

Поняття ПРО СИНТЕТИЧНІ ЛІКАРСЬКІ ЗАСОБИ НА ПРИКЛАДІ АСПІРИНУ



Фармацевтика — частина фармації,
зв'язана безпосередньо з
виробництвом ліків

Синтетичних лікарських засоби – це
лікарські препарати, що за своїм
походженням відносяться до ряду
ксенобіотиків, тобто препарати, які
являються для організму
чужорідними речовинами



- синтетичні препарати витіснили комплексні ліки природного походження.
- Один із таких препаратів, який набув широкого застосування в медицині є аспірин.





Мал. 17.1. 1. У центрі – Лістер Джозеф [лорд Лістер] (1827–1912) – видатний англійський хірург і науковець, творець хірургічної антисептики. Уперше вдало використав дезінфікуювальні властивості продукту органічного синтезу – фенолу C_6H_5OH (карболової кислоти) – для знезаражування ран. 2. Апарат Лістера для розливання розчину карболової кислоти

Історія виникнення препарату

В одного зі співробітників фірми «Байєр» на ім'я Фелікс Гофман, який займався аніліновими барвниками, батько страждав артритом (запалення суглобів), але мав непереносимість саліцилатів натрію через хронічне подразнення шлунку (що не дивно, тому що доза в 6-8 г саліцилату в день є сильним подразником для травного тракту). Гофман розшукував в хімічній літературі відомості про похідні саліцилату натрію з меншою кислотністю і наткнувся на дані про ацетилсаліцилову кислоту (вона була синтезована 30 роками раніше).

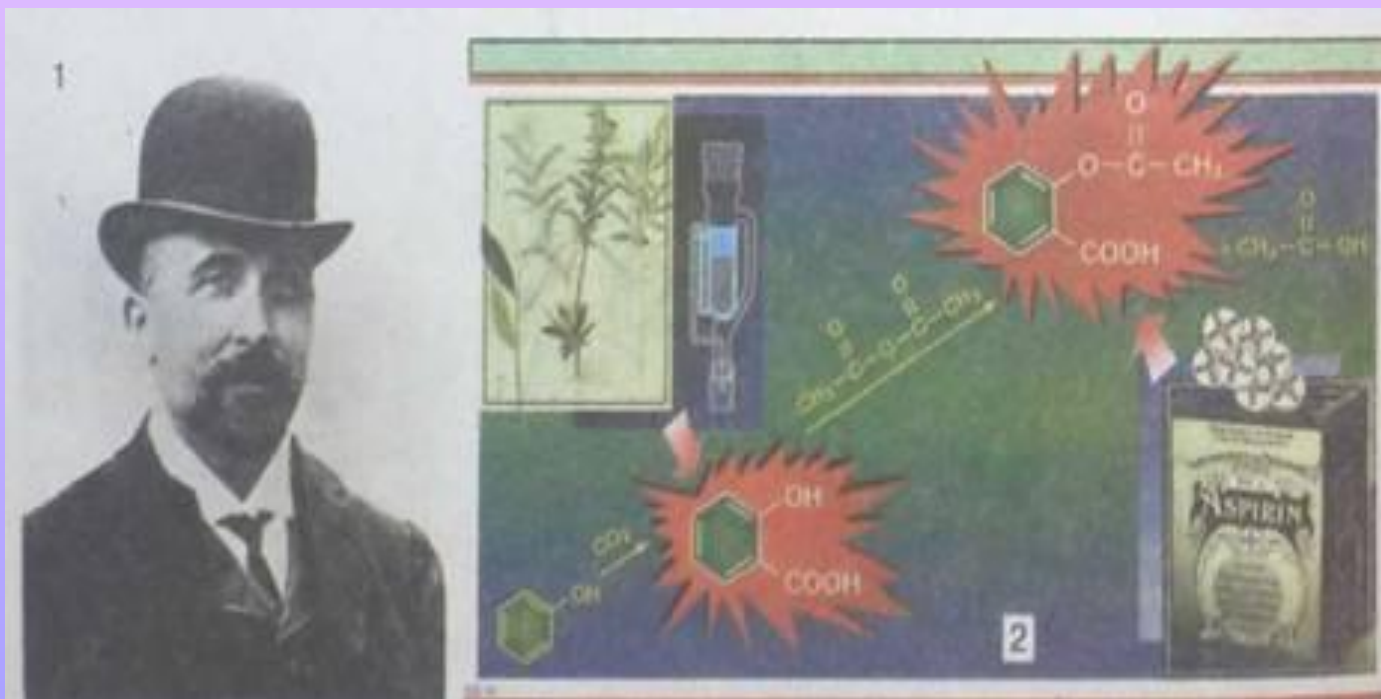
Ацетилсаліцилова кислота виявилася приємнішою на смак і більш ефективно допомагала його батькові.

Новому препарату дали назву «аспірин», узявши букву «а» від слова «*acetyl*» (ацетил) і частину «Спірин» від німецького слова «*Spirsaure*», яке, у свою чергу, походить від колишньої латинської назви лабазника в'язолистного (*Spiraea ulmaria*) — рослини, що містить великі кількості саліцилової кислоти. Зараз рослина називається гадючник в'язолистий (*Filipendula ulmaria*).

Розв'яжіть задачу.

- ▣ Обчислити масу саліцилової кислоти, яку необхідно використати для одержання 1 упаковки аспірину.

У 1899 р. на фірмі «Байєр» почалося виробництво препарату під назвою «аспірин» як анальгетичний, жарознижуючий і протизапальний засіб. У той час препарат випускався у вигляді порошку, розфасованого в скляні пляшечки.



Ацетилсаліцилова кислота

Ацетилсаліцилова кислота (аспірин) — безбарвні голчасті кристали моноклінної структури, у чистому вигляді без запаху, але у вологому середовищі (наприклад при контакті з повітрям) набуває запаху оцтової кислоти.

Одержують взаємодією оцтового ангідриду та саліцилової кислоти. Вживають як протизапальний, знеболюючий, жарознижуючий засіб.

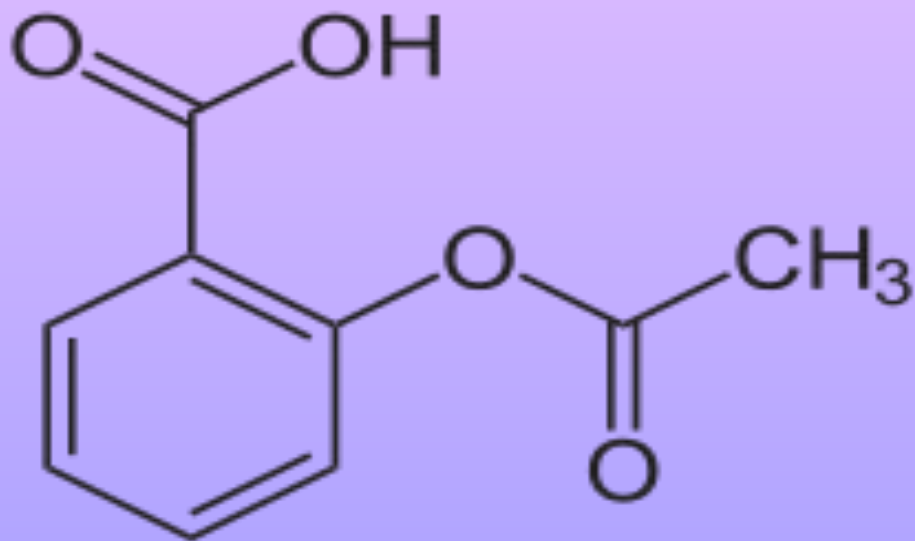


Хімічна назва	2-(Ацетилокси)бензойна кислота
Хімічна формула	$C_9H_8O_4$
Молярна маса	180.16

Синоніми

Аспірин, 2-ацетоксибензойна кислота,
ацетат саліцилової кислоти

Структурна та кульостержнева моделі аспіріну



Властивості

Фізичні властивості

Температура плавлення 135 °С (швидке нагрівання)

Твердіння розплаву 118 °С

Температура кипіння 135 °С (розкладення)

Густина 1,4 г/см³

Розчинність одного граму:

-у воді: 25 °С — 300 мл; 37 °С — 100мл

-у спирті 5 мл-у хлороформі 17 мл-в етері 10-15 мл

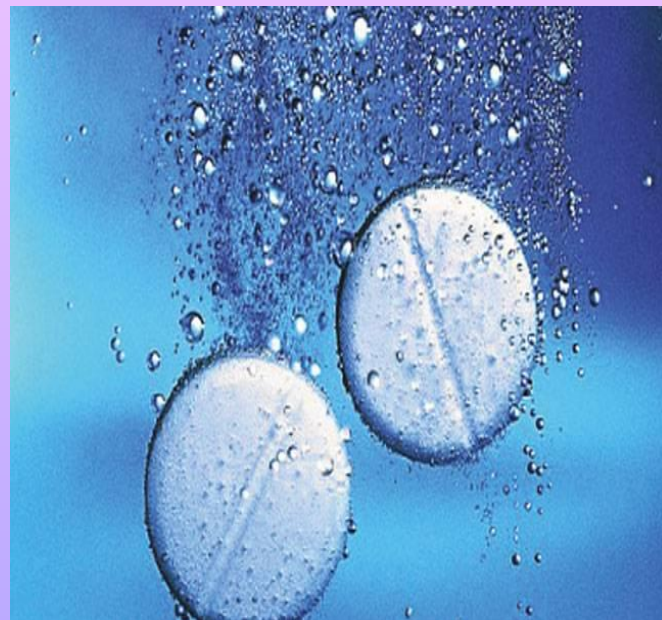
Розкладається у киплячій воді та при розчиненні у лужних розчинах. Добре розчинні у воді неорганічні солі ацетилсаліцилової кислоти, проте такі розчини нестійкі та за цих умов ацетилсаліцилова кислота швидко гідролізується.

Як лікарський засіб ацетилсаліцилова кислота широко відома у світі під запатентованою торговою маркою «Аспірин» фірми «Bayer».

Синтез

У круглодонній колбі, забезпеченій зворотним холодильником, розчиняють обережно нагріваючи 1,3 г саліцилової кислоти у 1,2 г оцтового ангідриду і потім додають краплю концентрованої сірчаної кислоти. Реакційну суміш нагрівають 1,5 години на киплячій водяній бані, після цього суміш охолоджують і, перемішуючи скляною паличкою, додають невелику кількість холодної води та фільтрують твердий продукт, який промивають спочатку крижаною водою, а потім невеликою кількістю толуену. Вихід реакції становить 1,5 г (88%).

Із маточного розчину випаровуванням можна одержати ще деяку кількість продукту. Ацетилсаліцилову кислоту перекристалізують із бензену або хлороформу.



Застосування

Популярне знеболювальне (анальгетик), розроблений в 20 столітті як ліки від головного болю і артриту. Аспірин містить простагландин і виробляється з дерева білої верби (*Salix alba*). При тривалому використанні навіть в помірних дозах аспірин може викликати шлункову кровотечу, пошкодження нирок і дефекти слуху, тому аспірин не рекомендують дітям до 12 років. Також вважають, що він може викликати рідкісне захворювання, синдром Рея.

Проте дослідження показують, що аспірин може попередити інфаркт і тромбоз, тому схильним до серцево-судинних захворювань людям рекомендується постійно вживати його в малих дозуваннях (близько 80 мг на добу).



- ▣ - якщо у воду, де стоять квіти, кинути пігулку аспірину, квіти простоять довше;
- деякі господині додають аспірин при консервації в банки. Нібито від цього вони не вибухнуть. Досить сумнівна порада, на мій погляд.

▣ *Краще все-таки застосовувати аспірин за прямим призначенням!*

▣ *Будьте здорові!*

