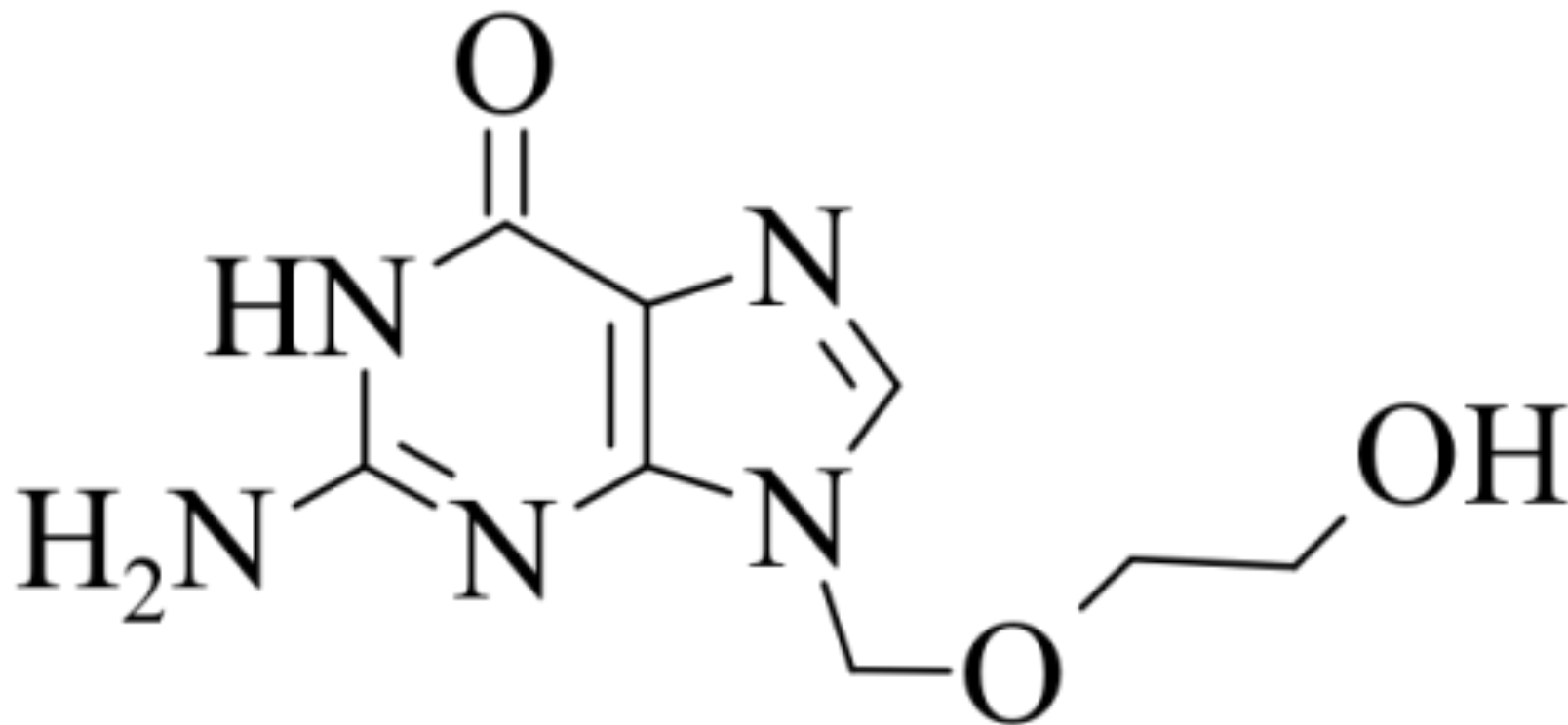




# ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ АЦИКЛОВИРА

Подготовила студентка 4 курса фармацевтического  
факультета 13 группы  
Бугаенко Екатерина Евгеньевна

# ХИМИЧЕСКАЯ ФОРМУЛА



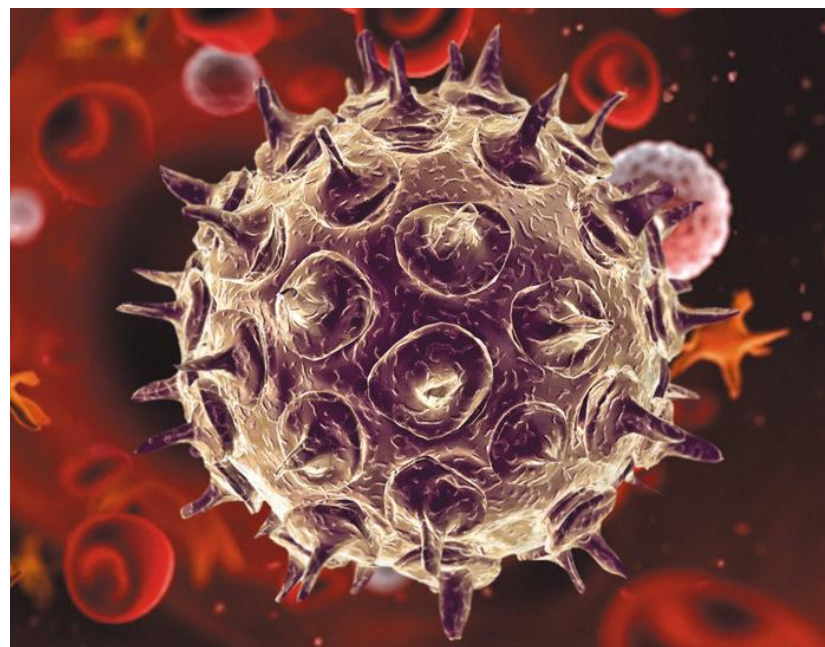
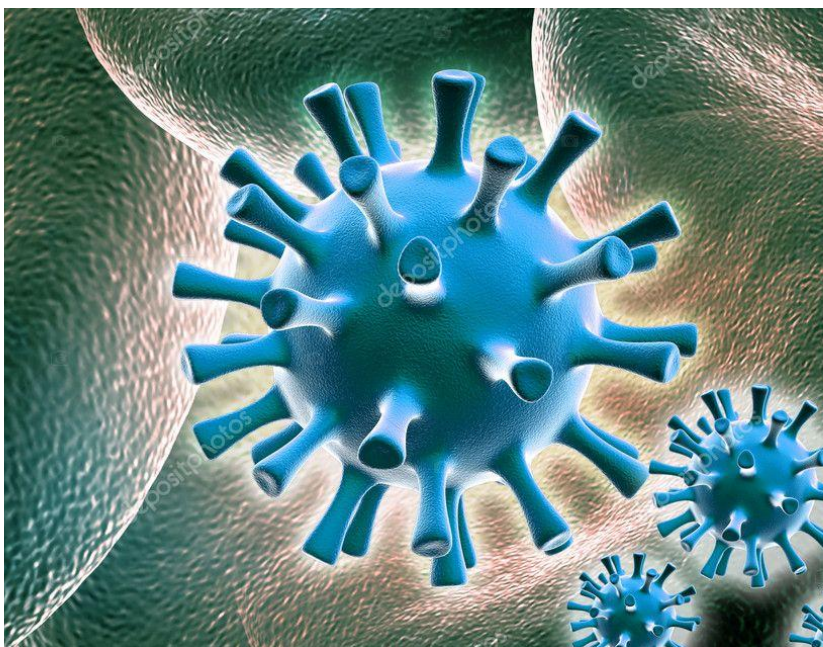
Производное ГУАНИНА

• **Фармакологическая группа -  
противовирусное  
(противогерпетическое) средство**



# СПЕКТР АКТИВНОСТИ

- Активен в отношении вируса **Herpes simplex** типов 1 и 2, вируса **Varicella zoster**, вируса **Эпштейна-Барр** и **цитомегаловируса**



- *Внешний вид*

Белый или почти белый кристаллический порошок



## • *Растворимость*

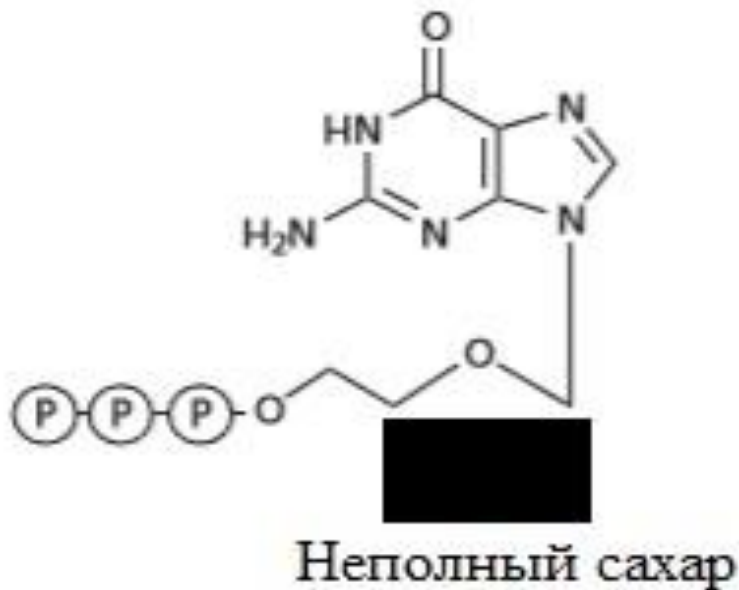
- *Мало растворим в воде*
- *Очень мало растворим в 96% спирте*
- *Практически нерастворим в гептане*
- *Растворяется в разведенных растворах:*



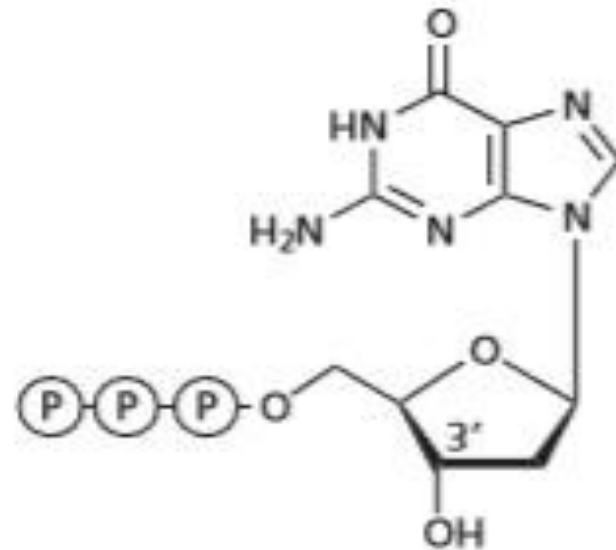
- минеральных кислот
- гидроксидов щелочных металлов

# СВЯЗЬ СТРУКТУРЫ И ДЕЙСТВИЯ

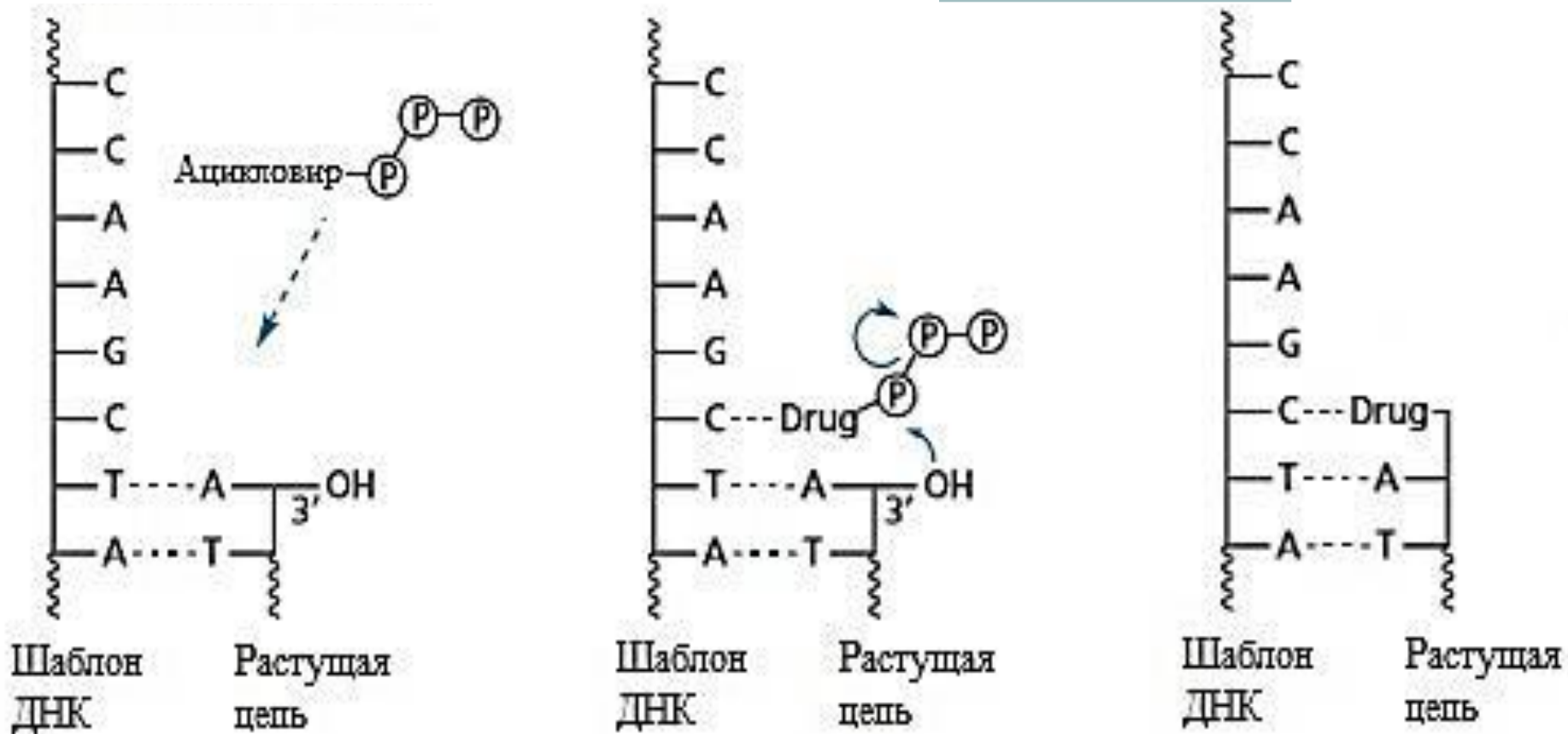
- Ацикловир – ациклический нуклеозид



Ацикловир трифосфат



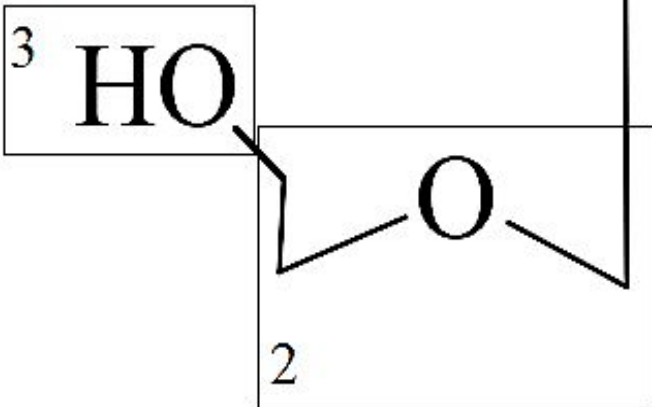
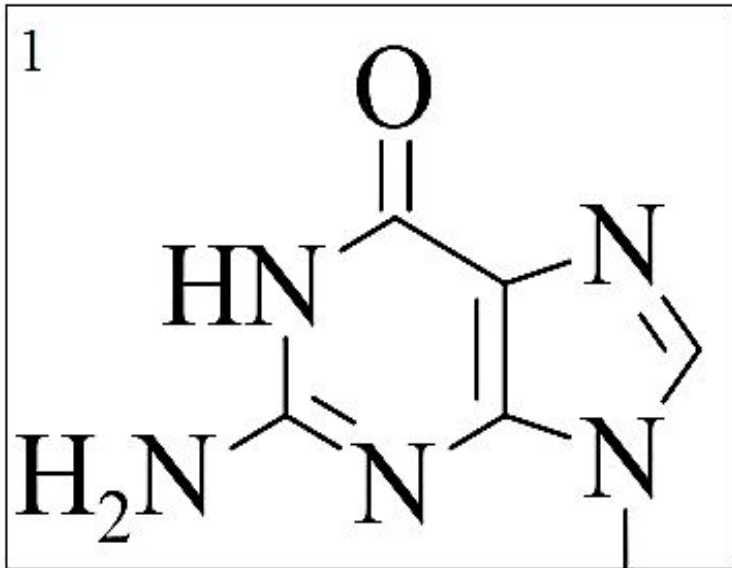
Дезоксигуанозин трифосфат



## Механизм терминации

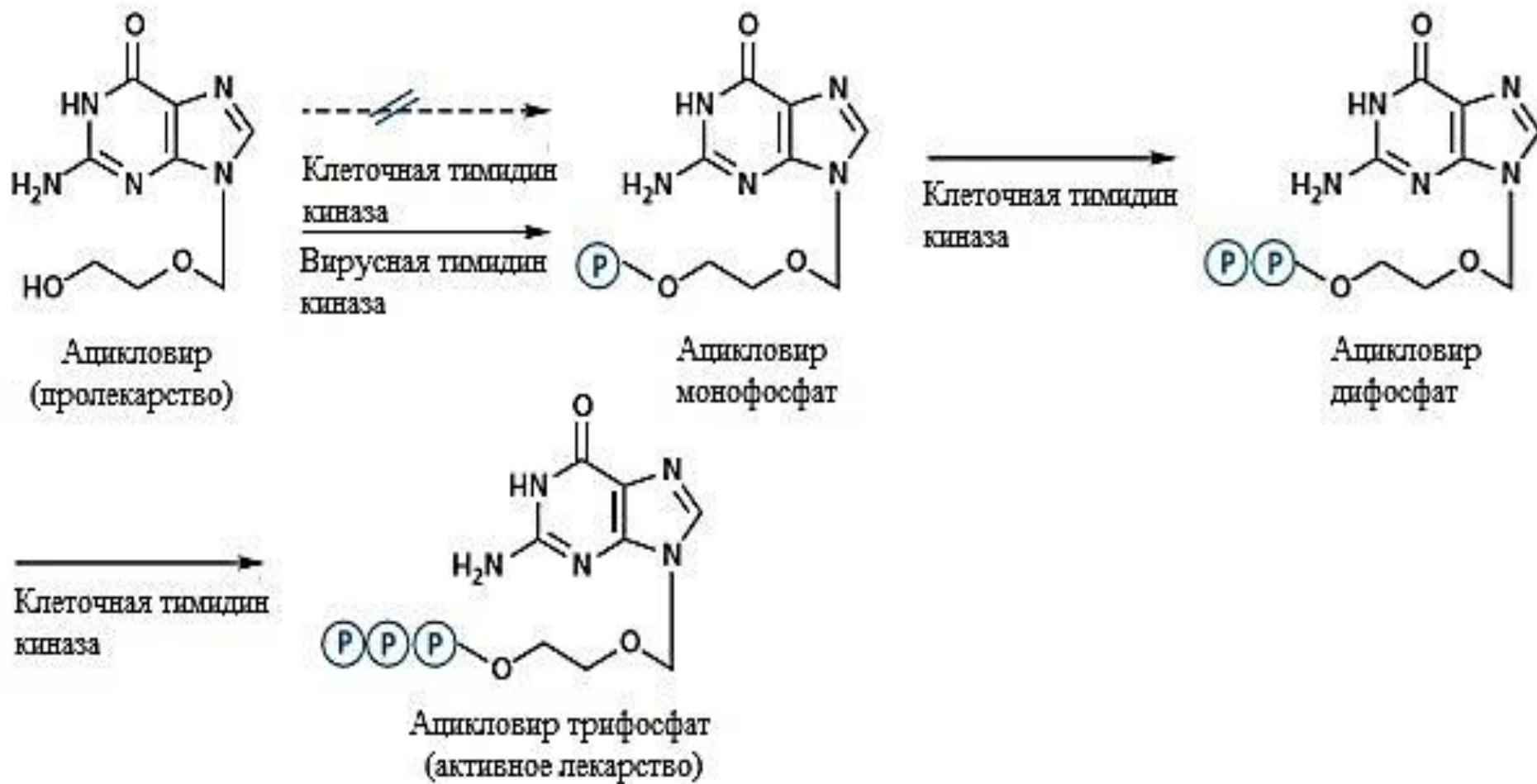
Встраивается в растущую цепь ДНК  
 во время репликации  
 рост цепочки прекращается



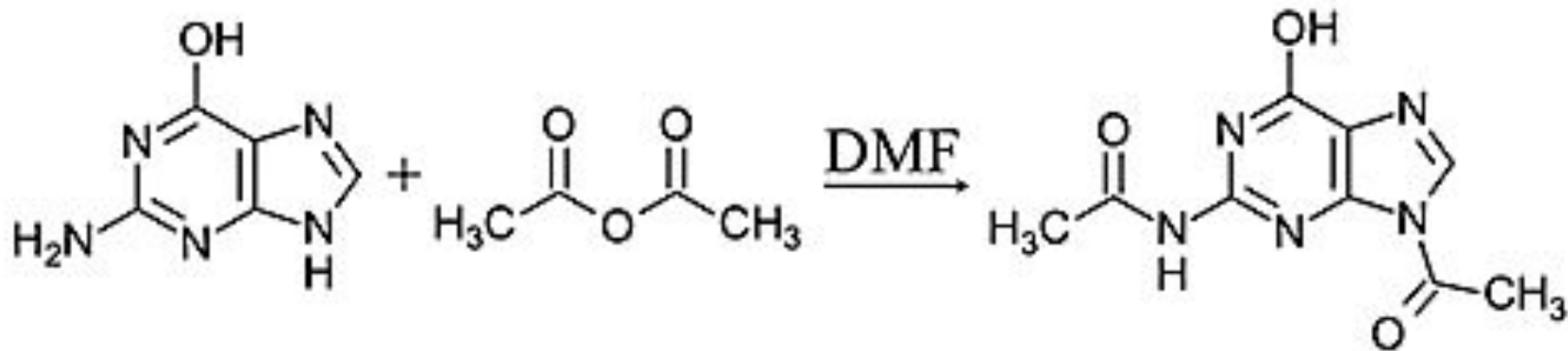


1. Содержит основание гуанина -> может образовывать пару с цитозиновыми фрагментами
2. Сахарная единица неполна и не имеет необходимой группы OH -> цепь нуклеиновой кислоты не может расти дальше
3. Гидроксильная группа подвергается фосфорилированию в вирусно-инфицированных клетках

# ФОСФОРИЛИРОВАНИЕ АЦИКЛОВИРА



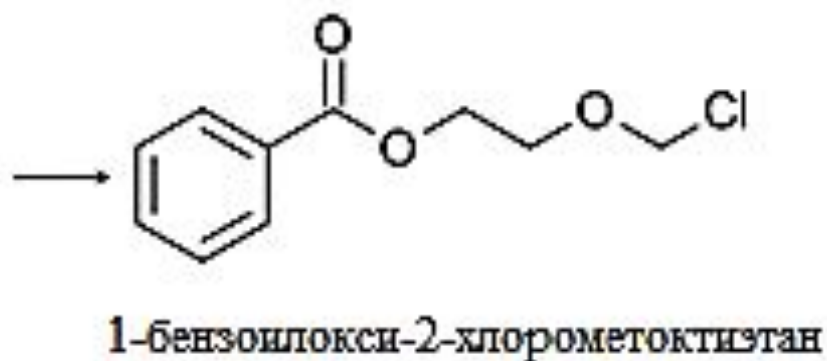
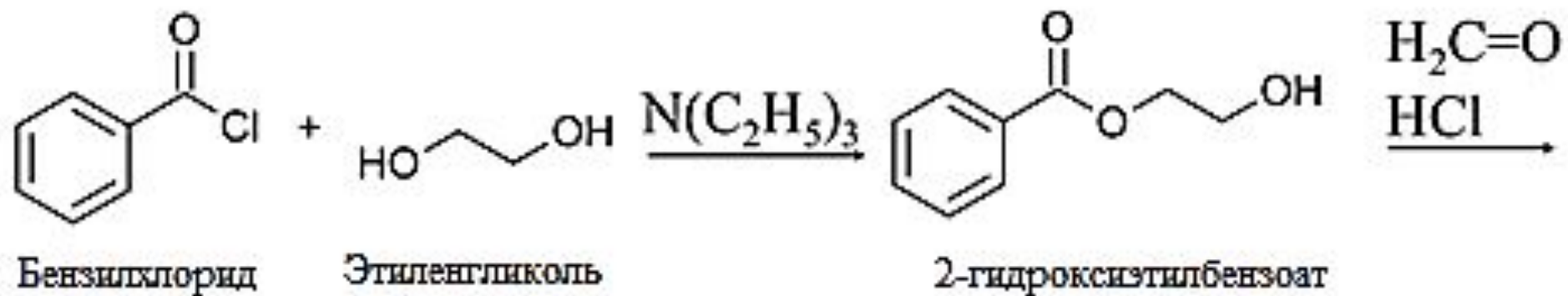
# СИНТЕЗ АЦИКЛОВИРА

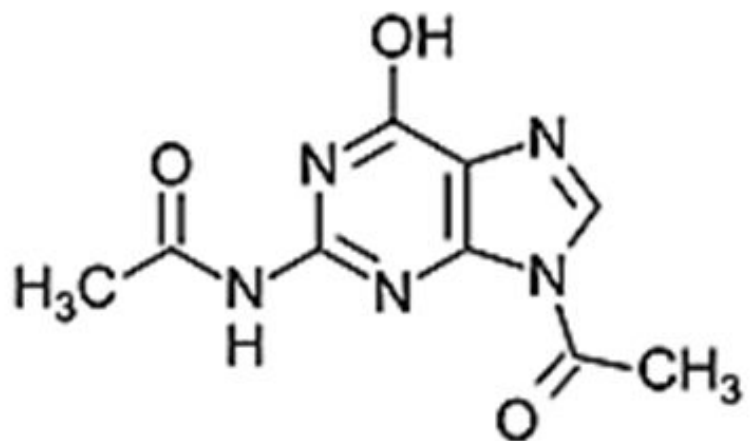


Гуанин

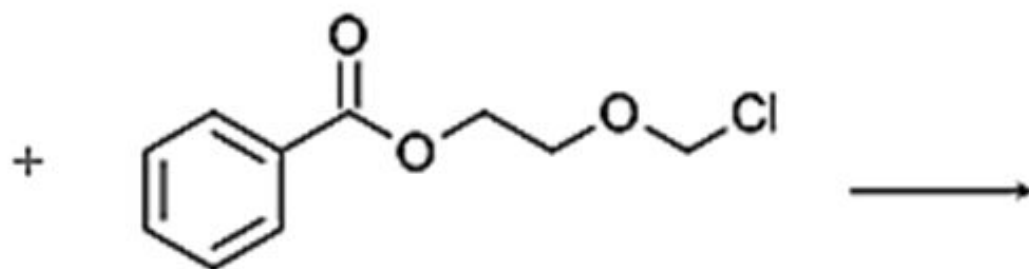
Уксусный ангидрид

N<sup>2</sup>,9-диацетилгуанин



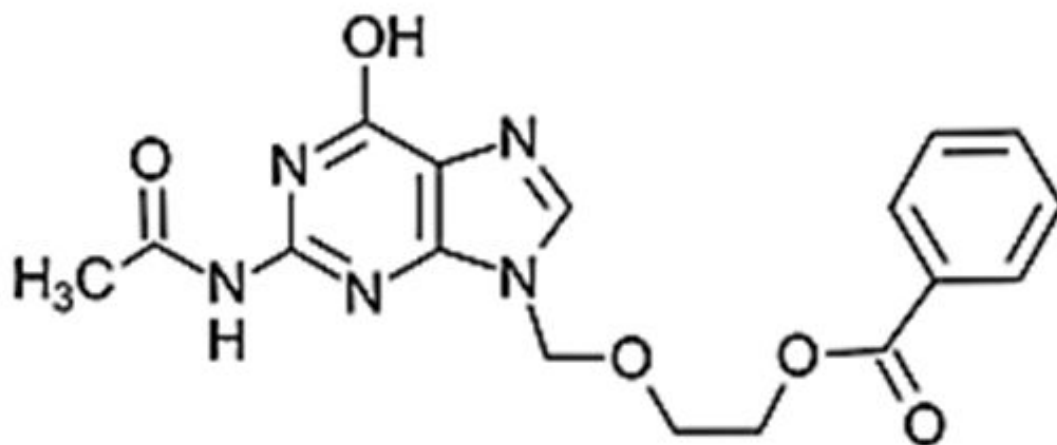


$N^2,9$ -диацетилгуанина

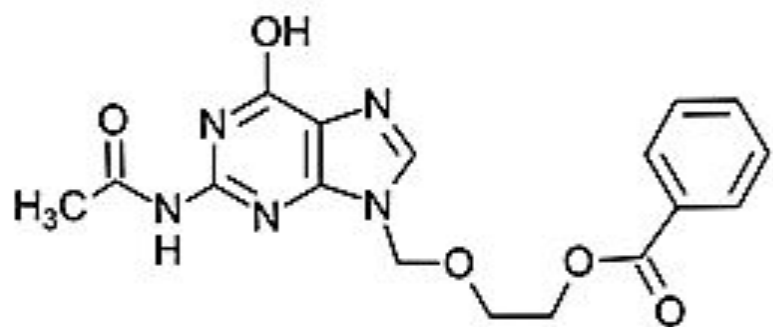


1-бензоилокси-2-хлорометоктиэтан

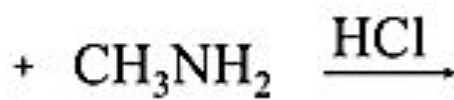
DMF, NaOAc →



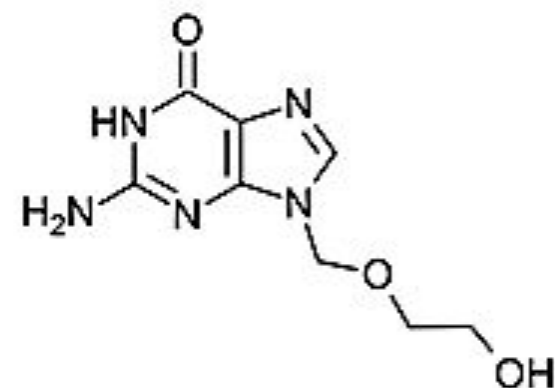
$N^2$ -ацетил-9-(2-бензоилоксиэтоксиметил)гуанин



N<sup>2</sup>-ацетил-9-(2-бензоилоксиэтоксиметил)гуанин



Метиламин

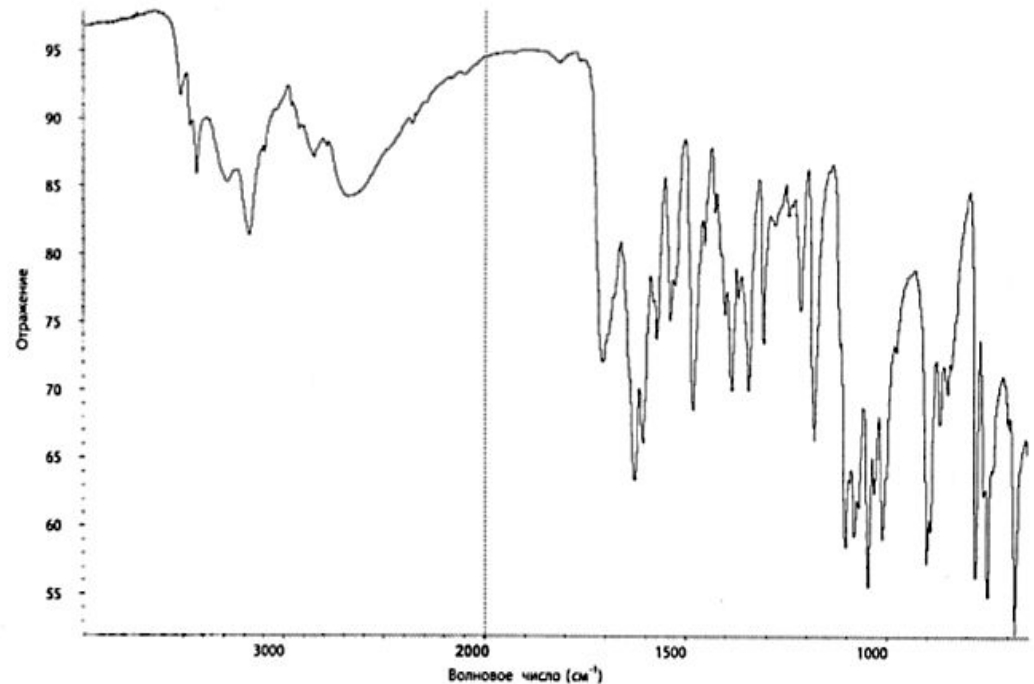


Ацикловир

# Методы контроля качества

## • Подлинность

Используют абсорбционную спектрофотометрию в ИК-области. Сравнивают со спектром:



## • Количественное определение

0,150 г ИО растворить в 60 мл кислоты уксусной безводной Р.

Титруют 0,1 М раствором кислоты хлорной потенциометрически.



**СПАСИБО  
ЗА ВНИМАНИЕ!**

