

**МИНИСТЕРСТВО
ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ КАЗАХСТАН**



**ЮЖНО – КАЗАХСТАНСКАЯ
ГОСУДАРСТВЕННАЯ
ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ
АКАДЕМИЯ**

Кафедра фармакогнозии и химии

ПРЕЗЕНТАЦИЯ

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

Выполнила Мавленова Д

Группа: 207 Б ФР

Приняла:Алиханова Б

Шымкент-2017

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

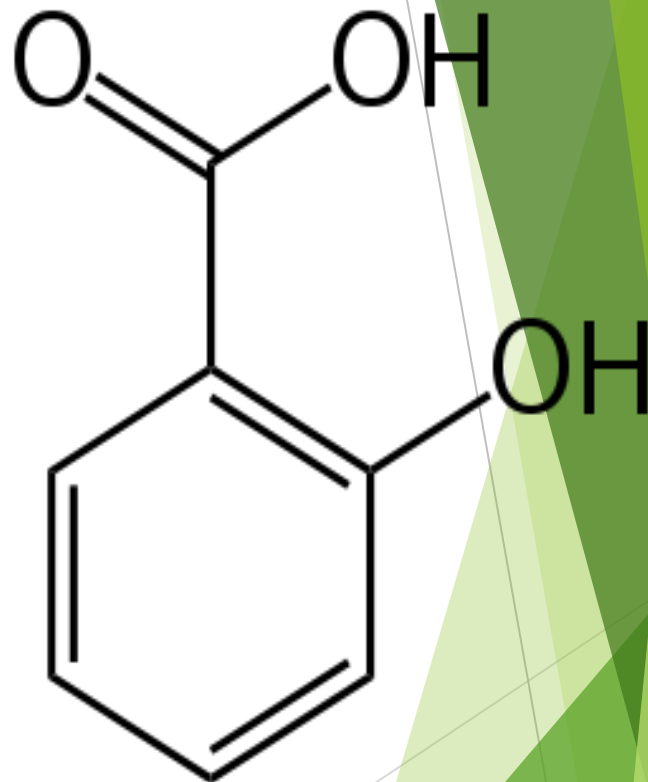
Список использованной литературы

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-гидроксibenзойная или фенольная кислота, $C_6H_4(OH)COOH$; 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 Рафаэлем Пириа и затем синтезирована им же.



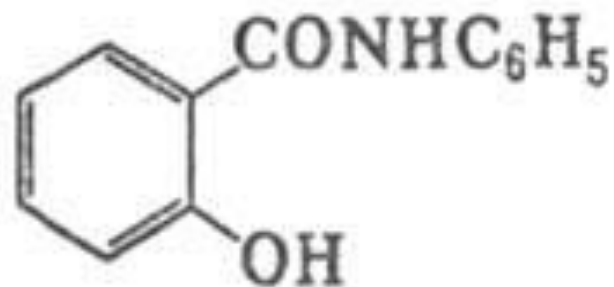
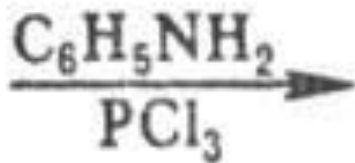
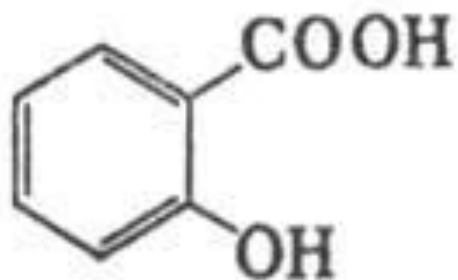
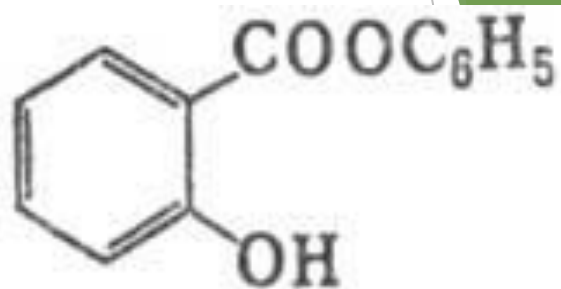
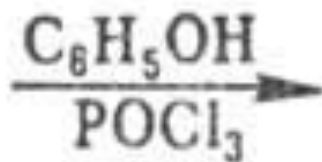
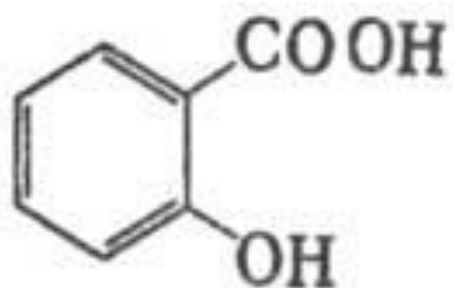
Физические свойства

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

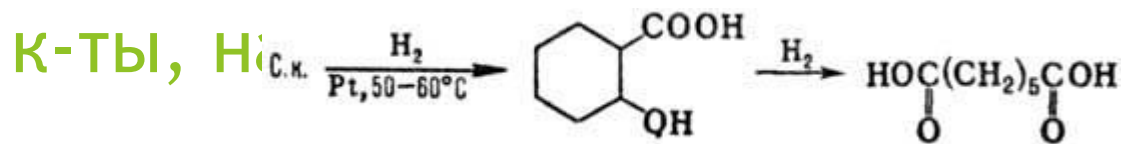
Химические свойства

- Является двухосновной кислотой: $pK_1 = 2,97$ $pK_2 = 7,5$.
- 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 -комплекса гидроксильной группой.

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

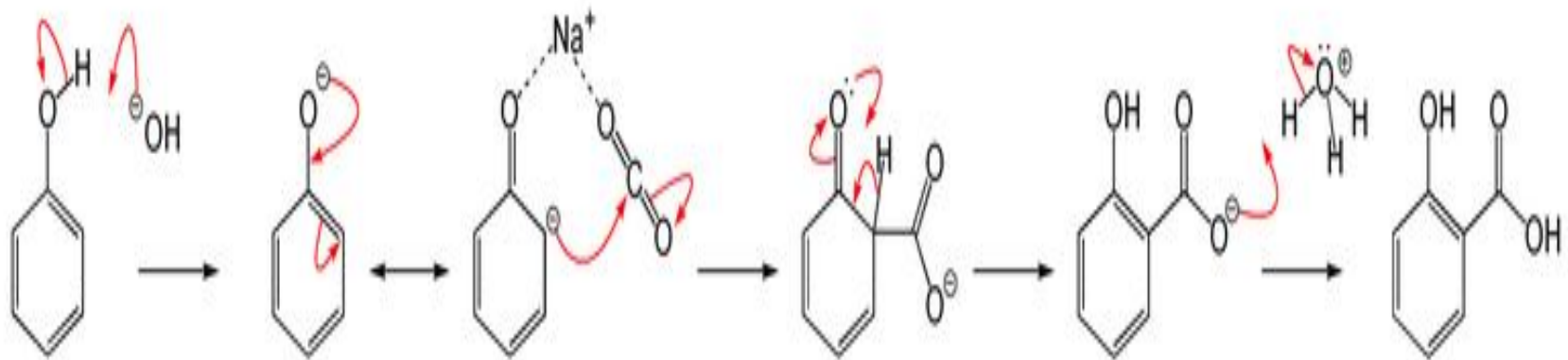


Гидрирование Гидрирование салициловой кислоты Гидрирование салициловой кислоты на Pt с послед. гидролизом Гидрирование салициловой кислоты на Pt с послед. гидролизом, а также восстановление Гидрирование салициловой кислоты на Pt с послед. гидролизом, а также восстановление Na в изоамиловом спирте протекает с образованием пимелиновой



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):



Производные салициловой кислоты

кислота
ацетилсалицило
вая (аспирин)

ацетилсалицилат
лизина ацелизин

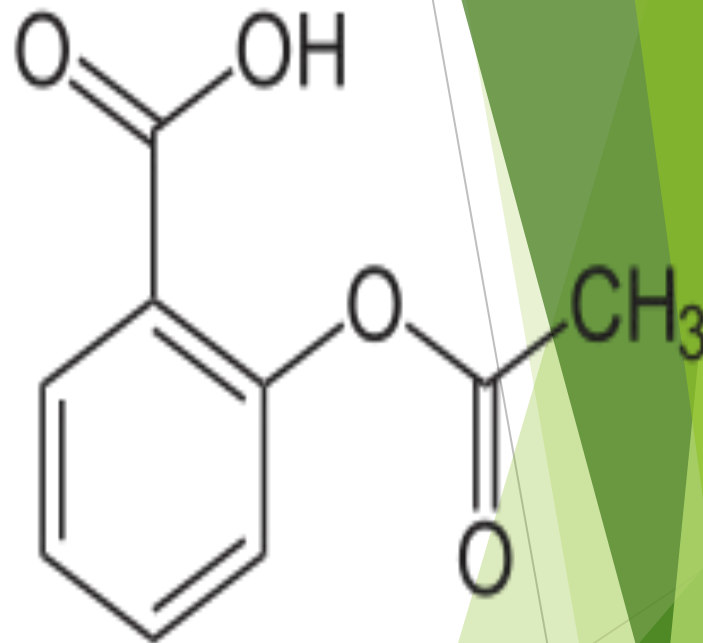
метилсалицилат

натрия салицилат

салициламид.

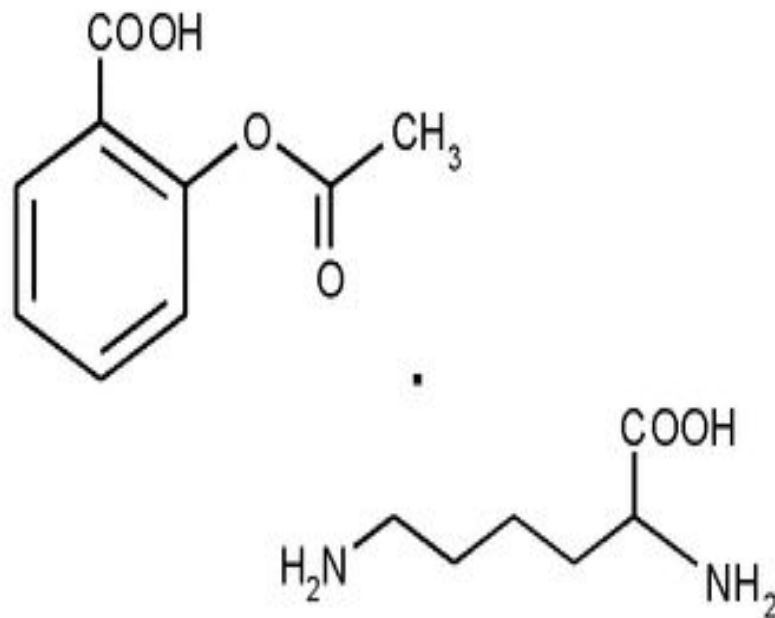
Ацетилсалициловая кислота

- Ацетилсалици́ловая кислота́ (разг. аспирин [31]; лат. *Acidum acetylsalicylicum*, салициловый эфир, салициловый эфир уксусной кислоты, салициловый эфир уксусной кислоты) — лекарственное средство, оказывающее анальгезирующее (обезболивающее), жаропонижающее (обезболивающее), жаропонижающее,



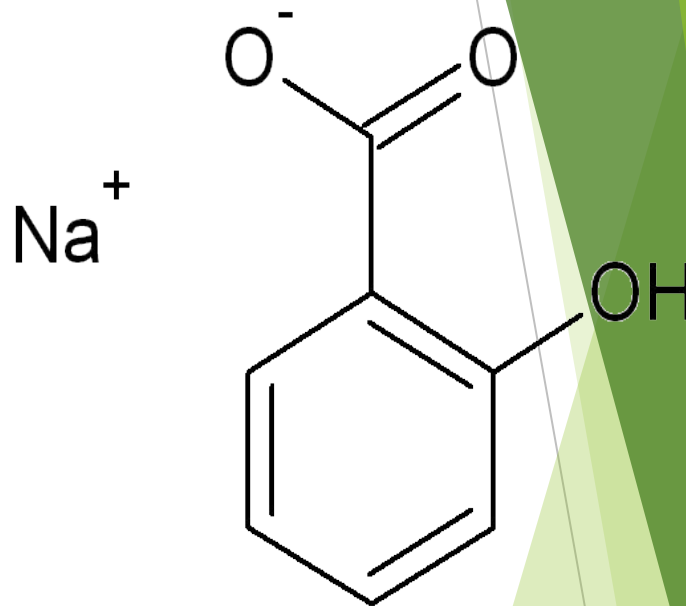
Ацетилсалицилат лизина

- Белый кристаллический порошок без запаха или со слабым специфическим запахом. Легко растворим в воде.
Фармакологическое действие - противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее, антиагрегационное.



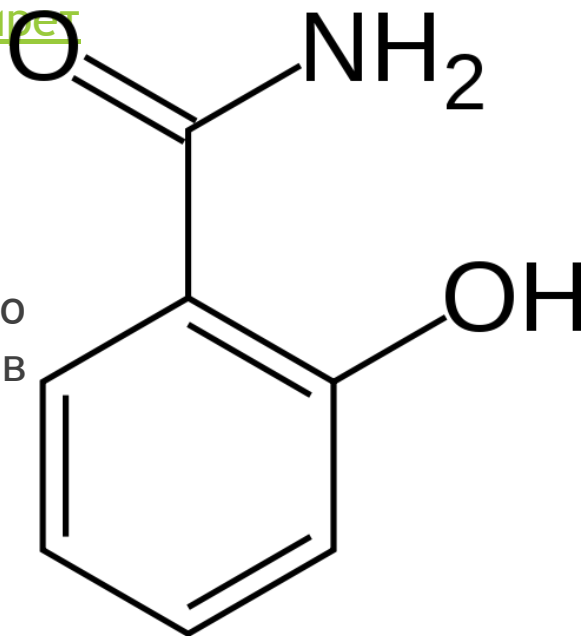
Натрия салицилат

- Натрия салицилат — лекарственное средство, анальгетик — лекарственное средство, анальгетик и антипиретик — лекарственное средство, анальгетик и антипиретик из группы производных салициловой кислоты. Основной профиль применения — в качестве болеутоляющего и жаропонижающего средства. Относится к возможным заменам ацетилсалициловой кислоты для чувствительных к ней людей.



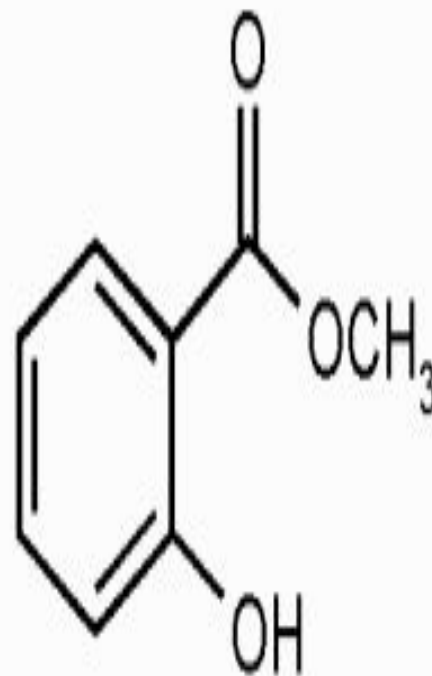
Салициламид

- Салициламид — лекарственное средство, анальгетик — лекарственное средство, анальгетик и антипиретик из группы производных салициловой кислоты. Медицинское применение салициламида аналогично ацетилсалициловой кислоте, то есть используется в основном в качестве болеутоляющего и жаропонижающего средства.



Метилсалицилат

Метилсалицилат (Methyl salicylas) – метиловый эфир метиловый эфир салициловой кислоты. Бесцветная летучая жидкость с сильным характерным запахом, основной компонент винтегрениневого эфирного масла Бесцветная летучая жидкость с сильным характерным запахом, основной компонент винтегрениневого 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 винтегрениневого эфирного масла,



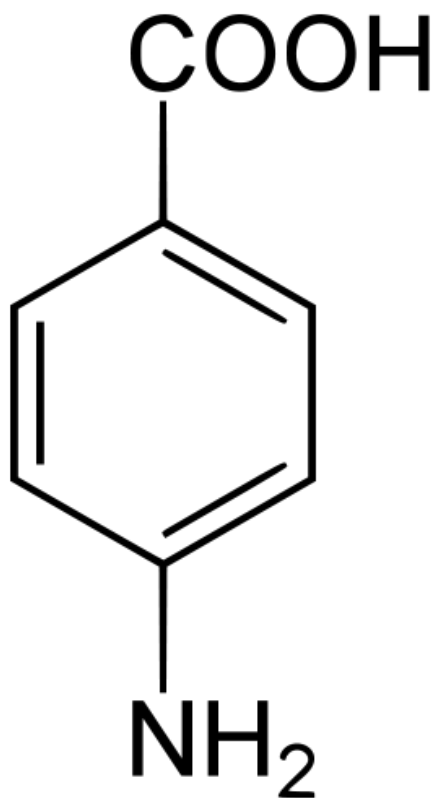
Применение в медицине

- Салициловая кислота – активный компонент ивовой коры. Ещё в XIX в. её использовали для лечения ревматизма и мочекишечного 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 «гальманин», 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 (салициламид) 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-аминосалициловую 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 шикиматным путём. Промежуточными соединениями являются шикимат. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4-дезоксихоризмат. Способностью к синтезу пара-аминобензоата обладают многие микрорганйзмы. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4-дезоксихоризмат. Способностью к синтезу пара-аминобензоата обладают многие микроорганизмы, растения. Промежуточными соединениями являются шикимат, хоризмат, 4-амино-4-дезоксихоризмат. Способностью к синтезу пара-аминобензоата обладают многие микроорганизмы, растения, грибы.

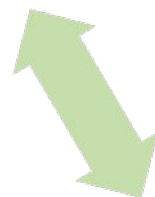
Метаболическая роль

- Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина. Являясь составной частью тетрагидрофолата Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина. Являясь составной частью тетрагидрофолата, остаток пара-аминобензойной кислоты участвует в синтезе пуринов Пара-аминобензоат является предшественником в биосинтезе важных кофакторов — тетрагидрофолата и тетрагидрометаноптерина.

Витамин В₁₀

- 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 В₉, 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.

Пара-аминобензойная
кислота



Аналоги
(сульфаниламиды)



Производные

Сульфаниламиды

Сульфаниламиды (лат. Сульфаниламиды (лат. sulfanilamide) – это группа химических веществ, производных пара-аминобензолсульфамида - амида сульфаниловой кислоты (пара-аминобензосульфоукислоты). Многие из этих веществ с середины двадцатого века употребляются в качестве антибактериальных препаратов. пара-Аминобензолсульфамид – простейшее соединение класса – также называется белым стрептоцидом Сульфаниламиды (лат. sulfanilamide) – это группа химических веществ, производных пара-аминобензолсульфамида - амида



Производные пара-аминобензойной кислоты

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



Заключение

Таким образом, производные салициловой и п-аминобензойной 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 углеводов», 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!