

**«АО» Южно-Казахстанская медицинская академия  
Кафедра Химических дисциплин**

# **ПРЕЗЕНТАЦИЯ**

**НА ТЕМУ: ГЕТЕРОФУНКЦИОНАЛЬНЫЕ  
ПРОИЗВОДНЫЕ БЕНЗОЛЬНОГО РЯДА КАК  
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА.**

*Выполнил: Мадениетов Ж.К.*

*Группа: В-СТОА-03-19*

*Принял:*

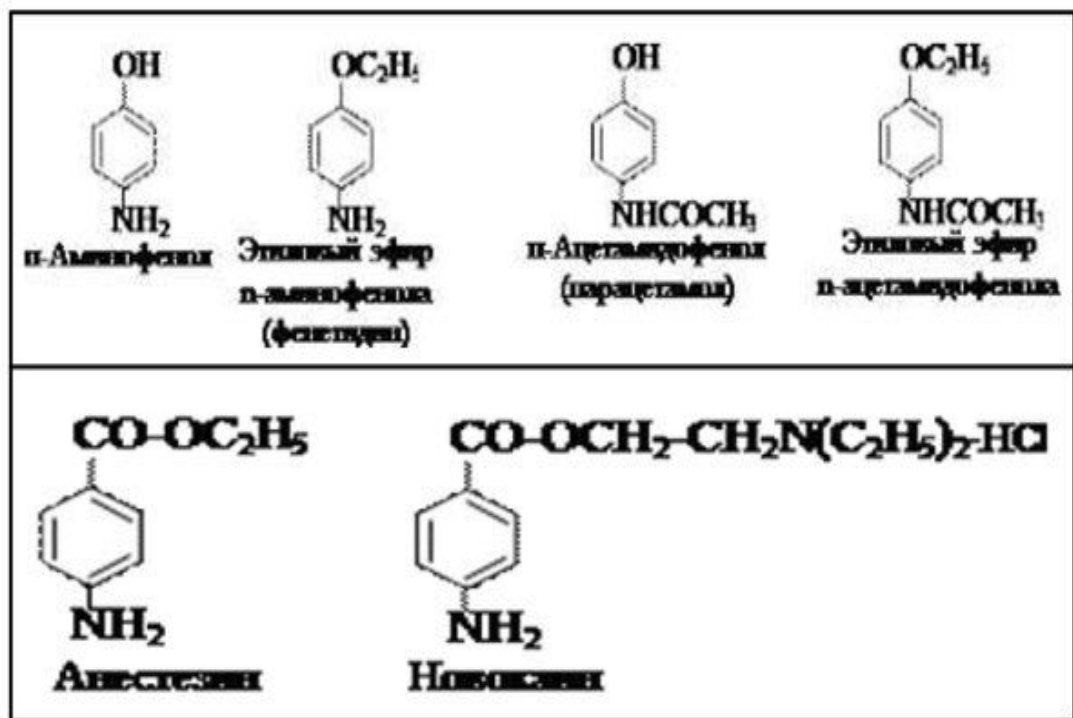
ШЫМКЕНТ 2019

# ПЛАН:

1. Введение
2. п-Аминофенол и его производные.
3. Салициловая кислота и ее производные.  
Номенклатура, строение, способы получения и химические свойства.
4. Номенклатура, строение, способы получения и химические свойства сульфаниловой кислоты и ее производных.
5. Практическое применение, значение в медицине и фармации п-аминобензойной (ПАБК), сульфаниловой и салициловой кислот.
6. Использованная литература

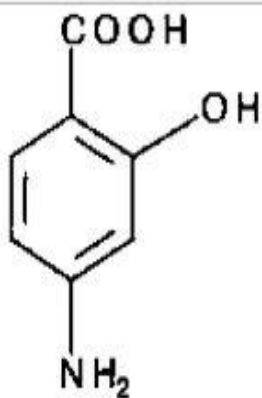
## ВВЕДЕНИЕ

- Сам бензол может быть причиной острых и хронических отравлений. Он оказывает раздражающее действие на кожу, пары его в большой концентрации вызывают возбуждение, расстройство дыхания.
- Но в последние десятилетия характеризуются появлением множества новых лекарственных средств и препаратов.
- Тем не менее большое значение продолжают сохранять некоторые группы известных ранее лекарственных средств, в частности таких, структурную основу которых составляет бензольное ядро.

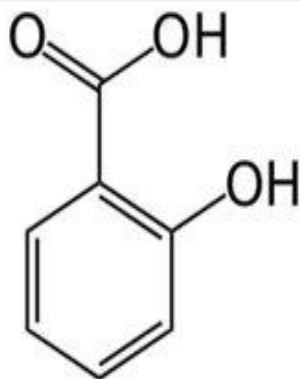


**ГЕТЕРОФУНКЦИОНАЛЬНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ  
БЕНЗОЛЬНОГО РЯДА КАК ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА**

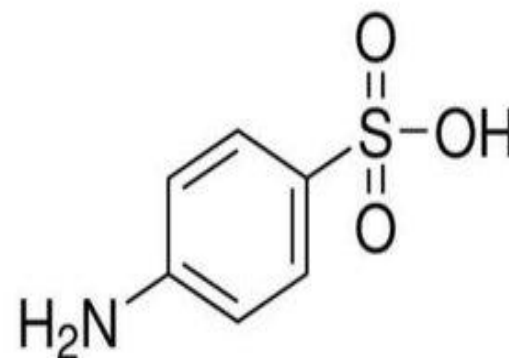
ПАСК



Салициловая кислота



Сульфаниловая кислота



ПАСК

Противотуберкулезное средство

Салициловая кислота

Антиспазматическое, жаропонижающее и антигрибковое действие

Сульфаниловая кислота

Антибактериальной активностью

# ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ

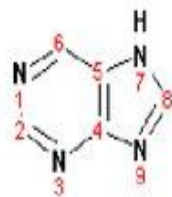
Гетероциклы	Реакционная способность	Нуклеофильность	Электрофильность
Могут рассматриваться как карбоциклические соединения с гетерозаместителями (гетероатомами) в цикле	Особенности реакционной способности гетероциклических соединений по сравнению с их карбоциклическими аналогами обуславливаются именно такими гетерозаместителями	Так, для пятичленных гетероциклов с одним гетероатомом (пиррольный тип), ароматический секстет электронов распределяется по пяти атомам цикла так, что ведёт к высокой нуклеофильности этих соединений.	Электрофильность гетероароматических соединений растёт при падении $\pi$ -электронной плотности, то есть при увеличении числа гетероатомов и, при их равном числе, выше для шестичленных, по сравнению с пятичленными, гетероциклами



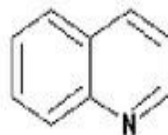
пиридин



пиримидин



пурин



хинолин

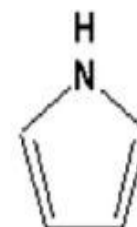
Шестичленные



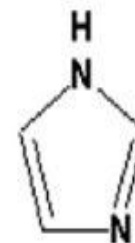
фуран



тиофен



пиррол



имидазол

Пятичленные

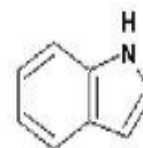
## СТРОЕНИЕ И НОМЕНКЛАТУРА

система является циклической

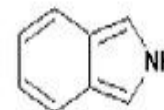
цикл является плоским

имеется сопряжение по всему циклу

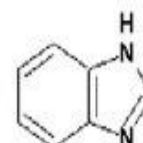
число р-электронов, участвующих в сопряжении, согласно правилу Хюккеля



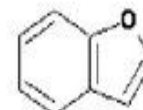
I



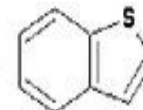
II



III



IV



V

Конденсированные

# АЛКАЛОИДЫ

Используются  
с древности

Насчитывается  
свыше 10000

Не существует  
единой  
классификации

## 4 Основных условия

Атом N часть гетероциклической системы

Сложная молекулярная структура

Фармакологическая активность

Растительное происхождение



# ОСНОВНЫЕ ГРУППЫ АЛАКАЛОЙДОВ

Истинные Алкалоиды

Содержат атом **N** в гетероцикле. Биогенетическими предшественниками являются аминокислоты

Протоалкалоиды

Атом **N** в боковой цепи. Биогенетическими предшественниками являются, так же, аминокислоты

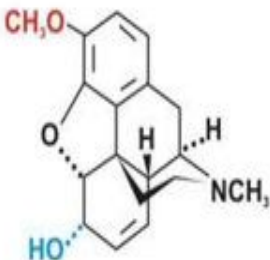
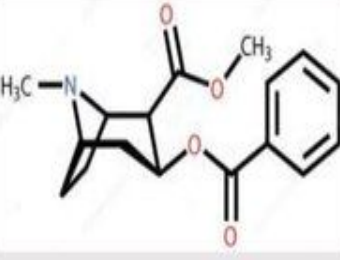
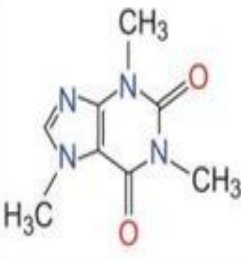
Полиаминные

Пептидные

Псевдоалкалоиды

Предшественниками аминокислоты не являются. В основном это терпеноидные и стероидные алкалоиды

# ВАЖНЕЙШИЕ АЛКАЛОИДЫ

Атропин	Кодеин	Кокаин	Кофеин	Пилокарпин
<p>Применяется в медицине как антидот при отравлениях антихолинэстеразными веществами, такими. Он эффективно снимает спазмы бронхов, расширяет зрачок и т.д.</p>	<p>Самый распространенный опиный алкалоид. Кодеин - наркотический анальгетик и противокашлевое средство.</p>	<p>Это мощный местный анестетик используется для смягчения болей, сопровождающих последнюю стадию рака. Его действие на ЦНС уменьшает седативный эффект и ослабление дыхания от применения морфина</p>	<p>Кофеин оказывает возбуждающее действие на ЦНС и ССС, используется для стимуляции сердечной деятельности, дыхания и как противоядие при отравлении морфином и барбитуратами</p>	<p>Используют для лечения глаукомы, усиления деятельности потовых и слюнных желез, при водянке на почве нефрита, при некоторых отравлениях (ртутью или свинцом) и др.</p>
	 <p>The image shows the chemical structure of Codeine, a pentacyclic alkaloid. It features a morphine skeleton with a hydroxyl group (HO) at the 3-position and a methyl group (NCH<sub>3</sub>) on the nitrogen atom. A hydroxyl group (CH<sub>3</sub>O) is also present at the 6-position.</p>	 <p>The image shows the chemical structure of Cocaine, a tropane alkaloid. It consists of a tropane ring system with a methyl group (H<sub>3</sub>C) on the nitrogen, a methyl ester group (COOCH<sub>3</sub>) at the 2-position, and a benzoyloxy group (COO-C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>) at the 3-position.</p>	 <p>The image shows the chemical structure of Caffeine, a purine alkaloid. It features a fused pyrimidine-imidazole ring system with methyl groups (CH<sub>3</sub>) attached to the nitrogen atoms at positions 1, 3, and 7.</p>	

Морфин	Никотин	Стрихнин	Хинин	Эфедрин
--------	---------	----------	-------	---------

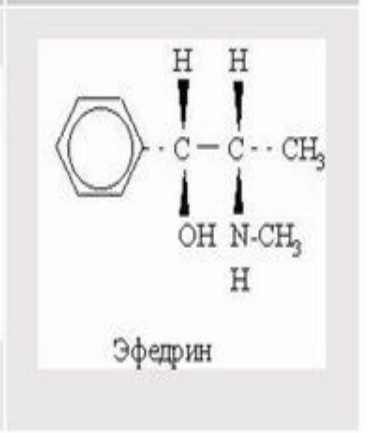
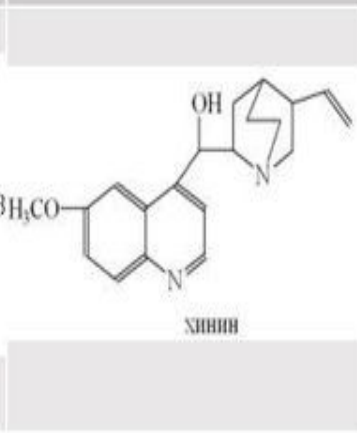
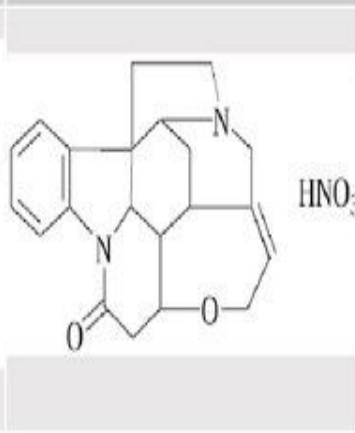
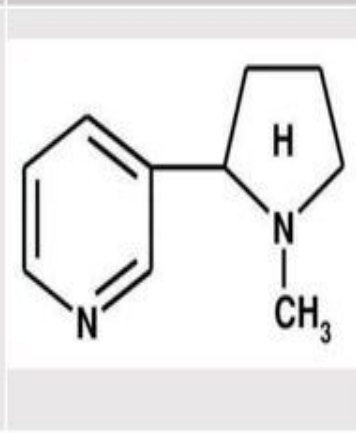
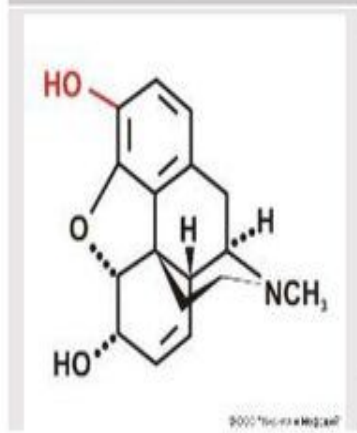
является важнейшим опиоидным алкалоидом. Он представляет собой наркотический анальгетик и применяется для обезболивания. Однако длительное его употребление приводит к привыканию и вызывает тошноту, рвоту, запоры.

В малых количествах он стимулирует дыхание, но в больших - подавляет передачу импульса в симпатических и парасимпатических нервных узлах. Никотин используется как инсектицид в аэрозолях и порошках

Он применяется при параличах, связанных с поражениями ЦНС, при хронических расстройствах ЖКТ и как общее тонизирующее при различных расстройствах питания и слабости,

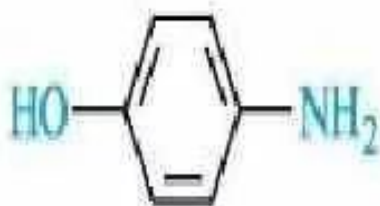
До Второй мировой войны хинин был единственным антималярийным препаратом. Хинин применяют также для приготовления шипучих тонизирующих напитков

Китайцы используют его более 5000 лет. Он применяется как мидриатик и для расширения бронхов. Он возбуждает симпатическую нервную систему, вызывает сужение сосудов, стимулирует сердечную деятельность

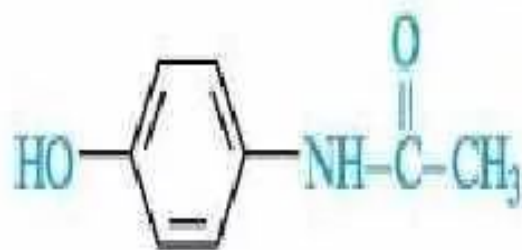


## **п-Аминофенол и его производные.**

Как гетерофункциональное соединение **п-аминофенол** может образовывать производные по каждой функциональной группе в отдельности и одновременно по двум функциональным группам. Сам **п-аминофенол** ядовит; интерес для медицины представляет его производное - **парацетамол**, оказывающий анальгетическое (обезболивающее) и жаропонижающее действие.

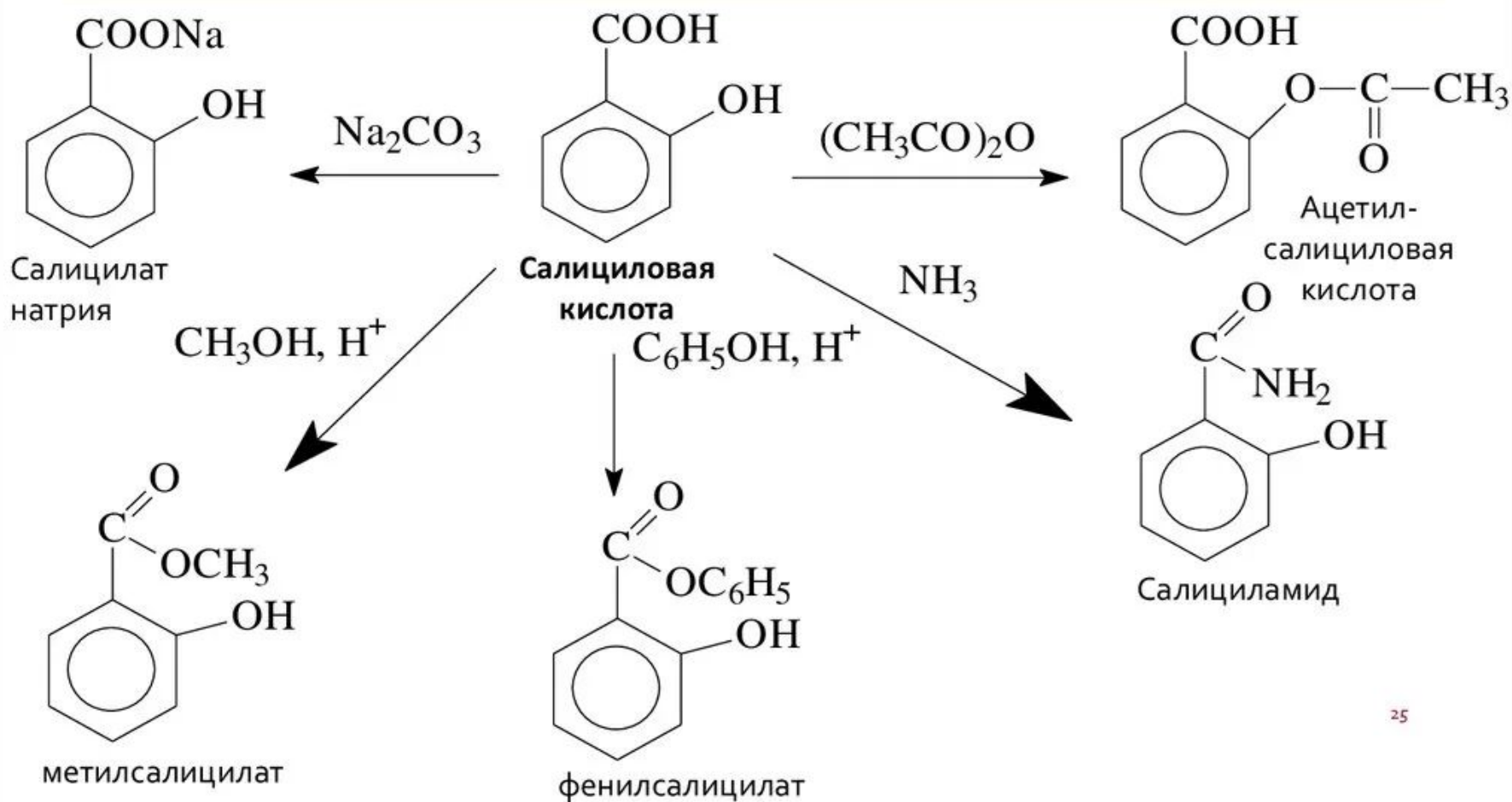


**п-аминофенол**



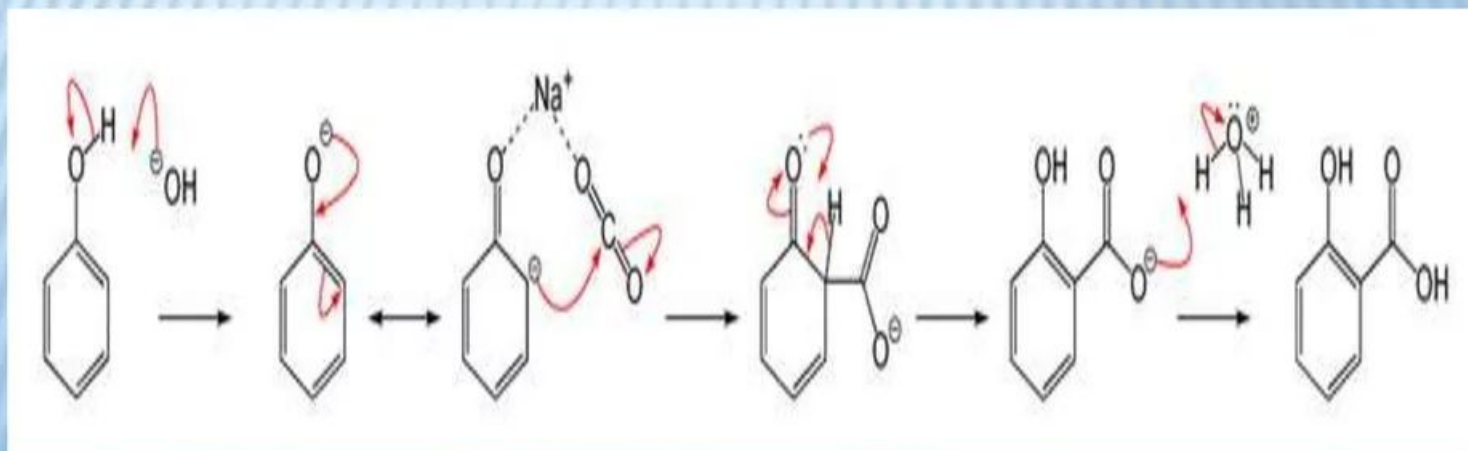
**п-ацетамидофенол (парацетамол)**

# ПРОИЗВОДНЫЕ САЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ КАК ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА



# ПОЛУЧЕНИЕ САЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

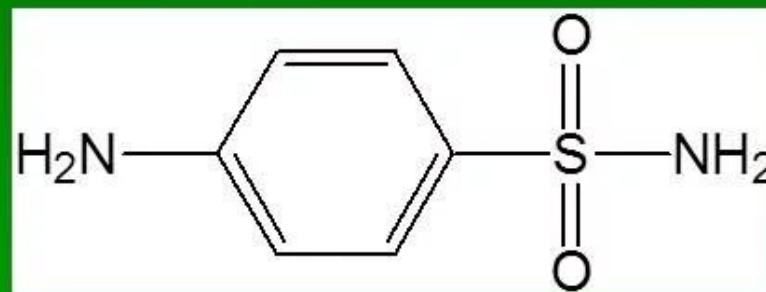
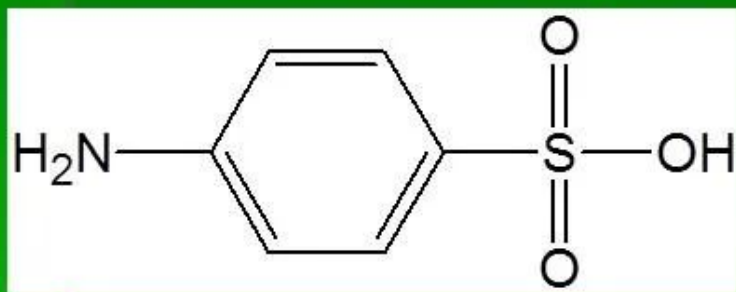
- ✘ При нагревании салициловая кислота декарбоксилируется до фенола, в промышленности салициловую кислоту обычно получают обратной реакцией — карбоксилированием фенолята натрия углекислым газом при 150–180 °С и давлении 5 атм (реакция Кольбе — Шмитта):



## Сульфаниловая кислота (*n*-аминобензолсульфо кислота)

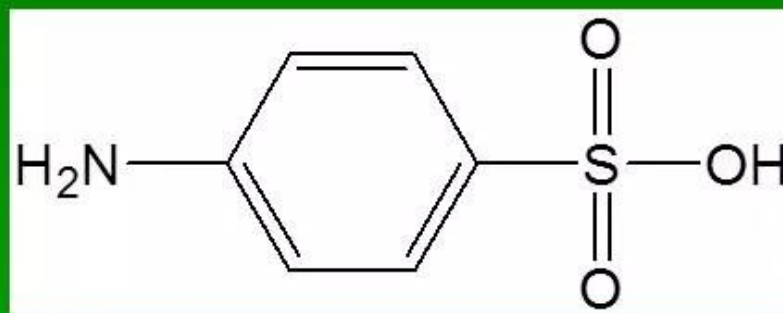
– продукт замещения группы –OH в молекуле сульфатной кислоты  $H_2SO_4$  на остаток анилина  $-C_6H_5-NH_2$ .

Она не является лекарственным веществом.



– **амид сульфаниловой кислоты (сульфаниламид)** – источник для получения большого количества лекарственных препаратов, которые близки по химической структуре и лечебным действием – **сульфаниламидных препаратов**, общая формула которых

# Сульфаниловая кислота (p-аминобензолсульфокислота)



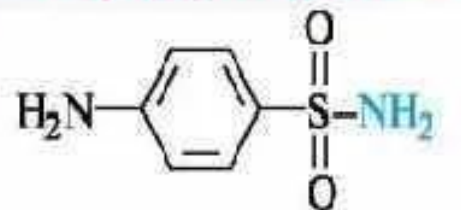
– продукт замещения группы –OH в молекуле сульфатной кислоты  $\text{H}_2\text{SO}_4$  на остаток анилина –  $\text{C}_6\text{H}_5\text{–NH}_2$ . Она не является лекарственным веществом.



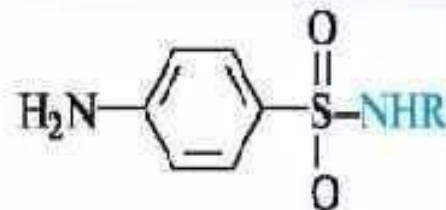
**Сульфаниловая кислота и ее производные.** Сульфаниловая (п-аминобензолсульфоновая) кислота существует в виде диполярного иона.



Амид сульфаниловой кислоты (сульфаниламид), известный как **стрептоцид**, является родоначальником группы лекарственных средств, обладающих антибактериальной активностью и называемых **сульфаниламидами**.



сульфаниламид (стрептоцид)

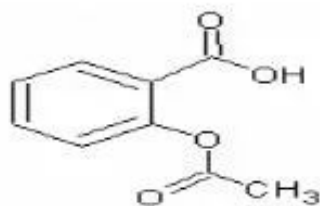
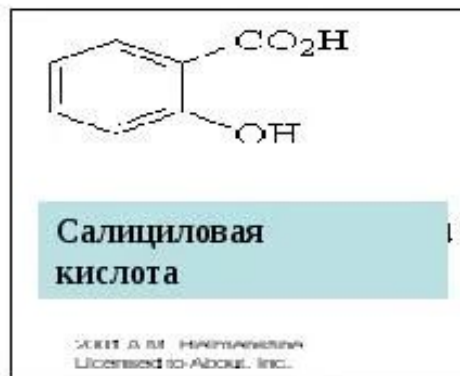


замещенный сульфаниламид

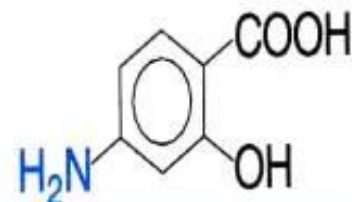
Все сульфаниламиды содержат **сульфонамидную группу  $-\text{SO}_2\text{NH}_2$** . Замена ее другими группами приводит к потере антибактериальной активности.

# Лекарственные средства на основе гетерофункциональных соединений

## Производные салициловой кислоты

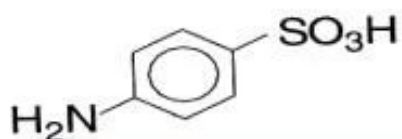


**Аспирин  
(ацетилсалициловая  
кислота)**

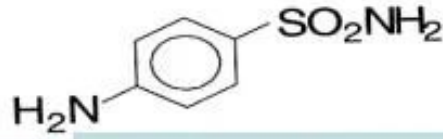


**Пара-аминосалициловая  
кислота**

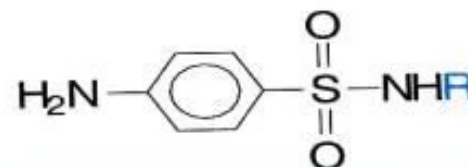
## Производные сульфаниловой кислоты



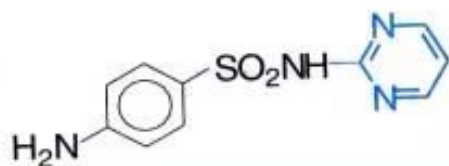
**Сульфаниловая кислота**



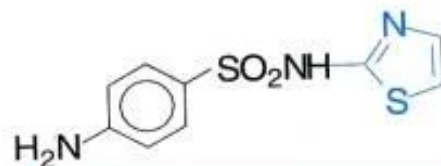
**Сульфаниламид**



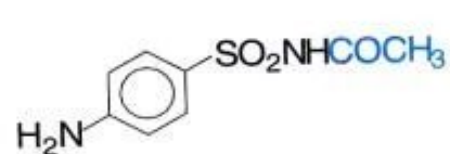
**Замещенный сульфаниламид**



**Сульфазин**



**Сульфатиазол**



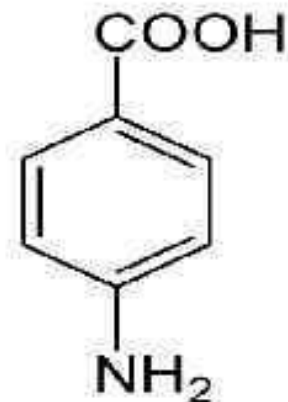
**Альбуцид**

# пара-Аминобензойная кислота (ПАБК) и ее производные.

**п-Аминобензойная кислота** обладает свойствами как ароматических кислот, так и ароматических аминов. Ее называют фактором роста микроорганизмов, поскольку **ПАБК** участвует в синтезе фолиевой кислоты (витамина  $B_9$ ).

**Эфиры** ароматических аминокислот обладают общим свойством — способностью вызывать **местную анестезию**

В медицине используют **анестезин** (этиловый эфир ПАБК) и **новокаин** (Р-диэтил-иноэтиловый эфир ПАБК).

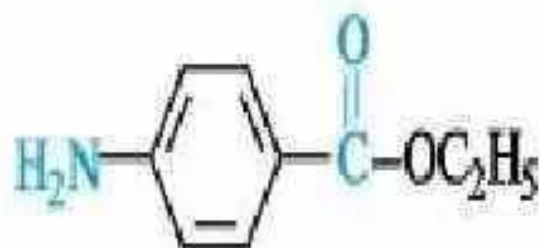


п-Аминобензойная кислота

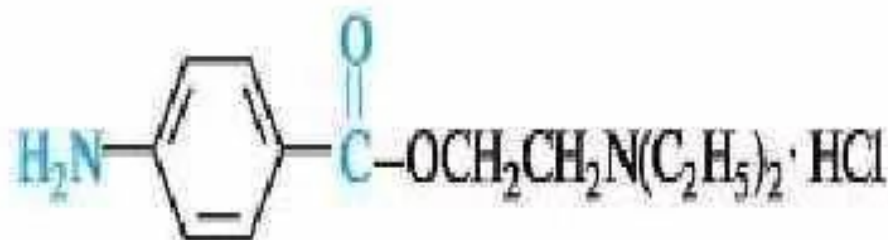


новокаин 47

**п-Аминобензойная кислота (ПАБК) и ее производные.** Эфиры ароматических аминокислот способны в той или иной степени вызывать местную анестезию. Особенно заметно это свойство у пара-производных. В медицине используют анестезин (этиловый эфир ПАБК) и новокаин (2-диэтиламиноэтиловый эфир ПАБК). Новокаин применяют в виде соли (гидрохлорида), что связано с необходимостью повышения его растворимости в воде.



анестезин



новокаин

# Это интересно!

- Пара-аминобензойная кислота необходима для роста микроорганизмов (в том числе и патогенных).
- Сульфаниломидные препараты, сходные по химическому строению с пара-аминобензойной кислотой соединяются с белками бактерий и тем самым лишают их возможности расти.



# ИСПОЛЬЗОВАННАЯ ЛИТЕРАТУРА:

1. Андреева Н.А., Витамины группы фолиевой кислоты, М., Издательство АН СССР, 1963. - 67 с.
2. Артеменко А.И. Удивительный мир органической химии. - М., изд. Высшая школа, 2005
3. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия - М., изд. Высшая школа, 1985
4. Беликов В.Г. Учебное пособие по фармацевтической химии-М, изд. Медицина, 1979
5. Березовский В.М., Химия витаминов, 2 изд., М., изд. «Пищевая промышленность» 1973
6. Критчфилд Ф. Анализ основных функциональных групп в органических соединениях.-М, изд. «Мир», 1965
7. Максютин Н.П., Каган Ф.Е., Кириченко Л.А., Митченко Ф.А. Методы анализа лекарств. - К, изд. Здоровье, 1984. 221 с.