

ЮЖНО-КАЗАХСТАНСКАЯ ГОСУДАРСТВЕННАЯ
ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ
АКАДЕМИЯ

Кафедра фармакогнозии и химии

Презентация

Тема: Производные салициловой
кислоты, п-аминобензойной
кислоты, применяемые в медицине.

Готовыла: Хурматова С.Н.

Группа: 207 «А» ФР

Приняла: Дильдабекова Л.А.

План.

- Салициловая кислота
- 1 Распространение в природе
- 2 Синтез
- 3 Физические свойства
- 4 Химические свойства
- 4.1 Салицилаты
- пара-аминобензойной кислота
- 1 Биосинтез
- 2 Заключение
- 3 Литература

Салици́ловая кислота

- Салици́ловая кислота (от лат. *salix* «ива», из коры которой она была впервые выделена) — 2-гидроксibenзойная или фенольная кислота, $C_6H_4(OH)COOH$; бесцветные кристаллы, хорошо растворима в этаноле, диэтиловом эфире и других полярных органических растворителях, плохо растворима в воде (1,8 г/л при 20 °C).
- Выделена из ивовой коры итальянским химиком Рафаэлем Пириа и затем синтезирована им же.

Распространение в природе

- В природе встречается в растениях в виде производных — главным образом в виде гликозида метилового эфира (в частности, салициловая кислота была впервые выделена из коры ивы, откуда и происходит название), свободная салициловая кислота наряду с салициловым альдегидом в небольших количествах содержится в эфирном масле, выделяемых из цветов некоторых видов спиреи (*Spiraea ulmaria*, *Spiraea digitata*).

Синтез

- 2-оксибензойную (салициловую) кислоту получают из фенолята натрия и углекислого газа в автоклавах при 180°C с последующей обработкой продукта реакции соляной кислотой (реакция Кольбе — Шмитта):

Физические свойства

- Салициловая кислота легкорастворима в этаноле, диэтиловом эфире, малорастворима в сероуглероде. Растворимость в воде (г/л): (0 °С), 1,8 (20 °С), 8,2 (60 °С), 20,5 (80 °С).

Химические свойства

- Является двухосновной кислотой (очень слабой по второй ступени): $pK_1 = 2,97$ $pK_2 = 13.82$.
- Реакционная способность бензольного ядра салициловой кислоты определяется наличием двух заместителей с противоположными мезомерным и индуктивным эффектами: донорной гидроксильной и акцепторной карбоксильной: в результате салициловая кислота значительно легче бензойной, но не так активно, как фенол, вступает в реакции электрофильного замещения вследствие стабилизации промежуточного σ -комплекса гидроксильной группой.
- Электрофильное замещение направляется в орто- и пара-положения к гидроксилу и зачастую сопровождается декарбоксилированием: так, нитрование салициловой кислоты приводит к пикриновой кислоте (2,4,6-тринитрофенолу), а бромирование — к 2,4,6-трибромфенолу, хотя сульфирование олеумом идёт без декарбоксилирования и даёт сульфосалициловую (2-гидрокси-5-сульфобензойную) кислоту.

Салицилаты

- Салициловая кислота образует соли — салицилаты.
Некоторые представители:
- Натрия салицилат
- Салицилат аммония

Физиологическая роль и действие салицилатов

- Действительна человека и животных[править | править код]
- Салициловая кислота и салицилаты, а также её сложные эфиры (метилсалицилат) и другие синтетические производные салициловой кислоты (например, ацетилсалициловая кислота — аспирин), обладают выраженным противовоспалительным действием.

Применение в медицине

- Салициловая кислота — активный компонент ивовой коры. Ещё в XIX в. её использовали для лечения ревматизма и мочекишечного диатеза, а сегодня это вещество синтезируют в больших количествах, так как оно служит основой для производства многих лекарств.
- Салициловая кислота обладает слабыми антисептическими, раздражающими и кератолитическими (в больших концентрациях) свойствами и применяется в медицине наружно в мазях и растворах при лечении кожных заболеваний; входит в состав пасты Лассара, присыпки «гальманин», препаратов «мозольная жидкость» и «мозольный пластырь». В аптечной сети продаётся в таких лекарственных формах, как спиртовой раствор для наружного применения (с содержанием салициловой кислоты 1 или 2 %) и мазь (2, 3, 5 и 10-процентная).
- Производные салициловой кислоты также применяются в медицине (салицилат натрия), её амид (салициламид) и ацетилсалициловую кислоту (аспирин) используют как жаропонижающие, противоревматические, противовоспалительные и болеутоляющие средства; фенолсалицилат — как антисептик, пара-аминосалициловую кислоту (структурно близкую с пара-аминобензойной кислотой, необходимой туберкулезным микобактериям, и поэтому метаболически конкурирующую с ней) — как специфическое противотуберкулёзное средство.

- Производные салициловой кислоты также применяются в медицине (салицилат натрия), её амид (салициламид) и ацетилсалициловую кислоту (аспирин) используют как жаропонижающие, противоревматические, противовоспалительные и болеутоляющие средства; фенилсалицилат — как антисептик, пара-аминосалициловую кислоту (структурно близкую с пара-аминобензойной кислотой, необходимой туберкулезным микобактериям, и поэтому метаболически конкурирующую с ней) — как специфическое противотуберкулёзное средство.



Другие сферы применения

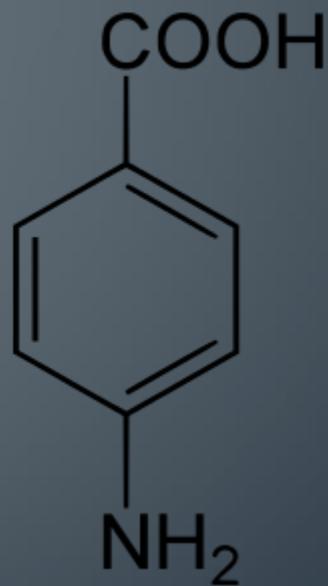
Благодаря антисептическому действию салициловую кислоту используют при консервировании пищевых продуктов;
Производство азокрасителей, душистых веществ (сложных эфиров салициловой кислоты);
Колориметрическое определение Fe и Cu, для отделения тория от других элементов.

Салициловая мазь

- Показания к применению препарата Салициловая мазь: Воспалительные и инфекционные поражения кожи; ожоги, мозоли, оmozолелость, бородавки, гиперкератоз, повышенное потоотделение стоп, выпадение волос, псориаз, обыкновенные угри, жирная себорея, экзема, отрубевидный лишай, дискератоз, ихтиоз, отит (входит в состав комбинированных ПС)



- пара-Аминобензойная кислота (бактериальный витамин Н1, витамин В10, ПАБК) — аминокислота, производное бензойной кислоты, порошок белого цвета, широко распространена в природе.



Биосинтез

- пара-Аминобензоат в природе синтезируется шикиматным путём. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4-дезоксихоризмат. Способностью к синтезу пара-аминобензоата обладают многие микроорганизмы, растения, грибы.
- Рац. формула
- $C_7H_7NO_2$

- пара-Аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина. Являясь составной частью тетрагидрофолата, остаток пара-аминобензойной кислоты участвует в синтезе пуринов и пиримидинов и, следовательно, РНК и ДНК.
- пара-Аминобензойная кислота является «фактором роста» для многих видов бактерий, например, лакто- и бифидобактерий, кишечной палочки. Участвует в синтезе витамина В9, и, как следствие, образовании эритроцитов (эритропоэзе). Также обладает лактогонным свойством (усиливает выделение молока у кормящей женщины), способствует установлению загара.

Эфиры ПАБК вызывают местную анестезию. В медицинской практике используют анестезин (этиловый эфир п-аминобензойной кислоты) и новокаин (N, N-диэтиламиноэтиловый эфир ПАБК). Оба вещества плохо растворимы в воде, поэтому для повышения растворимости анестезин и новокаин применяют в виде солей (гидрохлоридов).

Заключение

- Современная фармацевтическая промышленность предлагает огромное количество лекарств для лечения тех или иных заболеваний. Тем не менее требования к качеству новых лекарственных средств не менее жесткие, чем к качеству давно известных. Благодаря успешно развивающейся науке в области изучения лекарств мы получаем все новые данные о препаратах, которые ежедневно принимают миллионы людей во всем мире. На основе этих знаний исключены из Номенклатуры ЛС многие наиболее опасные и токсичные препараты и энергично внедряются их аналоги, но уже более эффективные и с минимальным количеством побочных эффектов.
- кислота бензойный витамин лекарственный

Литература

- Глава «Салициловая кислота» из книги «Жаропонижающие», Нотнагель Г., 1902 год, стр. 28.
- Беликов В.Г. Учебное пособие по фармацевтической химии-М, изд. Медицина, 1979
- Березовский В.М., Химия витаминов, 2 изд., М., изд. «Пищевая промышленность» 1973
Критчфилд Ф. Анализ основных функциональных групп в органических соединениях.-М, изд. «Мир», 1965