

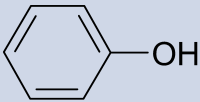
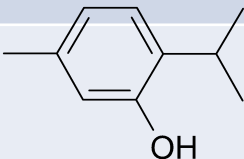
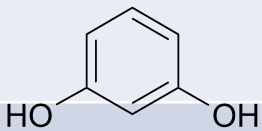


Фармацевтическая химия субстанций

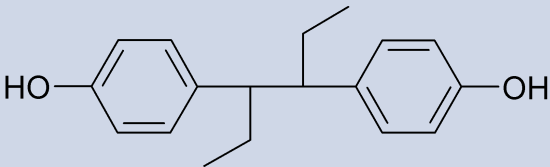
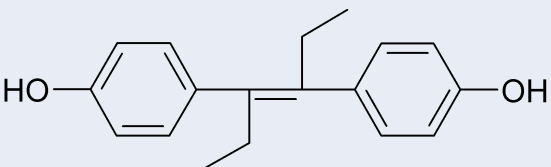
Лекция 5

Функциональные производные
ароматического ряда. 1 часть

Группа фенолов

Структура	Название	Описание
	Фенол (Phenolum, гидроксибензол)	Бесцветные, слабо-розовые или желтоватые кристаллы или кристаллическая масса со специфическим запахом. Гигроскопичен. Растворим в воде, легко растворим в спирте, галогенуглеводородах. ЛФ: растворы, мазь. Антисептическое средство.
	Тимол (Thymolum, 2- изопропил-5- метилфенол)	Крупные бесцветные кристаллы или кристаллический порошок. Летуч с водяным паром. Очень мало растворим в воде, легко растворим в полярных (спирт, уксусная кислота) и малополярных растворителях. ЛФ: порошок. Противоглистное средство.
	Резорцин (Resorcinum, 1,3- дигидроксибенз	Белый или желтоватый кристаллический порошок розовеющий на воздухе. Очень легко растворим в воде и спирте, легко –

Группа фенолов

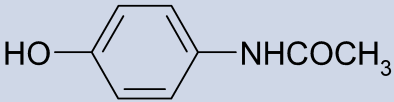
Структура, название	Описание
 <p>Синестрол (Synoestrolum, мезо-3,4-ди(4-гидроксифенил)гексан.</p>	<p>Белый или слегка желтоватый порошок. Практически нерастворим в воде, легко растворим в спирте и эфире, мало растворим в хлороформе. ЛФ : порошок, таблетки, раствор в масле для инъекций. Эстрогенное средство.</p>
 <p>Диэтилстильбэстрол (Diaethylstylboestrolum, транс-3,4-ди(4-гидроксифенил)гексен-3)</p>	<p>Белый кристаллический порошок. Растворим в спирте и эфире, мало растворим в хлороформе. ЛФ : таблетки. Эстрогенное средство.</p>

Качественная реакция с хлоридом железа (III)

ЛС	Окраска комплекса
Фенол	Фиолетовая
Резорзцин	Сине-фиолетовая
Тимол	Красно-фиолетовая
Синэстрол	Зелёная

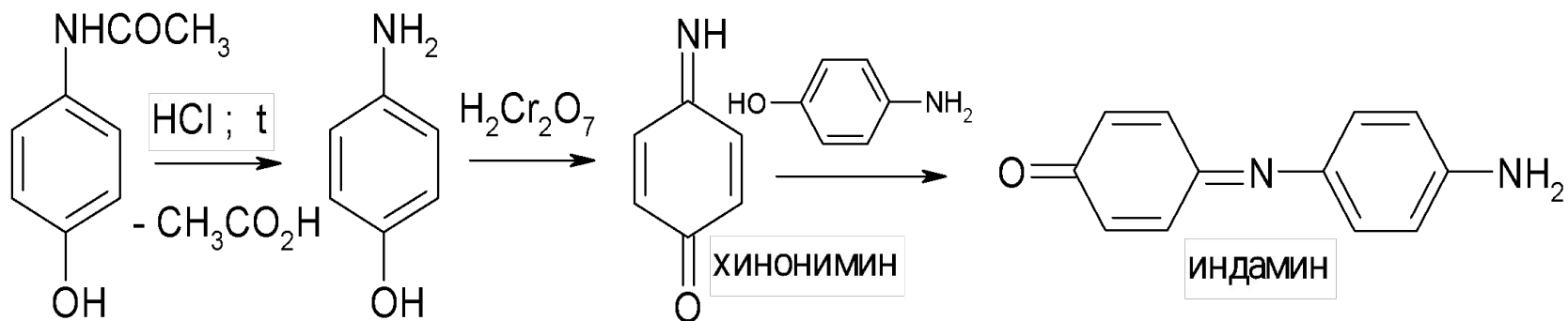


Производные 4-аминофенола

Структура	Название	Описание
	Парацетамол (Paracetamolum, 4-(ацетиламин о) фенол)	Белый или с кремовым или розоватым оттенком кристаллический порошок без запаха. $T_{пл}$ 168 -172 ⁰ С. Трудно растворим в воде, легко – в спирте, растворим в ацетоне и растворах щелочей, практически не растворим в эфире. ЛФ : порошок, таблетки. Жаропонижающее, болеутоляющее средство.

Другие характеристики по НД

- Окраска комплекса с FeCl_3
– сине-фиолетовая. Окисление



Образование азосоединения

Другие характеристики по НД

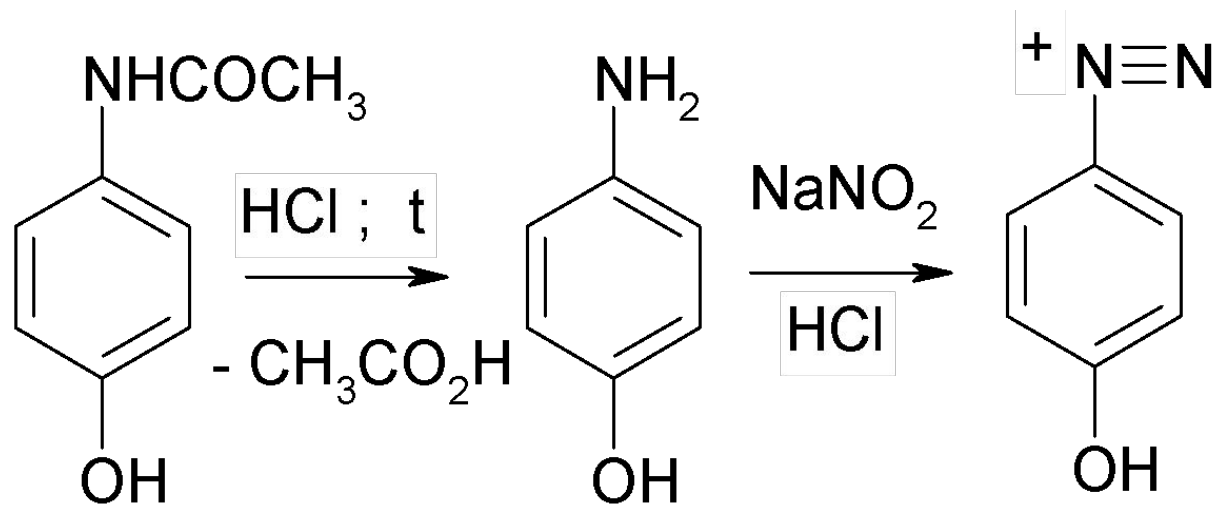
- Примеси :

4-аминофенол (не более 0,01%) (по раствору сравнения с нитропруссидом натрия)

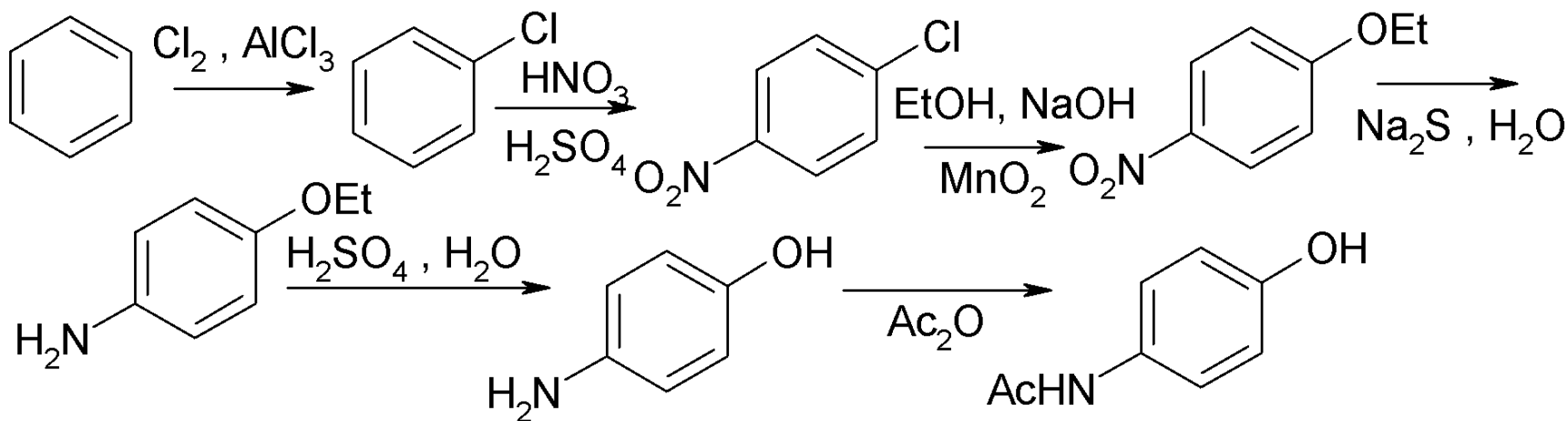
4-хлорацетанилид (не более 0,001%) (ТСХ)

- Количественное определение методом нитритометрии (медленно, в присутствии бромида калия, не выше 20⁰С)

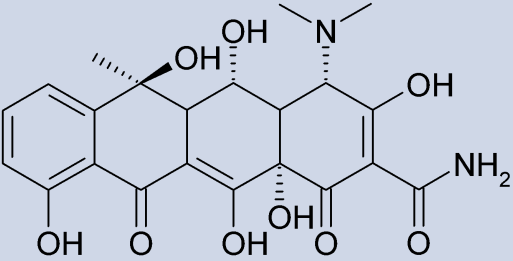
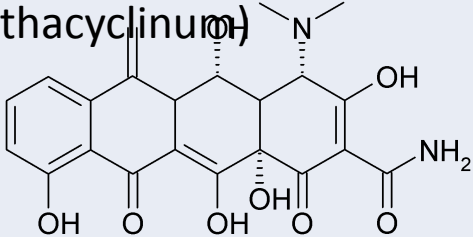
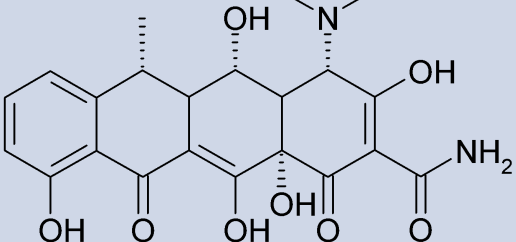
Нитритометрия парацетамола



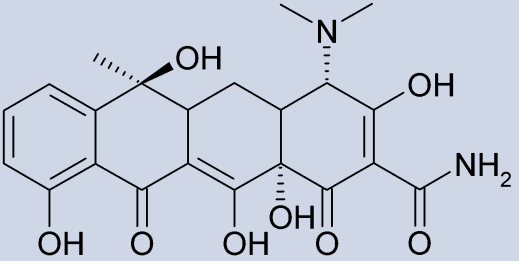
Синтез парацетамола



Производные гидрированного нафтацена

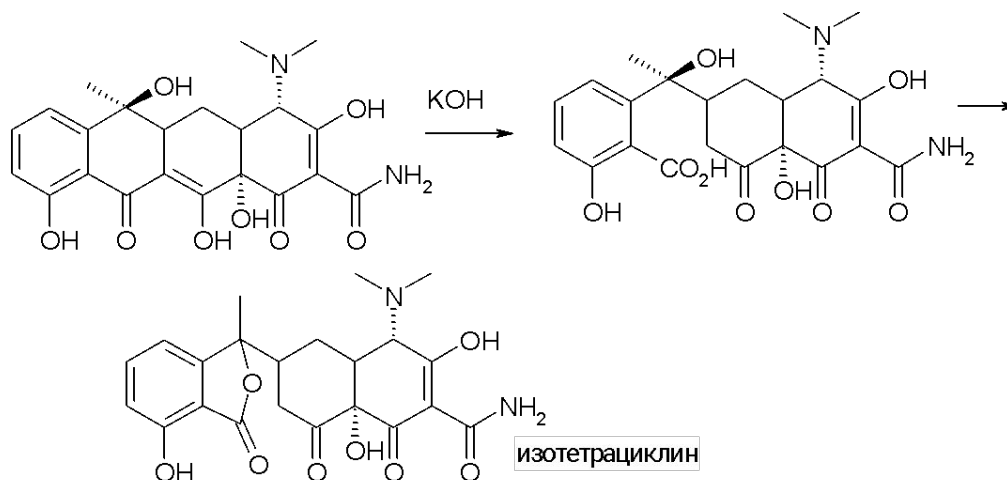
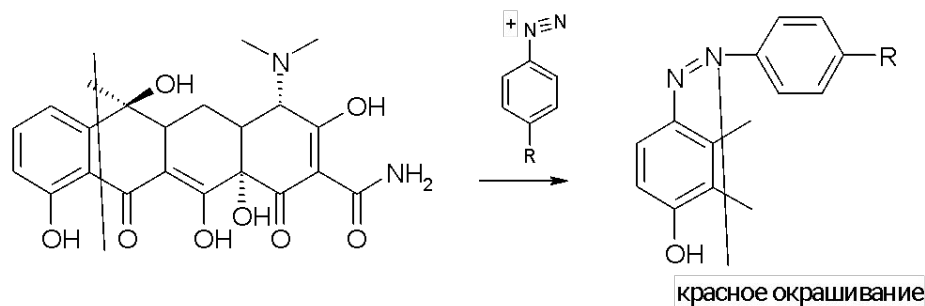
Структура, название	Описание
<p data-bbox="112 429 890 479">Окситетрациклин (Oxytetracyclinum)</p>  <p>The chemical structure of Oxytetracycline is a tetracycline derivative. It features a tetracyclic core with a phenolic ring at the 4-position, a dimethylamino group at the 12-position, and an amino group at the 4a-position. The structure is shown with stereochemistry: a hydroxyl group at C-5 is on a wedge, and hydroxyl groups at C-7 and C-8 are on dashes.</p>	<p data-bbox="981 429 1727 591">Светло-жёлтый кристаллический порошок без запаха. Темнеет на свету.</p> <p data-bbox="981 601 1804 762">Мало растворим в воде, легко растворим в разбавленных кислотах и щелочах. ЛФ : таблетки, мази.</p>
<p data-bbox="112 795 730 845">Метациклин (Methacyclinum)</p>  <p>The chemical structure of Methacycline is a tetracycline derivative. It features a tetracyclic core with a phenolic ring at the 4-position, a dimethylamino group at the 12-position, and an amino group at the 4a-position. The structure is shown with stereochemistry: a hydroxyl group at C-5 is on a dash, and hydroxyl groups at C-7 and C-8 are on dashes.</p>	<p data-bbox="981 795 1804 956">Жёлтый кристаллический порошок, горького вкуса. Умеренно растворим в воде, растворяется медленно.</p> <p data-bbox="981 966 1282 1013">ЛФ : капсулы.</p>
<p data-bbox="112 1090 716 1140">Доксициклин (Doxycyclinum)</p>  <p>The chemical structure of Doxycycline is a tetracycline derivative. It features a tetracyclic core with a phenolic ring at the 4-position, a dimethylamino group at the 12-position, and an amino group at the 4a-position. The structure is shown with stereochemistry: a hydroxyl group at C-5 is on a dash, and hydroxyl groups at C-7 and C-8 are on dashes.</p>	<p data-bbox="981 1090 1779 1138">Жёлтый кристаллический порошок.</p> <p data-bbox="981 1148 1528 1252">Легко растворим в воде, растворяется медленно.</p> <p data-bbox="981 1262 1597 1309">ЛФ : желатиновые капсулы.</p>

Тетрациклин

Структура	Название	Описание
 <p>The image shows the chemical structure of Tetracycline, a tetracycline antibiotic. It consists of a tetracyclic core with a phenyl ring fused to the first ring. The structure features several hydroxyl groups (OH) and a dimethylamino group (N(CH3)2) attached to the rings. A carboxamide group (-CONH2) is attached to the second ring. Stereochemistry is indicated with wedged and dashed bonds.</p>	<p>Тетрациклин (Tetracyclinum, 4- диметиламино-1,4,4- а,5,5а,6,11,12а- октагидро-3,6,10,12,12а- пентаокси-6-метил-1,11- диоксонафтацен-2- карбоксамид)</p>	<p>Жёлтый кристаллический порошок без запаха, горького вкуса. При хранении на свету темнеет. Очень мало растворим в воде, мало растворим в спирте. ЛФ : таблетки, покрытые оболочкой (для гидрохлорида – порошок для инъекций, капсулы, мази). Антибиотик.</p>

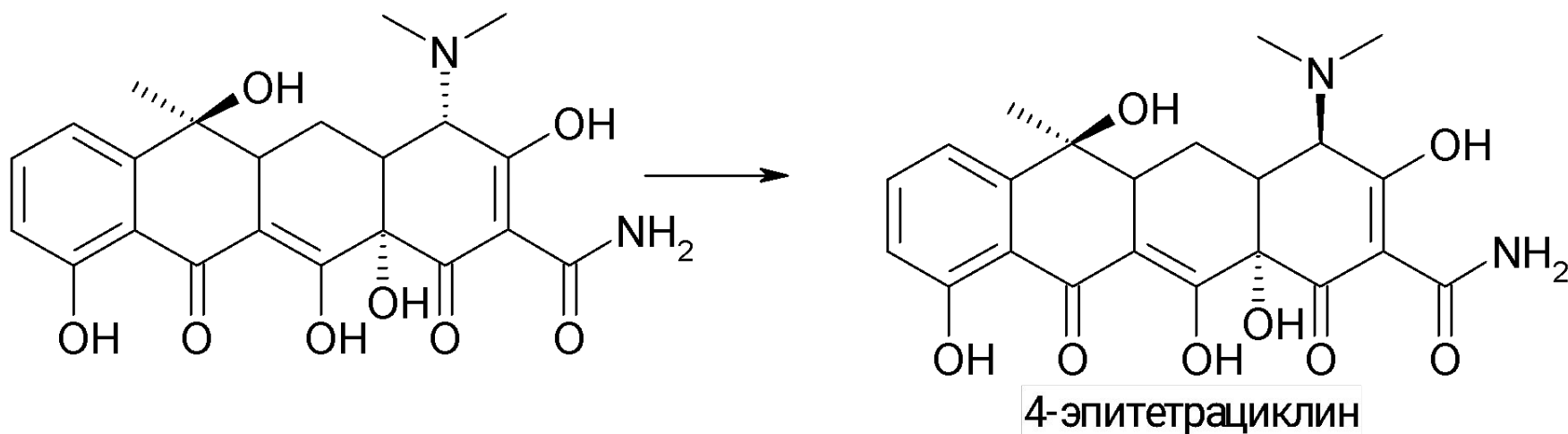
Другие характеристики по НД

- Подлинность (с диазониевыми солями и под действием щёлочи)



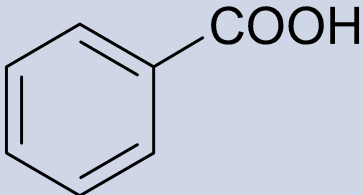
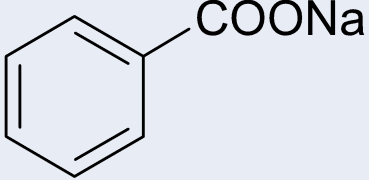
Другие характеристики по НД

- Реакция с конц H_2SO_4 : тетрациклин – фиолетовое ; окситетрациклин – вишнёво-красное
- Примеси – 4-эпитетрациклин (ТСХ)



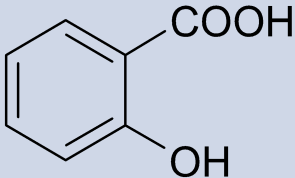
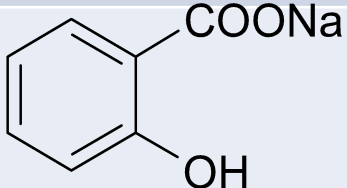
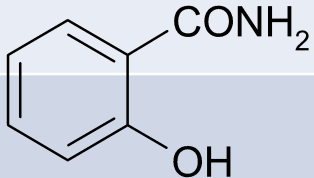
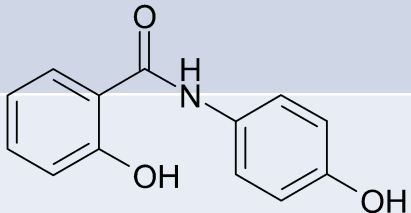
- Производят тетрациклин биотехнологическим методом на культурах плесневых грибов

Производные бензойной кислоты

Структура	Название	Описание
	Бензойная кислота (Acidum benzoicum)	Бесцветные игольчатые кристаллы или белый мелкокристаллический порошок. $T_{пл}$ 121 -125 ⁰ С. При нагревании возгоняется. Мало растворима в воде, растворима в кипящей воде, легко растворима в спирте, хлороформе, растворима в жирных маслах. ЛФ : порошок, мази. Антисептическое средство.
	Бензоат натрия (Natrii benzoas, натриевая соль бензойной кислоты)	Белый кристаллический порошок без запаха. Легко растворим в воде, очень мало растворим в спирте. ЛФ : порошок, раствор для внутривенного введения, микстуры.

Производные салициловой

КИСЛОТЫ

Структура	Название	Описание
	Салициловая кислота (Acidum salicylicum, 2-оксibenзойная кислота)	Белые игольчатые кристаллы или порошок без запаха. Мало растворима в воде, легко в спирте, эфире. ЛФ : присыпки, мази, растворы. Антисептик
	Салицилат натрия (Natrii salicylas, натриевая соль 2-оксibenзойной кислоты)	Белый кристаллический порошок или чешуйки. Легко растворим в воде, глицерине, растворим в спирте. ЛФ : порошок, таблетки. Противоревматическое, болеутоляющее, др.
	Салициламид (Salicylamidum, амид 2-оксibenзойной кислоты)	Белый кристаллический порошок без запаха. Растворим в спирте, эфире, очень мало – в воде, мало – в хлороформе. ЛФ : порошок, таблетки.
	Оксафенамид (Oxaphenamidum, N-(4-оксифенил)амид 2-	Белый или с лиловато-серым оттенком порошок без запаха. Практически нерастворим в воде,

Производные салициловой КИСЛОТЫ

Структура	Название	Описание
	Ацетилсалициловая кислота (Acidum acetylsalicylum, 2-ацетоксибензойная кислота)	Бесцветные кристаллы или порошок без запаха, слабокислого вкуса. Гидролизуется. Растворим в хлороформе, эфире, мало - в воде, легко - в спирте. ЛФ : порошок, таблетки. Противовоспалительное, жаропонижающее и др.
	Фенилсалицилат (Phenylis salicylas, фениловый эфир 2-оксибензойной кислоты)	Белый кристаллический порошок со слабым запахом. Растворим в спирте, практически нерастворим в воде, легко в хлороформе. ЛФ : порошок, таблетки. Антисептик

Домашнее задание

- В схемах реакций добавить коэффициенты
- Разобраться в нумерации тетрациклинов и определить абсолютную конфигурацию хиральных центров