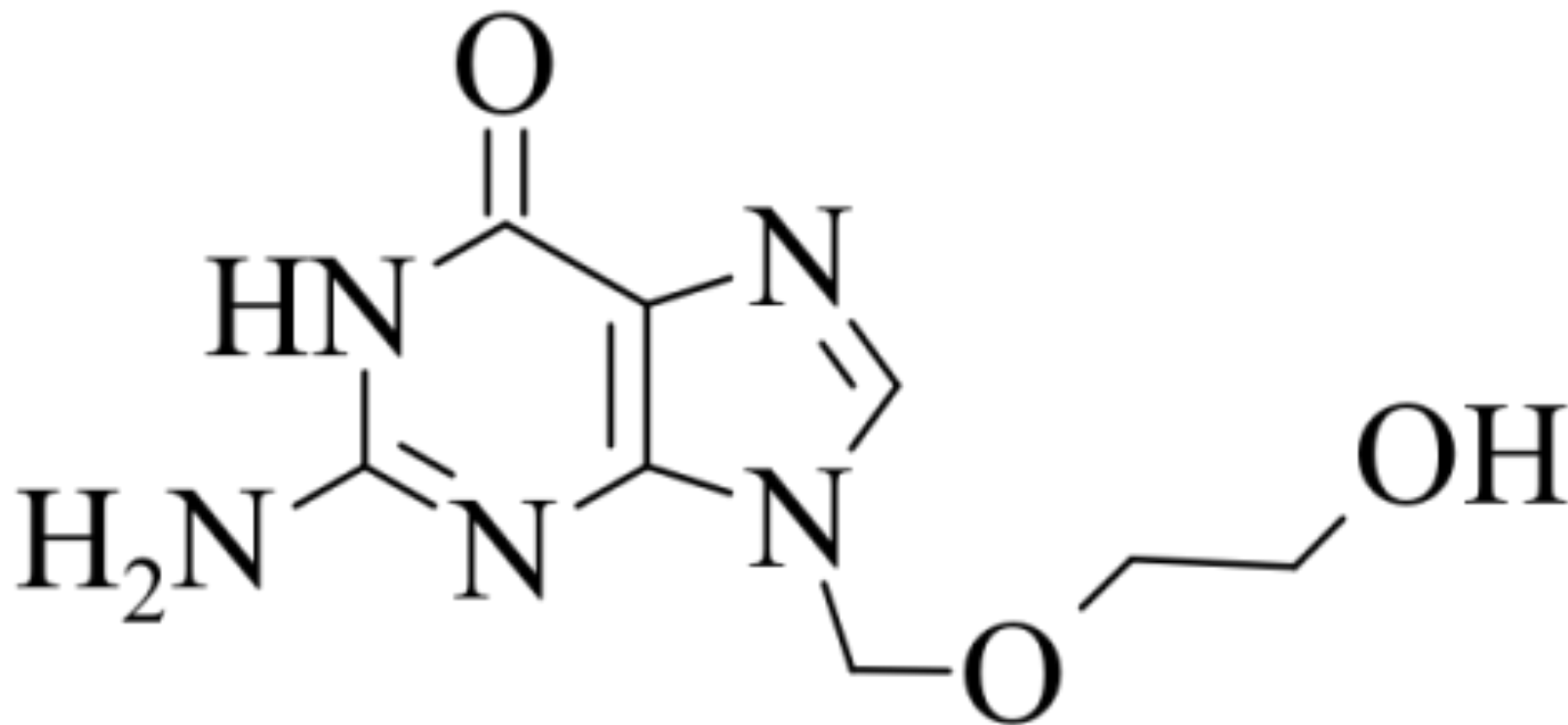




ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ХИМИЯ АЦИКЛОВИРА

Подготовила студентка 4 курса фармацевтического
факультета 13 группы
Бугаенко Екатерина Евгеньевна

ХИМИЧЕСКАЯ ФОРМУЛА



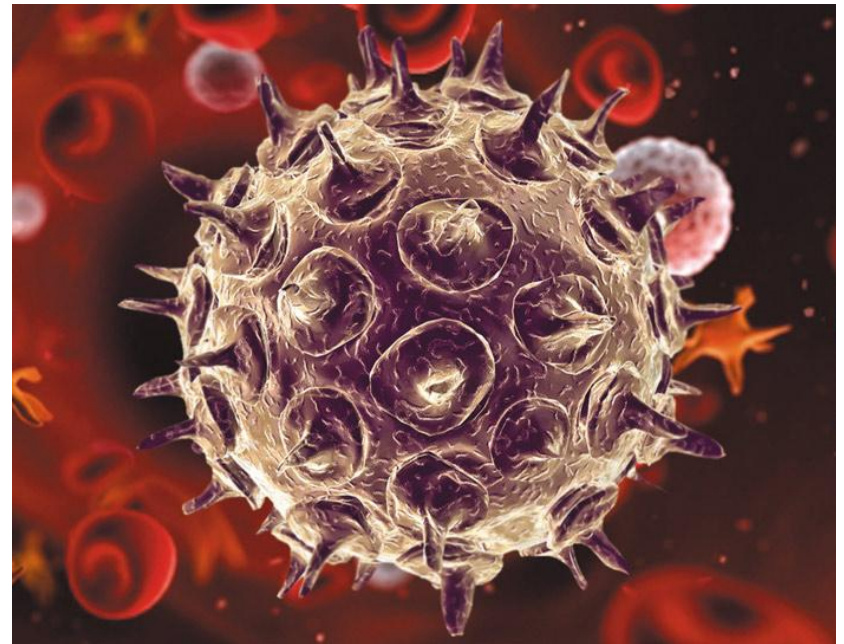
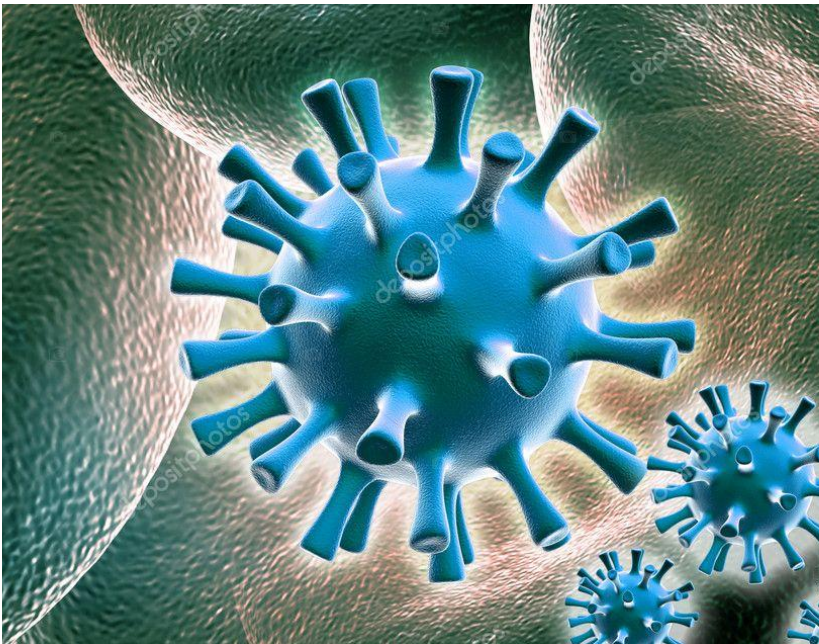
Производное ГУАНИНА

• **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*

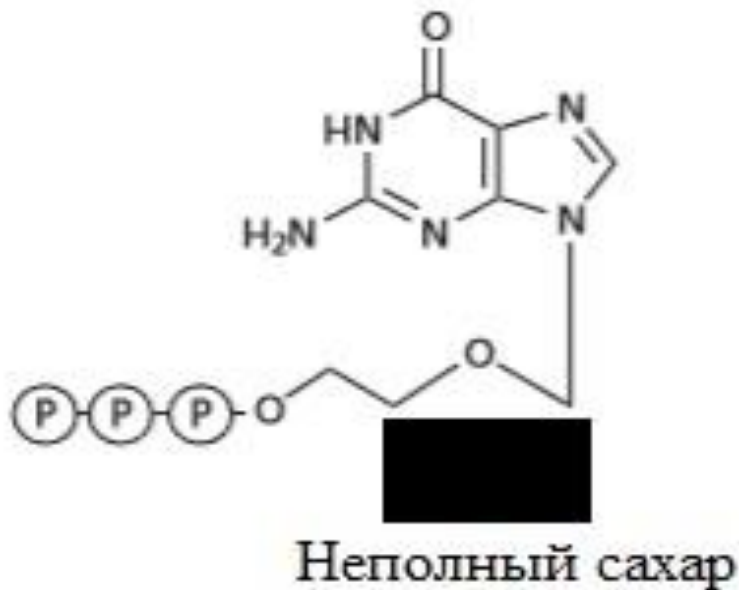
- *Мало растворим в воде*
- *Очень мало растворим в 96% спирте*
- *Практически нерастворим в гептане*
- *Растворяется в разведенных растворах:*



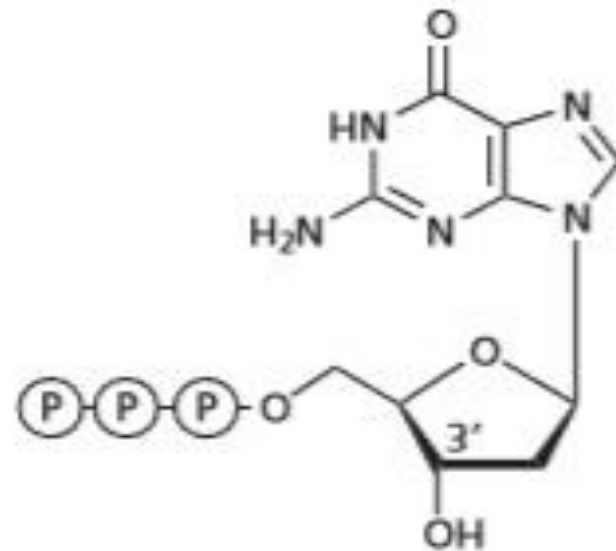
- минеральных кислот
- гидроксидов щелочных металлов

СВЯЗЬ СТРУКТУРЫ И ДЕЙСТВИЯ

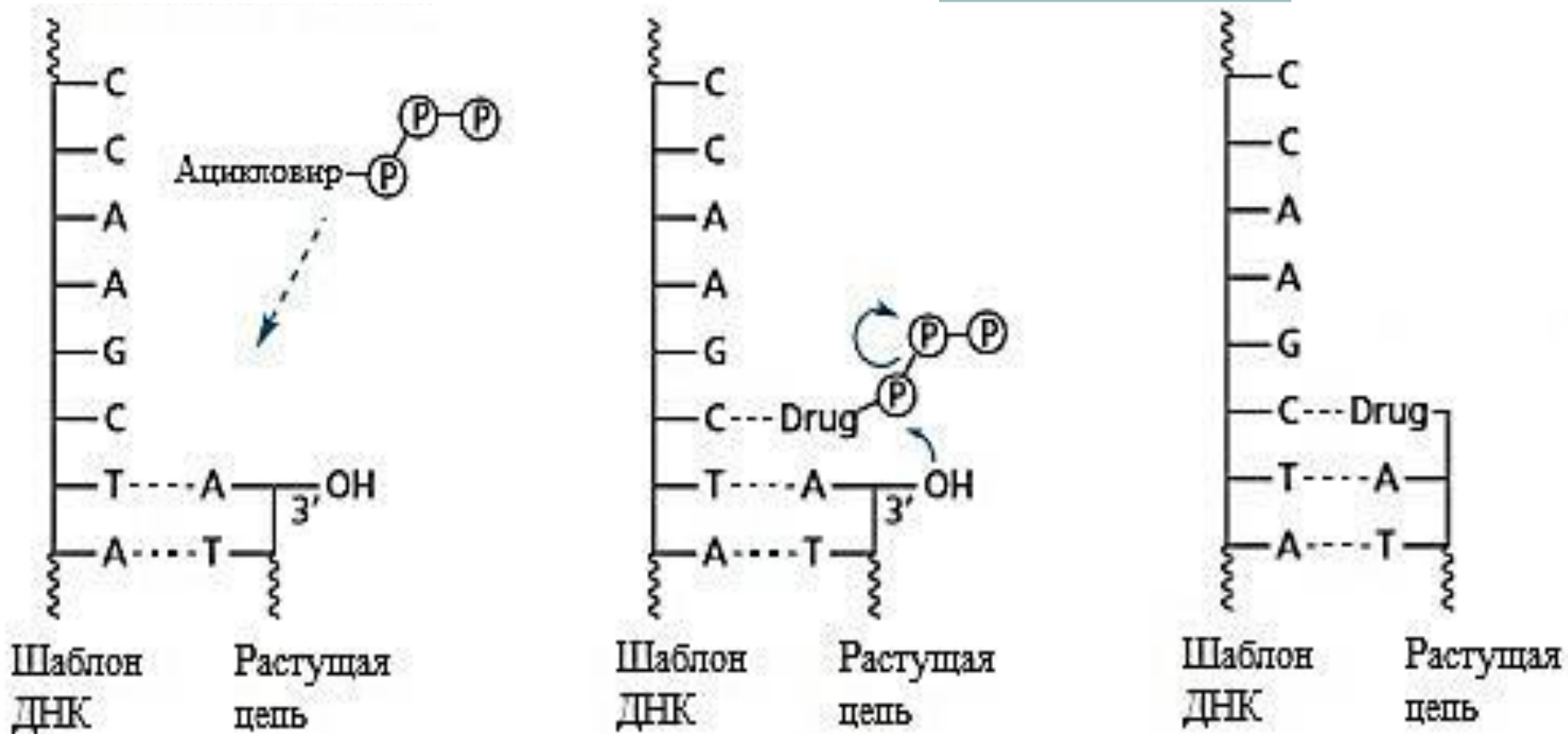
- Ацикловир – ациклический нуклеозид



Ацикловир трифосфат

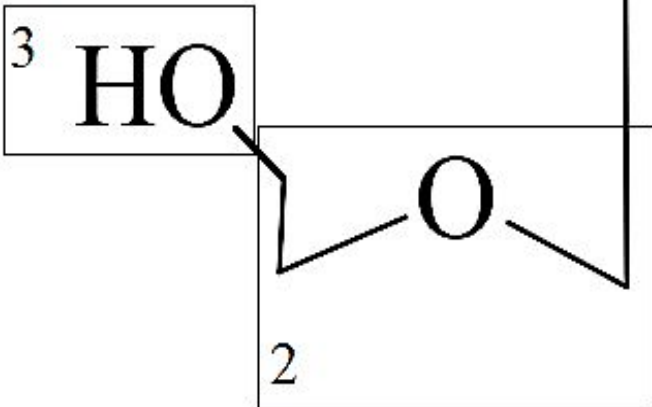
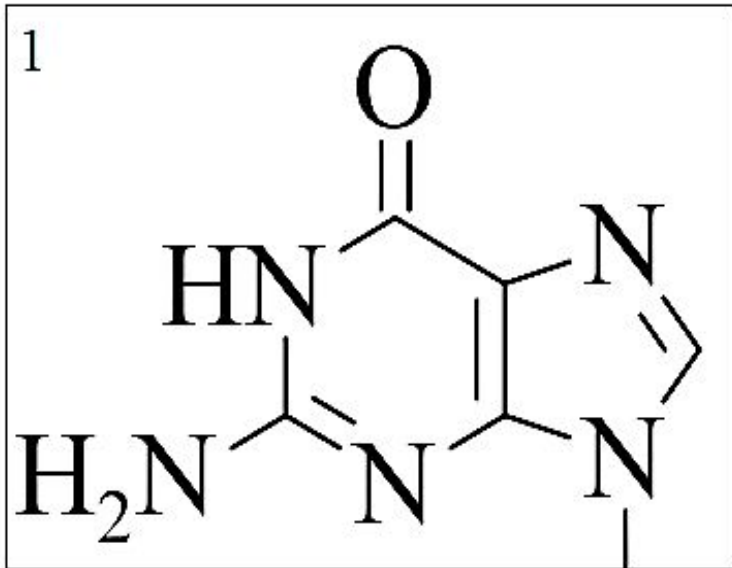


Дезоксигуанозин трифосфат



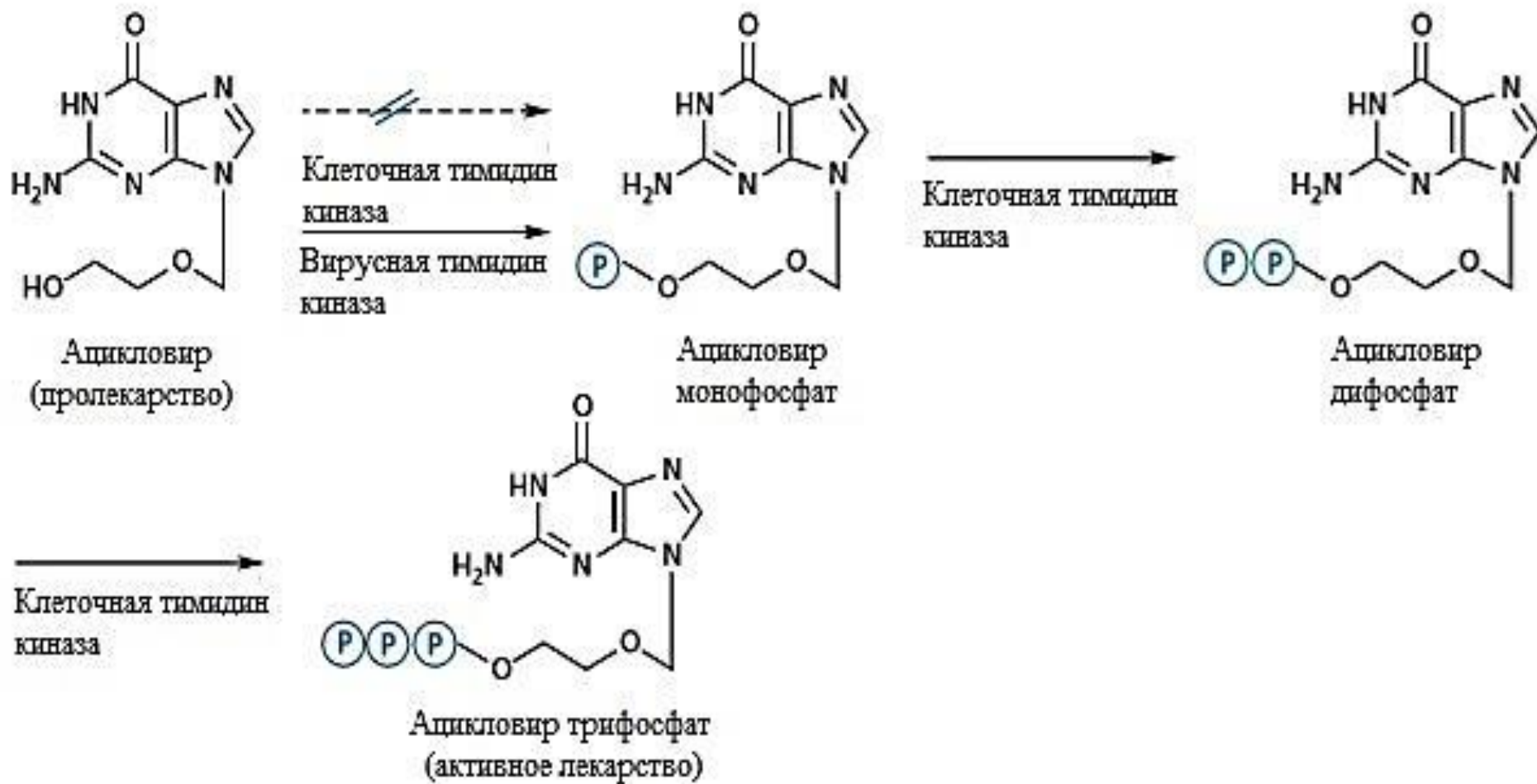
Механизм терминации

Встраивается в растущую цепь ДНК
 во время репликации
 рост цепочки прекращается

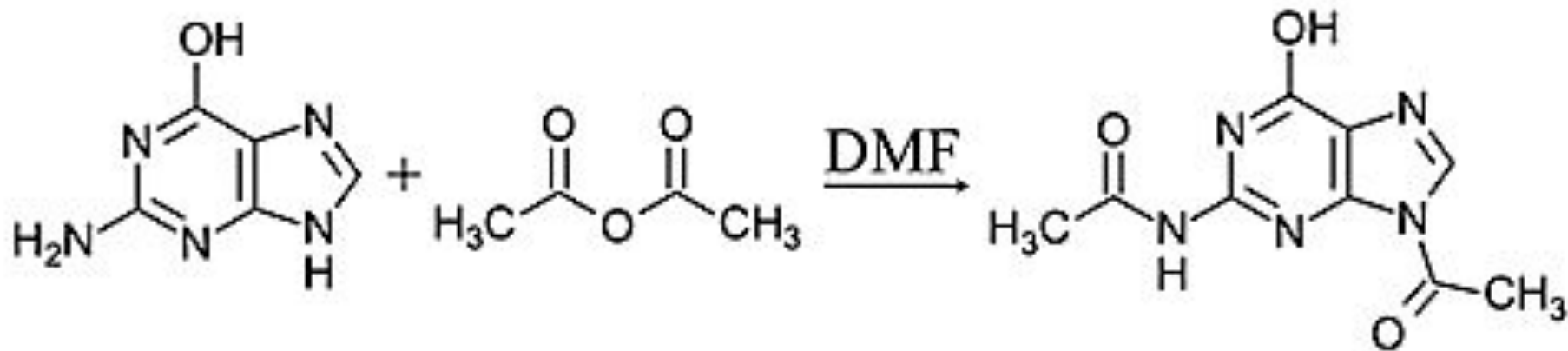


1. Содержит основание гуанина -> может образовывать пару с цитозиновыми фрагментами
2. Сахарная единица неполна и не имеет необходимой группы OH -> цепь нуклеиновой кислоты не может расти дальше
3. Гидроксильная группа подвергается фосфорилированию в вирусно-инфицированных клетках

ФОСФОРИЛИРОВАНИЕ АЦИКЛОВИРА



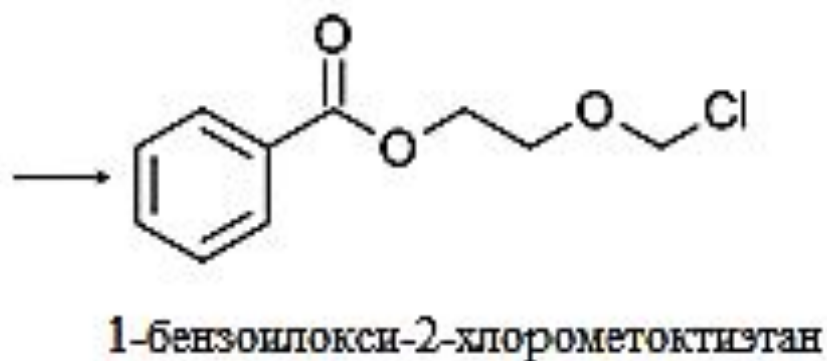
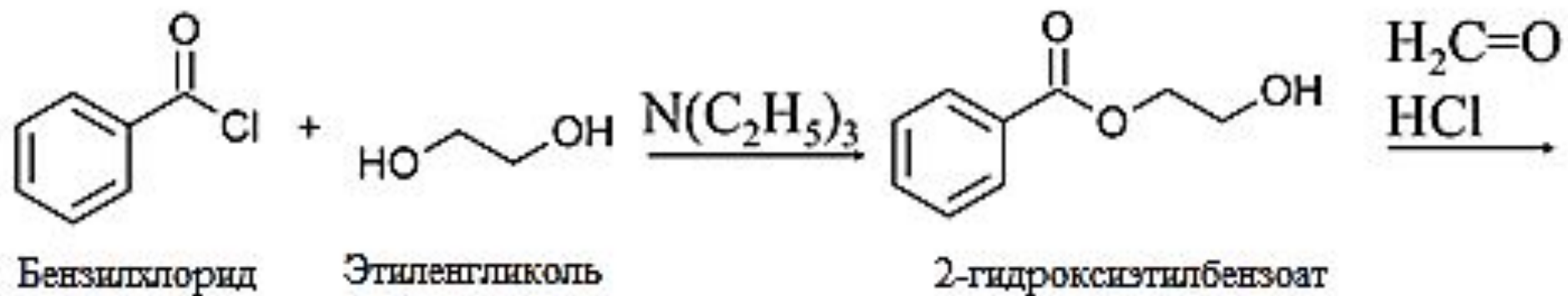
СИНТЕЗ АЦИКЛОВИРА

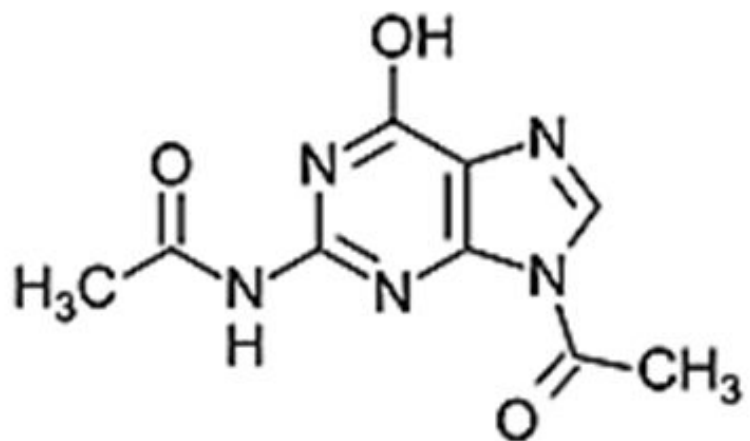


Гуанин

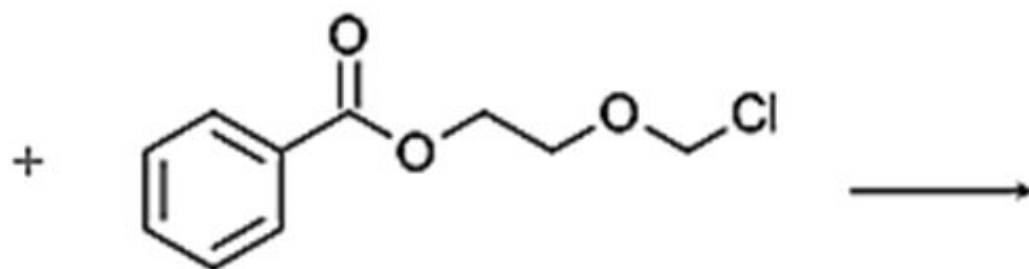
Уксусный ангидрид

N²,9-диацетилгуанин



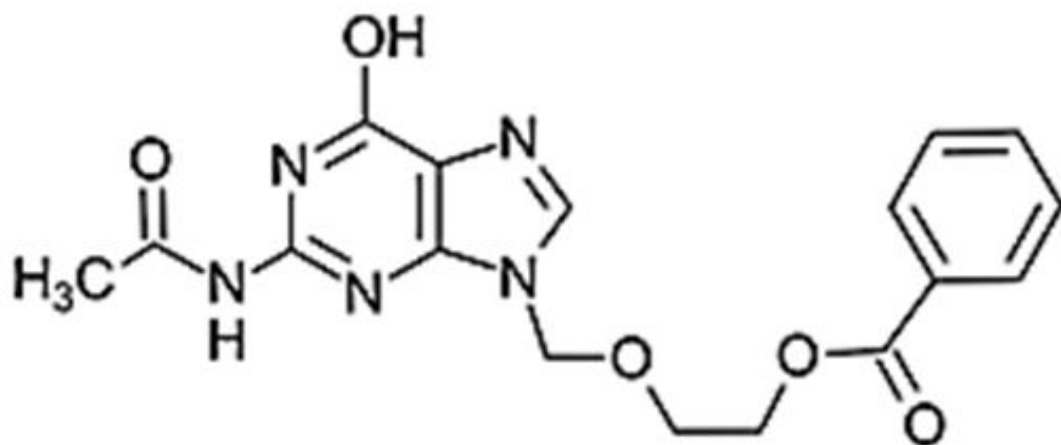


$N^2,9$ -диацетилгуанина

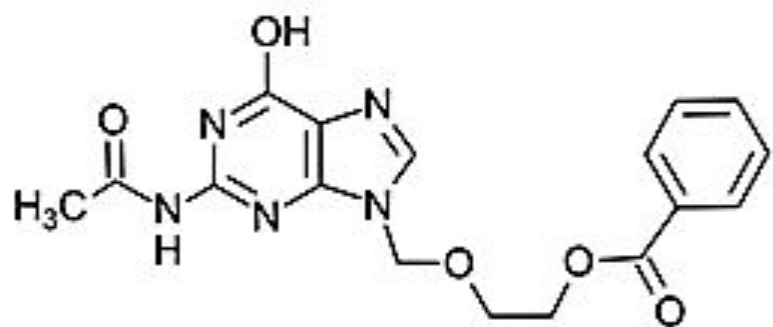


1-бензоилокси-2-хлорометоксиэтан

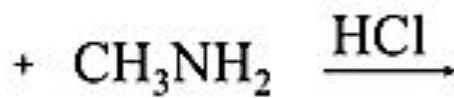
DMF, NaOAc \longrightarrow



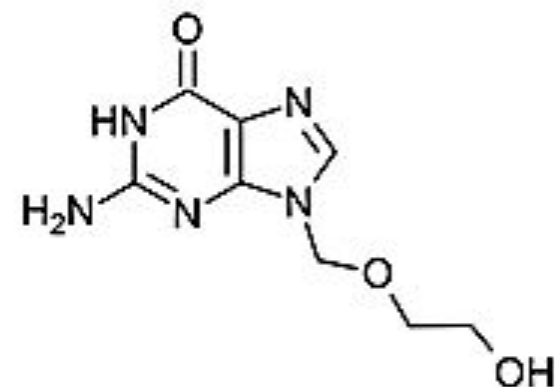
N^2 -ацетил-9-(2-бензоилоксиэтоксиметил)гуанин



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



Метиламин

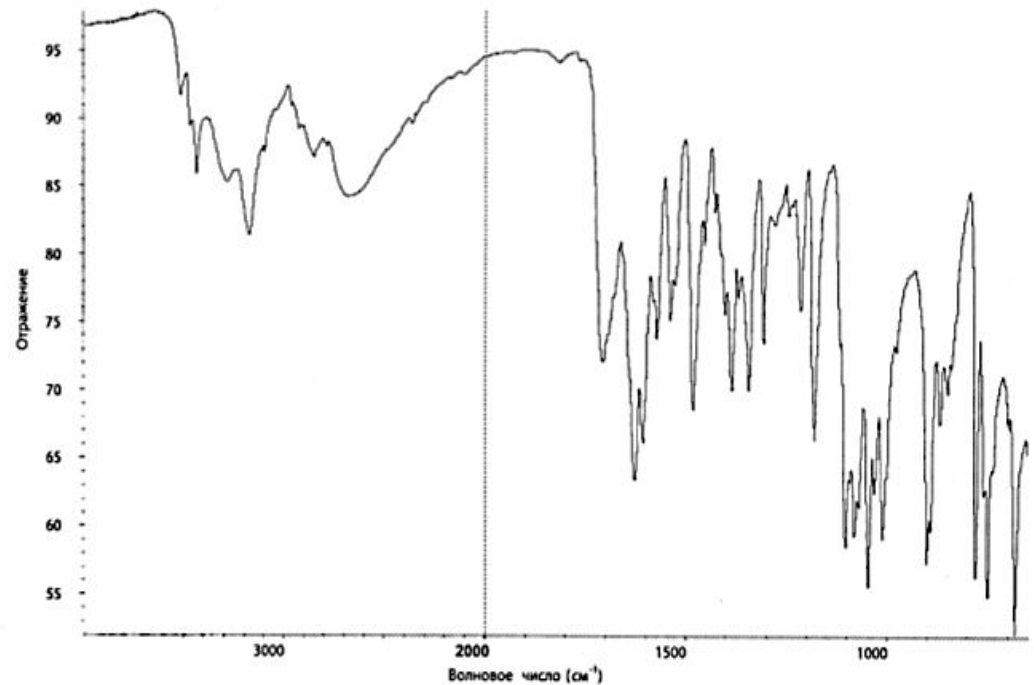


Ацикловир

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!**

