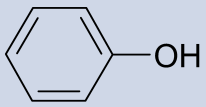
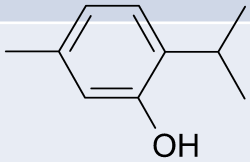
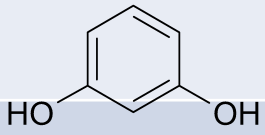
МИРЭА
Российский технологический университет

Фармацевтическая химия субстанций

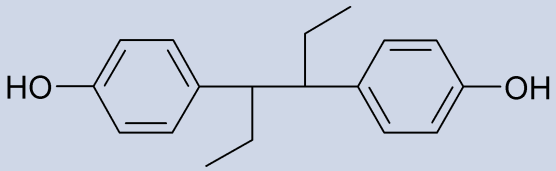
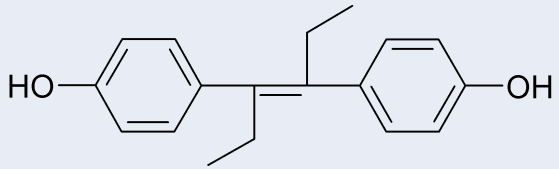
Лекция 5

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 –

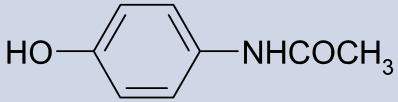
Группа фенолов

Структура, название	Описание
 Синестрол (Synoestrolum, мезо-3,4-ди(4-гидроксифенил)гексан.	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.
 Диэтилстильбэстрол (Diaethylstylboestrolum, танс-3,4-ди(4-гидроксифенил)гексен-3)	Белый кристаллический порошок. Растворим в спирте и эфире, мало растворим в хлороформе. ЛФ : таблетки. Эстрогенное средство.

Качественная реакция с хлоридом железа (III)

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

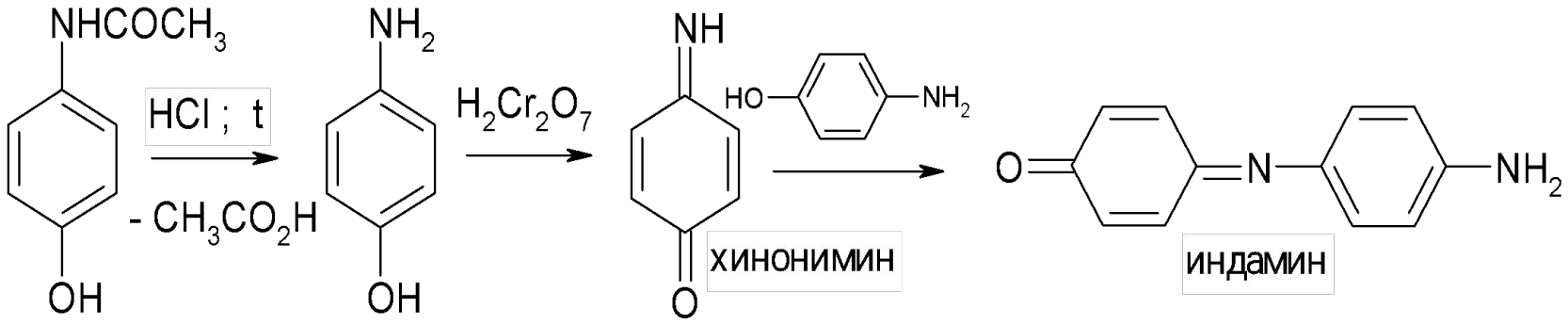
Производные 4-аминофенола

Структкра	Название	Описание
	Парацетамол (Paracetamolum, 4-(ацетиламино) 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

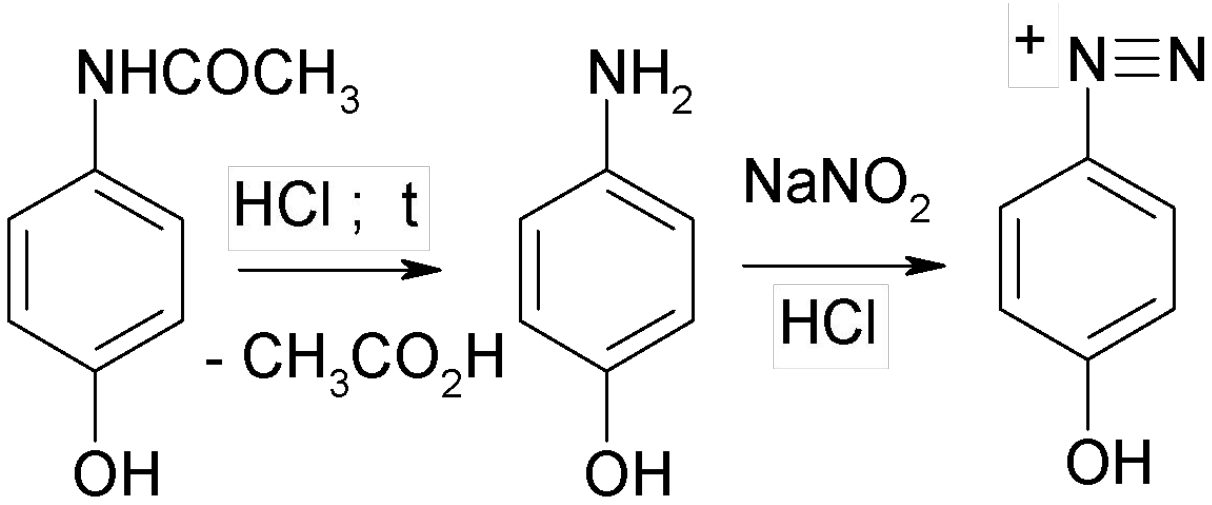
- Примеси :

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

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

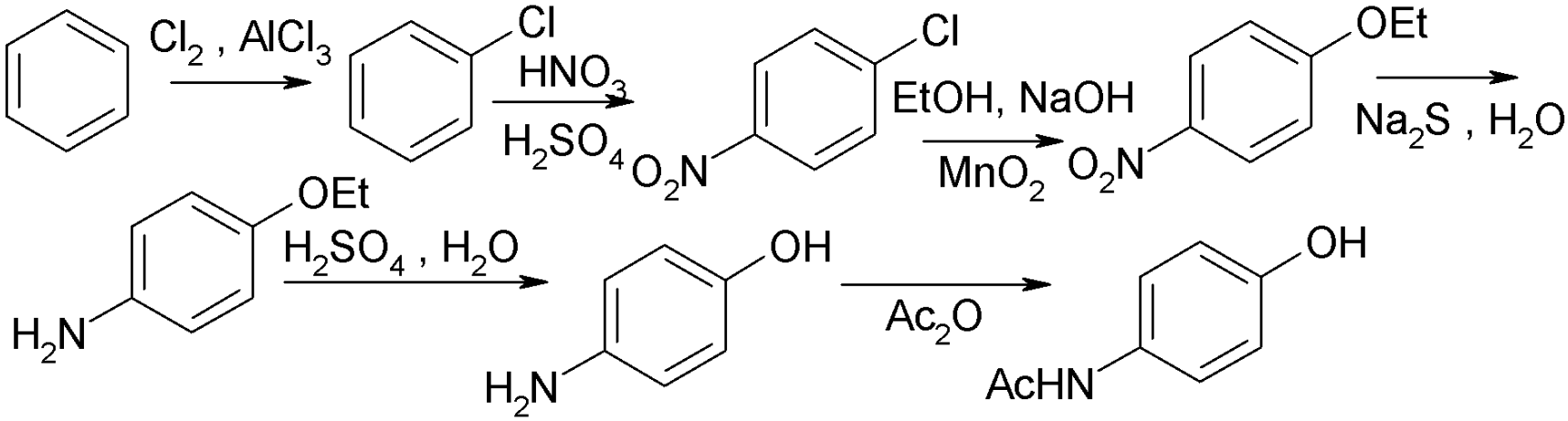
- Количественное определение методом нитритометрии (медленно, в присутствии бромида калия, не выше 20^0С)

Нитритометрия парацетамола

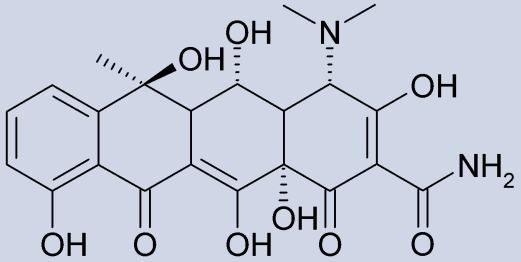
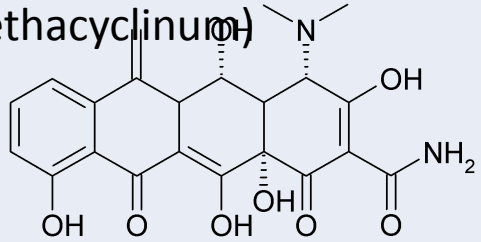
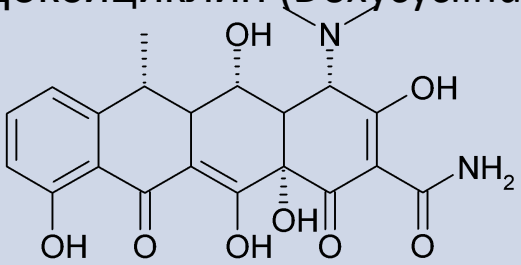


$$NaNO_2 + KI + HCl = I_2 + NO + KCl + H_2O$$

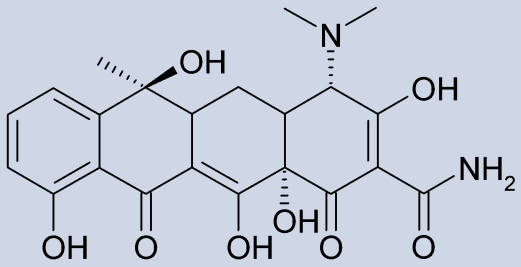
Синтез парацетамола



Производные гидрированного нафтацена

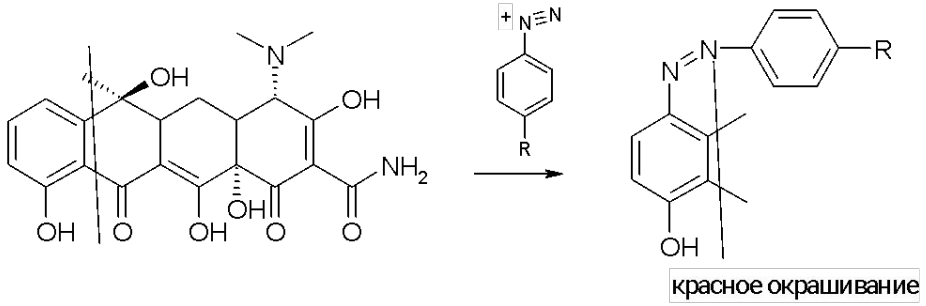
Структура, название	Описание
Окситетрациклин (Oxytetracyclinum) 	Светло-жёлтый кристаллический порошок без запаха. Темнеет на свету. Мало растворим в воде, легко растворим в разбавленных кислотах и щелочах. ЛФ : таблетки, мази.
Метациклин (Methacyclinum) 	Жёлтый кристаллический порошок, горького вкуса. Умеренно растворим в воде, растворяется медленно. ЛФ : капсулы.
Доксициклин (Doxycyclinum) 	Жёлтый кристаллический порошок. Легко растворим в воде, растворяется медленно. ЛФ : желатиновые капсулы.

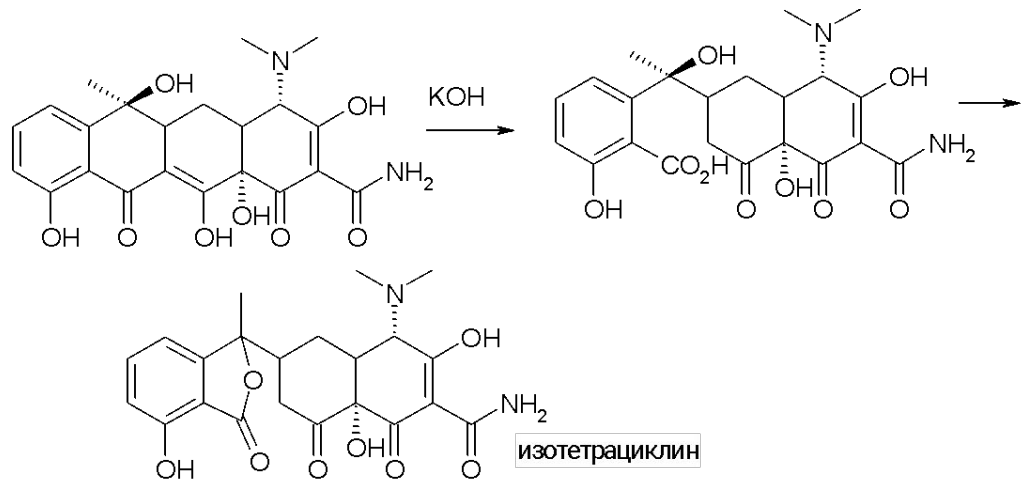
Тетрациклин

Структура	Название	Описание
	Тетрациклин (Tetracyclinum, 4-диметиламино-1,4,4 a,5,5a,6,11,12a-октагидро-3,6,10,12,12a-пентаокси-6-метил-1,11-диоксонафтацен-2-карбоксамид)	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.

Другие характеристики по НД

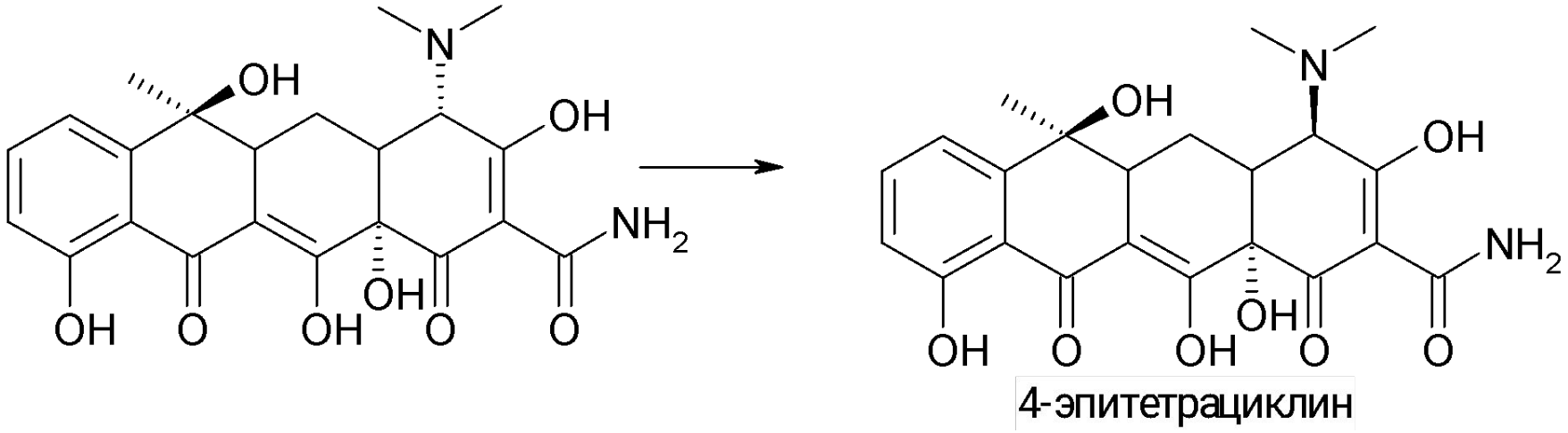
- Подлинность (с диазониевыми солями и под действием щёлочи)





Другие характеристики по НД

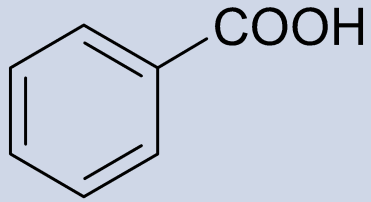
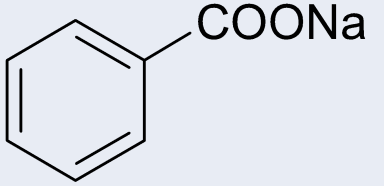
- Реакция с конц H_2SO_4 : тетрациклин – фиолетовое ; окситетрациклин – вишнёво-красное
- Примеси – 4-эпитетрациклин (ТСХ)



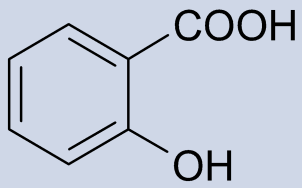
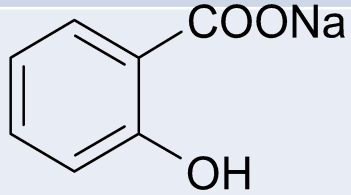
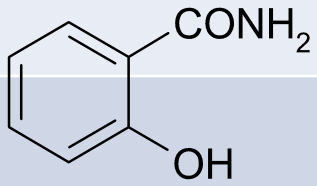
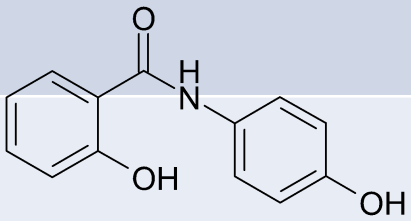
4-эпитетрациклин

- 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-оксибензойная 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-оксибензойной кислоты)	Белый кристаллический порошок или чешуйки. Легко растворим в воде, глицерине, растворим в спирте. ЛФ : порошок, таблетки. Противоревматичес-кое, болеутоляющее, др.
	Салициламид (Salicylamidum, амид 2-оксибензойной 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)	Бесцвеные 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 (Phenylii 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