



**МЕДИЦИНСКИ УНИВЕРСИТЕТ – ПЛОВДИВ**  
**ФАКУЛТЕТ „ФАРМАЦИЯ“**  

---

**ЦЕНТЪР ЗА ДИСТАНЦИОННО ОБУЧЕНИЕ**

**Лекция № 19**

**ДИУРЕТИЦИ**

**Проф. Пламен Пейков, дф**

# Вазодилататори

Пурини

Пиридини

С друга структура

Терапевтично приложение:

Високо кръвно налягане;

Високо кръвно налягане по време на бременност или раждане;

Сърдечна недостатъчност;

Високо кръвно налягане, което засяга артериите в белите дробове.

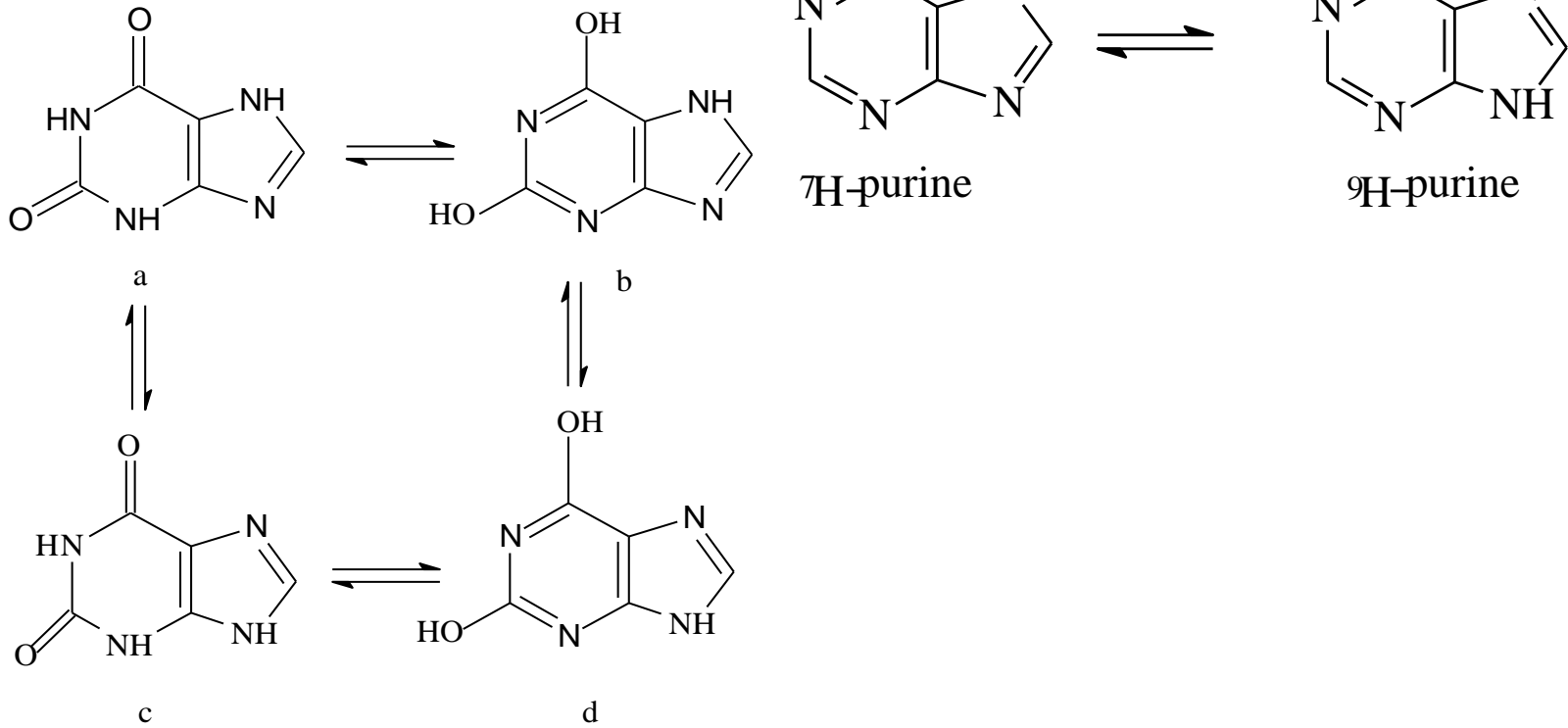
Лечение на периферна съдова болест- болест на Рейно (локална асфиксия на пръстите на двете ръце) , акроцианоза (малките кръвоносни съдове се стеснят и намалят достъпа на кислород до ръцете и краката), болест на Бюргер, атеросклероза на мозъчните и периферните съдове, ретинопатия; ангиопатии (увреждане на малките кръвоносни съдове и това води до структурни промени) свързани с измръзване, травми, изгаряния, тютюнопушене, диабет.

Акроцианоза нарушение на периферните съдови области в крайниците, в резултат на което крайните части на тялото придобиват синкаво-червен цвят, често може да настъпи и при студ.

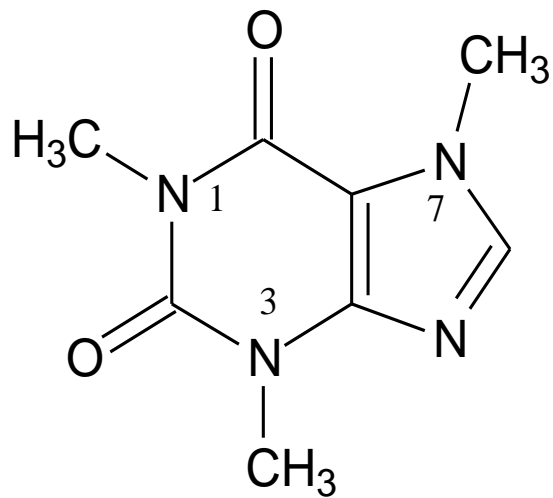
Болестта на Бюргер е автоимунно, хронично възпалително заболяване на малките и средни артерии.

# Метилксантини

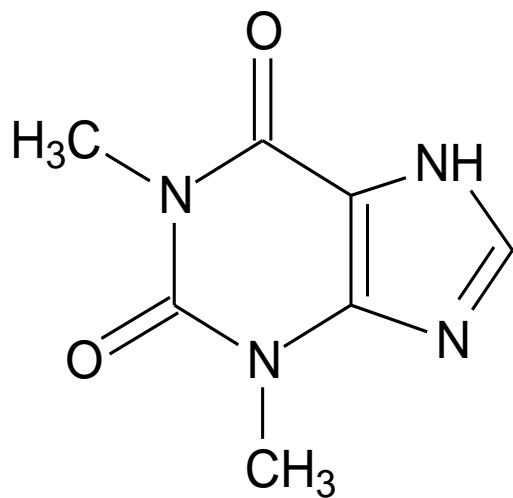
## КСАНТИН



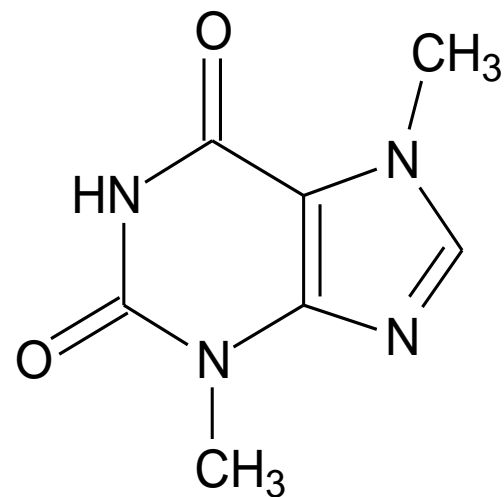
Caffeine



Theophylline



Theobromine



# Caffeine

LD<sub>50</sub> – 150-200 mg (80-100 чаши кафе)

Комбинирани лекарства – аналгетици и кофеин

**Caffeine**

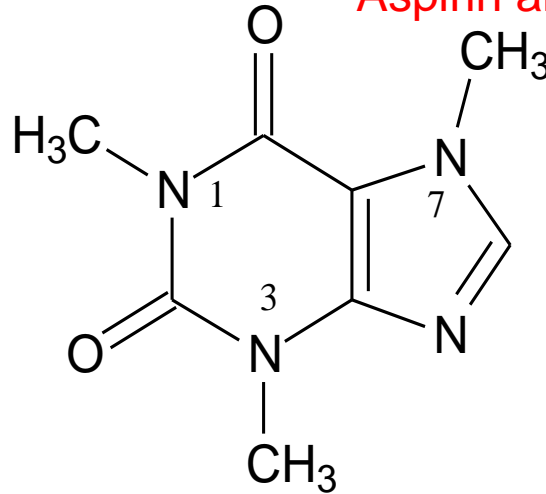
*Ph Eur*

Caffeine

Central nervous stimulant

Aspirin and Caffeine Tablets

**Caffeine Hydrate**

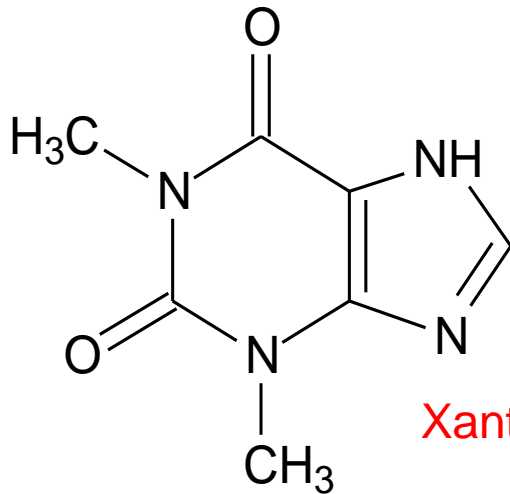


1,3,7-trimethyl-3,7-dihydro-1*H*-purine-2,6-dione

Theobromine

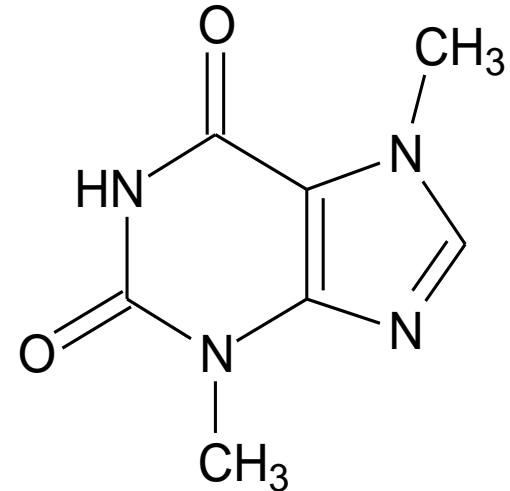
**Theophylline**

Theophylline



Xanthine bronchodilator

Aminophylline Injection



**Theobromine**

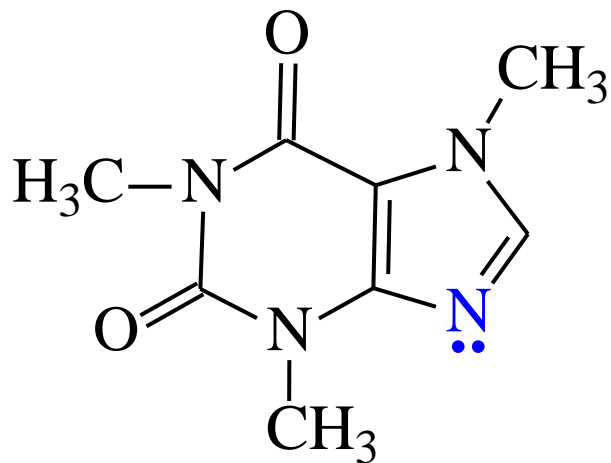
Prolonged-release Theophylline Tablets

**Theophylline Hydrate**



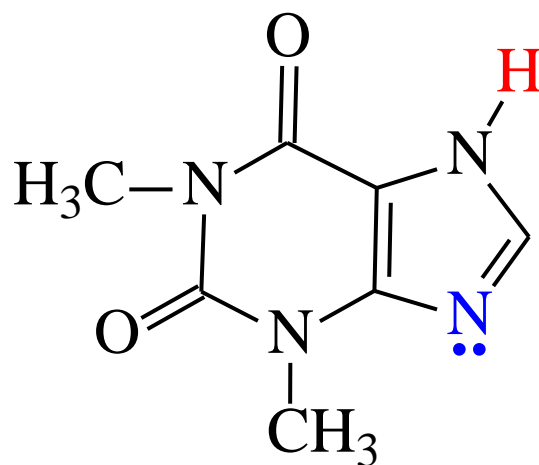
**Киселинно – основни свойства на**  
**метилксантините**

Caffeine



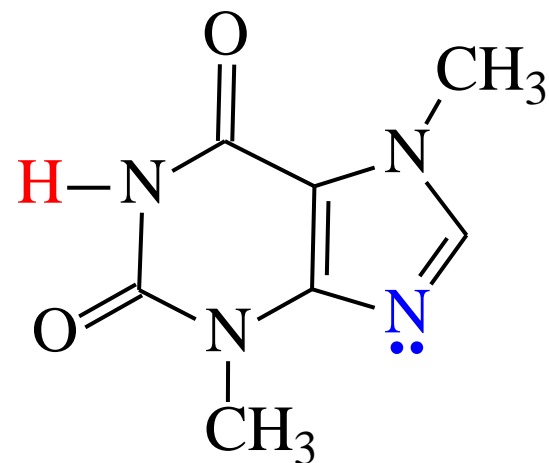
$pK_B = 0.6$

Theophylline



$pK_B = 0.3$   
 $pK_A = 8.6$

Theobromine

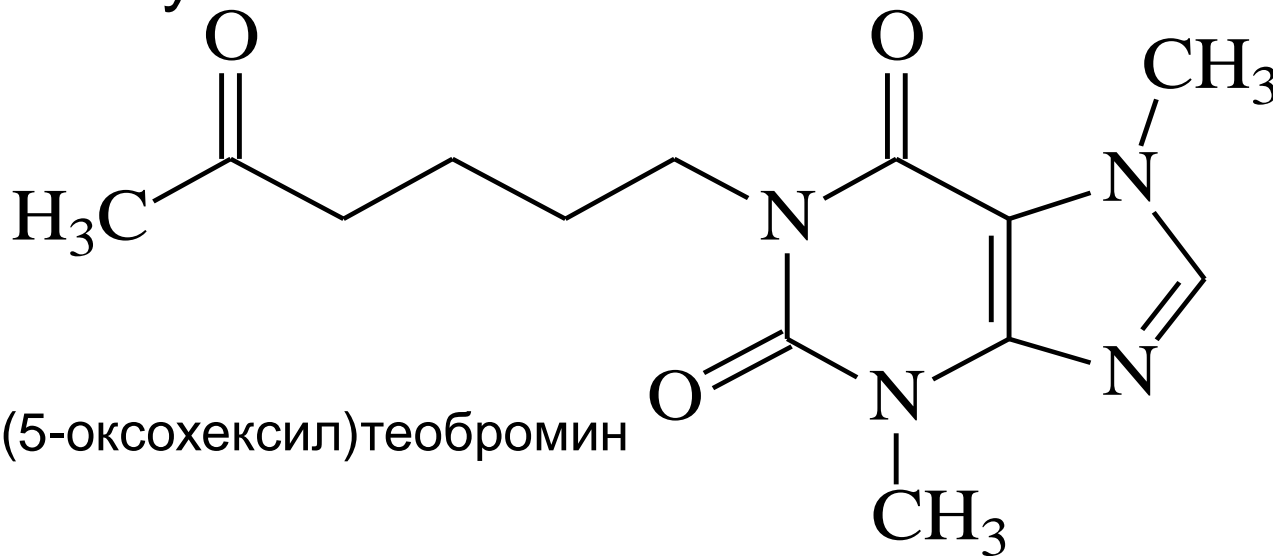


$pK_B = 0.12$   
 $pK_A = 10.05$

# Пурини

Инхибира фосфодиестеразата.

Pentoxifylline



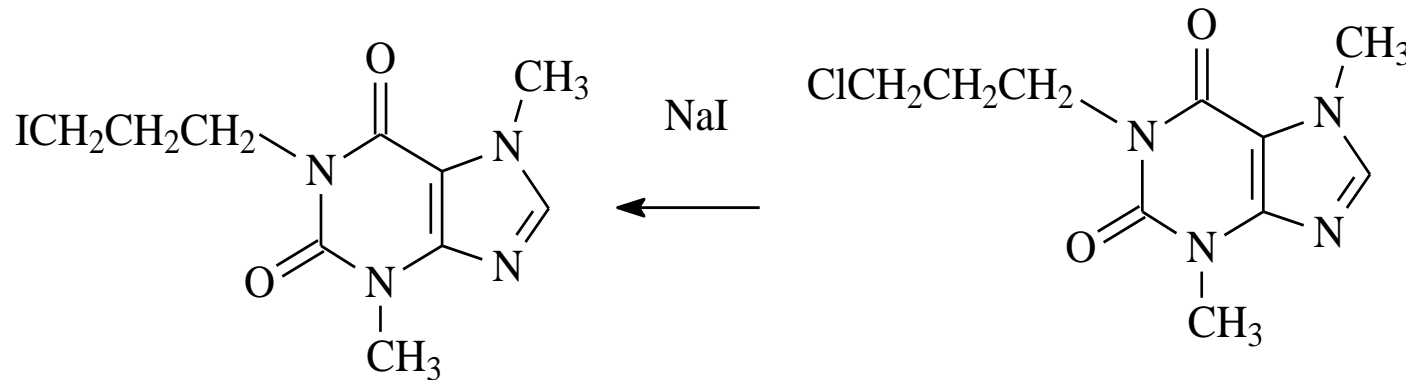
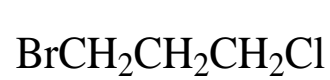
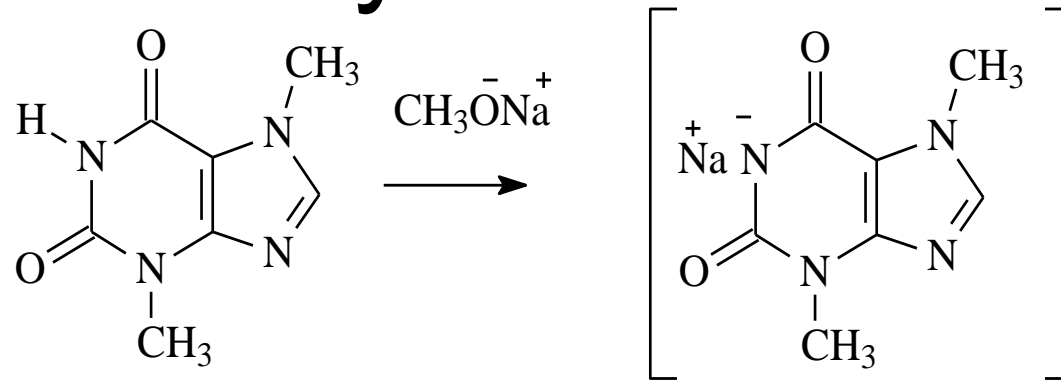
1-(5-оксогексил)теобромин

*Ph Eur*

3,7-Dimethyl-1-(5-oxohexyl)-3,7-dihydro-1H-purine-2,6-dione

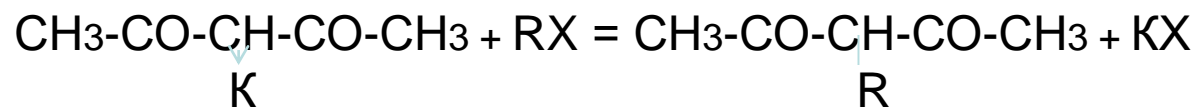
Инхибира агрегацията на тромбоцитите.

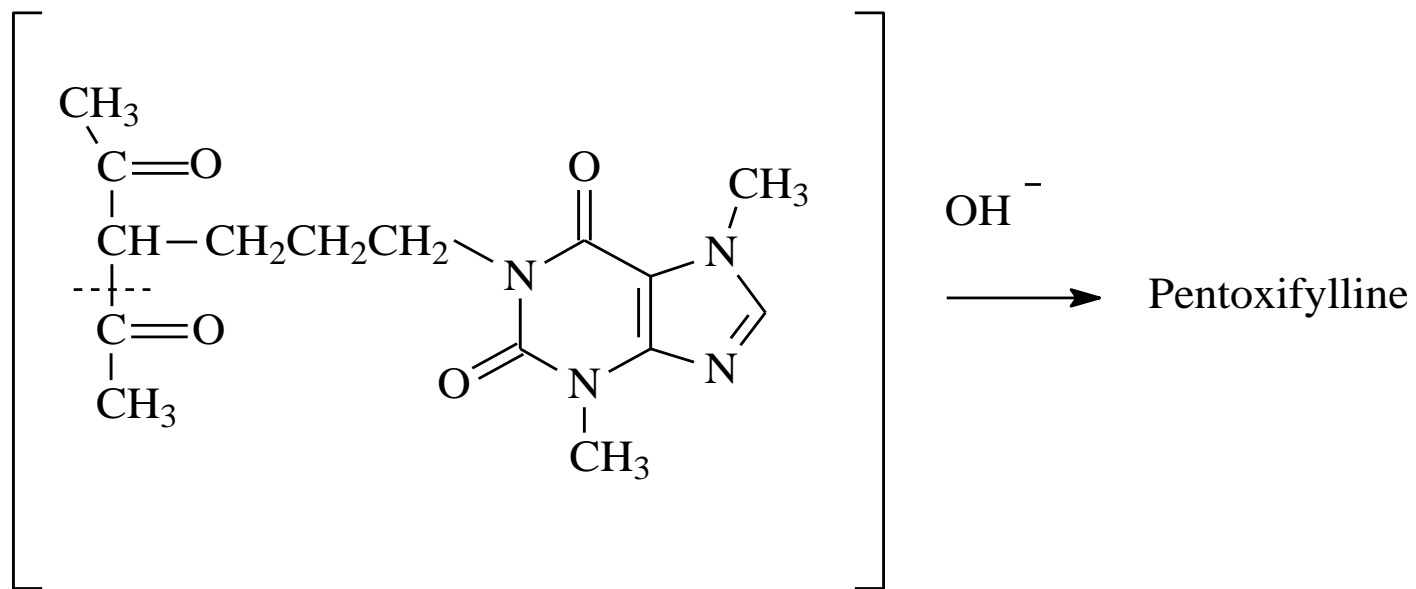
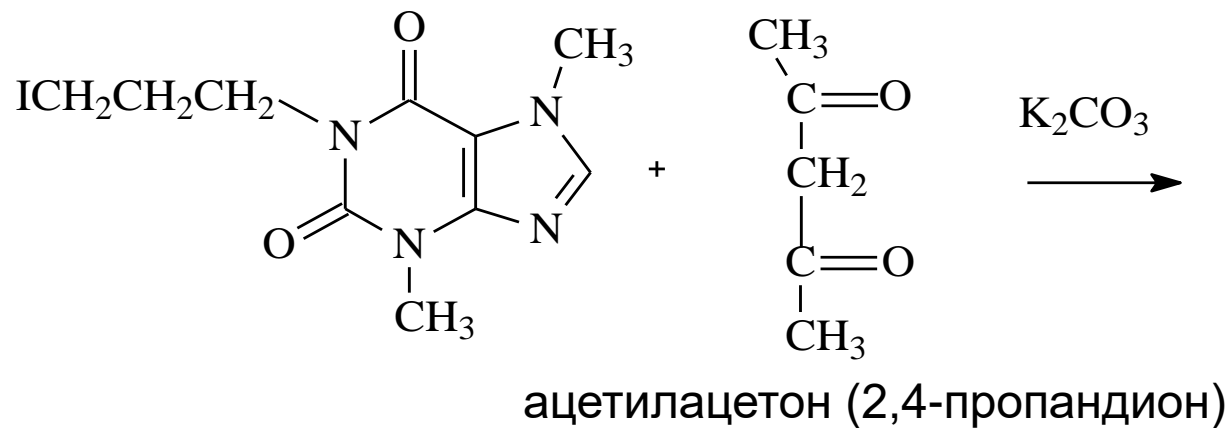
# Получаване



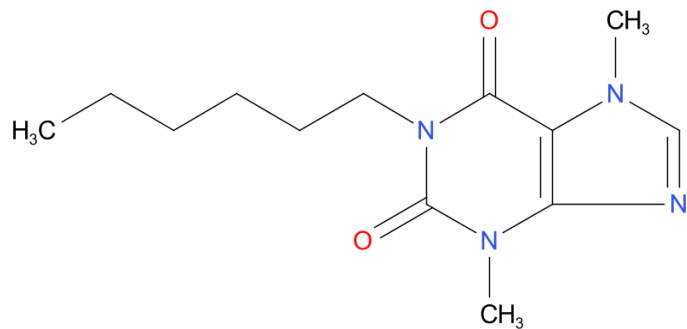
Реакция на Финкелщайн  
Получаване на йодоалкани  
$$R-Cl + NaI = R-I + NaCl$$

При взаимодействие на алкална сол на СН-киселина (ацетоцетов естер или ацетилацетон) с първични или вторични халоалкани се извършва С-алкилиране.





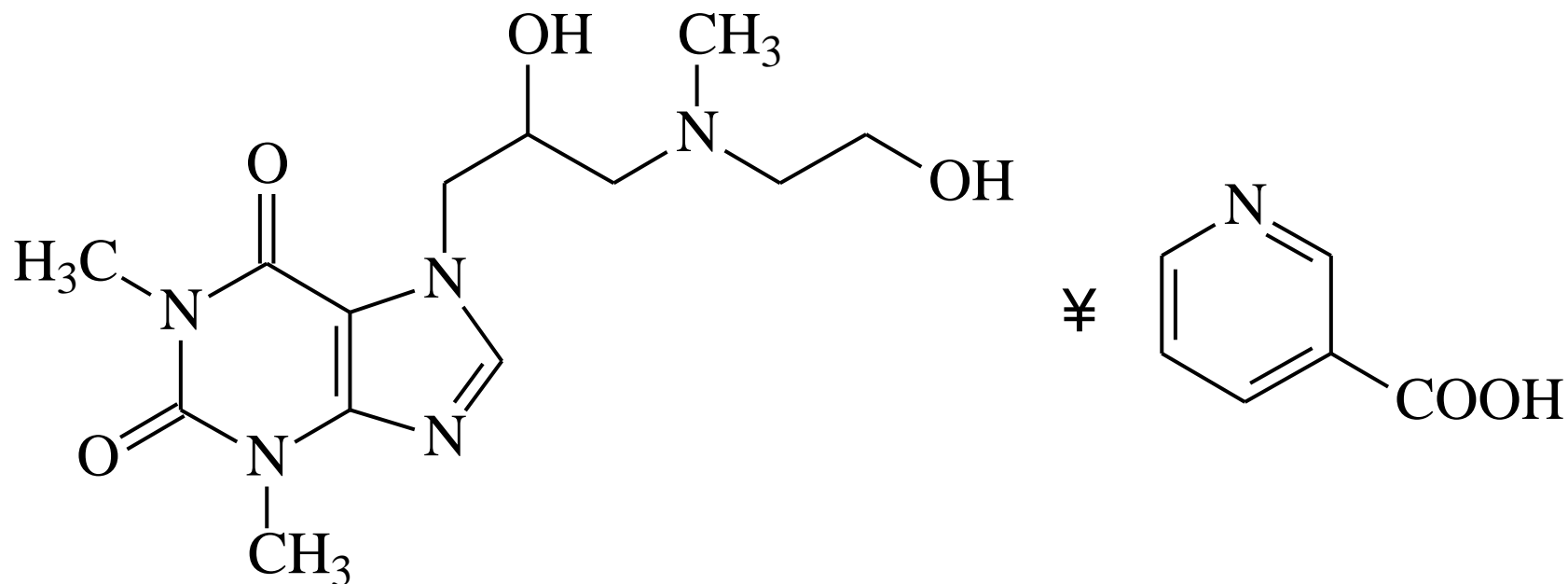
Pentifylline – вазодилататор и в комбинация с никотинова киселина се прилага при нарушения на кръвообращението на мозъка и очите.



1-хексилтеобромин



# Xanthinol nicotinate

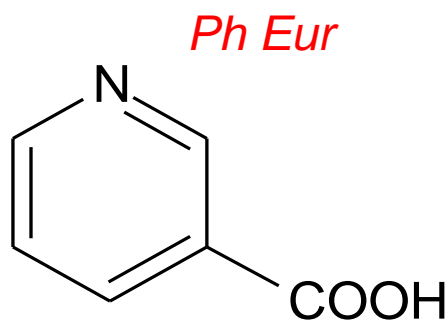


3,7-дихидро-7-[2-гидрокси-3-[(2-гидроксиетил)метиламино]пропил]-  
1,3-диметил-1H-пурин-2,6-дион никотинат

7-[2-hydroxy-3-(2-hydroxyethyl-methylamino)propyl]-1,3-dimethylpurine-2,6-dione

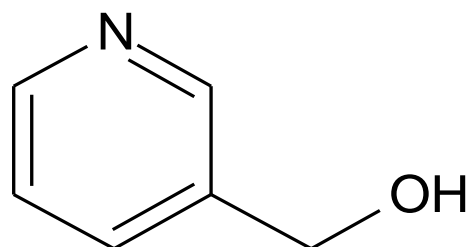
# Пириди́ни

Nicotinic acid



*pyridine-3-carboxylic acid*

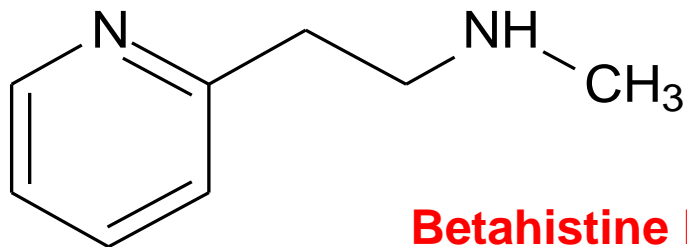
Nicotinilalcohol tartrat  
(Radecol)



3-pyridylmethanol hydrogen (2*R*,3*R*)-tartrate

Betahistine

**Betahistine Mesilate**



**Betahistine Dihydrochloride**

*Ph Eur*

*N-Methyl-2-(pyridin-2-yl)ethanamine dihydrochloride*

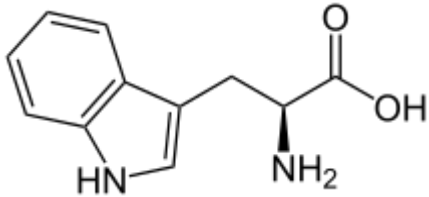
Nicotinic acid (Niacin, vitamin B3) –антихиперлипидимиеен и вазодилатиращ ефект.

Vitamin B3 – nicotinic acid, nicotinamide, nicotinamide riboside.

Пелагра – дефицит на Nicotinic acid .

Дерматити, нервна система и диарии.

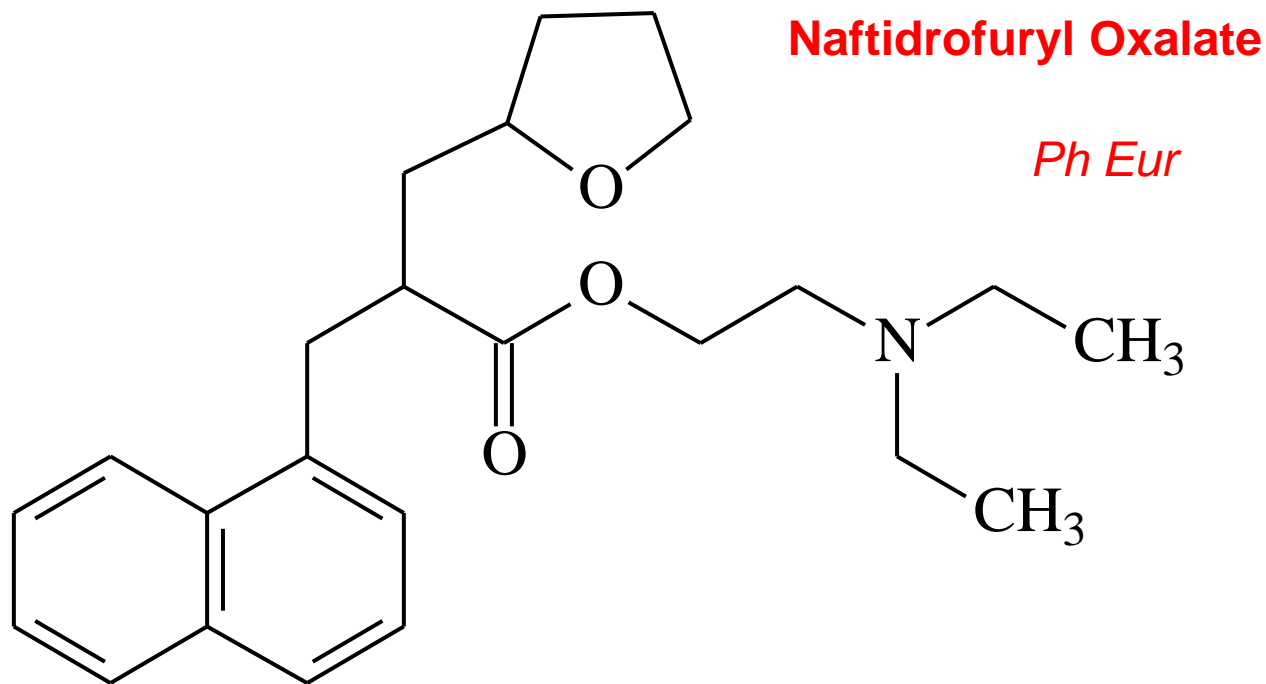
Биосинтез-пет етапа от **L-Tryptophan**.



**L-Tryptophan**

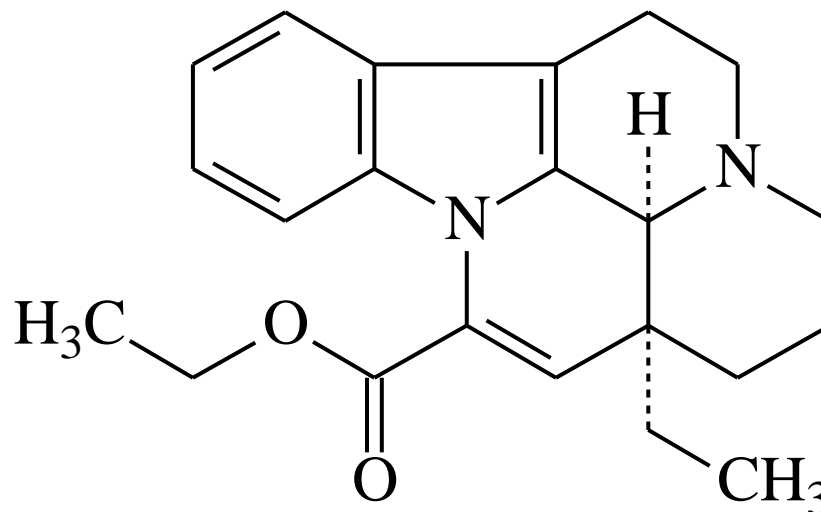
# С разнообразен строеж

Nafronyl (Naftidrofuryl, Dusodril)



2-(diethylamino)ethyl 2-[(naphthalen-1-yl)methyl]-3-(tetrahydrofuran-2-yl)propanoate hydrogen oxalate

# Vinpocetine (Cavinton)



(3α,16α)-eburnamenine-14-carboxylic acid ethyl ester

(3α,16α)-ебурнаменин-14-карбоксилова киселина  
етил естер

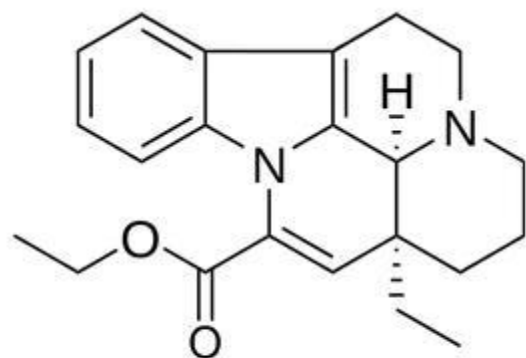
**Vinpocetine ( ethyl apovincamate)**

полусинтетично производно на **vincamine**.

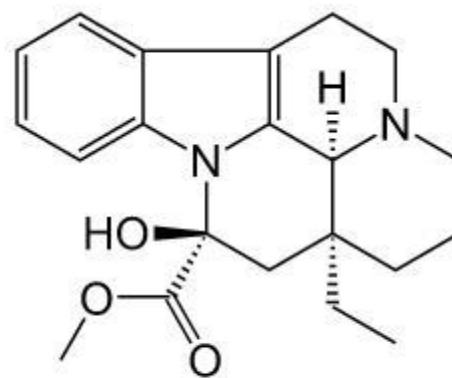
Вазодилататор и ноотропни свойства.

Vinca minor

Vincamine основен алкалоид на *Vinca minor* L., Apocynaceae.



Vinpocetine



Vincamine

Vinprocetine може да подобри притока на кръв към мозъка, подобрява паметта и предотвратява болестта на Алцхаймер и други състояния, които вредят на ученето, паметта и уменията за обработка на информацията при възрастта на хората.

Увеличава притока на кръв в мозъка.