

Эта часть работы выложена в ознакомительных целях. Если вы хотите получить работу полностью, то приобретите ее воспользовавшись формой заказа на странице с готовой работой:

<https://studservis.ru/gotovye-raboty/kurovaya-rabota/171670>

Тип работы: Курсовая работа

Предмет: Химия (другое)

1. Характеристики метилурацила и производных пиримидина 5

1.1. Описание свойств метилурацила 5

1.2. Характеристики пиримидина и его производных 7

2. Производство лекарственных средств 17

2.1. Общая характеристика препарата с метилурацилом 17

2.2. Метилурацил и особенности его применения 21

Заключение 23

Список литературы 24

Введение

Актуальность настоящей работы состоит в том, что сегодня фармакопея знает большое количество лекарственных веществ, которые являются производными пиримидина. При этом нужно понимать, что спектр применения этих веществ разнообразный.

Достаточно сказать, что в некоторых случаях на основе пиримидина можно делать обезболивающее, а можно готовить мощные агрохимические препараты. Вообще нужно сказать, что сегодня химикам-фармакологам понятно, что пиримидиновая группа сама по себе способна оказывать мощное воздействие на химические свойства второго вещества во взаимодействии, с которым оно должно действовать.

Далее следует сказать, что фармакологи уверены, что лекарственные возможности пиримидиновой группы веществ так до конца не изучены. В научных работах высказывается мнение, что необходимо продолжать работу с этой группой препаратов с целью получения новых лекарственных веществ. Точно так же необходимо продолжать исследовать само химическое соединение.

Многим современным фармакологам понятно, что, несмотря на сложности обработки исходного вещества, сегодня еще существуют варианты для проведения химических опытов с целью получения лекарственных веществ нового типа и направления применения.

Здесь нужно заметить, что препарат впервые был синтезирован более 70 лет назад. Главный плюс метилурацила, как производного вещества пиримидина является возможность широкого применения метилурацила. Сегодня существуют работы, которые обосновывают применение пиримидина, как например, в дерматологии, так и в хирургии, гинекологии или стоматологии (ЧЛХ).

Однако нужно признать, что этой разработке уже много лет. Поэтому необходимо на базе пиримидина разрабатывать новые препараты способные заменить метилурацил.

Цель работы – выявить особенности биологически активных веществ производных пиримидина на примере метилурацила.

Объект исследования – производные пиримидина и в частности метилурацил.

Предмет исследования – биологически активные вещества производные пиримидина на примере метилурацила.

Задачи исследования:

1. Анализ научной литературы по теме исследования.
2. Охарактеризовать пиримидин и его производные вещества.
3. Охарактеризовать особенности метилурацила.
4. Выявить особенности производства пиримидина и метилурацила.
5. Сделать выводы по итогам исследования.

1. Характеристики метилурацила и производных пиримидина

1.1. Описание свойств метилурацила

CAS №: 626-48-2 C₅H₆N₂O₂ [10]

HSDB, MESH: 6-метилурацил.

HSDB: 2,4-дигидрокси-6-метилпиримидин.

HSDB, RTECS: 6-метил-2,4(1H,3H)-пиримидиндион.

NLM: 2(1H)-пиримидинон, 4-гидрокси-6-метил-(8Cl).

Mm = 126,12 Да. Точка плавления — 275 °C; log P (октанол-вода) = -0,77; растворимость в воде — 7000 мг/л при температуре 22 °C. Белый кристаллический порошок без запаха, малорастворимый в воде и спирте.

Форма выпуска: таблетки, мазь, суппозитории ректальные.

Укажем фармакологические свойства [1].

Метилурацил является производным пиримидина, структурного элемента нуклеиновых кислот. Обладает анаболическим и антикатаболическим свойствами. Ускоряет регенерацию, заживление ран, стимулирует клеточное и гуморальное звенья иммунитета, оказывает противовоспалительное действие. Специфическим свойством является стимулирующее влияние на эритро- и особенно лейкопоз. Метилурацил оказывает защитное действие при фотодерматозе.

Рассмотрим показания метилурацила [4].

Агранулоцитарная ангина, алиментарно-токсическая алейкия, хроническая бензолная интоксикация, лейкопения, обусловленная химиотерапией опухолей, рентгено- или радиотерапией или прочими факторами; переломы костей, пептическая язва желудка и двенадцатиперстной кишки, хронический гастрит, воспалительные заболевания кишечника (сигмоидит, язвенный колит), гепатит, панкреатит. В форме мази назначают при длительнозаживающих ранах, ожогах, трофических язвах и других повреждениях кожи, фотодерматозе.

Особенности применения метилурацила.

Перорально во время или после еды в дозе 0,5 г 4 раза в сутки (при необходимости – до 6 раз в сутки). Дозы для детей в возрасте от 3 до 8 лет – по 0,25 г, старше 8 лет – по 0,25-0,5 г 3 раза в сутки. Курс лечения при заболеваниях пищеварительного тракта – обычно 30-40 дней, в других случаях курс может быть менее длительным. Возможно также ректальное применение в форме суппозитория при воспалительных заболеваниях кишечника.

Мазь применяют наружно, нанося на пораженные участки кожи.

Кратность и длительность применения обусловлены характером и выраженностью заболевания, достигнутым эффектом.

Укажем противопоказания средства [2].

Острый и хронический (особенно миелоидный) лейкоз, лимфогранулематоз, злокачественные заболевания костного мозга, повышенная чувствительность к метилурацилу.

Побочные эффекты.

При приеме внутрь – головная боль, головокружение, изжога, аллергические реакции, при местном применении – кратковременное ощущение жжения.

Существуют особые указания [10].

Метилурацил целесообразно назначать при легких формах лейкопении.

Таким образом, можно сделать вывод, что метилурацил качественный медицинский препарат широкого спектра действия. Выпускается разных лекарственных формах. Может быть, как в виде таблеток, так и в виде мазей, кремов или содержится в составе свечей.

Метилурацил имеет ярко выраженное успокаивающее и противомикробное или противовоспалительное действие. В этом отношении нужно указать, что все производные пиримидина в той или иной степени обладают такими регенерирующими или заживляющими функциями. Также метилурацил используется для профилактики внутренних инфекционных процессов.

1.2. Характеристики пиримидина и его производных

1. Пиримидин [1].

Пиримидин (C₄N₂H₄, 1,3- или м-диазин, миазин) — гетероциклическое соединение, имеющее плоскую молекулу, бесцветные кристаллы с характерным запахом температура плавления +21°C

Пиримидин входит в состав нуклеиновых кислот, витаминов, а также в состав многих природных и синтетических ЛП:

Одним из синтетических производных пиримидина являются ЛС, производные 2,4,6-пиримидинтриона

(барбитураты).

Барбитуровая кислота - самостоятельного применения в медицине не имеет, но производные барбитуровой кислоты - барбитураты проявляют успокаивающее, снотворное, противосудорожное, наркотическое действие.

Барбитуровая к-та проявляет свои кислотные свойства за счет способности к таутомерным превращениям (2 вида таутомерии).

Подвижность протонов в 5-ом положении связана с перераспределением электронной плотности на рядом стоящие кислороды в 4-м и 6-м положении, что дает возможность существования барбитуровой кислоты в енольной форме:

Подвижность протона в 5-ом положении позволила ученым-синтетикам, заменяя их на соответствующие радикалы, получить ЛС под общим названием барбитураты. Причем фармакологическое действие проявляют только производные, у которых оба атома водорода заменены на соответствующие радикалы. Лактим-лактазная таутомерия [6]:

Барбитураты существуют в двух формах - это ЛС в кислотной лактажной форме (Барбитал, Фенобарбитал, Бензонал) и ЛС в солевой форме - лактильной (Барбитал-натрий, Этаминал-натрий, Гексенал, Тиопентал). Фармакологическое действие и форма выпуска:

Барбитал - снотворное, порошок; сон вызывает через 0,5-1 час после приема. Сон длится 6-8 часов.

Негативные эффекты: кумулируется (интоксикации и передозировки), угнетение ЦНС.

Барбитал-натрий - действие см. барбитал, но ввиду растворимости - всасывается быстрее, действие наступает быстрее, но и быстрее выводится. Форма выпуска - порошок (готовят микстуры). Возможно приготовление раствора для инъекций.

Фенобарбитал - действие в зависимости от дозы: в малых дозах - успокаивающее, входит в состав успокоительных и спазмолитических средств (Корвалол, Валокардин); в более высоких дозах - снотворный эффект; в еще более высоких - противоэпилептический эффект (одно из самых эффективных противосудорожных средств). Выпускается в виде таблеток.

Таминал-натрий - снотворное действие, в более высоких дозах - наркотическое опьянение. Спец/учет.

Форма выпуска - порошок, возможно приготовление растворов для инъекций, ректальных свечей. Наркоз наступает быстро и быстро заканчивается.

Бензонал - пролекарство (носитель

1. Арчаков, А.И. Оксигеназы биологических мембран / А.И. Арчаков. - М., 1983. - 180 с.

2. Евдокименко П.В. Метилурацил - забытый отечественный лекарственный препарат - Актуальные проблемы экопрофилактики и пути их решения. Материалы Всероссийской научно-практической конференции. Под общей редакцией Д.В. Воробьева, Н.В. Тимушкиной. - Саратов: Саратовский источник, 2019 - С. 77-79

3. Мещерякова С.А. Синтез, свойства, структура и биологическая активность новых S- и N- производных пиримидина - Автореф дисс на соискание ученой степени доктора фармацевтических наук - Уфа: Башкирский государственный медицинский университет, 2016 - 48 с.

4. Мунасипова Д.А. Синтез, свойства и биологическая активность тиазан-производных 6-метилурацила. - Автореф дисс на соискание ученой степени кандидата химических наук - Уфа: Башкирский государственный медицинский университет, 2014 - 25 с.

5. Петрова И.В., Катаев В.А., Мещерякова С.А., Николаева К.В., Мунасипова Д.А., Фархутдинов Р.Р. Антиоксидантные свойства производных пиримидина // Медицинский вестник Башкортостана. 2013. №4. URL: <https://cyberleninka.ru/article/n/antioksidantnye-svoystva-proizvodnyh-pirimidina> (дата обращения: 30.04.2021).

6. Петрова, И.В. Изучение спектра антиоксидантной активности новых производных урацила in vitro / И.В. Петрова, Р.Р. Фархутдинов, В.А. Катаев // Биология - наука XXI века: матер. Межд. конф. Москва, 24 мая 2012 г. //под ред. Р.Г. Василовой. - М.: МАКС-Пресс, 2012. - С. 695-696.

7. Синтез и изомерия продуктов взаимодействия 5 (6)-нитро-2-хлорбензимидазола с эпителиохлоргидином / В.А. Катаев [и др.] // Журнал органической химии. - 2002. - Т. 38, № 10. - С. 1560-1562.

8. Фархутдинов Р.Р. Методики исследования хемилюминесценции биологического материала на хемилюминометре ХЛ-003 / Р.Р. Фархутдинов, С.И. Тевдорадзе // Методы оценки антиоксидантной активности биологически активных веществ лечебного и профилактического назначения: сборник докладов/ под ред. Е.Б. Бурлаковой. - М.: Изд-во РУДН, 2005. - С. 147-154.
9. Фархутдинов Р.Р. Хемилюминесцентные методы исследования свободнорадикального окисления в биологии и медицине / Р.Р. Фархутдинов, В.А. Лиховских. - Уфа, 1995. - 92 с.
10. Muraoka S., Miura T. // Pharmacology Toxicology. - 2003. - Vol. 93. - P. 284.

Эта часть работы выложена в ознакомительных целях. Если вы хотите получить работу полностью, то приобретите ее воспользовавшись формой заказа на странице с готовой работой:

<https://studservis.ru/gotovye-raboty/kurovaya-rabota/171670>