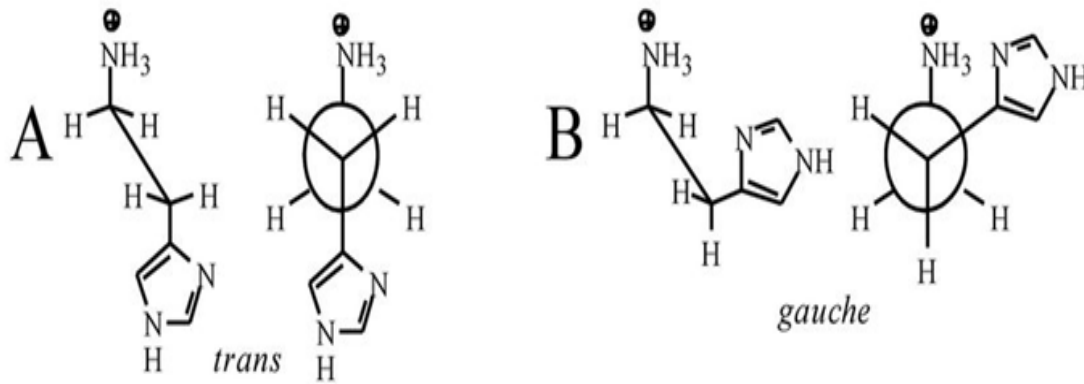
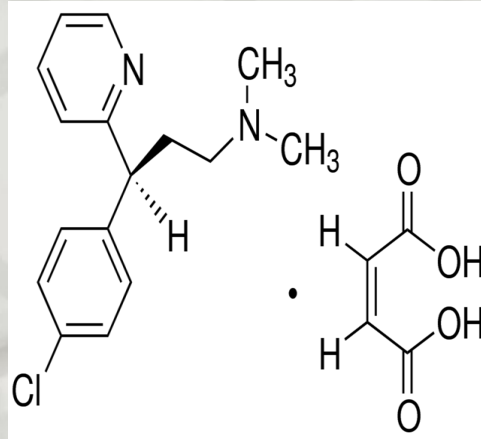


Histamine



Histamin akiraldır ancak histamin reseptörleri yüksek stereoselektivite gösterir. Trans konformer H1 ve H2 reseptörlerine gauche ise H3 reseptörüne affinite gösterir.

- H1-Reseptör antagönistlerinin büyük bir kısmı kiral moleküllerdir ve aktiviteleri stereoselektiftir



S-(+)-Klorfeniramin (S-(+)-deksklorfeniramin),

R-(+)-izomerinden 200 kez **daha aktif**

- Stereoizomerlerin biyolojik aktiviteleri karşılaştırıldığında,
 - İzomerlerden sadece birinin daha az olmakla birlikte her ikisinin de aynı derecede aktif olduğu örnekler var
 - Daha çok her iki izomer de aynı aktiviteyi farklı miktarlarda gösterir

Stereoselektif bir aktivitede,

- rasemik karışımdaki izomerlerden daha aktif olana **eutomer** (*eu*)
- daha az aktif olana ise **distomer** (*dis*) denir

Enansiyomerlerin aktivite veya afinitelerinin oranı **eudismik oran**

Antagonistler, reseptöre yüksek afinite gösteren bileşikler, yüksek *eudismik* oran gözlenir