МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ КАЗАХСТАН



ЮЖНО – КАЗ<mark>АХСТАНСКАЯ</mark> ГОСУДАРСТВЕННАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ АКАДЕМИЯ

Кафедра фармакогнозии и химиии

ПРЕЗЕНТАЦИЯ

Тема: Производные салициловой, пара-аминобензойной кислот, применяемые в медицине.

Выполнила Мавленова Д

Группа: 207 Б ФР

Приняла: Алиханова Б

План

Введение

Основная часть

- 1. Салициловая кислота
 - а) физические свойства
 - б) химические свойства
 - с) получение
 - д) производные салициловой кислоты
 - е) применение в медицине
- 2. Пара-аминобензойная кислота
- а) биосинтез
- б) метаболическая роль
- с) витамин В12
- д) производные пара-аминобензойной кислоты
- е) применение в медицине

Заключение

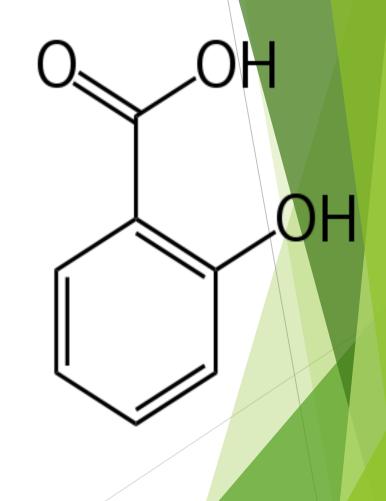
Список использованной литературы

Введение

Препараты группы салициловой кислоты являются классическими противоревматическими средствами. Помимо противовоспалительного, они оказывают хорошо выраженное жаропонижающее и обезболивающее действие. Противовоспалительное действие салициловых препаратов не связано с антимикробным влиянием, а, возможно, зависит от их способности стимулировать выделение адренокортикотропного гормона передней долей гипофиза. Этот гормон в свою очередь усиливает отделение гормонов коры надпочечника, обладающих мощным противовоспалительным действием.

Салициловая кислота

- Салици́ловая кислота (от лат. salix «ива», из коры которой она была впервые выделена) 2-гидроксибензойная или фенольная кислота, С₆Н₄(ОН) СООН; бесцветные кристаллы, хорошо растворима в этаноле, диэтиловом эфире и других полярных органических растворителях, плохо растворима в воде (1,8 г/л при 20 °С).
- Выделена из ивовой коры итальянским химиком <u>Рафаэлем</u> <u>Пириа</u> и затем синтезирована им же.



Физические свойства

► Салициловая кислота легкорастворима в этаноле Салициловая кислота легкорастворима в этаноле, диэтиловом эфире Салициловая кислота легкорастворима в этаноле, диэтиловом эфире, малорастворима всероуглероде. Растворимость в воде (г/л): (0°С), 1,8 (20°С), 8,2 (60°С), 20,5 (80°С).

Химические свойства

- Является <u>двухосновной кислотой</u>: $pK_1 = 2,97 pK_2 = 7,5$.
- Реакционная способность бензольного ядра салициловой кислоты определяется наличием двух заместителей с противоположными мезомерным и индуктивным эффектами: донорной гидроксильной и акцепторной карбоксильной: в результате салициловая кислота значительно легче бензойной Реакционная способность бензольного ядра салициловой кислоты определяется наличием двух заместителей с противоположными мезомерным и индуктивным эффектами: донорной гидроксильной и акцепторной карбоксильной: в результате салициловая кислота значительно легче бензойной, но не так активно, как фенол, вступает в реакции электрофильного замещения вследствие стабилизации промежуточного σ-VONE BOYCE FILEBOYCH BUILDY FOURBOY

Салициловая кислота-одна из наиб. распространенных оксибензойных кислот Салициловая кислота-одна из наиб. распространенных оксибензойных кислот. Образует по функц. группам два ряда производных. <u>Хлорангидридами</u>Салициловая кислота-одна из наиб. распространенных оксибензойных кислот. Образует по функц. группам два ряда производных. Хлорангидридами и <u>ангидридами</u>Салициловая кислота-одна из наиб. распространенных оксибензойных кислот. Образует по функц. группам два ряда производных. Хлорангидридами и ангидридами к-т ацилируется по <u>гидроксигруппе</u>Салициловая кислота-одна из наиб. распространенных оксибензойных кислот. Образует по функц. группам два ряда производных. Хлорангидридами и ангидридами к-т ацилируется

COOH

$$C_6H_5NH_2$$

OH

 $C_6H_5NH_2$

OH

Гидрирование Гидрирование салициловой кисло ты Гидрирование салициловой кислоты на Pt с послед. гидролизом Гидрирование салицилово кислоты на Pt с послед. гидролизом, а также восстановление Гидрирование салиц ой кислоты на Pt с послед. гидролизом, а также восстановление На в изоамиловом спирте протекает с образованием пимелиновой ______ нос(сн₂)₅сон K-ТЫ, НСс.к. Н2

Получение салициловой

КИСЛОТЫ

При нагревании салициловая кислота декарбоксилируется до фенола, в промышленности салициловую кислоту обычно получают обратной реакцией — карбоксилированием 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):

Производные салициловой кислоты

кислота ацетилсалицило вая (аспирин)

<u>ацетилсалицилат</u> <u>лизина</u> <u>ацелизин</u>

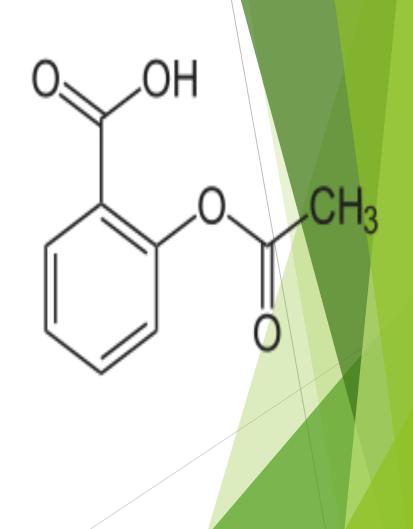
метилсалицилат

натрия салицилат

салициламид.

Ацетилсалициловая кислота

Ацетилсалициловая кислота (разг. аспирин [3]; <u>лат.</u> Acidum acetylsalicylicum, салициловый эфир, салициловый эфир уксу сной кислоты, салициловый эфир уксу сной кислоты) — $\underline{\mathsf{лекарствен}}$ ное средство, оказывающее анальгезирующее (обез боливающее), жаропон ижающее (обезболиваю щее), жаропонижающе e,

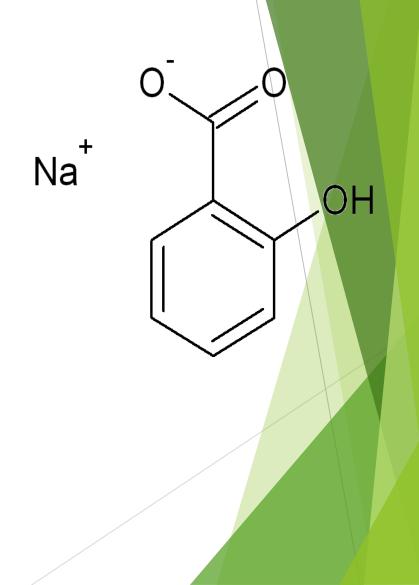


Ацетилсалицилат лизина

Белый кристаллический порошок без запаха или со слабым специфическим запахом. Легко растворим в воде. <u>Фармакологическое</u> действие противовоспалительн ое, анальгезирующее, жаропонижающее, антиагрегационное.

Натрия салицилат

Натрия салицилат лекарственное средство, анальгетик лекарственное средство, анальгетик и а нтипиретик лекарственное средство, анальгетик и а нтипиретик из группы производных салициловой кислоты. Основной профиль применения — в качестве болеутоляющего и жаропонижающего средства. Относится к возможным заменам ацетилсалицило <u>вой кислоты</u> для чувствительных к ней людей.

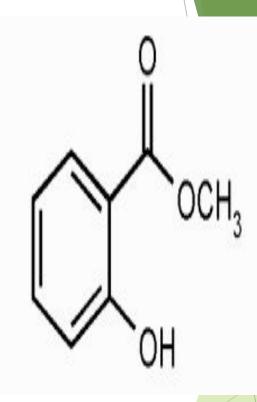


Салициламид

Салицилами́д — лекарственное средство, анальгетик лекарственное средство, анальгетик и антипи NH_2 ик из группы производных салициловой кислоты. Медицинское применение салициламида аналогично ацетилсалициловой кислоте, то есть используется в основном в качестве болеутоляющего и жаропонижающего средства.

Метилсалицилат

Метилсалицила́т (Methylii salicylas) метиловый эфирметиловый эфир са лициловой кислоты. Бесцветная летучая жидкость с сильным характерным запахом, основной компонент винтегрененевого эфирного масла Бесцветная летучая жидкость с сильным характерным запахом, основной компонент винтегрененевого эфирного масла, в настоящее время используется преимущественно синтетический метилсалицилат. Применяют наружно в качестве обезболивающего и противовоспалительного средства per se и в смеси с хлороформом Бесцветная летучая жидкость с сильным характерным запахом, основной компонент винтегрененевого эфирного масла,



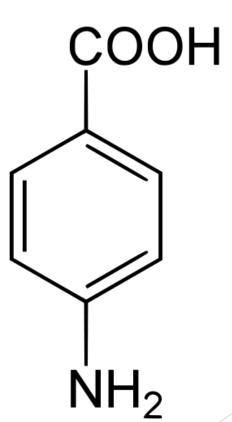
Применение в медицине

- □ Салициловая кислота активный компонент ивовой коры. Ещё в XIX в. её использовали для лечения ревматизма и мочекислого диатеза, а сегодня это вещество синтезируют в больших количествах, так как оно служит основой для производства многих лекарств.
- Салициловая кислота обладает слабыми антисептическими, раздражающими и кератолитическими (в больших концентрациях) свойствами и применяется в медицине наружно в мазях и растворах при лечении кожных заболеваний; входит в состав пасты Лассара Салициловая кислота обладает слабыми антисептическими, раздражающими и кератолитическими (в больших концентрациях) свойствами и применяется в медицине наружно в мазях и растворах при лечении кожных заболеваний; входит в состав пасты Лассара, присыпки «<u>гальманин</u>», препаратов «мозольная жидкость» и «мозольный пластырь». В аптечной сети продаётся в таких лекарственных формах, как спиртовой раствор для наружного применения (с содержанием салициловой кислоты 1 или 2 %) и мазь (2, 3, 5 и 10-процентная).

Производные салициловой кислоты также применяются в медицине (салицилат натрия), её амид (<u>салициламид</u>Производные салициловой кислоты также применяются в медицине (салицилат натрия), её амид (салициламид) и ацетилсалициловую кислоту (аспирин) Производные салициловой кислоты также применяются в медицине (салицилат натрия), её амид (салициламид) и ацетилсалициловую кислоту (аспирин) используют как жаропонижающие, противоревматические, противовоспалительные и болеутоляющие средства; фенилсалицилат — как антисептик, пара-аминосалици<mark>ловую</mark> кислоту (структурно близкую с пара-аминобензойной кислотой, необходимой туберкулезным микобактериям, и поэтому метаболически конкурирующую с ней) — как специфическое противотуберкулёзное средство.

Пара-аминобензойная кислота

■ Пара-аминобензойная кислота (бактериальный витамин Н¹, витамин В₁₀, ПАБК) — аминокислота, ПАБК) — аминокислота, производное бензойной кислоты, порошок белого цвета, широко распространена в природе.



Биосинтез

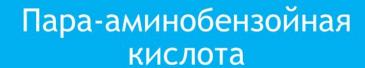
Пара-аминобензоат в природе синтезируется <u>шикиматным путём</u>. Промежуточными соединениями являются <u>шикимат</u>. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4дезоксихоризмат. Способностью к синтезу парааминобензоата обладают многие микроорганизмы. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4дезоксихоризмат. Способностью к синтезу парааминобензоата обладают многие микроорганизмы, <u>растения</u>. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4амино-4-дезоксихоризмат. Способностью к синтезу пара-аминобензоата обладают многие микроорганизмы, растения, грибы.

Метаболическая роль

Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов -<u>тетрагидрофолата</u>Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов -тетрагидрофолата и <u>тетрагидрометаноптерина</u>Парааминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина. Являясь составной частью тетрагидрофолата Парааминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина. Являясь составной частьютетрагидрофолата, остаток пара-аминобензойной кислоты участвует в синтезе пуринов Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов -тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина.

Витамин B_{10}

- ПАБК является витамином группы В, суточная потребность составляет 100 мг и, при сбалансированном питании, полностью удовлетворяется за счёт естественного содержания в продуктах питания.
- Участвует в синтезе витамина В_д, и, как следствие, образовании эритроцитов, и, как следствие, образовании эритроцитов (эритропоэзе, и, как следствие, образовании эритроцитов (эритропоэзе). Так же обладает лактогонным свойством (усиливает выделение молока у кормящей женщины), способствует установлению загара.





Аналоги (сульфаниламиды)

Производные

Сульфаниламиды

Сульфаниламиды (<u>лат.</u>Сульфаниламиды (лат. sulfanilamide) — это групп химических веществ, производных пара-аминобензолсульфамида - ами сульфаниловой кислоты (пара-аминобензосульфокислоты). Многие из этих веществ с середины двадцатого века употребляются в качестве антибактериальных препаратов. пара-Аминобензолсульфамид — простейшее соединение класса — также называется <u>белым</u> <u>стрептоцидом</u>Сульфаниламиды (лат. sulfanilamide) — это группа



Производные парааминобензойной кислоты

 Также широко используются производные парааминобензойной кислоты (новокаин, анестезин и др.), обладающие местным анестезирующим действием.





Заключение

Таким образом, производные салициловой и паминобензойной кислот играют важную роль в организме человека. Препараты, полученные из них применяются в очень широком спектре заболеваний, оказывая различные воздействия на те или иные органы, либо на весь организм в целом.

Список использованной литературы

- 1. А.К. Патсаев «Функциональные производные углеводородов», учебное пособие. 2003г.
- 2. Патсаев А.К., Алиханова Х.Б. «Учебно-методическое пособие по органической химии для самостоятельной работы студентов фармацевтических факультетов. Шымкент, 2007, с. 100-115
- 3. Использование Интернета

Спасибо за внимание!