

## مسكنات الألم المركزية، مضادات النقرس

د. أحمد حسن

31/10/2017

**RB** Pharmac

الكيمياء الصيدلانية 2 |  نظري



اخواتي اخواتي شدو الهمة عنا شغل اليوم .... انطلقوو .

### فهرس المحاضرة :

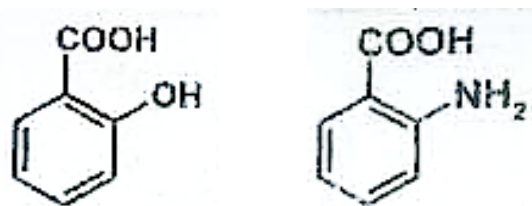
• مشتقات ن اريل انترايليك	2	• ايتيرات المورفين الدستورية	17
• حمض الميفناميك، حمض فلوفيناميك، حمض نيفلوميك	3	• مسكنات الألم المركزية الاصطناعية	18
• مشتقات البيروكسيكام	8	• أدوية النقرس وفرط حمض البول	20
• مسكنات الألم المركزية	12	• أدوية نقص التركيز	22
• المورفين و مشتقاته	13		

## مشتقات ن اريل انترانيليك :N- Aryl anthranilic Acid

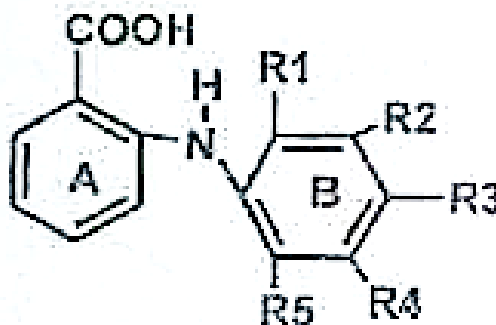
### مقدمة:

امينو بنزويك اسيد ((حمض الانترانيليك)) مركب لا يملك خصائص علاجية "مسكنة للألم ومضادة للالتهاب..." ولكن عند تحويل الامين الأولي الى ثانوي (مرتبط بمجموعة اريل<sup>1</sup>) حصلنا على مشتقات حمض الانترانيليك التي تملك الخواص العلاجية (المضادة للالتهاب...).

هناك تشابه بين حمض الصفصاف وحمض الانترانيليك لكن الآخر غير مستخدم بالمداواة.



المستعمل هو المشتقات العطرية على الوظيفة الأمينية التي لها الصيغة (التالية<sup>2</sup>):

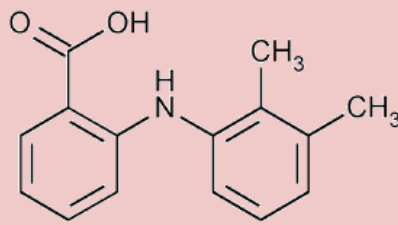
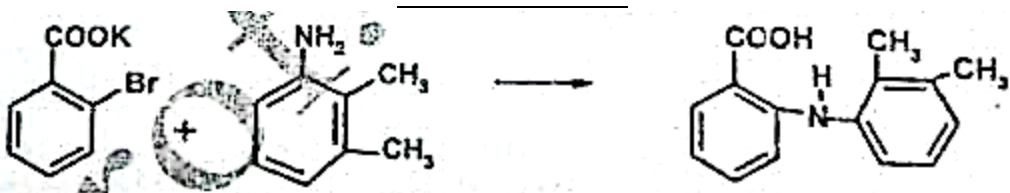
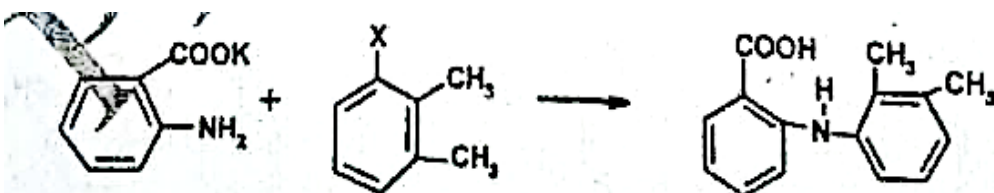


<sup>1</sup> حلقة عطرية.

<sup>2</sup> ان كل من الحلقتين العطريتين A و B يمكن ان تكونا متجانستين أو غير متجانستين، ولكن عطريتين حتماً.

سنبدأ بالحديث عن هذه المشتقات (:

## أولاً: حمض الميفناميك Mefnamic Acid:

	<p><b>التسمية والصيغة<sup>3</sup>:</b></p>
<p>(1) الملح البوتاسي لحمض بروم 2- الجاوي + دي ميتيل 2,3- انيلين ← حمض ميفناميك.</p>  <p>(2) الملح البوتاسي لحمض أمين 2- الجاوي + دي ميتيل 2,3- هالوجين 1- فينيل ← حمض ميفناميك.</p> 	<p><b>الاستحصال<sup>4</sup>:</b></p>
<p>~ بلورات بيضاء أو مسحوق ناعم عديم الطعم والرائحة.</p> <p>~ لا ينحل في الماء قليل الانحلال في الغول والكلوروفورم والايتر، ينحل في المحاليل القلوية.</p> <p>~ نلاحظ انه محب للدمس --&gt; <u>فالا امتصاص جيد.</u></p>	<p><b>الصفات الفيزيائية<sup>5</sup>:</b></p>

<sup>3</sup> R<sub>1</sub>,R<sub>2</sub>= CH<sub>3</sub> , R<sub>3</sub>,R<sub>4</sub>,R<sub>5</sub>=H

<sup>4</sup> يمكن ان يصنع ايضاً انطلاقاً من: امينو بنزونيك اسيد ثم نضيف دي ميتيل فينيل.

<sup>5</sup> اخواتي اخواتي يعني صرتو تعرفو كيف منسنتج هي الخصائص بالاعتماد على الصيغة.

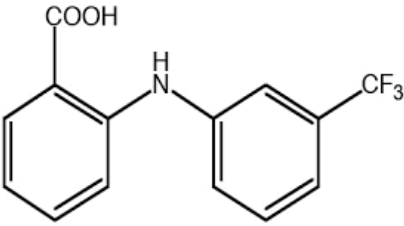
حيث: نعلم خصائص المجموعة الكربوكسيلية.(مرت سابقاً)

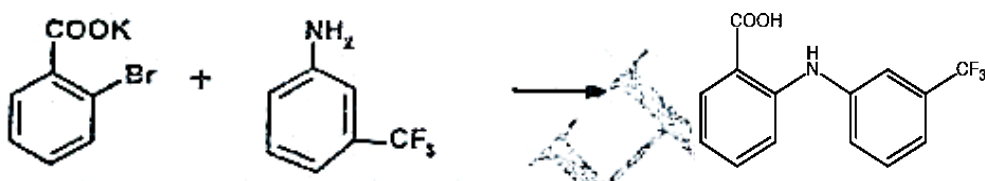
وكذلك خصائص المجموعة الامينية. (مرت سابقاً)

وكذلك خصائص الحلقة العطرية.(مرت سابقاً)

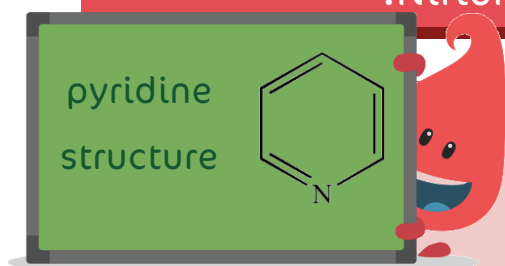
<p><b>الاستقلاب:</b></p>	<p>~ الانزيمات الكبدية حتى تستقلب هذا المركب ممكن:</p> <p>(1) <u>تحوله الى غول:</u> <math>\text{CH}_3 \leftarrow \text{CH}_2\text{OH}</math></p> <p>(2) <u>ممكن ان يتشكل ايبوكسي:</u> <math>\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{R}^1 \quad \text{R}^2 \quad \text{R}^3 \quad \text{R}^4 \end{array} \right)</math> عن طريق أنزيمات مؤكسدة، ثم يأتي أنزيم آخر ويؤدي الى تشكيل مجموعات OH، فعملية الاستقلاب تحتاج لوقت واستنفار أنزيمات الكبد.</p> <p>~ هذه المركبات بشكل عام تملك صعوبة في استقلابها لذلك لا تعطى للأطفال ومرضى القصور الكبدي أو الكلوي.</p> <p>~ اصعب استقلاباً من مشتقات البيرازول.</p> <p><u>ملاحظة: استقلاب الميفناميك لا يعطي انيلين لان الرابطة قوي بين الحلقتين.</u></p>
<p><b>الاستعمال:</b></p>	<p>~ مسكن للألم وآلم الطمث وخافض للحرارة ومضاد التهاب ولمعالجة الرثية المفصلية ويعطى بمقدار (0.5 – 1.5) غ باليوم.</p> <p>~ يمكن ان يعبر الى الجهاز العصبي المركزي ولكن بكميات ضئيلة اي ليست بالكمية التي تؤثر على الجهاز العصبي.</p>

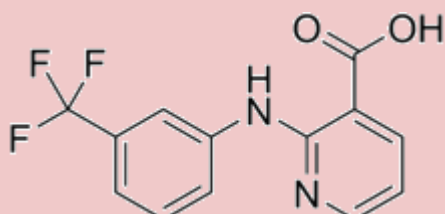
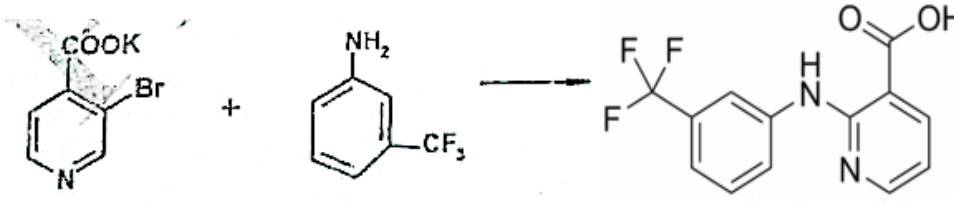
### ثانياً: حمض فلوفيناميك Flufenamique Acid:

<p><b>التسمية والصيغة:</b></p>	 <p>2 - ((3 - (Trifluoro Methyl)anilino)) Benzoic Acid</p>
	<p>نلاحظ وجود <math>\text{CF}_3</math> (حيال الله الرجال) ماذا تتوقعون من ذلك؟؟؟</p> <p>👉 الاطراح سوف يسهل "يزداد".</p> <p>👉 الامتصاص والنفاذ كذلك.</p>
<p><b>الاستحصال:</b></p>	<p>الملح البوتاسي لحمض هالوجين -2 الجاوي + تري فلوروميثيل -3 انيلين</p> <p>← <u>حمض فلوفيناميك.</u></p>

	
<p>~ مسحوق بلوري أصفر شاحب<sup>6</sup> عديم الرائحة.</p> <p>~ لا ينحل في الماء، ينحل في الغول والكلوروفورم والايتر.</p>	<p><b>الصفات الفيزيائية:</b></p>
<p>~ مسكن للألم و ألم الطمث وخافض للحرارة ومضاد التهاب ولمعالجة الرثية المفصلية يعطى بمقدار<sup>7</sup> (0.8 – 0.4) غ باليوم.</p> <p>~ يمكن ان يستخدم في معاجين الاسنان لالتهاب اللثة.</p>	<p><b>الاستعمال:</b></p>

### ثالثاً: حمض نيفلوميك Niflumique Acid:

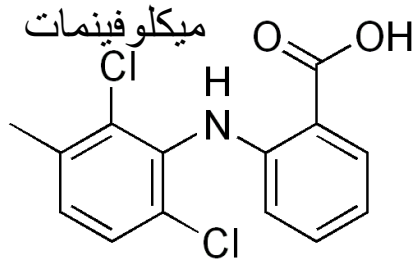
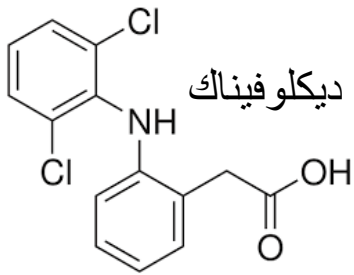


	<p><b>التسمية والصيغة:</b></p>
<p>2 -((3 - (Trifluoro methyl)anilino)) Pyridin E - 3 - Carboxylic Acid</p>	
<p>الملح البوتاسي لحمض هالوجين 2- البيريديني + تري فلوروميثيل 3- انيلين ← حمض نيفلوميك.</p> 	<p><b>الاستحصال:</b></p>
<p>تحسن قليلاً لوجود نواة البيريدين، ولكنها تملك خصائص محبة للنواة، وهذا يمكن ان يسبب مشاكل أخرى.</p>	<p><b>الاستقلاب:</b></p>
<p>مسكن للألم وألم الطمث وخافض للحرارة ومضاد التهاب ولمعالجة الرثية المفصلية، يعطى بمقدار (1 – 0.5) غ باليوم.</p>	<p><b>الاستعمال:</b></p>

<sup>6</sup> نلاحظ وجود مجموعة مولدة للون "F" Chromophore.

<sup>7</sup> نلاحظ ان جرته اقل من جرعة الميفناميك.

## رابعاً: ميكلوفينمات Meclofenmat:



اتذكرو شي؟؟؟؟

ديكلوفيناك مثلاً ^\_^

هذا المركب يعطي خصائص جيدة، ويشابه فعالية الديكلوفيناك.

الاستعمال:

يعطى بمقدار 100 – 500 mg في اليوم.

الجرعة:

## ♥ الخصائص الفارماكولوجية للمشتقات الأنترانيليكية:

تثبت بروتيني  
بلازمي بنسبة  
90%.عمره النصفى  
من 2-4  
ساعات.امتصاص  
هضمي سريع  
بعد 4 ساعات.إطراح اساسي  
بولي بنسبة  
60%.استقلاب  
كبدى.

## ▪ مضادات الاستطباب والتأثيرات الجانبية:

تحسس هضمي (إقياء  
وإسهال).قرحات هضمية ونزوفات  
دموية.

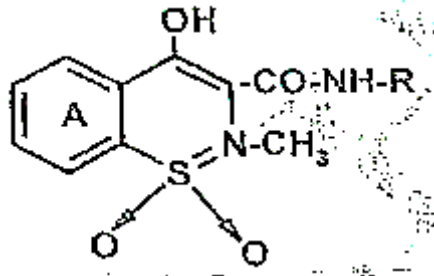
قصور كبدى وكلوى.

سمية على الجهاز  
الدموى وفقر دم.اضطرابات عصبية (دوار، أرق)  
واضطرابات نفسية.



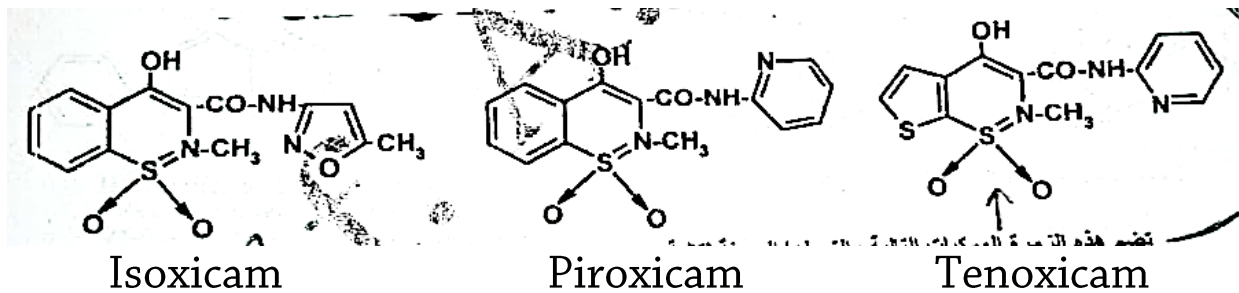
## مشتقات البيروكسيكام :derive's Piroxicamse

### مقدمة:



مشتقات ظهرت حديثاً، أليست من مشتقات (السلفا<sup>8</sup>)؟ طبعاً ^ \_ ^.

تضم هذه الزمرة المركبات التالية والتي لها الصيغ التالية:



<sup>8</sup> SO<sub>2</sub> سلفون ، SO سلفوكسيد.



## أولاً: بيروكسيكام Piroxicam.



مجموعة ال  
OH "الفينولية"  
لها خصائص  
حمضية أيضاً.

مجموعة SO2  
لها خصائص  
حمضية جيدة،

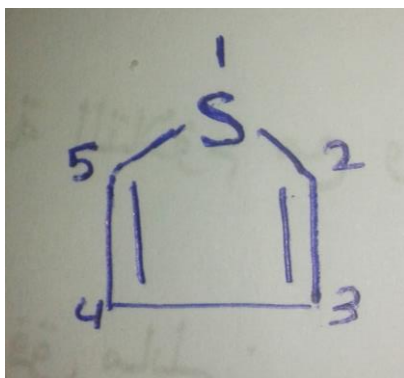
يرأىكون هل يملك  
خصائص حمضية أم  
قلوية؟؟؟

➤ الرابط الاميدي ممكن أن يتخرب بتأثير انزيمات معينة.

➤ وجود الأوكسجين يَمَكِّن هذا المركب ان يسبب اختلاطات وتداخلات مع مركبات أخرى "سواء كان مصدرها غذائي ام دوائي" بالإضافة الى إمكانية تشكل ايبوكسيدات.

➤ لا يعطى للأطفال، يملك تأثير مضاد للشنج.

## ثانياً: التينوكسيكام Tinoxicam.



يشبه البيروكسيكام، لكن  
استبدلنا حلقة البنزن  
بحلقة Thiophene  
صيغتها:

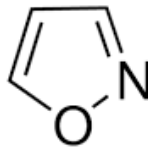
## ثالثاً: الايزوكسيكام Isoxicam.

➤ نلاحظ انه يشبه البيروكسيكام، ولكن استبدلنا نواة البيريدين بنواة أخرى.

فقرة  
هامّة

له خصائص محبة للماء ← الامتصاص غير جيد،  
ولكن في الحقيقة هذا المركب يمتص بشكل جيد،  
طيب كيف؟؟ شو هي هيك؟؟؟

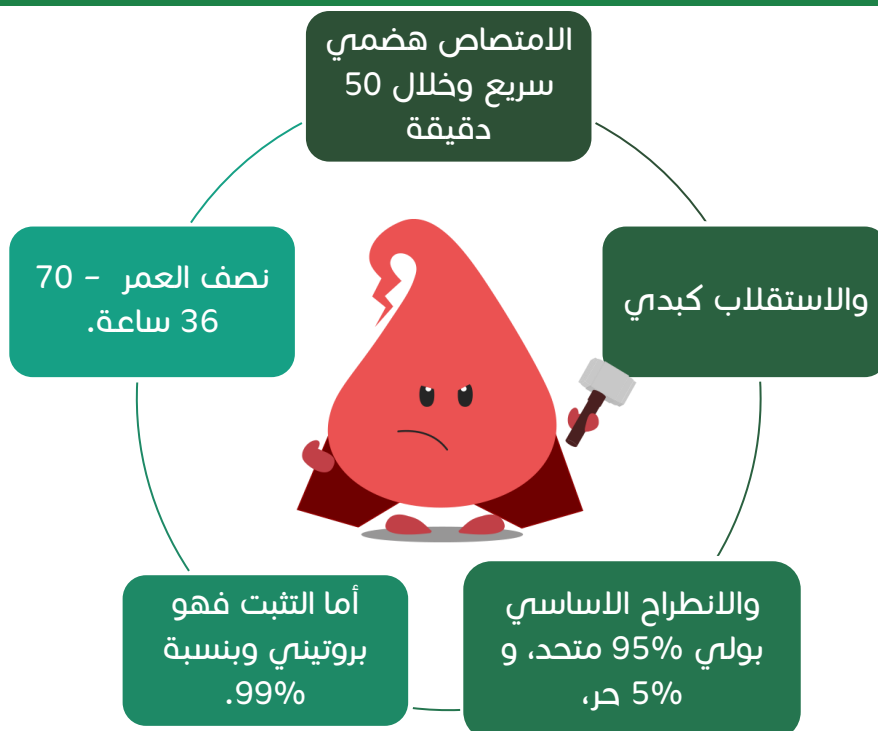
سبب ذلك هو وجود مجموعات وظيفية مثل  $\text{SO}_2$  ومجموعة Oxazole صيغتها:



فالأغشية الخلوية تملك جزيئات لا متجانسة فيها ((O,N,S...)) وهذا المركب يملك  
هذه العناصر أيضاً التي تساعد على النفاذ.

الاستعمال: مسكن للألم وخافض للحرارة ومضاد التهاب وخافض لحمض البول  
يعطى بمقدار (10 – 30) ملغ باليوم.

## الخصائص الفارماكولوجية للمشتقات البيروكسيكام:



## مضادات الاستطباب والتأثيرات الجانبية:

تحدث بعض هذه الادوية اضطرابات هضمية اقياء، اسهال.



تحدث بعض هذه الادوية قروحات هضمية ونزوفات دموية.



تحدث بعض هذه الادوية قصور كبدي وكلوي.



تحدث بعض هذه الادوية سمية على الجهاز الدموي: نزوفات، فقر دم.



تحدث بعض هذه الادوية اضطرابات عصبية: دوار - أرق - نفسي.



مضادات الالتهاب الغيرستيرويدية يمكن ان تستعمل في حالة الشقيقة لتخفيف الألم.

ملاحظة:

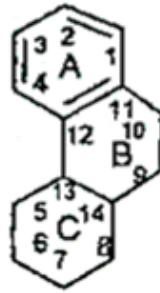


و الآن نبدأ ب...

## مسكنات الألم المركزية:

أولاً: المورفين ومشتقاته:

تأخذ هذه المركبات الصيغة التالية:



اوكتاهيدروفيانترين.

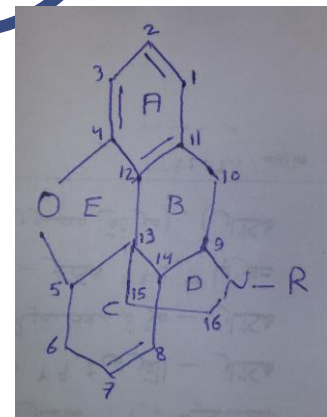
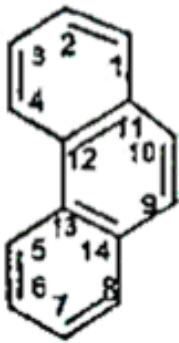
• نلاحظ انه تم اشباع بعض الروابط،  
مادة سامة.

• يعتبر نواة هذه المركبات.

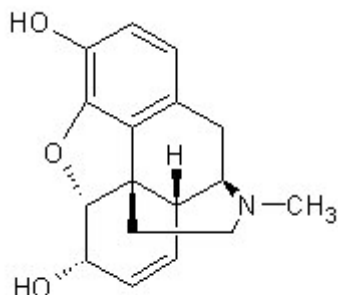
نواة مورفين.

• نلاحظ انه عبارة عن ثلاث حلقات عطرية، مادة استقلابها صعب، سامة كذلك.

فيانترين.



المورفين<sup>9</sup> Morphine:



Structure of morphine

نلاحظ من الصيغة انه يتكون من 5 حلقات A-B-C-D-E.

طبعاً خصائص المجموعات السابقة (الكحولية - فينولية...) معروفة لدينا.

يحتوي المورفين في صيغته على الوظائف التالية:

- a. وظيفة غولية على الكربون رقم 6.
- b. وظيفة فينولية على الكربون رقم 3.
- c. وظيفة ايتيرية مكونة جسراً أوكسجينياً بين الكربون 4 و 5.
- d. وظيفة امينية ثالثة تحمل جذر ميتيل.

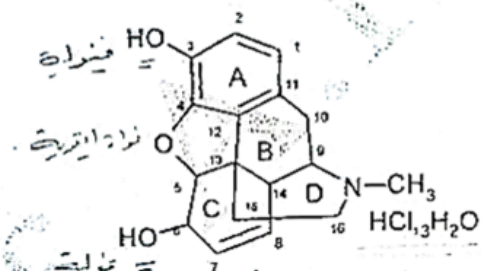
الاستحصال:	يستحصل المورفين من عقار الافيون Opium.
الخصائص الفيزيائية:	<p>~ قليل الانحلال في الماء (ينحل في الماء عندما يكون بالشكل الملحي) ينحل في الغول والكلوروفورم، مر الطعم.</p> <p>~ بلورات بيضاء تميل للون الاصفر قليلاً.</p>

<sup>9</sup>جميع هذه المركبات تتمتع بصفة محبة للدسم عالية فهي تصل للجهاز العصبي المركزي بسهولة.

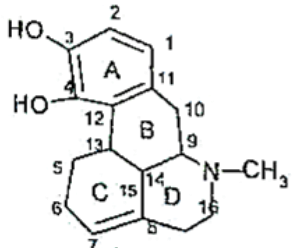
<p>~ مع دراجندروف (تحت آزوتات البزموت +  <math>(KI + HCL) \rightarrow</math> لون.          ~ مع بوشادرا (يود + يود البوتاسيوم)  <math>\rightarrow</math> لون.          ~ مع ماير (ثاني كلور الزئبق + يود          البوتاسيوم) <math>\rightarrow</math> لون.          ~ بالأكسدة بالماء الاوكسجيني <math>\rightarrow</math> وظيفة          امينو اوكسيد <math>\rightarrow</math> "جينومورفين"</p>	<p>تفاعلات الوظيفية الامينية الثالثية (آزوت عضوي):</p>	<p>يعطي المورفين تفاعلات الوظائف الكيميائية الموجودة في بنيته:</p>	<p>الخصائص الكيميائية:</p>
<p>~ مع فوق كلور الحديد <math>\rightarrow</math> لون بنفسجي.          ~ يعطي المورفين تفاعلات إرجاع، فهو          يرجع فري سيانور البوتاسيوم إلى          فروسيانور البوتاسيوم.</p>	<p>تفاعلات الوظيفة الفينولية:</p>		
<p>~ يعطي المورفين استرات مع الحموض          العضوية.          ~ يتأكسد المورفين ويتحول الى مورفينون.</p>	<p>تفاعلات الوظيفة الغولية:</p>		
<p>~ يتحول المورفين بتأثير القلويات          والحموض المركزة وبالحرارة الى          "الابومورفين" الذي يستعمل كمقيء.</p>	<p>تفاعلات الرابطة المضاعفة:</p>		
<p>~ حمض - اساس في وسط لا مائي.</p>		<p>المعايرة:</p>	

وأهم المركبات المشتقة من المورفين هي:

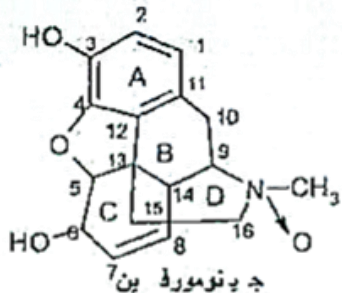
### A. كلوريدات المورفين<sup>10</sup>:

	<p><b>الصيغة:</b></p>
<p>مسكن مركزي للألم، مثبط لمركز التنفس، منوم، مضاد للسعال.</p>	<p><b>الاستعمال:</b></p>

### B. الابومورفين:

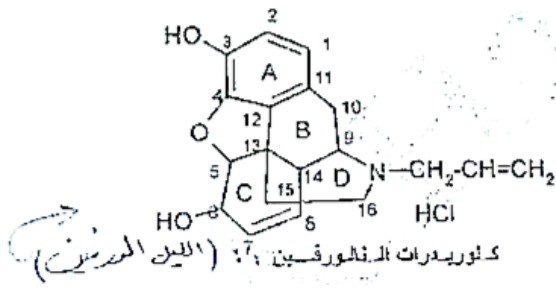
	<p><b>الصيغة:</b></p>
<p>ليس لهذا المركب اي تأثير مسكن إنما يستعمل مقيء، يملك تأثير مخدر، ولكن عندما يؤخذ من قبل المريض سيسبب تقيئ فلا يظهر تأثيره.</p>	<p><b>الاستعمال:</b></p>

### C. جينومورفين<sup>11</sup> Genomorphine (امينو اوكسيد المورفين):

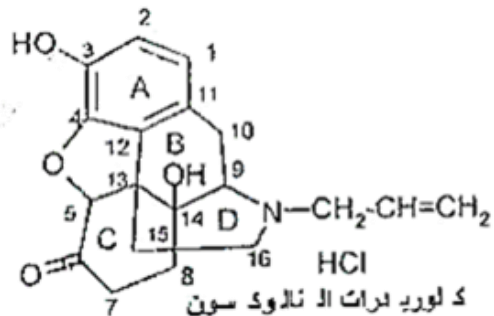
	<p><b>الصيغة:</b></p>
<p>يشبه تأثير المورفين ولكن بشكل اضعف قليل السمية، لا يسبب الاعتياد، لإبعد فترة طويلة يستعمل مهدئاً، وفي معالجة المتسممين باعتياد المورفين يعطى بمقدار 40 ملغ وهذا يعادل 10 ملغ من المورفين.</p>	<p><b>الاستعمال:</b></p>

<sup>10</sup>مثبط لمركز التنفس ومنوم ولكن حسب الجرعة.  
<sup>11</sup>نعلم انه ناتج من مفاعلة المورفين مع الماء الأوكسجيني.

## ثانياً: كلوريدات النالورفين: (اليل المورفين)

	صيفته <sup>12</sup>
<p>وهو عبارة عن بلورات بيضاء أو مسحوق ناعم مر الطعم ينحل في الماء قليل الانحلال في الغول لا ينحل في الكلورفورم والايتر.</p>	الخصائص الفيزيائية:
<p>يستخدم في معالجة المتسممين باعتماد المورفين يعطى بمقدار 5 - 10 ملغ كل (10 - 15) دقيقة لتنشيط التنفس.</p>	الاستعمال:

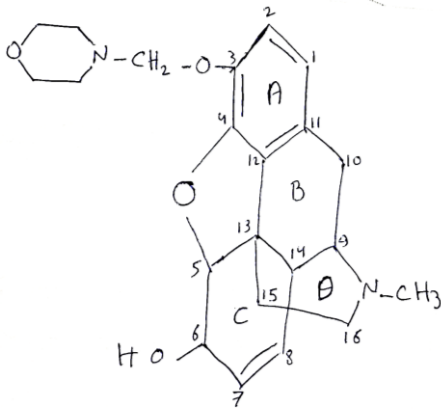
## ثالثاً: كلوريدات النالوكسون: اليل نورمورفين

	صيفته
<p>هو بلورات بيضاء أو مسحوق ناعم مر الطعم، ينحل في الماء قليل الانحلال في الغول، لا ينحل في الكلورفورم والايتر.</p>	الخصائص الفيزيائية:
<p>يستخدم في معالجة المتسممين باعتماد المورفين.</p>	الاستعمال:

<sup>12</sup>تلاحظ زيادة طول السلسلة المرتبطة بال N.

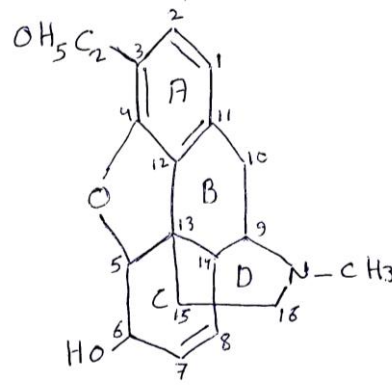


## رابعاً: ايتيرات المورفين الدستورية:



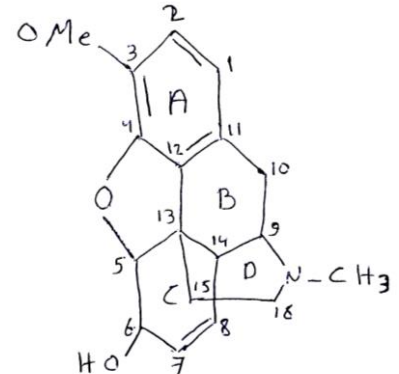
فولكودين:

مسكن للسعال  
(100) ملغ.



الديونين:

مسكن للسعال  
(100) ملغ.



الكودئين:

مسكن للسعال  
(100 - 20) ملغ.

"الايتر الايتيلي للمورفين"

نلاحظ تحويل المجموعة  
الفينولية الى مشتق  
ايتري "ايتوكسي"  
يقوي التأثير المضاد  
للسعال، كما ان التأثيرات  
الأخرى بقيت.

"الايتر الميثيلي للمورفين"

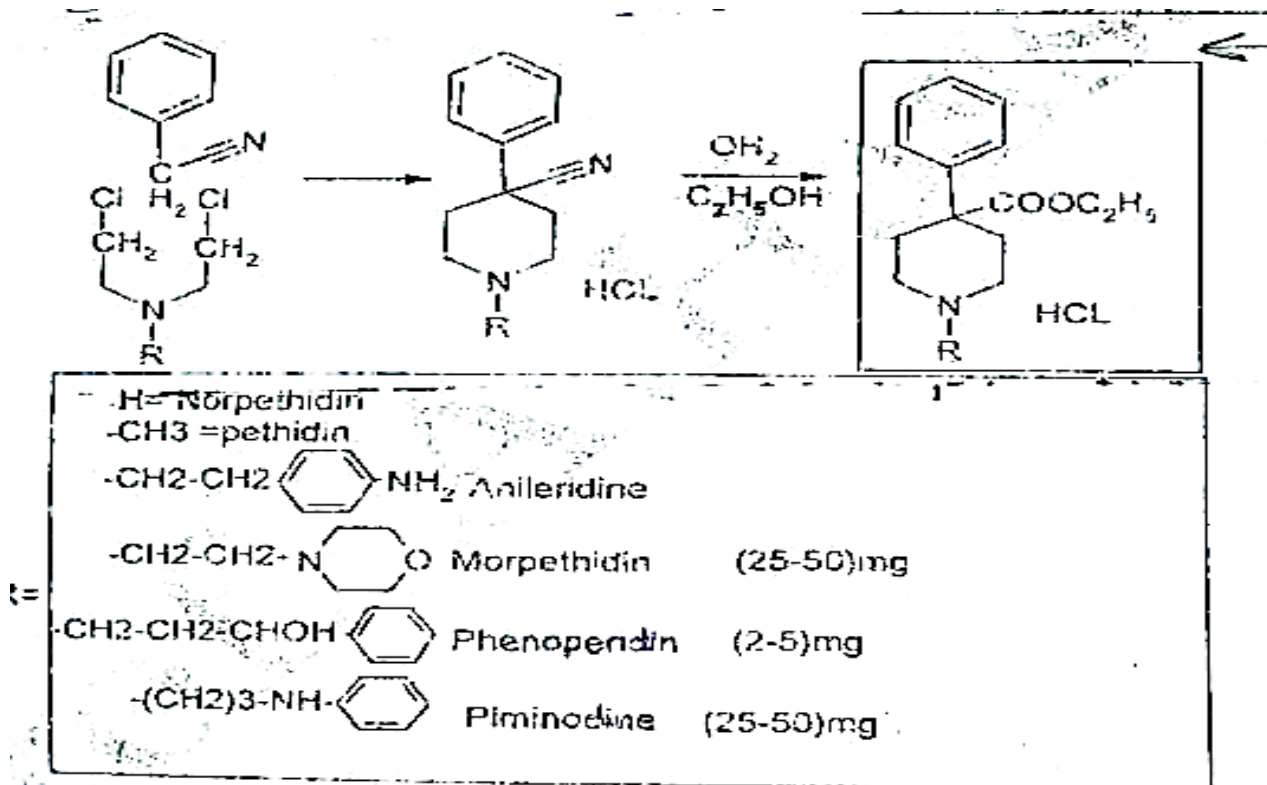
حولنا المجموعة الفينولية  
في المورفين الى  
مجموعة ميثوكسي.

نلاحظ في المركبات الثلاث أن  
العمل يكون على المجموعة  
الفينولية، والجرعات متشابهة ايضاً،  
وجميعها لها تأثير...  
مسكن للسعال.

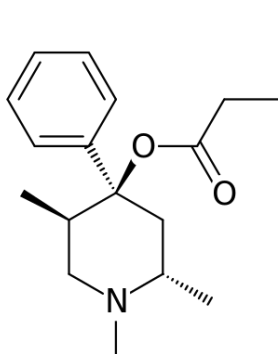
## خامساً: مسكنات الألم المركزية الاصطناعية:

## 1- مشتقات البيتيدين:

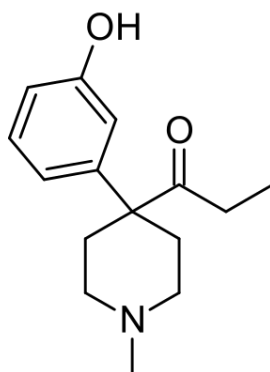
استبدال المجموعات R كلوريدات الالكيل - 1 فينيل - 4 بيبيريدين - كاربوكسيلات - 4 الايتيل. ويستحصل عليها بالطريقة التالية:



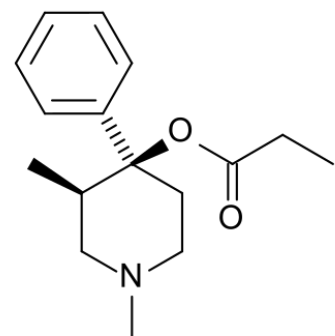
## ➤ مشابهات البيتيدين:



Trimepridine



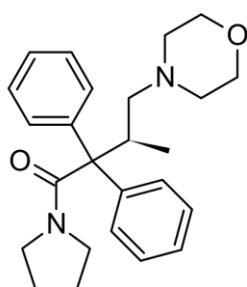
Cetobimidine



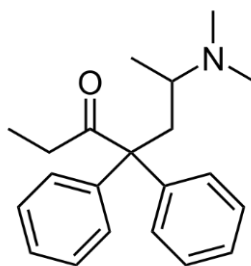
Alphaprodine

هذه المركبات جميعها تستعمل كمسكنة للألم ومضادة للتشنج.

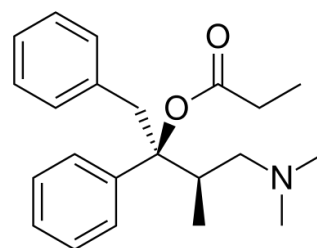
## 2- مشتقات الميتادون:



Dextromoramide  
مسكن أقوى من المورفين  
(5 - 20) ملغ.

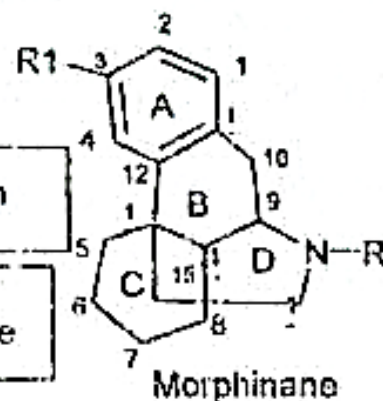
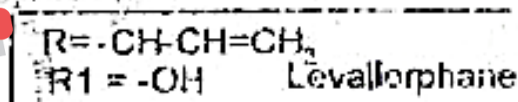
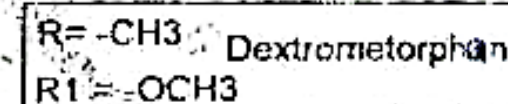
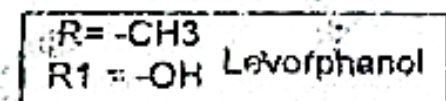


Methadone  
مسكن أقوى من المورفين  
(2.5 - 10) ملغ.



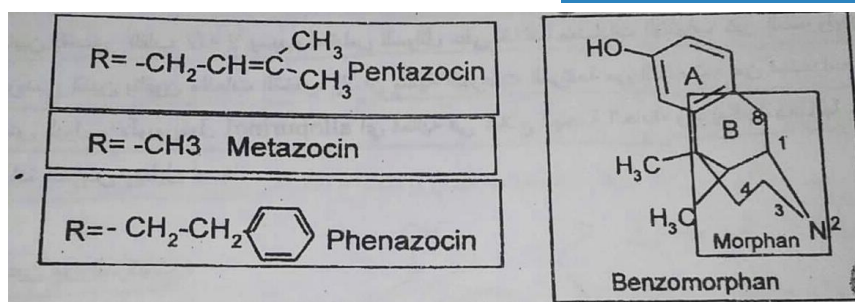
Dextropropoxyphene  
مسكن أضعف من المورفين  
(50 - 100) ملغ.

## 3- مشتقات المورفينان:



Levallorphan-3	Dextrometorphan-2	Levorphanol-1
يعاكس تأثير المورفين (1) ملغ.	مسكن مضاد للسعال (15 - 30) ملغ.	مسكن كالمورفين (1.5 - 4.5) ملغ.

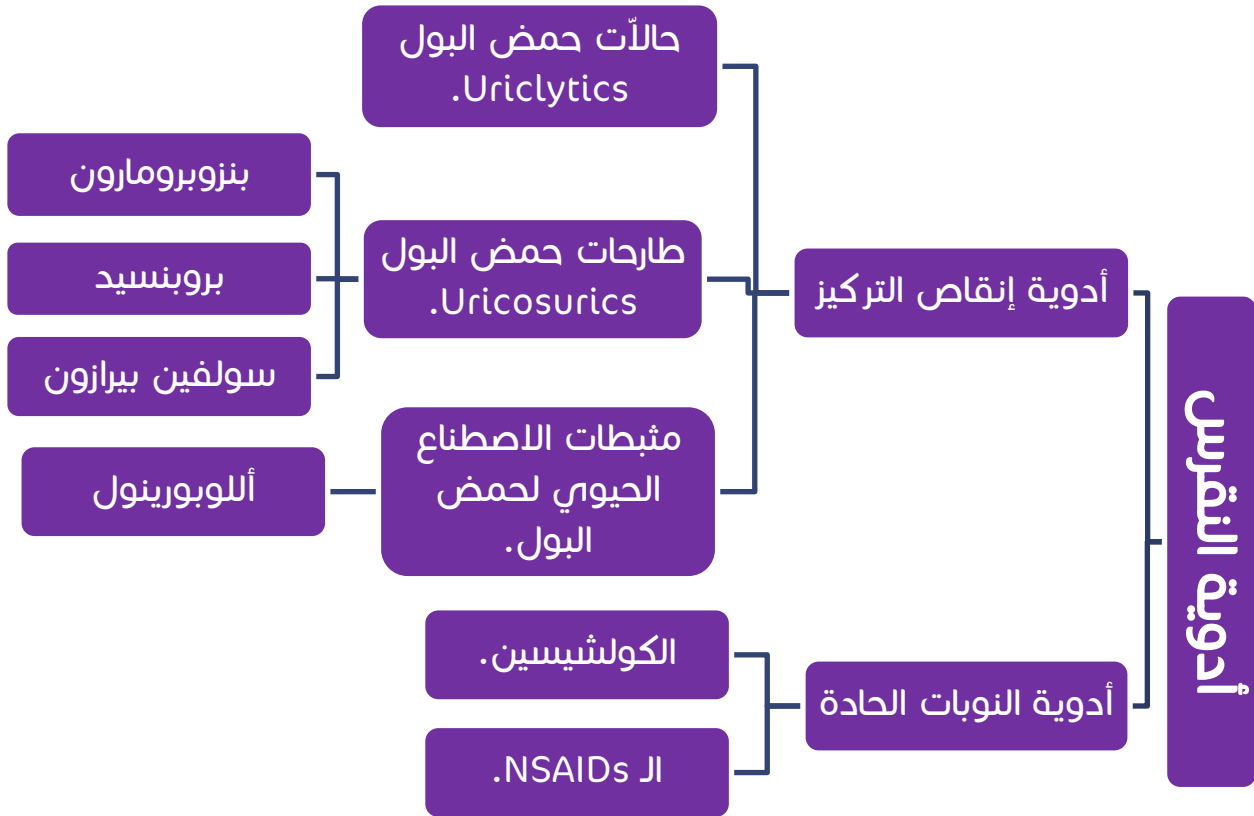
## 4- مشتقات البنزومورفان:



فينازوسين مسكن، المقدار (1-2) ملغ	البنزازوسين مسكن، مضاد سعال لا يسبب الأدمان (( بالجرعة الموجودة و لكن زيادة الجرعة تسبب الادمان)) أضعف من المورفين، (20-150) ملغ
--------------------------------------	--

## أدوية النقرس وفرط حمض البول .Me'dicaments de goutte et des huperuricemis

### مقدمة:



### أولاً: أدوية النوبات الحادة:

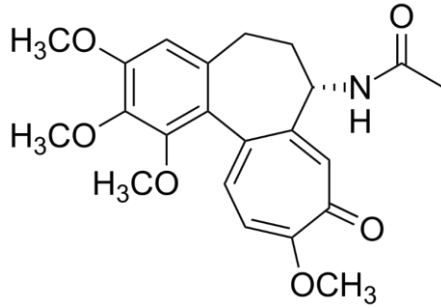
يمكن معالجة هجمات النقرس الحادة باستخدام جرعات كبيرة من مضادات الالتهاب الغير ستيروئيدية مثل الديكلوفيناك، الإندوميتاسين، الكيتوبروفن، النابروكسين، البيروكسكام، السولينداك.

مضادات الالتهاب الغير الستيروئيدية NSAIDs: ليست علاج، بل تخفف الألم فقط.

## ❖ الكولشيسين Colchicine:

❖ يشكل بديلاً مناسباً لمضادات الالتهاب غير الستيروئيدية وقد يماثلها من حيث الفعالية، ويتمتع بأهمية خاصة لدى المرضى المصابين بقصور القلب لأنه لا يسبب احتباس السوائل على خلاف مضادات الالتهاب الغير ستيروئيدية، كما يمكن استعماله لدى المرضى الذين يتلقون مانعات تخثر، إلا ان سمية الجرعات المرتفعة من الدواء تحد من استخدامه.

❖ بالمقابل ليس لطارحات حمض البول و الالوبورينول أي فعالية في علاج الهجمة الحادة، وقد يفاقم استعمالها خلال الهجمات من التظاهرات الحادة للمرض ويطيل أمدھا.

عبارة عن قلويد نحصل عليه من نبات اللحاح الخريفي Cholchicum Autumnal.	
	الصيغة:
<p>~ بلورات أو مسحوق عديم الشكل ذو لون اصفر مخضر، عديم الرائحة، ذو طعم مر شديد.</p> <p>~ ينحل بالغول والكلوروفورم، قليل الانحلال بالماء.</p> <p>~ تتميز بخاصة انها محبة للنواة بحيث تبدي فعالية مضادة للإنقسام، وذلك من خلال تأثير المركب على النكليوتيدات التي يحملها DNA، وإن هذا المركب يتفاعل مع نواة البيريميدين والبورين ويؤدي بدوره الى ايقاف انتساخ DNA.</p>	الخصائص الفيزيائية:
<p>~ يستعمل لمعالجة <u>النوبات الحادة</u> للنقرس، يعطى بمقدار (0.5 – 6) ملغ باليوم، يعطى هذا الدواء بحذر شديد لتأثيراته الجانبية الكثيرة.</p> <p>~ يستخدم في علاج <u>حمى البحر المتوسط</u>.</p> <p>~ يعطى بحذر نظراً لتأثيراته الجانبية.</p> <p>~ يسبب اضطرابات هضمية.</p>	الاستعمال:

## أدوية إنقاص التركيز:

تتم السيطرة على المرض من خلال:

زيادة إطراح حمض البول في البول (باستخدام طارحات حمض البول كالسولفين بيرازون Sulfipyrazone والبروبنسيد Probenecid)،

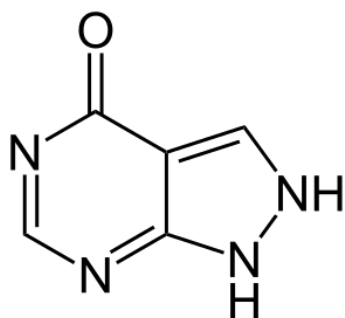
إنقاص اصطناع حمض البول انطلاقاً من البورينات باستخدام مثبطات الكزانئين أوكسيداز Xanthine Oxidase (الألوبورينول Allapurinol)،



## ❖ اللوبورينول Allopurinol:

❖ دواء جيد التحمل واسع الاستخدام في السيطرة طويلة الأمد على النقرس، ويتمتع بفائدة خاصة في معالجة المرضى المصابين بضعف الوظيفة الكلوية أو المرضى الذين يعانون من وجود حصيات البولات إذ لا يمكن في هذه الحالات استخدام الادوية الطارحة لحمض البول، ولكنه لا يستخدم في علاج فرط حمض البول اللاعراضي.

❖ يتمتع المستقلب الفعال للألوبورينول بنصف عمر طويل وهذا يسمح بإعطاء الدواء بجرعة واحدة في اليوم، ومع ذلك يجب تجزئة الجرعات التي تزيد عن 300 ملغ.

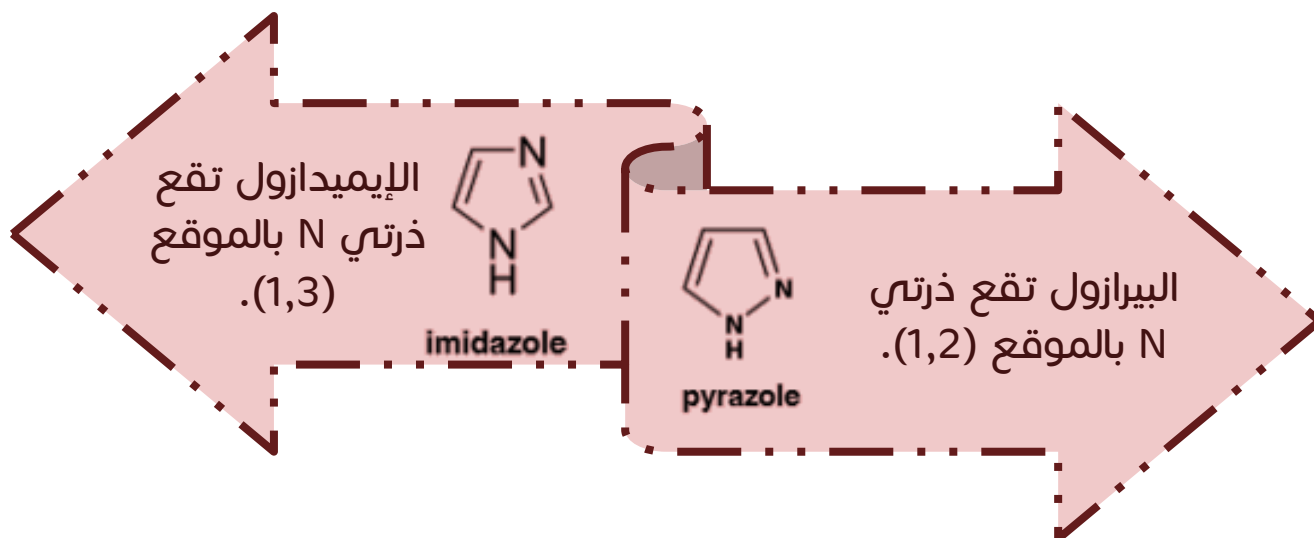


هيدروكسي -4 بيرازولو - (2-3) بيريسيدين.

نلاحظ أن الألوبورينول يشبه بالبنية اليوريك اسيد ولكن يحوي نواة بيرازول بدلاً من الإيميدازول الموجودة باليوريك اسيد.

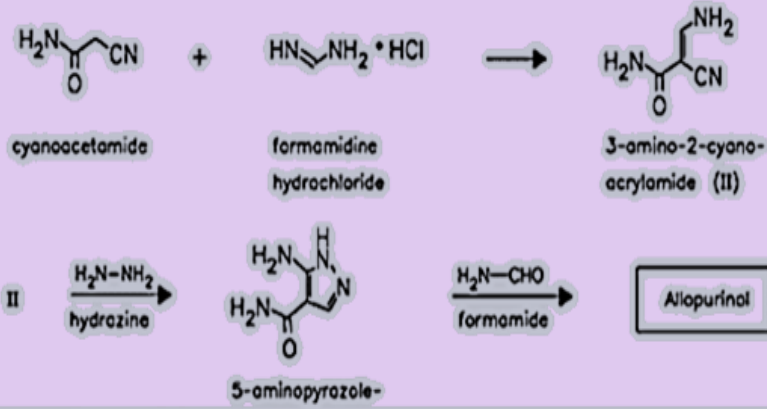
### ملاحظة:

نلاحظ أن الاختلاف بين نواتي الإيميدازول والبيرازول هو موقع ذرتي الآزوت:

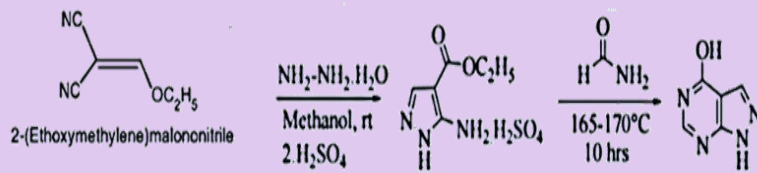


<p>1-يتم انطلاقاً من نواة البيرازول ونضيف لها نواة البيريميدين.</p> <p>2-الطريقة التقليدية:</p> <p>أن نقوم نحن بتصنيع النواتين. ^ _ ^</p> <p>إما من <u>السيانواسيتاميد + الفورم اميدين</u> ثم يعالج المركب الناتج بالهيدرازين ثم بالفورم أميد.</p>	<p>اصطناعه:</p>	<p>الخصائص الكيميائية:</p>
--	-----------------	----------------------------

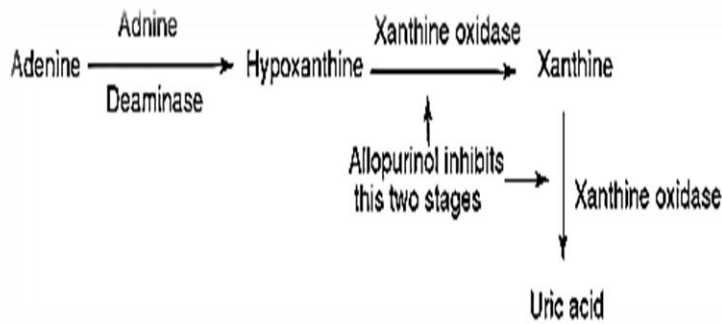




أو من مضاعف نتريل حمض المالنوك مع الهيدرازين ثم يعالج المركب الناتج بالفورم أميد.



-يثبط أنزيم الكزاننتين أوكسيداز الذي يقوم بأكسدة الكزاننتين والهيبيوكزاننتين<sup>12</sup> إلى اليوريك اسيد ← مما يؤدي لتخفيف الاصطناع الحيوي الداخلي لحمض اليوريك أو منعه.



آلية التأثير:

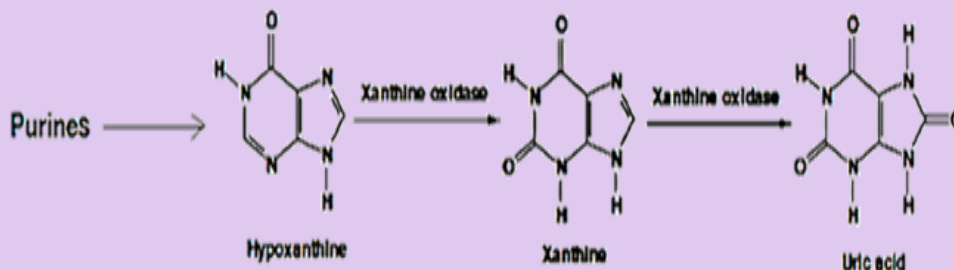
-حيث أن الألوپورينول يقوم بمنافسة الكزاننتين والهيبيوكزاننتين على هذا الأنزيم (كزاننتين أوكسيداز) نظراً لبنيته المشابهة جداً لهما وبالتالي أسهم في إشغال الأنزيم عنهما ← قلل من اصطناع حمض البول.

-يستعمل لمعالجة النقرس المزمن وارتفاع تركيز حمض البول، يعطى بمقدار (200 – 600) ملغ باليوم.

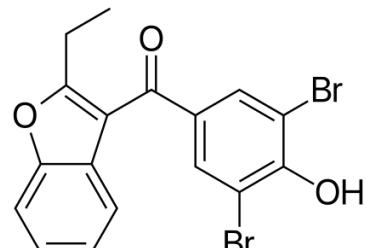
الاستعمال:

<sup>12</sup>نعلم ان الكزاننتين وهيبيوكزاننتين تنجم عن استقلاب البروتينات.

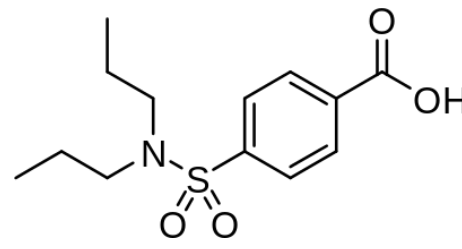


<p>الامتصاص هضمي سريع وخلال 30 – 60 دقيقة والاستقلاب كبدي والانطراح الاساس بولي 80% متحد أو حر ويؤثر من خلال إيقاف تصنيع حمض البول بواسطة الكسانتين أوكسيداز.</p>	<p>الخصائص الفارماكولوجية:</p>
	

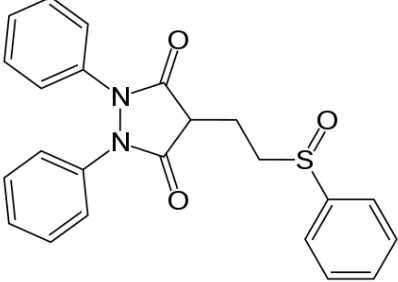
### ❖ بنزبرومارون :Benzbromarone:

	<p>الصيغة:</p>
<p>يستعمل لمعالجة النقرس المزمن وارتفاع تركيز حمض البول بآلية إعادة الامتصاص الأنبوبي يعطى بمقدار (100 – 300) ملغ باليوم.</p>	<p>الاستعمال:</p>

### ❖ بروبنيسيد :Probenecid:

	<p>صيغته</p>
<p>يستعمل لمعالجة النقرس المزمن وارتفاع تركيز حمض البول بآلية إعادة الامتصاص الأنبوبي يعطى بمقدار (250 – 500) ملغ باليوم.</p>	<p>الاستعمال:</p>

## ❖ سولفين بيرازون:

	صيغته:
لا ننسى أنه مسكن جيد ومضاد التهاب وطارح لحمض البول بتثبيط عودة الامتصاص الأنبوبي.	الاستعمال:

نلاحظ أن الألبورينول وبنزبرومارون و بروبنيسيد وسولفين بيرازون تستخدم في الحالة المزمنة.

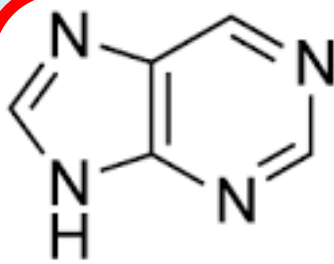
## مضادات الاستطباب والتأثيرات الجانبية لأدوية النقرس:

تحدث بعض هذه الأدوية تأثيراً على الكبد والكلى.

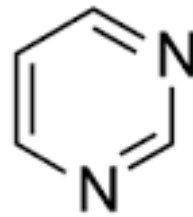


تحدث بعض هذه الأدوية تحسسات هضمية اقياء، اسهال.





purine (R)



pyrimidine (Y)

أضف ملاحظتك

.....

.....

.....

.....

.....

.....

.....

.....

لتحميل محاضراتنا:  
[www.Rbcsteam.org/lectures](http://www.Rbcsteam.org/lectures)



لإرسال ملاحظاتكم:  
[goo.gl/forms/Hl8slZEmLSZvySq92](https://goo.gl/forms/Hl8slZEmLSZvySq92)



للاستفسار عن هذه المحاضرة على غروب الفريق على الفيس بوك:  
RBCs Pharmacy 2019 [www.facebook.com/groups/rbcs2019](https://www.facebook.com/groups/rbcs2019)



## RBCs' Quote

Education is not the  
learning of facts, but the  
training of mind to think.

Albert Einstein

