Управление образования администрации г.Дзержинска

Муниципальное Образовательное Учреждение

Средняя Общеобразовательная Школа№7

***НПК «Старт в науку»***

***Химия в медицине.***

***Сульфаниловая кислота.***

***Секция химии***

Автор работы: Панкова Мария, ученица 11класса Б

МОУ СОШ №7

Руководитель: Куимова Ольга Константиновна

Дзержинск 2011г.

Оглавление

Введение 3

I.Литературный обзор 5

1.История фармакологии 5

2.Классификация лекарств 9

2.1Антибактериальные и химиотерапевтические средства 12

2.2Снотворные средства 14

2.3 Алкалоиды 16

2.4 Психотропные средства 17

2.5 Анальгезирующие, жаропонижающие и противоспалительные средства 18

3. Сульфаниловая кислота 20

II. Практическая часть 23

1.Получение сульфаниловой кислоты 23

2.Перекристаллизация сульфаниловой кислоты 25

III. Выводы 26

IV. Cписок литературы 27

V. Приложение 28

**I.Введение**

Химия должна помогать медицине в борьбе с болезнями. Однако эти науки прошли длинный и сложный путь развития, прежде чем им удалось добиться успеха в решении общих задач. Химия делала первые неуверенные шаги, когда медики уже располагали целым арсеналом сведений и наблюдений и часто довольно успешно справлялись с болезнями. Человек тысячами нитей связан с окружающей средой - он часть природы и следует ее законам. И в те времена, когда химики еще ничего не знали об элементах, атомах и молекулах, эта истина была усвоена врачами.

В средние века алхимики неоднократно делали попытки вмешаться в медицину и часто врач, и химик совмещались в одном лице. Однако алхимические теории не могли принести пользы практической медицине, так как они основывались не на опыте, а на предвзятых и ложных утверждениях и, как правило, вели к ошибкам. Так, легендарный химик и врач, Василий Валентин, написавший книгу о сурьме («триумфальная колесница антимония»), предлагал ее для избавления от всех болезней. Этот элемент - аналог мышьяка - ничего, кроме вреда, не мог принести страждущим. Случайные удачи химиков и использование народного опыта все-таки помогали медикам, и контакты между ними и химиками никогда не прерывались. В XV в. Теофраст Парацельс опроверг учение о пневмах, но тут же заменил их не менее таинственным «археем», не имеющим материальной природы, но подчиняющим себе материю. Эти фантастические «теории» были скоро забыты, но практическая врачебная деятельность Парацельса оказалась продуктивной. Он исследовал соединения ртути и мышьяка и заложил основу ятрохимии - науки о применении определенных химических соединений для лечения болезней. Правда, рецепты Парацельса вызвали бы у современных врачей скорее испуг, чем восхищение, но все же это были шаги по правильному пути, который действительно мог привести к успеху и привел к нему через четыре сотни лет. История медицины сохранила опись «всяким зельям», привезенным в Москву в 1602г. английским аптекарем Джеймсом Френчем по поручению королевы Елизаветы. Среди «зелий» числятся: «цидоны яблоки в сахаре, слива дамасен, сироп соку цитронов, водка коричная, можжевеловая, пиретрум, калган, алоэ, опиум» и даже «глина армянская»; имеются и вещества животного происхождения, например «олений рог». Всего 171 лекарство.

Некоторые из них, безусловно, приносили пользу, это, в частности, «сок цитронов», т.е. лимонный сок, калган, алоэ, которые и ныне применяются в медицине.

В XIX в. прогресс теоретической химии, великие открытия М. В.

Ломоносова, А. Лавуазье, Д.И. Менделеева, достижения в области биологии, стимулированные созданием микроскопа (Левенгук, XVII в.), развитие клеточной теории и бактериологии тесно сблизили дороги химии и медицины и способствовали появлению плодотворных идей. Блестящим выражением новых идей оказалось создание метода дезинфекции. Химики нашли вещества, способные уничтожать в окружающей среде невидимых и свирепых врагов организма - микробов, вызывающих нагноение ран, общее заражение крови, различные инфекционные заболевания. При этом речь шла не о специальном подборе веществ, действующих именно на данный вид микроорганизмов, а о дезинфицирующем воздействии, которое губит все микробы. Постепенно были заложены основы гигиены - области, в которой пути химии и медицины сошлись с великой пользой для человечества.

Цель: Доказать необходимость медицинских препаратов на примере сульфаниловой кислоты.

Задачи:

1. Изучить историю создания фармакологии.
2. Рассмотреть классификацию и применения лекарственных препаратов.
3. Получить и идентифицировать сульфаниловую кислоту.

**I. Литературный обзор.**

1. История фармакологии.

Фармацевтическая промышленность является сравнительно молодой отраслью производства. Еще в середине 19 столетия производство лекарственных средств в мире было сосредоточено в разобщенных аптеках, в которых провизоры изготовляли препараты по только им известным рецептам, передававшимся по наследству. Большую роль в то время играли средства неродной медицины. Фармацевтическое производство развивалось неравномерно и зависело от ряда обстоятельств. Так, работы Луи Пастера в 60-х годах 19 века послужили основой для производства вакцин, сывороток. Освоение промышленного синтеза красителей в Германии в последней четверти 19 века привело к производству лекарств фенацетина и антипирина.

В 1904 г. немецкий врач Пауль Эрлих заметил, что при введении некоторых красителей в ткани подопытных животных эти красители лучше окрашивают клетки бактерий, чем клетки животного, в которых эти бактерии живут. Эрлих нашел краситель, который внедрялся в трипаносомы, вызывающие у человека сонную болезнь. Вместе с тем для мышей. На которых проводился опыт, краситель был безвреден. Эрлих опробовал краситель на зараженных мышах; у них болезнь протекала легче, но все же краситель был слабым ядом для трипаносом. Тогда Эрлих ввел в молекулу красителя атомы мышьяка – сильнейшего яда. Он надеялся, что краситель “утащит” весь мышьяк в клетки трипаносом, а мышам его достанется совсем не много. Так и случилось. К 1909 г. Эрлих доработал свое лекарство, синтезировав вещество, избирательно поражавшее трипаносомы, но малотоксичное для теплокровных животных – 3,3’-диамино-4.4’- дигидроксиарсенобензол. В его молекуле два атома мышьяка. Так начиналась химия синтетических лекарственных препаратов.

До 30-х годов 20 века в фармацевтической химии основное место занимали лекарственные растения (травы). В середине 30-х годов 20 века фармацевтическая промышленность стала на путь целенаправленного органического синтеза, чему способствовало обнаруженное немецким биологом Г. Домагком (19340) антибактериальное свойство красителя – пронтозила, синтезированного в 1932 г. Начиная с 1936 г. на основе этого соединения широко развернулись поиски так называемых сульфаниламидных антикокковых препаратов.

В X—XI веке появились на Руси первые рукописные руководства по лекарствоведению. Они содержали описания лекарственных средств растительного происхождения и назывались «травниками», «зелейниками». Лекарственные растения в те времена продавались в зеленных лавках вместе с овощами. Лица, не имеющие медицинского образования, часто использовали эти растения неправильно, что приводило к отравлениям.

Свободная торговля лекарственными растениями была запрещена только в начале XVIII века. Указом Петра I лекарственные растения разрешалось продавать только в аптеках. К этому времени относится создание «аптекарских огородов», на которых специально выращивали лекарственные растения. Такие огороды были созданы в Петербурге (ныне Ботанический сад в Ленинграде), под Воронежем, на Украине.

В середине XIX века в России появились первые лаборатории экспериментальной фармакологии. Самая первая лаборатория такого рода была создана в России в Дерпте (Тарту) в 1847 г. В 60—70-х годах фармакологические лаборатории были открыты в Петербургской медико-хирургической академии, в Московском, Киевском и Казанском университетах.

Большой интерес к экспериментальной фармакологии проявляли передовые русские клиницисты. Так, выдающийся хирург Н. И. Пирогов совместно с А. М. Филомафитским провел экспериментальное изучение действия первых наркотических препаратов — эфира и хлороформа — на организм животных. При клинике крупнейшего русского терапевта С. П. Боткина была создана фармакологическая лаборатория, в которой исследовались многие лекарственные средства, в том числе сердечные гликозиды, жаропонижающие вещества, горечи и др. С 1879 по 1890 г. этой лабораторией заведовал И. П. Павлов — в будущем великий русский физиолог. Таким образом, И. П. Павлов начинал свою научную деятельность в качестве фармаколога и как фармаколог приобрел большую известность. Поэтому, когда в 1890 г. освободилось место профессора кафедры фармакологии Петербургской военно-медицинской академии, оно было предложено И. П. Павлову, который и заведовал этой кафедрой до 1895 г.

С 1899 г. кафедрой фармакологии Военно-медицинской академии стал заведовать Н. П. Кравков (1865—1924). Бессменно оставаясь в этой должности до 1924 г., он сделал чрезвычайно много для развития отечественной фармакологии. Н. П. Кравкова по праву считают основоположником отечественной научной фармакологии. С необычным даром научного предвидения он развивал наиболее прогрессивные и перспективные направления в фармакологии. Одним из первых Н. П. Кравков стал изучать зависимость действия лекарственных веществ от их химического строения, дозы, состояния организма, на который они воздействуют. Ему принадлежат замечательные работы по эндокринологии, токсикологии. Н. П. Кравков уделял большое внимание внедрению достижений фармакологии в клинику. Так, например, им было предложено первое средство для внутривенного наркоза — гедонал, который он совместно с хирургом С. П. Федоровым испытал в клинике.

Н. П. Кравков был также замечательным педагогом, автором учебника по фармакологии, выдержавшего 14 изданий. Он создал свою школу в фармакологии, многие его ученики стали известными фармакологами.

Развитию фармакологии в значительной степени способствовала деятельность таких крупнейших русских фармакологов, как А. А. Лихачев (1866—1942), М. П. Николаев (1893— 1949), А. И. Кузнецов (1898—1951), Н. В. Вершинин (1867—1951), В. И. Скворцов (1879—1958), А. И. Черкес (1892—1974), Н. В. Лазарев (1895—1974), С. В. Аничков (1892—1981).

Прогресс современной фармакологии связан с научно-исследовательской работой, проводимой в научно-исследовательских институтах, на кафедрах фармакологии, а также с развитием фармацевтической промышленности. До 1917 г. в России не было фармакологических научно-исследовательских институтов, химико-фармацевтическая промышленность была развита крайне слабо и большинство лекарственных препаратов ввозилось из-за границы.

После Великой Октябрьской социалистической революции в СССР был создан ряд специальных институтов, где стали разрабатываться фармакологические проблемы. Увеличилось количество кафедр фармакологии, которые также ведут большую научно-исследовательскую работу. Особенно следует отметить развитие в СССР химико-фармацевтической промышленности, которая в настоящее время практически полностью удовлетворяет потребности страны в медикаментах.

В дальнейшем начал формироваться современный фармацевтический рынок, который действительно, в отличие от существовавшей ранее планово-распределительной системы, можно называть рыночным образованием. Спустя 10 лет на фармацевтическом рынке Российской Федерации все еще происходят структурные изменения, которые показывают, что процесс формирования рыночной инфраструктуры не завершен.

Историческое развитие лекарственного обеспечения населения России привело, в конечном итоге, к возникновению современного фармацевтического рынка. Динамичное развитие фармацевтического рынка определяется его жизненным [приоритетом](http://www.SmartCat.ru/Referat/ztpeiramma.shtml), так как человечество самого начала своего существования нуждается в постоянном [потреблении](http://www.SmartCat.ru/Referat/ptjeiramck.shtml) продукции медицинского назначения, чтобы поддерживать свое здоровье на необходимом для полноценной жизни уровне. [Потребность](http://www.SmartCat.ru/Referat/vtjeiramie.shtml) конечного [потребителя](http://www.SmartCat.ru/Referat/ctjeirampx.shtml) в обеспечении лекарственными средствами является необходимым условием для защиты здоровья, а иногда и жизни. Индивид, имеющий при прочих равных условиях хорошее здоровье, имеет предпочтительные возможности для получения большего [дохода](http://www.SmartCat.ru/Management/stkedramfh.shtml), и повышения, соответственно, уровня своего [благосостояния](http://www.SmartCat.ru/Referat/gtvebramtt.shtml). Поэтому, перспектива развития фармацевтического рынка более чем оптимистична, так как [потребитель](http://www.SmartCat.ru/Referat/ctjeirampx.shtml) всегда будет нуждаться в продукции предлагаемой [данным](http://www.SmartCat.ru/Referat/ktuecramxp.shtml) рынком. Высокая социальная приоритетность рынка фармацевтической продукции сочетается с низкой [эластичностью](http://www.SmartCat.ru/Referat/ottemrambl.shtml) [спроса](http://www.SmartCat.ru/Referat/itjekramvr.shtml) на лекарственные средства, что позволяет относить фармацевтический [рынок](http://www.SmartCat.ru/Referat/mtsejramzn.shtml) в [категорию](http://www.SmartCat.ru/Referat/ttweeramgg.shtml) социально-значимых рынков.

2.Классификация лекарств

Системы классификации лекарственных средств выполняют функцию «общего языка», используемого для унифицированного описания их номенклатуры в стране или регионе, а так же позволяют сравнить на национальном и международном уровнях данные о потреблении лекарственных средств.

Обеспечение доступа к стандартизированной и валидированной информации об использовании лекарственных средств необходимо для:

- проведения аудита структуры их потребления,

- выявления недочетов при их использовании,

- инициирования образовательных и других мероприятий и т.д.

Главная цель создания международных стандартов — сравнение данных из разных стран.

В области исследований потребления лекарственных средств

Анатомо-терапевтическая и химическая (Anatomical Therapeutic Chemical — ATC) классификация

Анатомо-терапевтическая (Anatomical Therapeutic — АТ) классификация

В рамках системы, разработанной EPhMRA, лекарственные средства разбиваются на группы трех или четырех уровней. Классификация АТС модифицировала и расширила классификацию EPhMRA, включив в нее терапевтические/фармакологические/химические подгруппы на четвертом уровне и химические субстанции на пятом уровне.

Классификацию EPhMRA использует IMS с целью предоставления статистических результатов исследований рынка для нужд фармацевтической промышленности. Необходимо подчеркнуть, что из-за целого ряда технических различий между классификационными системами EPhMRA и АТС нельзя провести прямое сравнение данных, собранных с помощью обеих систем.

Классификационная система АТС (Anatomical Therapeutic Chemical classification system) наряду со специально разработанными единицами потребления лекарственных средств - установленными суточными дозами (DDD - Defined Daily Doses) принята ВОЗ в качестве основы международной методологии для проведения статистических исследований в области потребления лекарственных средств.

В настоящее время систему АТС/DDD широко используют как государственные учреждения, так и фармацевтические компании во многих странах мира.

Любые международные стандарты рождаются в поисках компромисса, и система классификации лекарственных средств не является исключением из общего правила. Лекарственные средства могут использоваться по двум или более одинаково важным показаниям, в то же время основные показания к их применению в разных странах могут различаться. Это нередко приводит к появлению различных альтернатив для их классификации, однако следует принять решение в отношении основного показания. Страны, в которых лекарственные средства используют иначе, чем это определено системой АТС, могут стремиться разрабатывать национальные классификационные системы. Однако прежде следует взвесить значение национальных традиций, с одной стороны, и возможности ввести методологию, которая позволит проводить достоверные сравнения потребления лекарственных средств на международном уровне. В настоящее время можно привести множество примеров того, что активное внедрение методологии ATC/DDD оказалось мощным импульсом для проведения национальных исследований в сфере потребления лекарственных средств и создания дееспособных систем по контролю лекарственных средств.

Так же лекарственные вещества разделяют по двум классификациям:

Лекарственные вещества

Химические

Фармакологические

Первая классификация более удобна для медицинской практики. Согласно этой классификации, лекарственные вещества делятся на группы в зависимости от их действия на системы и органы.

В основу химической классификации положено химическое строение и свойства веществ, причем в каждой химической группе могут быть вещества с различной физиологической активностью. По этой классификации лекарственные вещества подразделяются на:

Лекарственные вещества

Неорганические

Органические

Неорганические вещества рассматриваются по группам элементов периодической системы Д. И. Менделеева и основным классам неорганических веществ (оксиды, кислоты, основания, соли).

Органические соединения делятся на производные алифатического, алициклического, ароматического и гетероциклического рядов. Химическая классификация более удобна для химиков, работающих в области синтеза лекарственных веществ.

2.1 Антибактериальные и химиотерапевтические средства

Обычно антибиотиком называют вещество, синтезируемое одним микроорганизмом и способное препятствовать развитию другого микроорганизма. Слово “антибиотик” состоит из двух слов: от греч. anti – против и греч. bios – жизнь, то есть вещество, действующее против жизни микробов.

В 1929 г. случайность позволила английскому бактериологу Александру Флемингу впервые наблюдать противомикробную активность пенициллина. Культуры стафилококка, которые выращивались на питательной среде, были случайно заражены зеленой плесенью. Флеминг заметил, что стафилококковые палочки, находящиеся по соседству с плесенью, разрушались. Позднее было установлено, что плесень относится к виду Penicillium notatum.

В 1940 году удалось выделить химическое соединение, которое производил грибок. Его назвали пенициллином. В 1941 году пенициллин был опробован на человеке как препарат для лечения болезней, вызываемых стафилококками, стрептококками, пневмококками и др. микроорганизмами.

В настоящее время описано около 2000 антибиотиков, но лишь около 3% из них находят практическое применение, остальные оказались токсичными. Антибиотики обладают очень высокой биологической активностью. Они относятся к различным классам соединений с небольшим молекулярным весом. Антибиотики различаются по своей химической структуре и механизмом действия на вредные микроорганизмы. Например, известно, что пенициллин не дает возможности бактериям производить вещества, из которых они строят свою клеточную стенку. Нарушение или отсутствие клеточной стенки может привести к разрыву бактериальной клетки и выливанию ее содержимого в окружающее пространство. Это может также позволить антителам проникнуть в бактерию и уничтожить ее. Пенициллин эффективен только против грамположительных бактерий. Стрептомицин эффективен и против грамположительных и грамотрицательных бактерий. Он не позволяет бактериям синтезировать специальные белки, нарушая, таким образом, их жизненный цикл. Стрептомицин вместо РНК вклинивается в рибосому, и все время путает процесс считывания информации с мРНК. Существенным недостатком стрептомицина является чрезвычайно быстрое привыкание к нему бактерий, кроме того, препарат вызывает побочные явления: аллергию, головокружение и т п.

К сожалению, бактерии постепенно приспосабливаются к антибиотикам и поэтому перед микробиологами постоянно стоит задача создания новых антибиотиков.

К антибактериальным химиотерапевтическим средствам в первую очередь относятся сульфаниламидные препараты и антибиотики. Сульфаниламиды — первые антибактериальные средства, использованные в борьбе с такими болезнями, как ангина, пневмония, дифтерия, различные желудочно-кишечные заболевания

(дизентерия и др.). Они эффективны в борьбе и с пневмококками, менингококками, гонококками. В настоящее время сульфациламиды подразделяют на препараты, хорошо всасывающиеся в желудочно-кишечном тракте

(сульфадимезин, сульфазин, норсульфазол, этазол - непродолжительного действия; сульфадиметоксин, сульфапиридазин - продолжительного действия), и препараты, плохо всасывающиеся (фталазол):

Механизм действия всех сульфаниламидов основан на структурной аналогии их строения и строения фолиевой кислоты, которую синтезируют многие бактерии.

2.2 Снотворные средства

Снотворные средства угнетающе влияют на передачу возбуждения в головном мозге. По механизму влияния на центральную нервную систему их относят к наркотическим веществам. Небольшие дозы снотворных средств действуют успокаивающе, средние—вызывают сон, большие - наркотическое действие. Механизм сна под влиянием снотворных средств отличается от естественного, характеризующегося чередованием периодов «медленного» и «быстрого» (до 25% общей продолжительности) сна. Большинство снотворных укорачивает длительность быстрого сна.

Барбитураты, бывшие долгое время основными снотворными препаратами, стали терять свое ведущее значение. Вместе с тем все шире применяются соединения бензодиазепинового ряда - нитразепам, мидазолам, темазепам, флуразепам, флунитразепам и др.

Барбитураты обладают рядом недостатков. Вызываемый ими сон отличается от естественного: они облегчают наступление сна (засыпание), но меняют его структуру - соотношение фаз быстрого (парадоксального, десинхронизированного) и медленного (ортодоксального, синхронизированного) сна. Нередко сон становится прерывистым, с обилием сновидений, кошмаров. После него остается продолжительная сонливость, разбитость, нарушение координации движений, нистагм и другие нежелательные явления. При многократном использовании развивается толерантность (привыкание), и для получения снотворного эффекта необходимо увеличивать дозу. Большие дозы могут угнетать дыхание, снижать АД (вплоть до сосудистого коллапса), понижать температуру тела, уменьшать диурез и др. На некоторых больных барбитураты оказывают ""парадоксальное"" действие - вызывают, вместо успокоения и сна, возбуждение. Может развиться эффект отмены - полная бессонница при прекращении приема препарата. Одно из основных отрицательных проявлений действия барбитуратов - возникновение при повторном применении физической и психической зависимости.

Снотворные средства группы бензодиазепина (нитразепам и др.) имеют в определенной степени преимущество по сравнению с барбитуратами - лучше переносятся. Однако ни по характеру вызываемого сна, ни по побочным эффектам они также не отвечают ""физиологическим"" требованиям. Все транквилизаторы группы бензодиазепина оказывают в той или иной степени седативное действие и способствуют наступлению сна. По интенсивности отдельных сторон действия (седативного, анксиолитического, миорелаксирующего и др.) разные препараты этой группы различаются между собой. К средствам, оказывающим наиболее выраженное снотворное действие, относятся нитразепам, триазолам, феназепам, флуразепам, темазепам и др. По механизму действия снотворные бензодиазепины в основном сходны с транквилизаторами этого ряда. Все они связываются в тканях мозга со специфическими бензодиазепиновыми рецепторами. В последнее время эти рецепторы подразделяют на подгруппы (БД\_1 и БД\_2). Полагают, что снотворный эффект обусловлен тропностью к БД\_1-рецепторам. Взаимодействие с бензодиазепиновыми рецепторами сопровождается активацией ГAMК-рецепторов, что приводит к ингибированию функциональной активности клеток ЦНС. Основное значение для снотворного эффекта имеет угнетение активности клеток ретикулярной активирующей системы ствола мозга.

Появились также снотворные препараты новых химических групп (зопиклон, золпидем). Из давно известных снотворных препаратов применяется бромизовал (бромурал).

2.3 Алкалоиды

В 1943 году швейцарский химик А. Гофман исследовал различные вещества основного характера, выделяемые из растений – алкалоиды (т. е. подобные щелочам). Однажды химик случайно взял в рот немного раствора диэтиламида лизергиновой кислоты (ЛСД), выделенного из спорыньи, - грибка, растущего на ржи. Через несколько минут у исследователя появились признаки шизофрении – начались галлюцинации, сознание помутилось, речь стала бессвязной. “Я чувствовал, что плыву где-то вне своего тела, описывал впоследствии свое состояние химик. – Поэтому я решил, что умер“. Так Гофман понял, что он открыл сильнейший наркотик, галлюциноген. Оказалось, что достаточно 0,005 мг ЛСД попасть в мозг человека, чтобы вызвать галлюцинации. Многие алкалоиды принадлежат к ядам и наркотикам. С 1806 года был известен морфин, выделяемый из сока головок мака. Это хорошее обезболивающее средство, однако, при длительном применении морфина у человека вырабатывается к нему привыкание, организму требуются все большие дозы наркотика. Таким же действием обладает сложный эфир морфина и уксусной кислоты – героин.

Алкалоиды – весьма обширный класс органических соединений, оказывающих самое различное действие на организм человека. Среди них и сильнейшие яды (стрихнин, бруцин, никотин), и полезные лекарства (пилокарпин – средство для лечения глаукомы, атропин – средство для расширения зрачков, хинин – препарат для лечения малярии). К алкалоидам относятся и широко применяемые возбуждающие вещества – кофеин, теобромин, теофиллин. Кофеин содержится в зернах кофе (0,7 – 2,5%) и в чае (1,3 – 3,5%). Он обусловливает тонизирующее действие чая и кофе.

Теобромин добывают из шелухи семян какао, в небольшом количестве он сопутствует кофеину в чае, теофиллин содержится в чайных листьях и кофейных зернах. Интересно, что некоторые алкалоиды являются противоядиями по отношению к своим собратьям. Так, в 1952 г. из одного индийского растения был выделен алкалоид резерпин, который позволяет лечить не только людей, отравившихся ЛСД или другими галлюциногенами, но и больных, страдающих шизофренией.

2.4 Психотропные средства

Все психотропные вещества по их фармакологическому действию можно разделить на две группы:

1) Транквилизаторы – вещества, обладающие успокаивающими свойствами. В свою очередь транквилизаторы подразделяются на две подгруппы:

- Большие транквилизаторы (нейролептические средства). К ним относятся производные фенотиазина. Аминазин применяется как эффективное средство при лечении психических больных, подавляя у них чувство страха, тревоги, рассеянность.

- Малые транквилизаторы (атарактические средства). К ним относятся производные пропандиола (мепротан, андаксин), дифенилметана (атаракс, амизил)вещества, имеющие различную химическую природу (диазепам, элениум, феназепам, седуксен и др.). Седуксен и элениум применяются при неврозах, для снятия чувства тревоги. Хотя токсичность их невелика, наблюдаются побочные явления (сонливость, головокружение, привыкание к препаратам). Их не следует применять без назначения врача.

2) Стимуляторы – вещества, обладающие антидепрессивным действием

(фторазицин, индопан, трансамин и др.)

2.5 Анельгезирующие, жаропонижающие и противовоспалительные средства.

Анальгетики - крупная группа лекарственных препаратов, производные салициловой кислоты (орто-гидроксибензойной). Ее можно рассматривать как бензойную кислоту, содержащую в орто-положении гидроксил, либо как фенол, содержащий в орто- положении карбоксильную группу.

Салициловая кислота – сильное дезинфицирующее средство. Ее натриевая соль применяется как болеутоляющее, противовоспалительное, жаропонижающее средство и при лечении ревматизма.

Из производных салициловой кислоты наиболее известен ее сложный эфир- ацетилсалициловая кислота, или аспирин. Аспирин – молекула, созданная

искусственно, в природе он не встречается. При введении в организм ацетилсалициловая кислота в желудке не изменяется, а в кишечнике под влиянием щелочной среды распадается, образуя анионы двух кислот – салициловой и уксусной. Анионы попадают в кровь и переносятся ею в различные ткани. Активным началом, обусловливающим физиологическое действие аспирина, является салицилат-ион.

Ацетилсалициловая кислота обладает противоревматическим, противовоспалительным, жаропонижающим и болеутоляющим действием. Она также выводит из организма мочевую кислоту, а отложение ее солей в тканях (подагра) вызывает сильные боли. При приеме аспирина могут возникнуть желудочно- кишечные кровотечения, а иногда – аллергия.

Лекарственные вещества были получены за счет взаимодействия карбоксильной группы салициловой кислоты с различными реагентами. Например, при действии аммиака на метиловый эфир салициловой кислоты остаток метилового спирта заменяется аминогруппой и образуется амид салициловой кислоты – салициламид.

Он используется как противоревматическое, противовоспалительное, жаропонижающее средство. В отличие от ацетилсалициловой кислоты салициламид в организме с большим трудом подвергается гидролизу.

Салол – сложный эфир салициловой кислоты с фенолом (фенилсалицилат) обладает дезинфицирующими, антисептическими свойствами и употребляется при заболеваниях кишечника.

Замена в бензольном кольце салициловой кислоты одного из водородных атомов на аминогруппу приводит к пара-аминосалициловой кислоте (ПАСК), которая используется как противотуберкулезный препарат.

Распространенными жаропонижающими и болеутоляющими средствами являютсяпроизводные фенилметилпиразолона – амидопирин и анальгин. Анальгин обладает небольшой токсичностью и хорошими терапевтическими свойствами.

3. Сульфаниловая кислота

Сульфаниловая кислота, n-аминобензолсульфокислота, бесцветные кристаллы, разлагающиеся при 280-300 С; ограниченно растворимы в воде (1 г в 100 г при 20 С).

Сульфаниловая кислота — нутренняя соль, в которой аминогруппа нейтрализована остатком сульфокислоты, поэтому она не образует солей с минеральными кислотами, но её сульфогруппа может быть нейтрализована щелочами.

АМИНОБЕНЗОЛСУЛЬФОКИСЛОТЫ (анилинсульфокислоты), соединения общей ф-лы H2NC6H5-n(SO3H)n, где n = 1, 2, 3, 4. Кристаллы, не имеющие четких т-р плавления; не раств. в орг. р-рителях; аминобензолдисульфокислоты хорошо раств. в воде, аминобензолмоносульфокислоты -плохо. Такие св-ва аминобензолсульфокислот (в отличие от бензолсульфокислоты, хорошо р-римой в воде и плавящейся при низкой т-ре) обусловлены их структурой внутр. соли, напр. для п-аминобензолсульфокислоты (сульфаниловая кислота).

Поэтому по NH2-группе аминобензолсульфокислоты не образуют солей с минер. кислотами, не алкилируются и не ацилируются. Однако кислотность SО3Н-группы в аминобензолсульфокислотах значительно превышает основность NН2-группы, вследствие чего аминобензолсульфокислоты-более сильные кислоты (напр., рКа при 25°С 2,48, 3,73 и 3,24 соотв. для о-, м- и п-аминобензолсульфокислот), чем карбоновые; они м. б. нейтрализованы щелочью с образованием хорошо р-римой в воде соли:

Соль алкилируется и ацилируется по аминогруппе. п-Аминобензолсульфокислота сульфируется олеумом при 170-180°С или конц. H2SO4 над оксидом фосфора Р2О5, превращаясь соотв. в 1-аминобензол-2,4-дисульфокислоту или 1-аминобензол-2,4,6-трисульфокислоту, м-Аминобензолсульфокислота - олеумом при умеренной т-ре с образованием смеси 1-аминобензол-2,5-дисульфокислоты, три- и тетрасульфокислот. Практич. значение для синтеза м-аминофенола и его производных имеет замена группы SO3H на гидроксигруппу сплавлением м-аминобензолсульфокислоты с NaOH при 280 °С.

При диазотировании аминобензолсульфокислоты превращаются в диазобензолсульфокислоты -O3SC6H4N2, используемые в произ-ве азокрасителей. Важное значение в синтезе лек. ср-в имеет амид п-аминобензолсульфокислоты.

В пром-сти п-аминобензолсульфокислоту получают нагреванием анилинсульфата при 180-200°С в среде полихлорбензолов; м-аминобензолсульфокислоту - сульфированием нитробензола олеумом с послед. восстановлением NO2-группы чугунной стружкой или Н2 (кат. - Ni), о-аминобензолсульфокислоту - из о-хлорнитробензола .

Наиб. практич. значение имеет п-аминобензолсульфокислота, которую применяют в производстве кислотных азокрасителей для шерсти, шелка и кожи, протравных дисазокрасителей для шерсти, хромовых азокрасителей для кожи, прямых азокрасителей для хлопка, индикатора метилового оранжевого, сульфаниламидных препаратов и др. Кроме того, п-аминобензолсульфокислота - реагент для определения NO-2 и CN- и обнаружения Os, Ru, Ce(IV); реактив в гистохимии, напр. для блокирования альдегидов в тканях, для определения билирубина в крови. м-Аминобензолсульфокислоту используют в производстве моноазокрасителей, протравных и прямых азокрасителей, оптических отбеливателей, активных красителей, о-аминобензолсульфокислоту в производстве активных и кислотных азокрасителей для шерсти, сине-зеленых полиазокрасителей для хлопка, 1-аминобензол-2,4(и 2,5)-дисульфокислоты - в производстве прямых азокрасителей.

Сульфаниловую кислоту получают из анилина; нагреванием анилинсульфата C6H5NH2×H2SO4 при 180—200 °C. Из реакционной смеси, полученной нагреванием анилина с 3 молями серной кислоты в течение 5 часов при 180—190 °C, можно выделить чистую сульфаниловую кислоту с выходом 60 %. Малая растворимость кислоты в холодной воде облегчает ее отделение от избытка серной кислоты и от дисульфокислот. Лучшим техническим методом получения сульфаниловой кислоты является нагревание моносульфата анилина в течение 8 часов при 180 °C. Сульфаниловая кислота образуется также при кипячении анилина с 2 весовыми частями олеума в течение нескольких минут, однако при этом происходит сильное разложение. Сульфаниловая кислота образуется вместе с другими соединениями при действии на анилин этилового эфира хлорсульфоновой кислоты. Ее можно получить также нагреванием анилиновой соли этилсерной кислоты.

Сульфаниловая кислота используется как аналитический реагент. Применяется в синтезе красителей. В лаборатории сульфаниловую кислоту используют для определения нитритов и обнаружения некоторых металлов (осмия, рутения и др.). Применение в медицине нашел амид сульфаниловой кислоты: H2N—C6H4—SO2NH2, сульфаниламид, называемый белым стрептоцидом, и некоторые его производные (альбуцид, сульгин, сульфидин, сульфадимезин, сульфазол).

Представляет собой белые до серого цвета кристаллы, разлагающиеся при 280—300 °C, ограниченно растворимые в воде (1 г в 100 г при 20 °C).

**II Практическая часть**

1. Получение сульфаниловой кислоты.

**Цель работы**: получить сульфаниловую кислоту из анилина и серной кислоты. Ознакомиться с механизмом сульфирования ароматических соединений.

Таблица№1 «Характеристика исходных веществ»

|  |  |  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| Вещество | М вес | Ткп.С  ТплС | ND20 | D420 | Количество | | |
| мл | г | мг |
| Анилин | 93 | 184  \_ | 1,5863 | 1,022 | 9 | 9,198 | 0,098 |
| H2SO4 | 98 | 336разл    10 | \_ | 1,84 | 5,2 | 9,568 | 0,051 |
| Сульфаниловая кислота | 173 | -  288р. | \_ | \_ |  | 17 | 0,098 |
|  | | | | | | | |

Сульфанирование ароматических анилов.

Для получения сульфаниловых кислот из первичных ароматических анилов применяется метод «Запекания». Этот метод основан на том, что кислые и сернокислые соли многих первичных ароматических анилов, получаемых действием эквимомерного количества серной кислоты при нагревании в течение нескольких часов, при температуре выше 1800-1900 переходит в сульфаниловую кислоту параряда.

С6H5NH2+H2SO4 C6H5NH3NSO4  C6H7NO3S

Введение сульфангруппы в ядро (орто-, параположение) зависит от температуры при котором проводится нагревание. При осторожном нагревании до умеренно высокой температуры (1300С) сульфа группа вступает в ортоположение и образование орта анилинсульфа кислоты (ортаниловая кислота). Нагревание до температуры 1900С приводит к образованию параанилинсульфа кислоты (сульфаниловая кислота). Процесс обратим, ортаниловая кислота при нагревании до 1900С превращается в более устойчивый параизомер.

Расчет теоретического выхода (продукта).

С6H5NH2+H2SO4 C6H7NO3S+H2O

Экспериментальная часть.

В фарфоровую чашку помещают 9 мл анилина. Охлаждают, затем осторожно, небольшими порциями прибавляют 5,2 мл Н2SO4 при энергичном охлаждении. Полученную вязкую массу растирают до получения сухого белого порошка соли анилина. Соль тщательно уплотняют и нагревают в металлическом кожухе (1800-1900) до получения твердого продукта. Полученный продукт охлаждают, измельчают в ступке и перекристализовывают из воды. Для обесцвечивания раствор кипятят с активирном углем. Уголь отфильтровывают, а раствор охлаждают. Выпавшие кристаллы отфильтровывают на воронке Вюхнера и сушат.

Идентификация сульфаниловой кислоты.

Идентифицируют превращением в соответствующий сульфанамид имеющий четкую температуру плавления.

Выход: \* 100% = 16,7%



Вывод: получила сульфаниловую кислоту из анилина и H2SO4 . Выход составил 16.7% от теоретического. Ознакомилась с механизмом сульфирования ароматических соединений.

**Перекристализация сульфаниловой кислоты.**

**Цель**: Провести очистку сульфаниловойвой кислоты используя меток перекристализации.

**Эксперементальная часть.**

Таблица№2 «Классификация веществ»

|  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- |
| Вещество | Молекулярный вес | toплавления(Co) | Растворимость в воде | Количество  (г) |
| сульфаниловой кислоты | 173 | 288(разлагается) | 6,67100  1,0825 | 3 |

В стаканчик объёмом 100мл посыпаем 3г сульфаниловой кислоты и приливаем 40 мл воды. Ставим стакан на плитку и ждём растворения кислоты в воде при этом перемешивая раствор стекляной палочкой и постепено добовляя воды. Когда кислота полностью растворится снимаем стаканчик с плитки и ставим немного охлождаться, после чего ставим стаканчик на лёд и дожидаемся кристализации, затем профильтровываем раствор черезфольтр Шота отделяя кристалы от маточного раствора.

Прибор фильтрации при пониженном давлении (см.рис1)

**III.Выводы**

1. В ходе изучения литературы, было доказано, что фармакология ведет начало своей истории с древних времен и развивается до сих пор, не только за границей, но имеет большой потенциал и в России.
2. Практически все препараты были созданы путем синтеза и перекристаллизации природных органических веществ. Идентификация веществ тоже не может обойтись без определенных знаний в области химии. Большому разнообразию лекарственных веществ человечество обязано именно химии. Благодаря ней, разнообразие препаратов позволяет подобрать наиболее подходящее лекарство в частных случаях заболевания.
3. Сульфаниловая кислота широко применяется в синтезе красителей, используется как аналитический реагент, в лаборатории её используют для определения нитритов и обнаружения некоторых металлов (осмия, рутения и др.) В медицине применение нашел амид сульфаниловой кислоты. Именно его называют стрептоцидом. Это недорогое и отличное средство, применяющееся в целях обеззараживания ран и порезов.

**IV.Список литературы**

1.«Углубленный курс органической химии. В двух книгах. Книга 1» Автор: Ф. Кери, Р. Сандберг

2.«Органическая химия» Автор: Габриелян О.С. изд. «Просвещение» 2003г.

3.bse.sci-lib.com/article107549.html

4. [www.chemweek.ru/.../el\_1510.htm](http://www.chemweek.ru/.../el_1510.htm)

5. ru.wikipedia.org/wiki/Сульфаниловая\_кислота

6. dic.academic.ru/dic.../Сульфаниловая

7. russian.alibaba.com/.../sulfanilic-acid-99--287915503.html

**V.Приложение**

**Рис.1**

