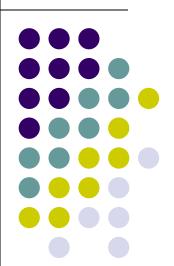
Лекция № 6

Химико-фармацевтические препараты



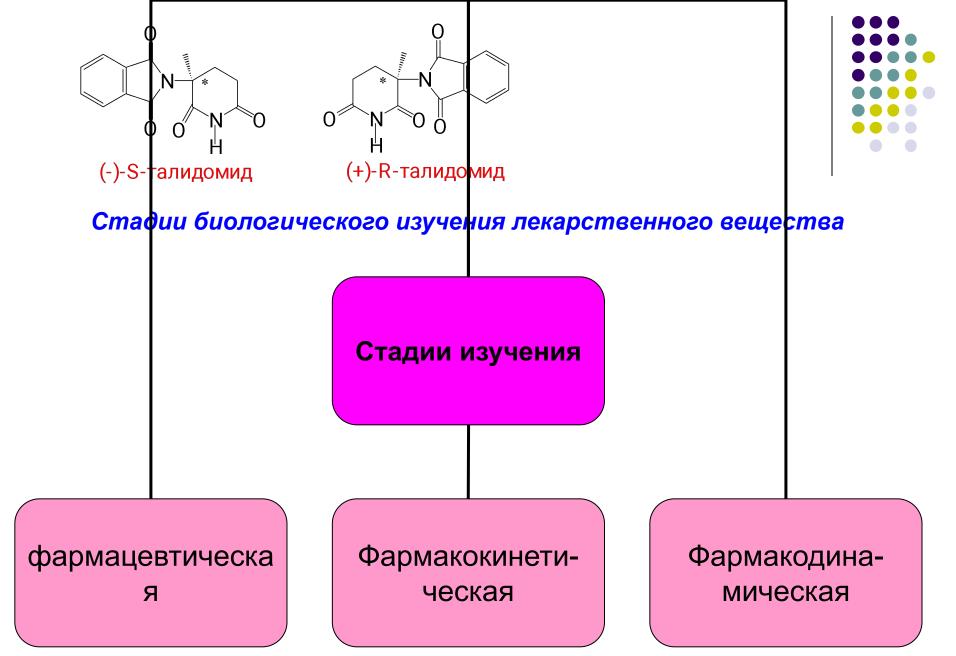
Лекарственные вещества - биологически активные вещества, применение которых для профилактики и лечения заболеваний человека разрешено законодательно

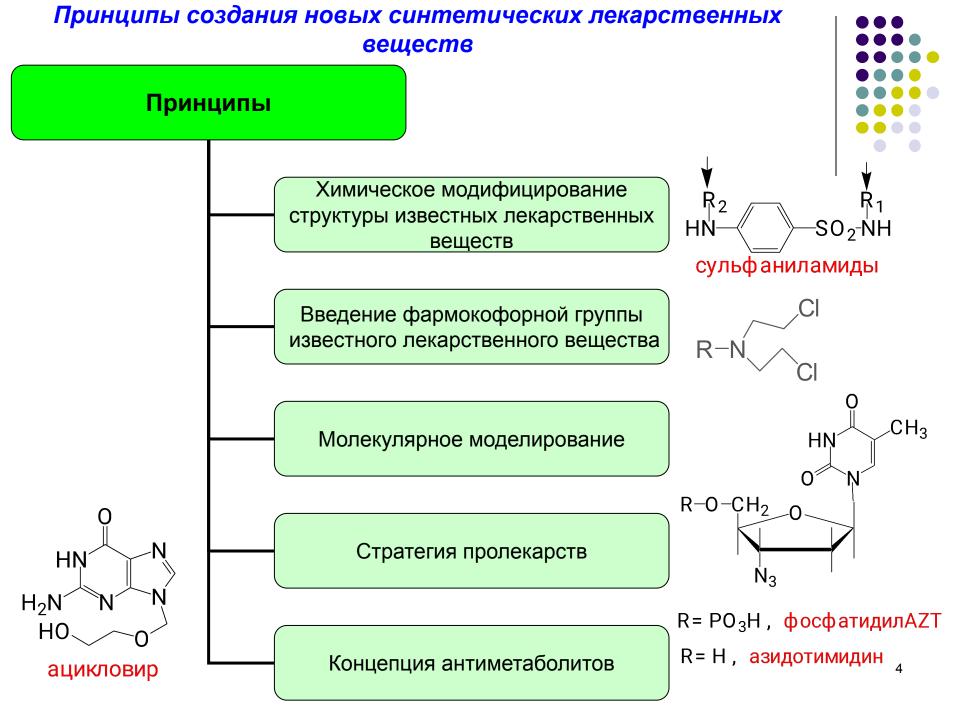


Высокая биологическая активность Избирательность Продолжительность лечебного действия Должно быть не токсичным Не должно вызывать побочных действий

е должно вызывать побочных действий
Высокая чистота
Высокая стабильность при хранении
Не слишком высокая себестоимость

Доступность

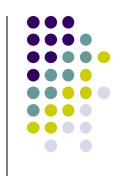






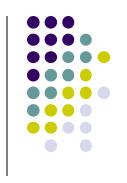


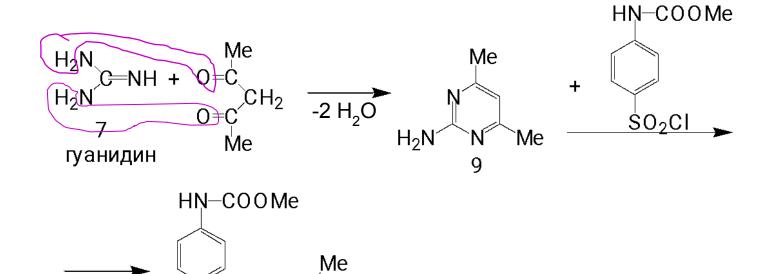
Противомикробные средства



Синтез стрептоцида:

$$O$$
 HN—COMe + H_2N — HCI -AcOH — NH_2 — SO_2CI — 7 — 8





10

сульф адимезин

SO₂-N

Η

Мe

Синтез триметоприма

Антибиотики

бензилпенициллин

ампициллин

Антибиотики ряда фторхинолонов

$$CI$$
 OEt
 $CH==C(COOEt)_2$
 3

EtOOC F COOEt N=CH

фторхлоранилин этоксиметиленмалонат

EtOOC

$$CH$$
 COOEt
 CH COOEt
 CH COOEt
 CH COOEt
 CH $COOET$
 $COOET$

норфлоксацин

Антибиотики - цефалоспорины

$$R_2$$
- C - NH H S - CH_2R $COOH$

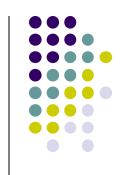


Представитель	1го поколения	2го поколения	3го поколения
R1	—S—N N H	-CI	—О- <mark>С-</mark> Ме О
R2	H Ph-C-NH ₂	H Ph—C—NH ₂	N C N-O Me
	цефатриазин	Цефаклор	цефатоксин

Противотуберкулезные препараты

$$O=C-NHNH_2$$
 $O=C-NHN$ $O=C-NHN$

фтивазид





$$\begin{array}{c|c} CH_3 & CH_3 \\ \hline & HNO_3 & 1. \ Na_2S \\ \hline & 2. \ (CH_3CO)_2O \\ \hline & NHC \\ \hline & CH_3 \\ \hline & CH=NNHCNH_2 \\ \hline & + \ H_2NNHCNH_2 \\ \end{array}$$

тиоацетазон

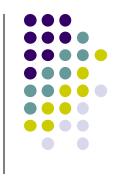
СН3

1.
$$MnO_2$$
2. H_2
1. $H_2NNHCNH_2$
2. $HO-CH_2SO_3Na$
гидроксиметилсульфонат Na
СН= $NNHCNH_2$
 NH_2
1. $H_2NNHCNH_2$
СН= $NNHCNH_2$
 $NHCH_2SO_3Na$
 $NHCH_2SO_3Na$
СОЛЮТИЗОН

Антисептики

$$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \hline \\ \text{AlCl}_3 \\ \hline \\ \text{AlCl}_3 \\ \hline \\ \text{I} - \ddot{\text{o}} \dot{\text{e}} \dot{\text{i}} \dot{\text{e}} \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \text{I} - \ddot{\text{o}} \dot{\text{e}} \dot{\text{i}} \dot{\text{e}} \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \\ \text{I} - \ddot{\text{o}} \dot{\text{e}} \dot{\text{i}} \dot{\text{e}} \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \\ \text{OH} \\ \\ \text{CH}_3 \\ \hline \\ \\ \text{CH}_3$$

Противовирусные средства



3-тиосемикарбазон-1-метилизатина

àäàì àí òàí àì èí

Br NHCHO

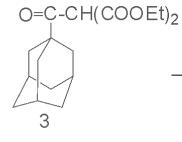
$$HCI$$
 H_2O
 $-CH_2OH$
 H_2O
 $-CH_2OH$

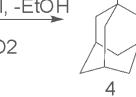
адамантан

адамантанамин



- 1. SOCI2
- 2. Et-OMg-CH(COOEt)2





Аc

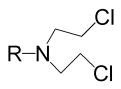
- 1. HCOOH, HCONH2
- 2. HCI

Me-CH-NH₂ * HCI

ремантадин

Противораковые средства

1. Вещества с дихлордиэтиламинным фрагментом



 $R=MeCH(CI)CH_2$ новэмбихин

 $R = -C_6H_4CH_2CH(NH_2)COOH$ сарколизин

$$R-NH_2 + CI-CH_2CH_2OH \longrightarrow R-N(CH_2CH_2OH)_2 \xrightarrow{+SOCl_2}$$

$$\longrightarrow R-N(CH_2CH_2OH)_2$$

$$\longrightarrow R-N(CH_2CH_2CI)_2$$

$$O=PCI_3 + HO(CH_2)_3NH_2 \rightarrow O_PCI \rightarrow O_PNR C$$

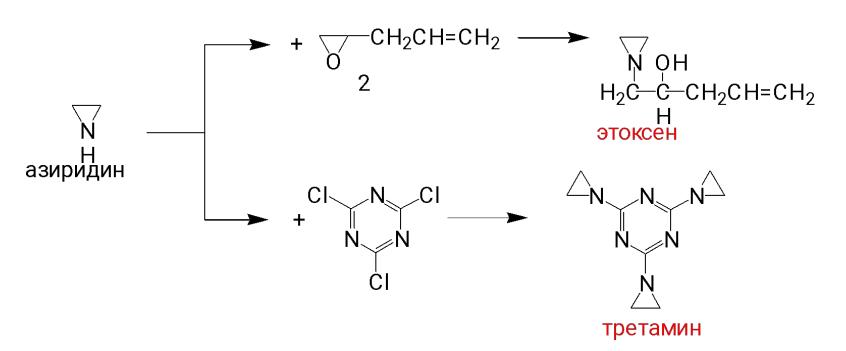
R=H, циклофосфан $R=CH_2CH_2CI$, трофосфамид



2. Вещества группы азиридина и оксирана

CI—CH
$$_2$$
CH $_2$ CI + NH $_3$ — CaO — N N H азиридин





$$S = P - N$$

$$\begin{array}{c|c} O & O \\ N-P-N & N-P-N \end{array}$$

дипин

тиофосфамид

$$3 \frac{1}{N} + S = PCI_3$$
 \longrightarrow $S = P - N$ тиофосфамид

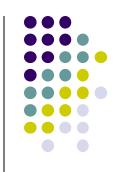
3. Вещества антиметаболитного действия

F-CH₂COOEt Et-C F
$$H_3$$
CS NH₂

+ C H 3

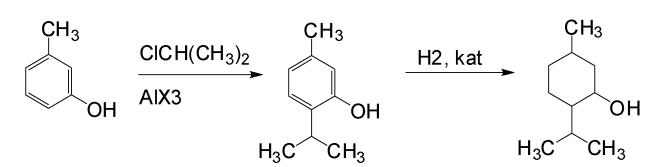
-EtONa
-H₂O ONa
-EtONa
-H₂O

$$H_3$$
CS N H_2 O, HCI H_2 O, HCI H_3 CS N H_4 H_4 СS H



Некоторые широкоприменяемые лекарственные средства

1. Ментол





2. Аспирин

OH NaOH
$$+ CO_2$$
 $+ CO_2$ $+ COONa$ $+ COOH$ $+$

аспирин