

**«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:

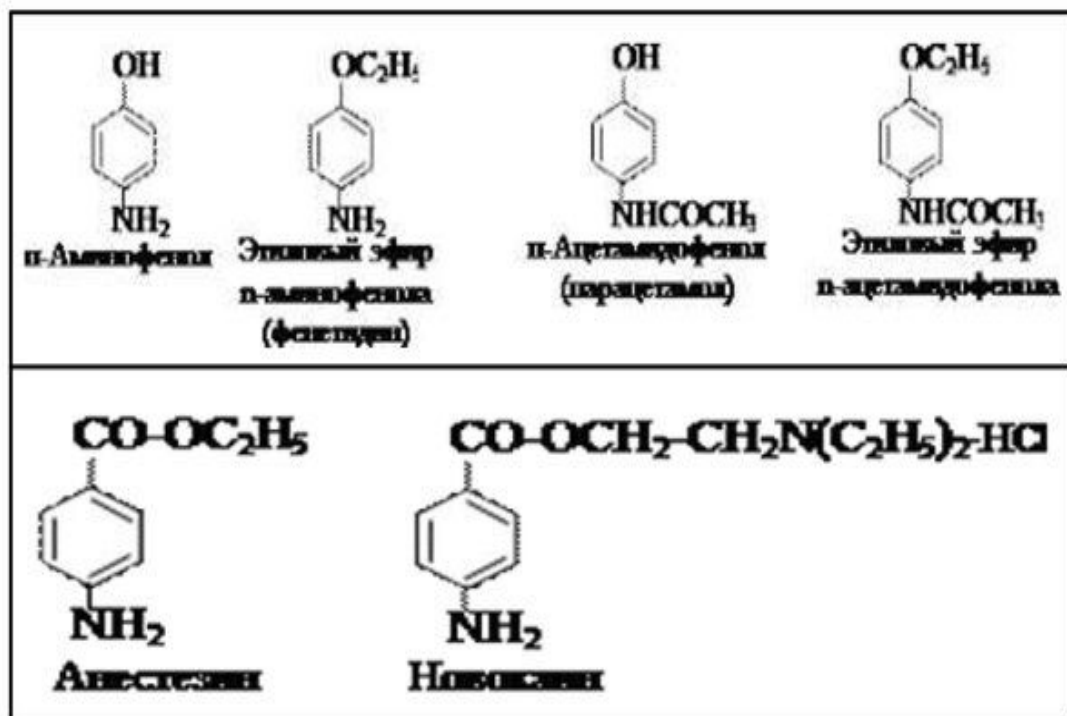
ШЫМКЕНТ 2019

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

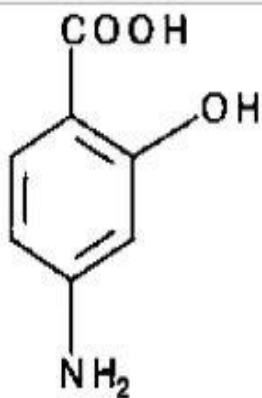
ВВЕДЕНИЕ

- 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.

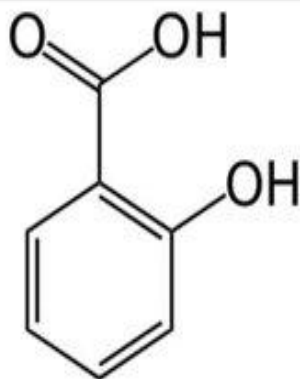


**ГЕТЕРОФУНКЦИОНАЛЬНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ
БЕНЗОЛЬНОГО РЯДА КАК ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА**

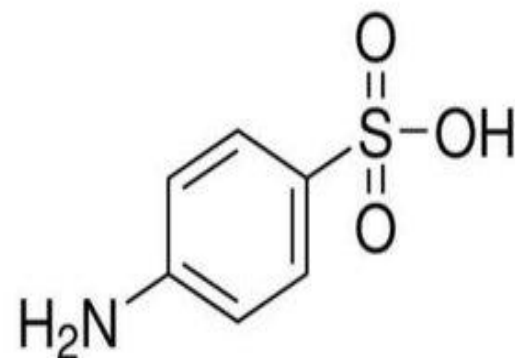
ПАСК



Салициловая кислота



Сульфаниловая кислота



ПАСК

Противотуберкулезное
средство

Салициловая кислота

Антиспазматическое,
жаропонижающее и
антигрибковое действие

Сульфаниловая кислота

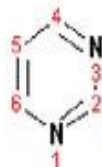
Антибактериальной
активностью

ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ

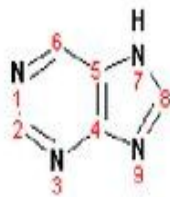
Гетероциклы	Реакционная способность	Нуклеофильность	Электрофильность
Могут рассматриваться как карбоциклические соединения с гетерозаместителями (гетероатомами) в цикле	Особенности реакционной способности гетероциклических соединений по сравнению с их карбоциклическими аналогами обуславливаются именно 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 п-электронной плотности, то есть при увеличении числа гетероатомов и, при их равном числе, выше для шестичленных, по сравнению с пятичленными, гетероциклами



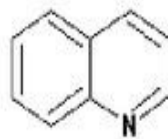
пиридин



пиримидин



пурин



хинолин

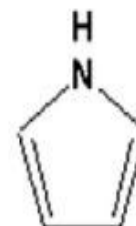
Шестичленные



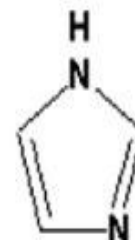
фуран



тиофен



пиррол



имидазол

Пятичленные

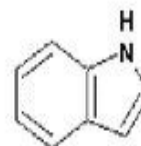
СТРОЕНИЕ И НОМЕНКЛАТУРА

система является циклической

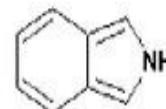
цикл является плоским

имеется сопряжение по всему циклу

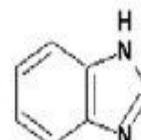
число p-электронов, участвующих в сопряжении,
согласно правилу Хюккеля



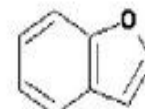
I



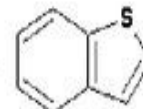
II



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

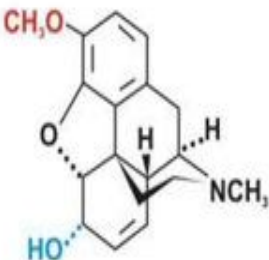
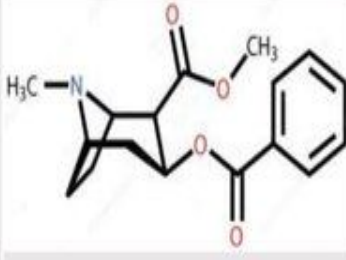
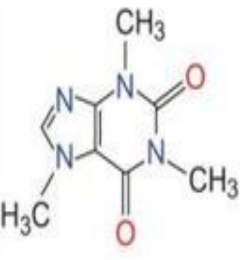
Полиаминные

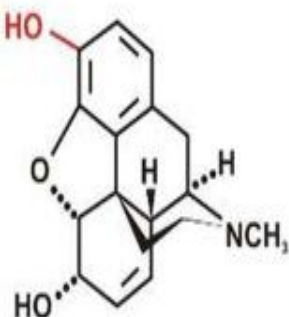
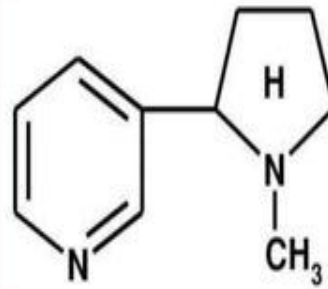
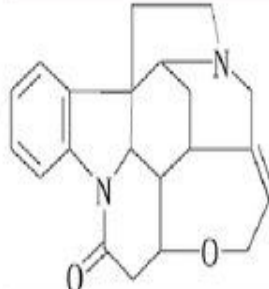
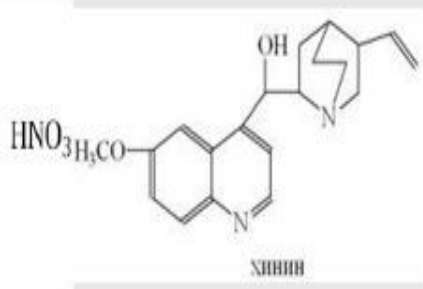
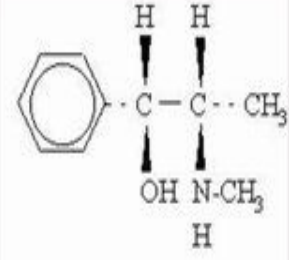
Пептидные

Псевдоалкалоиды

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

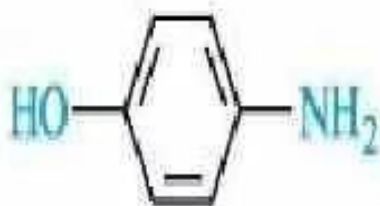
ВАЖНЕЙШИЕ АЛКАЛОИДЫ

Атропин	Кодеин	Кокаин	Кофеин	Пилокарпин
Применяется в медицине как антидот при отравлениях антихолинэстеразными веществами, такими. Он эффективно снимает спазмы бронхов, расширяет зрачок и т.д.	Самый распространенный опиный алкалоид. Кодеин - наркотический анальгетик и противокашлевое средство.	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.	Кофеин оказывает возбуждающее действие на ЦНС и ССС, используется для стимуляции сердечной деятельности, дыхания и как противоядие при отравлении морфином и барбитуратами.	Используют для лечения глаукомы, усиления деятельности потовых и слюнных желез, при водянке на почве нефрита, при некоторых отравлениях (ртутью или свинцом) и др.
				

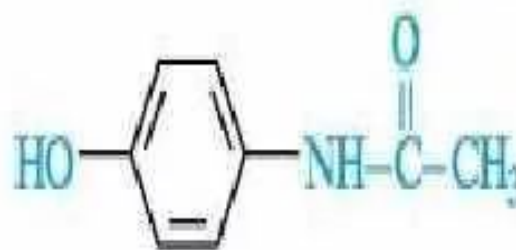
Морфин	Никотин	Стрихнин	Хинин	Эфедрин
является важнейшим опиным алкалоидом. Он представляет собой наркотический анальгетик и применяется для обезболивания. Однако длительное его употребление приводит к привыканию и вызывает тошноту, рвоту, запоры.	В малых количествах он стимулирует дыхание, но в больших - 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
 Chemical structure of Morphin (Morphine) showing the pentacyclic morphinan skeleton with hydroxyl groups at C3 and C6, and an N-methyl group.	 Chemical structure of Nicotinic acid (Pyridine-3-carboxylic acid) showing a pyridine ring with a carboxylic acid group at the 3-position.	 Chemical structure of Strychnine, a complex polycyclic alkaloid with multiple nitrogen and oxygen atoms.	 Chemical structure of Quinine, showing the quinoline core with a quinuclidine moiety and a sugar derivative.	 Chemical structure of Ephedrine, showing a benzene ring attached to a 1-methyl-2-phenylethanol derivative.

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.

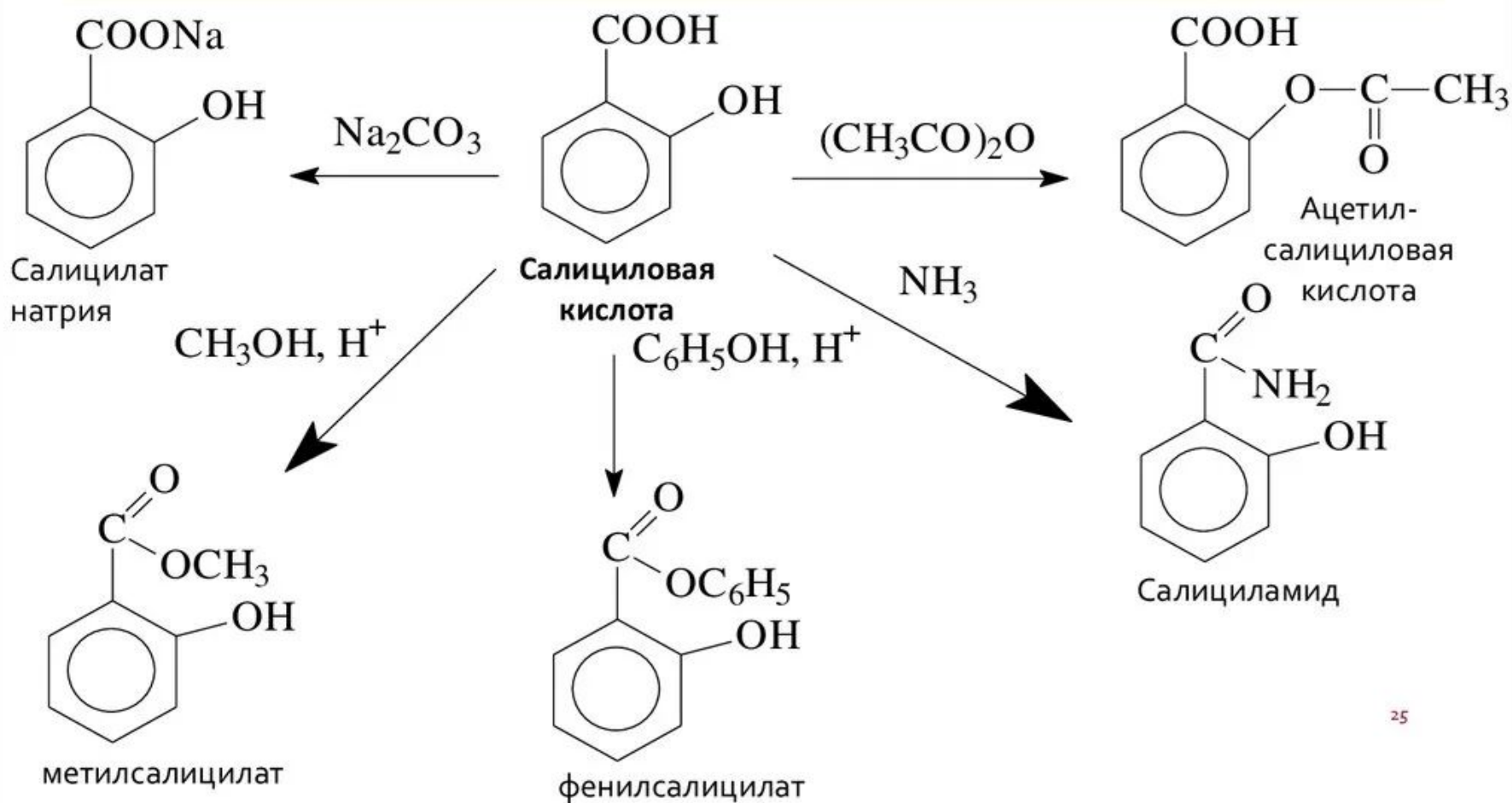


п-аминофенол



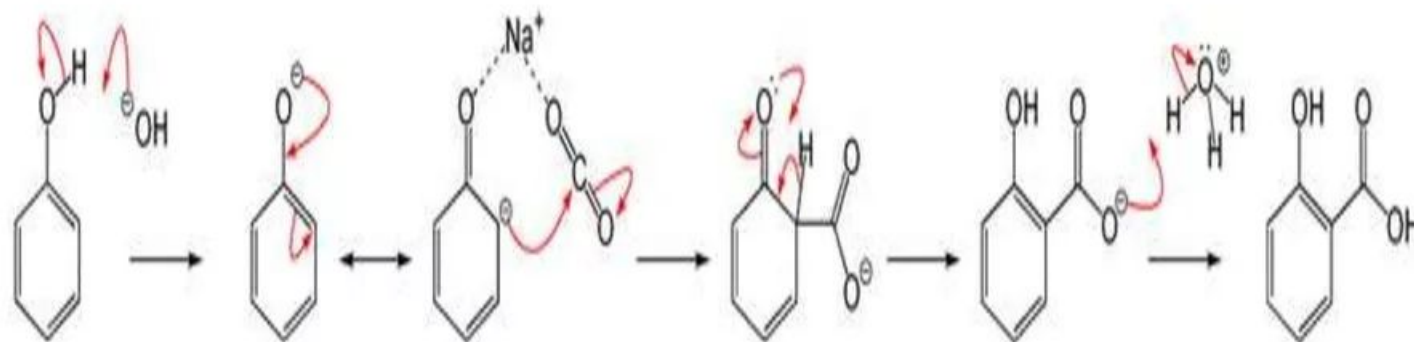
п-ацетамидофенол (парацетамол)

ПРОИЗВОДНЫЕ САЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ КАК ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА



ПОЛУЧЕНИЕ САЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

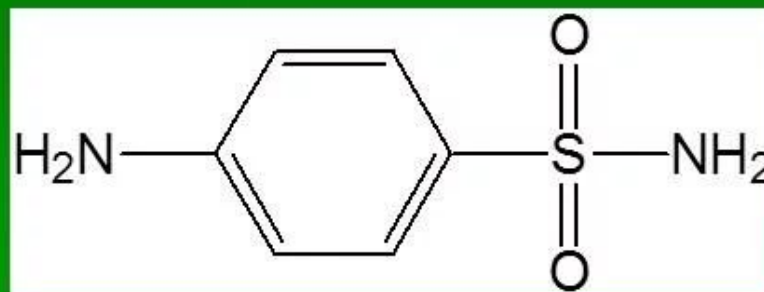
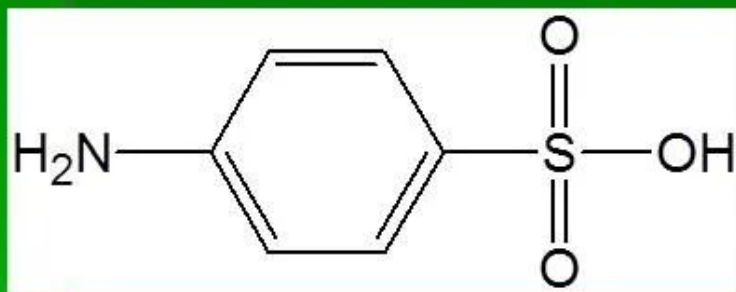
- ✗ При нагревании салициловая кислота декарбоксилируется до фенола, в промышленности салициловую кислоту обычно получают обратной реакцией — карбоксилированием фенолята натрия углекислым газом при 150–180 °С и давлении 5 атм (реакция Кольбе — Шмитта):



Сульфаниловая кислота (*n*-аминобензолсульфо кислота)

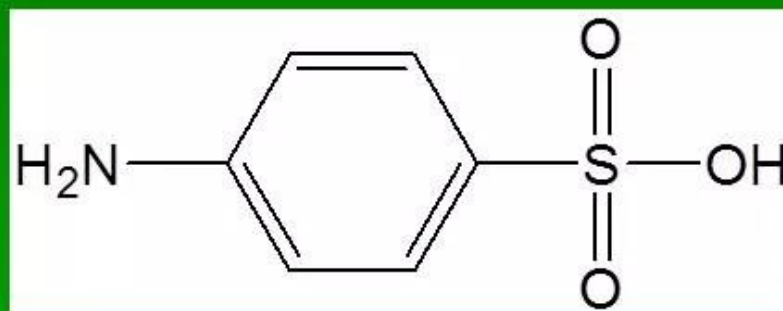
— продукт замещения группы —OH в молекуле сульфатной кислоты H_2SO_4 на остаток анилина $\text{—C}_6\text{H}_5\text{—NH}_2$.

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)

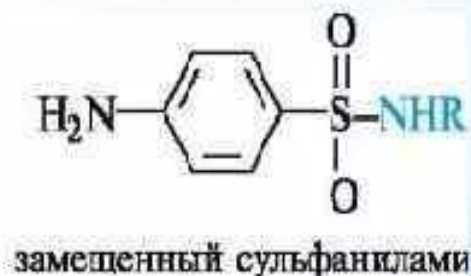


— продукт замещения группы —OH в молекуле сульфатной кислоты H_2SO_4 на остаток анилина — $\text{C}_6\text{H}_5\text{—NH}_2$. Она не является лекарственным веществом.

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



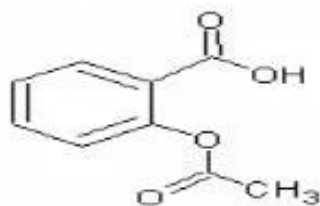
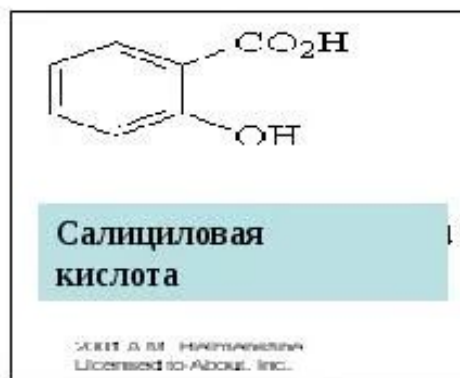
Амид сульфаниловой кислоты (сульфаниламид), известный как **стрептоцид**, является родоначальником группы лекарственных средств, обладающих антибактериальной активностью и называемых **сульфаниламидами**.



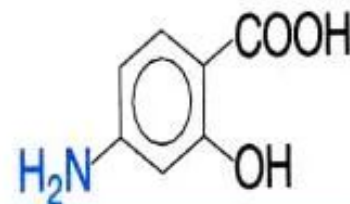
Все сульфаниламиды содержат **сульфонамидную группу $-\text{SO}_2\text{NH}_2$** . Замена ее другими группами приводит к потере антибактериальной активности.

Лекарственные средства на основе гетерофункциональных соединений

Производные салициловой кислоты

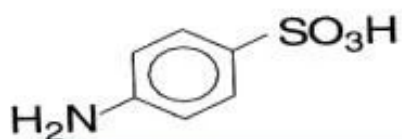


Аспирин
(ацетилсалициловая кислота)

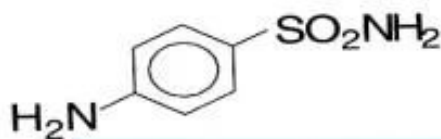


Пара-аминосалициловая кислота

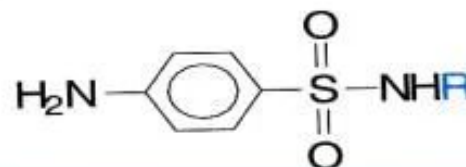
Производные сульфаниловой кислоты



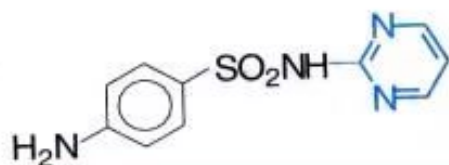
Сульфаниловая кислота



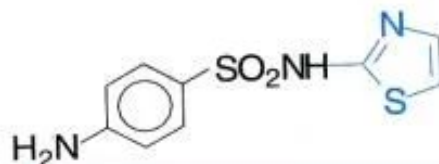
Сульфаниламид



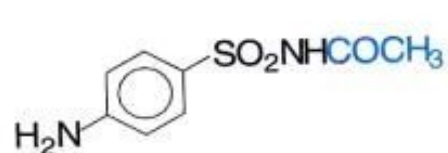
Замещенный сульфаниламид



Сульфазин



Сульфатиазол



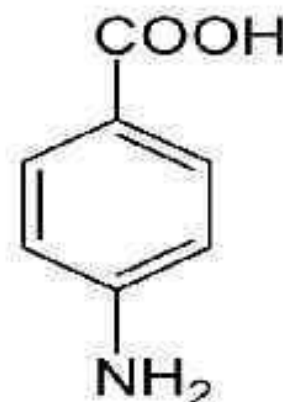
Альбуцид

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).

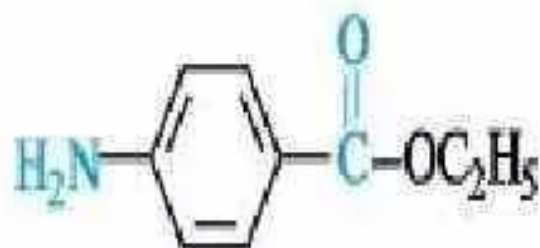


п-Аминобензойная кислота

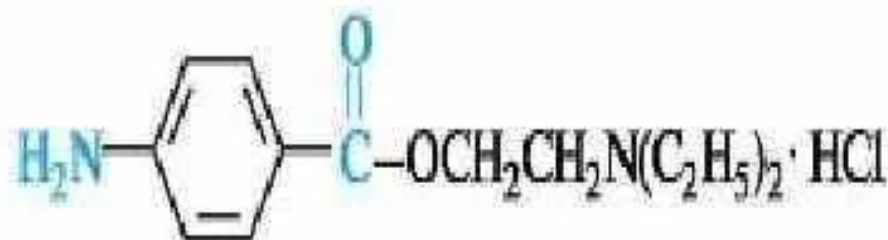


новокаин

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.