

Алкалоиды

Алкалоиды.

Алкалоиды - азотсодержащие вещества основного характера, являющиеся вторичными метаболитами преимущественно растений. Обладают высокой биологической и физиологической активностью.

Известно более 10000 алкалоидов, из них очень мало метаболитов животных, морских организмов, высших и низших грибов, водорослей.

Иногда присутствуют в виде четвертичных солей или солей органических кислот (лимонной, яблочной, янтарной, щавелевой, реже – уксусной, пропионовой и т.д.)

Различают истинные алкалоиды (как правило, азагетероциклические соединения; биогенетически происходят от аминокислот) иprotoалкалоиды (азот не включён в циклический фрагмент молекулы, азотсодержащая функция находится вне основного углеродного скелета молекулы).

Способность алкалоидов к солеобразованию используют для их выделения из экстрактов растительного сырья.

Образуют интенсивно окрашенные соли и комплексы с пикриновой, фосфорномолибденовой, фосфорновольфрамовой и кремневольфрамовой кислотами, что используется для аналитического (качественного) обнаружения алкалоидов.

Алкалоиды.

Способы классификации алкалоидов:

- 1) Химический (по типу гетероциклического фрагмента);
- 2) Ботанический (из каких семейств растений выделены);
- 3) По характеру биологического действия (болеутоляющие, сосудорасширяющие, противовоспалительные и т.д.).

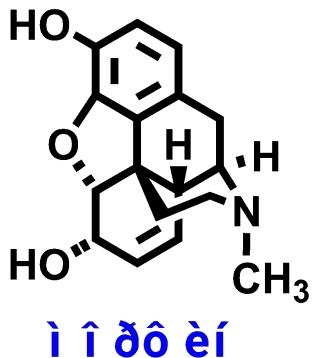
Наиболее богаты алкалоидами семейства бобовых (*Fabaceae*), паслёновых (*Solanaceae*), маковых (*Papaveraceae*), лютиковых (*Ranunculaceae*) и некоторых других.

Почти нет в розах, папоротниках, лишайниках и мхах. Совсем нет в бактериях.

Эфироносые и масличные растения почти не содержат алкалоидов.

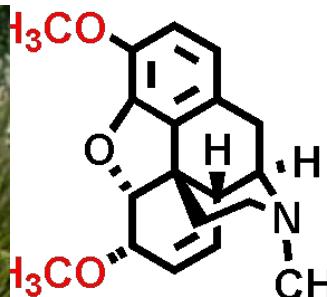
Группа морфина.

Выделено более 20 алкалоидов из мака *Papaver somniferum*. Основной – морфин.

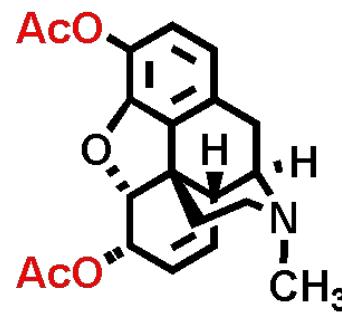


По химической классификации – к группе производных хинолина.

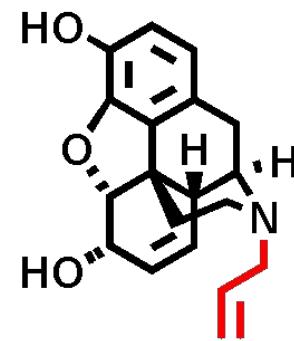
Относится к наркотическим анальгетикам (болеутоляющим средствам). Обладает седативным и снотворным эффектами, стимулирует гладкую мускулатуру, однако в больших дозах вызывает рвоту, запоры, затрудняет диурез, угнетение дыхания и гипотермию. Вызывает привыкание (наркомания).



òåáàèí áå
í å î áëàääàåò
êî ðè÷åñèèì äåéñòåèåì ;
ù çû âàåò êî í âöüñèè;
ÿâëÿåòñÿ âðåäíîé
ðèì åñüþ â î ï èéí ûô
ï ðåíà òðàòàô



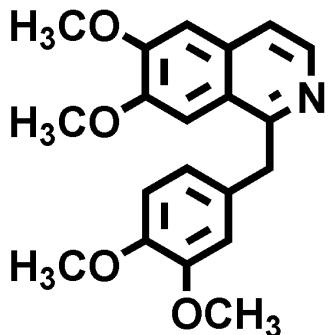
aaði èí



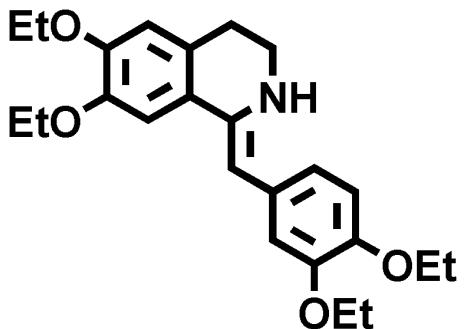
Í àëî ðô èí

àí òàäí í èñò ì î ðô èí à;
ï ðèì áí ýåöñÿ ï ðè
ëå÷åí èè í àðêî ì áí èè è
î ñòðû õ î òðàâëåí èÿõ
í àðêî òèêà ì è

Группа морфина.



І аї аâåðèí

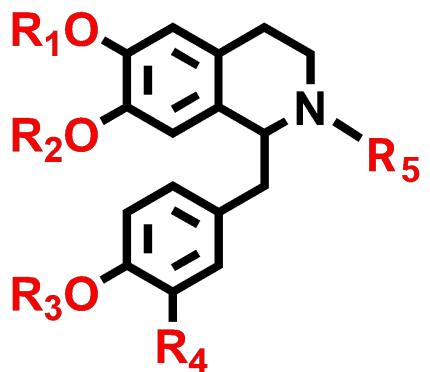


І ұ -ø і à

Папаверин выделен из опия, входит в состав спазмолитических и сосудорасширяющих препаратов; применяется при гипертонии, стенокардии, спазмах коронарных сосудов, сосудов мозга, гладкой мускулатуры брюшной полости.

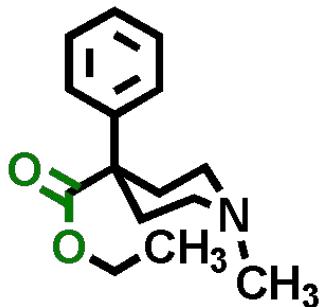
Но-шпа – полусинтетический аналог папаверина. Используется как спазмолитик.

По химической классификации – к группе производных изохинолина (бензилизохинолиновые алкалоиды).



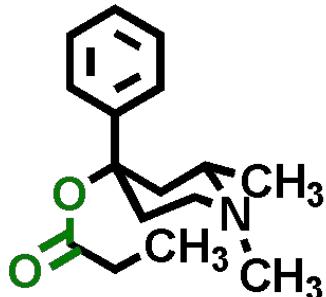
Название	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅
коклаурин	Me	H	H	H	H
ретикулин	Me	H	Me	OH	Me
лаудонозин	Me	Me	Me	OMe	Me
папаверолин	H	H	H	H	H

Синтетические анальгетики.



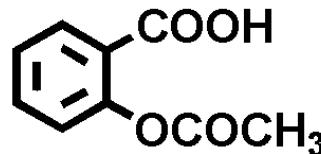
ëèäî ë

â 10 ðàç ñëàáåå
ì î ðô èí à è çí à÷èòåëüí î
ì áí åå ðî êñè÷åí

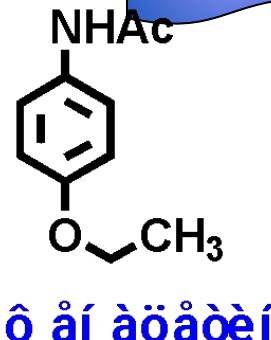


ï ðî ì åäî ë

â 2-4 ðàçà
ñëàáåå ì î ðô èí à



âñî èðèí
òî ðì î çèò ñèí òåç
ï ðî ñòàääàí äèí î â

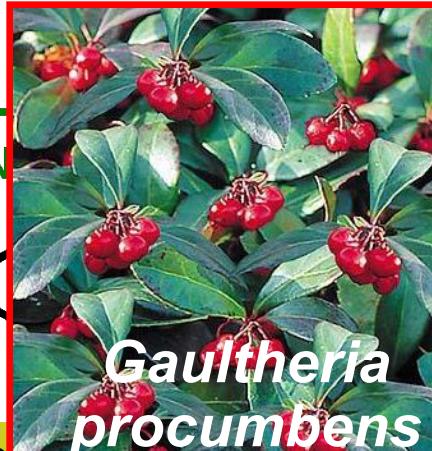


ô åí àöåðèí

î áëàäàþ ò

ï ðî òèåî âî ñî àëèòåëüí û ì è
æàðî ï î í èæàþ ù èí äåéñòåèåí

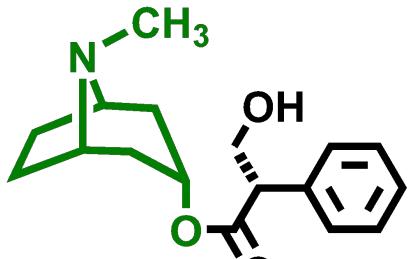
Салициловая кислота в виде сложных эфиров встречается в растениях, например, в ивах (*Salicaceae*), грушанке *Gaultheria procumbens*, гортецензии *Hydrangea macrophylla*, подмареннике *Galium aparine*, подорожнике *Plantago major*.



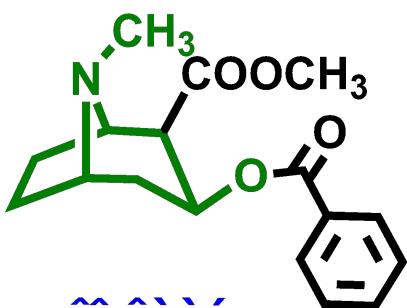
Фентанил – анальгетик наркотического действия, в 100-400 раз активнее морфина.

Группа атропина (группа кокаина, производные тропана).

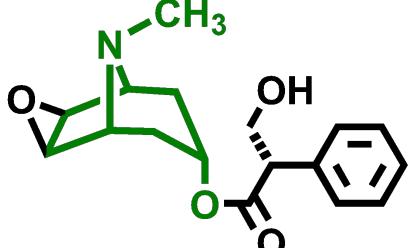
6



àòðî ï èí
æî ñöèàì èí



êî êàèí

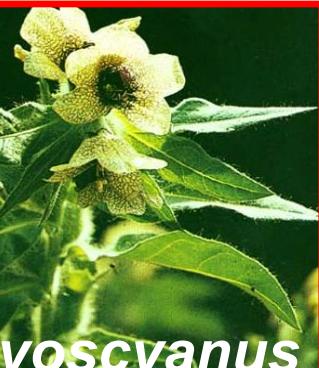


ñêî ï î ëàì èí

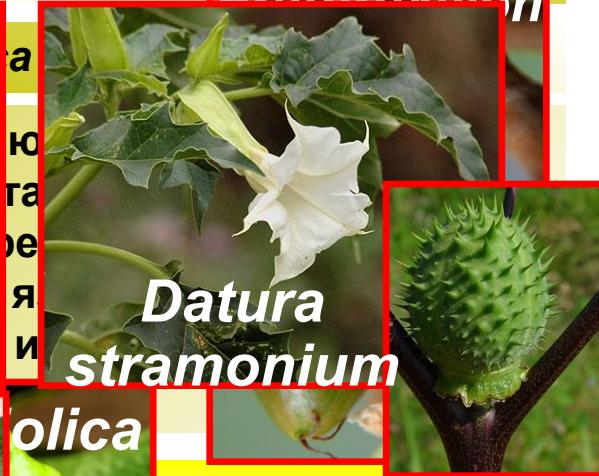
Большое содержание в растениях семейства Паслёновых (*Solanaceae*), особенно в красавке (белладонна, *Atropa belladonna*), дурмане (*Datura stramonium*) и белене (*Hyoscyamus niger*).



Atropa belladonna



Hyoscyamus niger

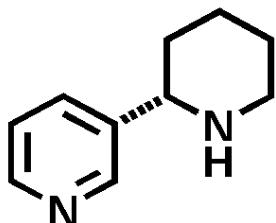


Datura *stramonium*

Группа никотина.

По химической классификации – к производным пиридина, пиперидина и пирролидина.

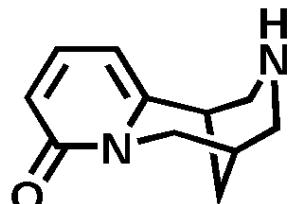
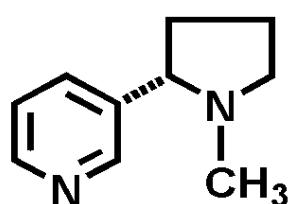
7



àí àáàçèí

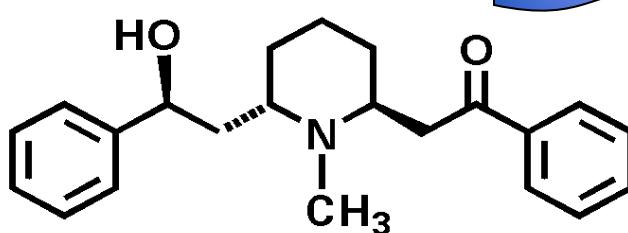
âû äåëåí èç åæâ áí èéâ
ååçèèñòí î ãï Anabasis
aphylla, èí ñåêòëöèä

í èéî ðèí



öèðèçèí

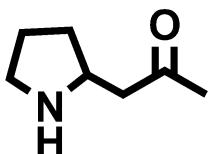
âû äåëåí èç òåðí î í ñèñà;
äî áàâëýþ ò â í ðí ðèâî -
í èéî ðèí î áû å ðàáëåðèè



ëî áåëëí

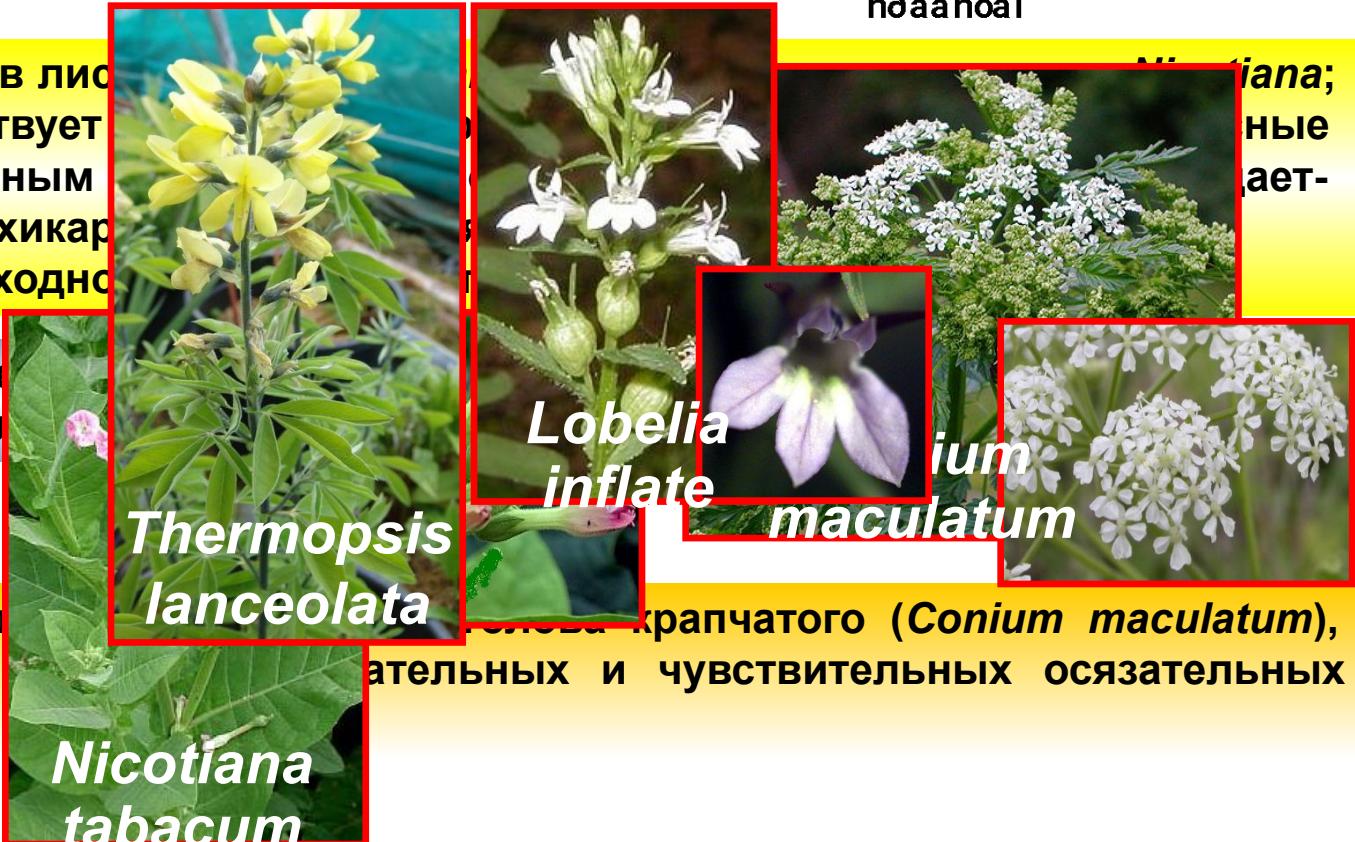
âû äåëåí èç Lobelia inflata;
äî çáóæäàþ ù åå è ñî ñóäî åâèåðåðüí î å
ääéñòåèå í à äû ðàðåðüí û å öäí ððû;
ýô ô åèòèåí î å àí àéäî ðè÷åñëí å
ñðåäñòåî

Никотин присутствует в листьях, высокотоксичен, действует на сосуды, является мощным средством от тошноты, рвоты, брахикиарии. Никотин - основное исходное вещество для синтеза табачных алкалоидов.



гигрин

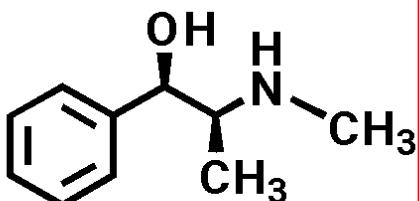
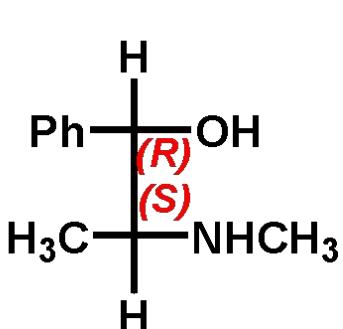
Гигрин выделен из:
Антиспазмолитиков



Конинин выделен из:
Парализует нервов.

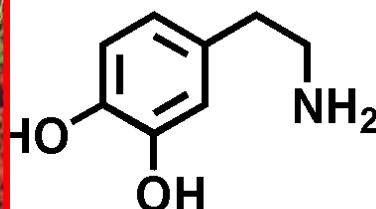
Листья храпчатого (Conium maculatum), а также чувствительных и чувствительных осознательных

Группа эфедрина (protoалкалоиды).



ýô åäðèí

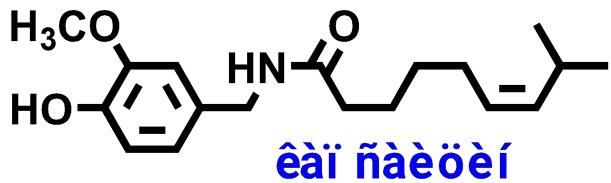
âû äåëåí èç õâî éí èêà
ðåì íî à Ephedra sinica



äî ô àì èí

â ã à ã Ephedra
sinica

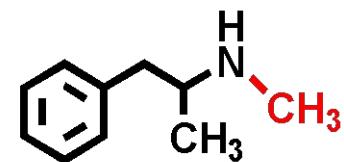
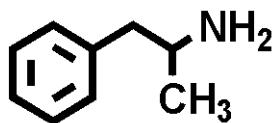
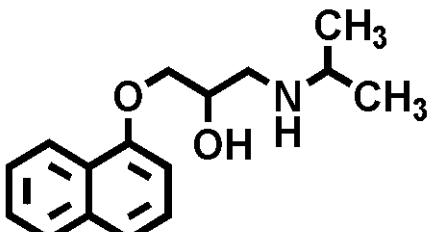
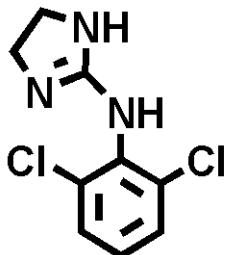
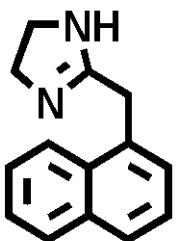
Эфедрин используется в лечении бронхиальной астмы и других аллергических заболеваний, для сужения сосудов и уменьшения воспалительных явлений, для повышения кровяного давления, при отравлении снотворными и наркотическими веществами.



Капсаицин – алкалоид, содержащийся в различных видах стручкового красного перца *Capsicum*, жгучий компонент перцев. Не является амином (амид).

Раздражает верхние дыхательные пути и кожу, используется как отвлекающее и обезболивающее средство, а также в мазях от обморожения. Вызывает массовую гибель злокачественных клеток благодаря воздействию на митохондрии.

Синтетические аналоги эфедрина (по механизму действия).



í àô òèçèí

êëî ô åëëí

áí àï ðëëëí

ô áí àì èí
(àì ô åòàì èí)

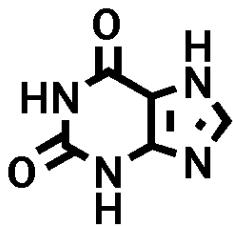
ì åòàì ô åòàì èí

ì î ù í î å áî çáóæäàþ ù åå äåéñòâèå í à Öí Ñ

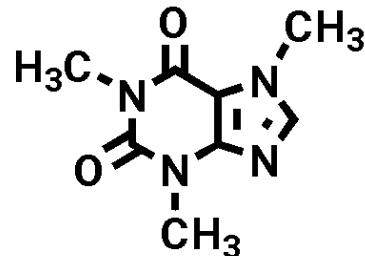
Âñå óêàçàí í û å ñî åäèí áí èý äåéñòâóþ ò í à α- è β-àäðåí î ðåöåí òî ðû .

Группа кофеина.

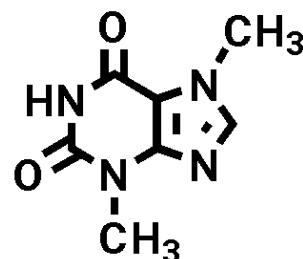
По химической классификации – к пуриновым алкалоидам.



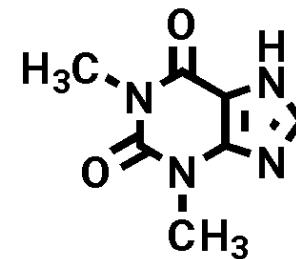
**ксантин
(дигидроксипурин)**



кофеин
в бобах кофе - до
1.5%, в чае - до 5%



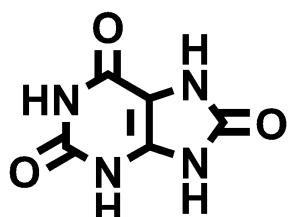
теобромин
(3,7-диметил-
ксантин)



теофиллин
бронхолитическое и
мочегонное действие

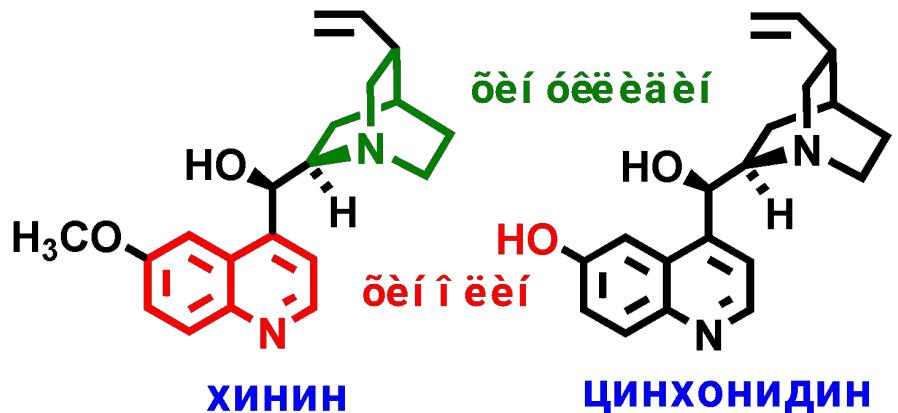
Кофеин выделяют из листьев чая, зёдрах кофе, бобах какао. Может быть получен из теобромина и теофиллина метилированием.

Кофеин является психостимулятором, возбуждает сердечную деятельность и ЦНС, расширяет коронарные сосуды, усиливает двигательную активность и диурез.



Выделяют из мочи КРС; является предшественником для синтеза кофеина в промышленности.

Хинин.

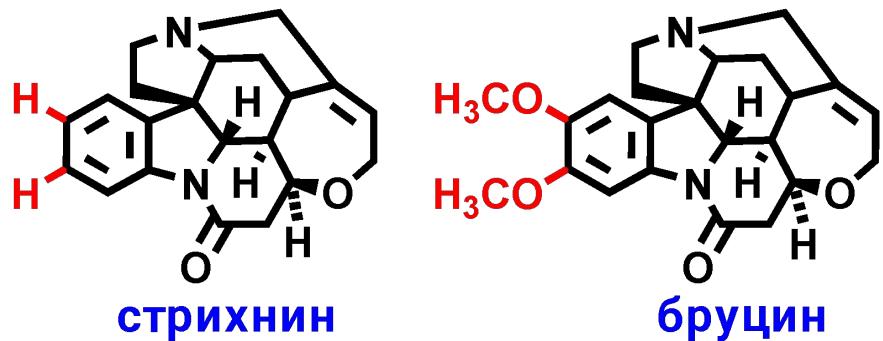


Известно более 20 подобных алкалоидов. Выделяют из коры хинного дерева, который был основным средством борьбы с малярией (возбудители – организмы малярийных комаров).



С фармакологической точки зрения – антибиотики. Имеют сильное действие на сердце при некоторых сердечных заболеваниях и в акушерской практике.

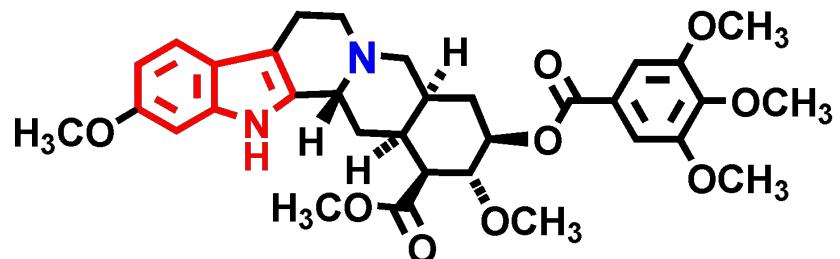
Стрихнин, бруцин.



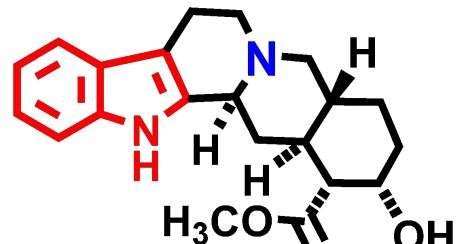
Стрихнин в малых дозах стимулирует центры кровообращения и дыхания, усиливает рефлекторные реакции (аналептик). Бруцин менее ядовит, обладает куареподобным действием. Используется для разделения рацемических карбоновых кислот.

Индольные алкалоиды

Очень разнообразная группа алкалоидов, частыми фрагментами в молекуле. Широкий спектр



ðåçåðї ёí

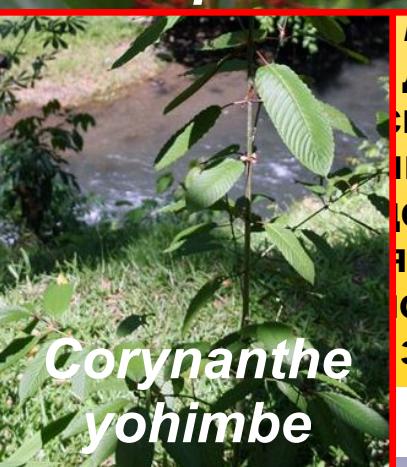


ёї õèї áèї

Выделен из коры африканского дерева коринанта (*Corynanthe yohimbe*). Обладает схожим с резерпином биологическим действием, но более известен как составная часть африканских «любовных напитков», возбуждает половую деятельность (афродиазик).

Rauwolfia serpentina

Выделен из раувольфии *serpentina* (кроме резерпина) алкалоидов. Обладает сильной (но заметной) кардиотонической активностью, сильным гипотензивным действием, успокаивает ЦНС. Применяется в лечении гипертонии, психозов, заболеваний. Применяется в

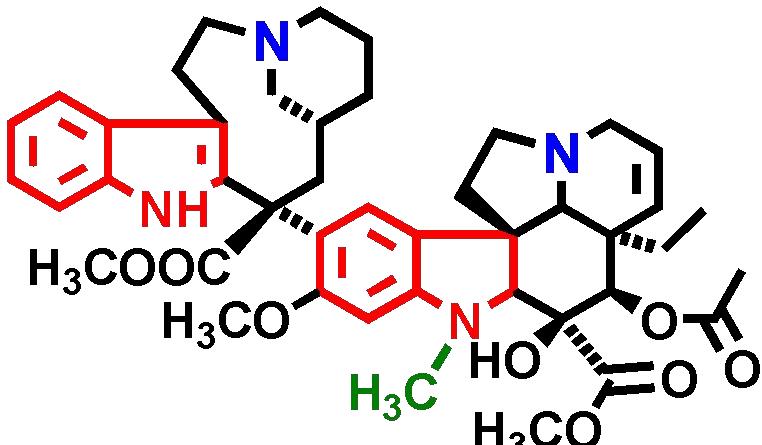


Corynanthe yohimbe

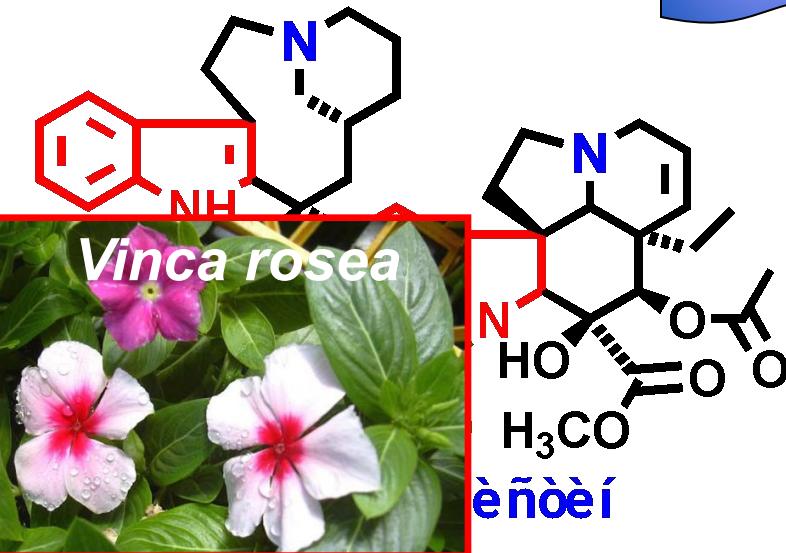
икличес-

Rauwolfia других 20 сильностью, сильностью), действием, в лечения огических змей.

Индольные алкалоиды.



âèí áëàñòèí

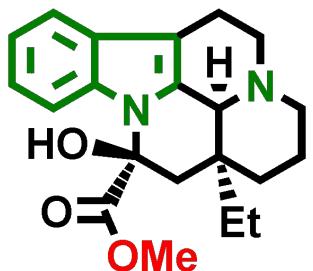


èñòèí

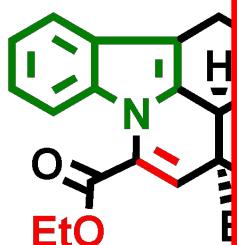


Среди прочих выделены из барвинка розового (*Vinca rosea*). Обладают мощной противораковой (цитотоксичной) активностью, подавляют синтез ДНК и РНК. Применяются в химиотерапии опухолей, а также как противовирусные препараты.

Аналогом по биологическому действию и структурному подобию алкалоидов является вид барвинок малый (*Vinca minor*), произрастающий на территории России и Сибири, в частности.



(+)-âèí êàì èí



(+)-âèí îò öà



Vinca minor

умеренно понижает артериальное давление, расширяя сосуды мозга, и проявляет антиэпилептический эффект. Минорин (другой алкалоид *Vinca minor*) селективно улучшает кровообращение в головном мозге. Похоже действие препарата винпоцетин.