

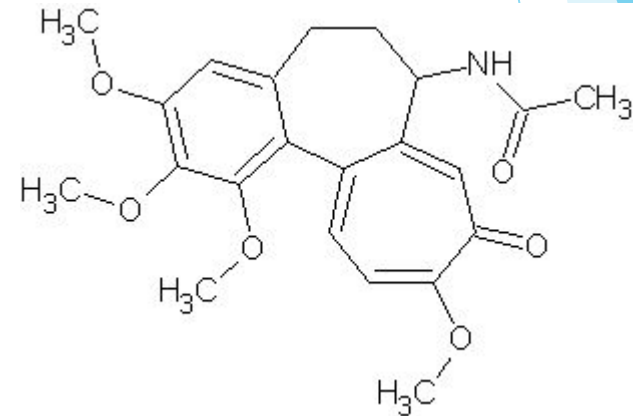
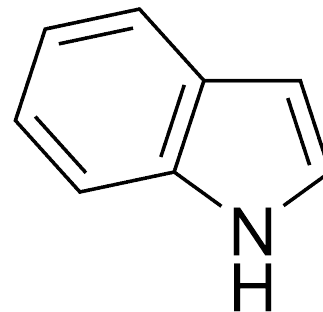
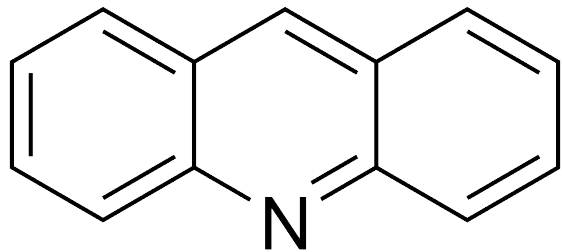
# Алкалоїди

Підготували: студенти РБМК  
Відділення: Фармація - бакалаврат  
Група: Б

## . ПОНЯТТЯ «АЛКАЛОЇДИ» І ЇХ ФУНКЦІЇ

Алкалоїди - це азотовмісні гетероциклічні основи, які мають сильну і специфічну біологічну активність.

Добре розчиняються у воді. Вміст алкалоїдів у рослинах, як правило, невелика - від слідів до кількох відсотків (на суху вагу рослини). У квіткових рослинах найчастіше представлено одночасно кілька груп алкалоїдів, різняться як по хімічній структурі, але і за біологічними ефектів.



Номенклатура алкалоїдів не була систематизована - як через складність сполук, так і за історичними причинами. Усі назви мають суфікс -ин(ін) і утворені різними способами: від родових назв рослин (гідрастин від *Hydrastis canadensis* і атропін від *Atropa belladonna*); від видових назв рослин (кокаїн від *Erythroxylon coca*); від назв лікарської рослини, з якого виділений алкалоїд (ерготамін від англійського ergot - ріжок); від виявленої фізіологічної активності (морфін від Морфея - давньогрецького бога сну); від особистого імені (пельтьєрин названий на честь хіміка П'єра Жозефа Пельтьє; за назвою цього алкалоїду названа група алкалоїдів - група пельтьєрину. Пельтьє виділив ряд алкалоїдів - еметин (1817), колхіцин (1819), стрихнін (1819), бруцин (1820), цинхонін (1820), хінін (1820), кофеїн (1820), піперин (1821), конїїн (1826), тебаїн (1835) і, між іншим, зелений пігмент рослин хлорофіл, якому він дав назву.

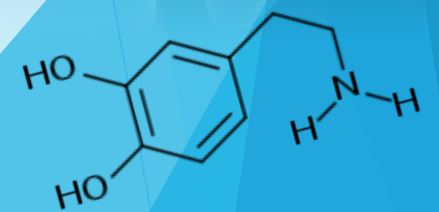
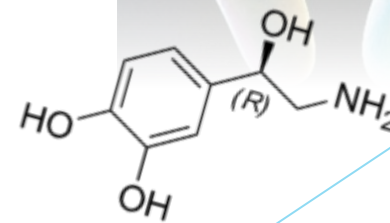
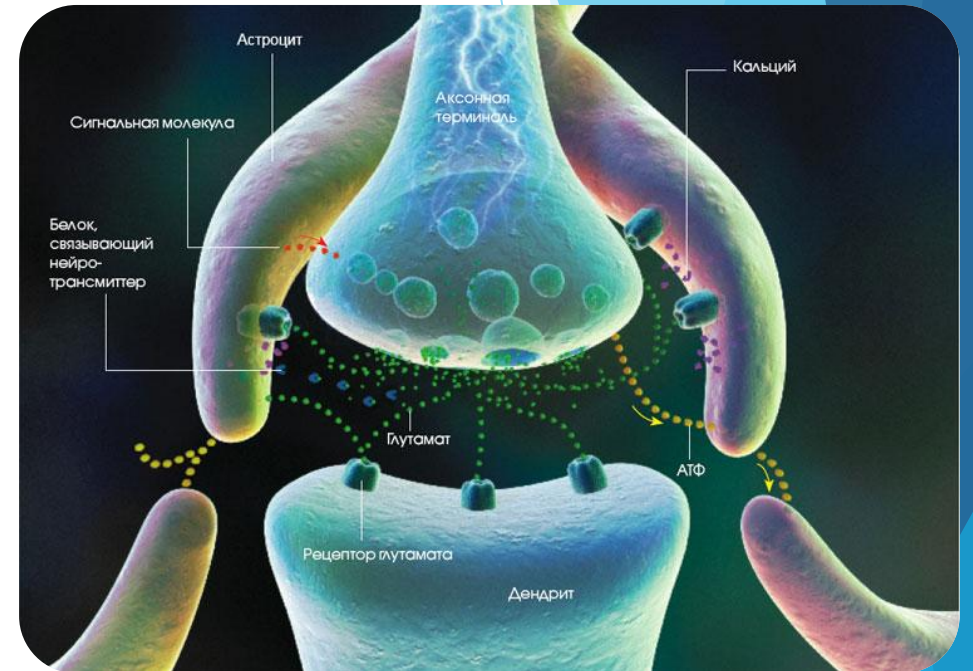
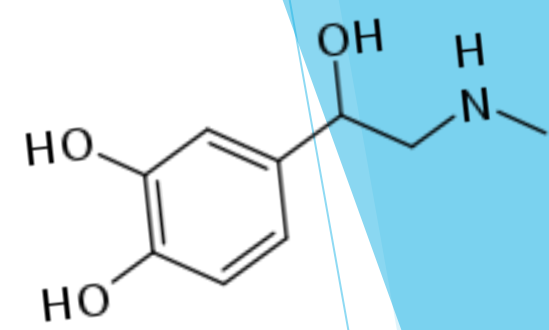
До теперішнього часу виділено понад 10 000 алкалоїдів різноманітних структурних типів, що перевищує число відомих сполук будь-якого іншого класу природних речовин.

Виробляються алкалоїди в основному в грибах і рослинах, (особливо багаті на них рослини із сімейства бобових, макових, пасльонових, Лютикова, лободових, складноцвітих), а діють на тварин, причому зазвичай вражають нервову та м'язову системи.





Хімічні основи їх дії, в загальному, зрозумілі. Багато гормонів та медіатори в організмі тварин - аміни або пептиди, також похідні амінокислот. Це ацетилхолін, адреналін, норадреналін, серотонін, дофамін, ендорфіни та інші. Алкалоїди в хімічному відношенні схожі на них. Потрапивши в тіло тварини або людини, вони зв'язуються з рецепторами, призначеними для регуляторних молекул самого організму, і блокують або запускають різноманітні процеси, наприклад передачу сигналу (ацетилхоліну) від нервових закінчень м'язів.



## Функції алкалоїдів

У рослинах функції алкалоїдів не цілком зрозумілі. Можливо, алкалоїди – це побічні продукти обміну речовин (метаболізму) у рослинах, або вони служать резервом для синтезу білків, хімічним захистом від тварин і комах, регуляторами фізіологічних процесів (росту, обміну речовин і розмноження) або кінцевими продуктами детоксикації, що знешкоджують речовини, нагромадження яких могло б зашкодити рослині. Кожне з цих пояснень може бути справедливим у конкретних випадках, однак 85–90% рослин зовсім не містять алкалоїдів.

## Якісний та кількісний аналіз

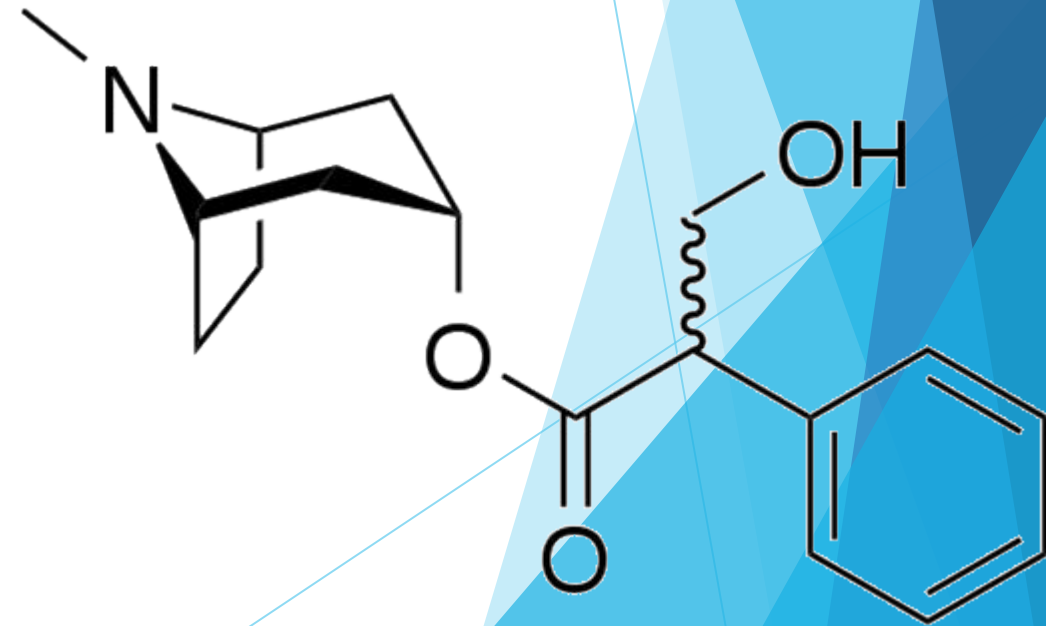
Алкалоїди дають осадові реакції з реактивом Майєра, реактивом Марме, 1% розчинами фосфорномолібденової, фосфорновольфрамкової, кременевольфрамкової кислот та ін. Ще більш швидкий і простий метод якісного аналізу заснований на здатності ряду алкалоїдів до флуоресценції в ультрафіолетовому світлі. Це властивість більш характерна для похідних гарману. Для того щоб виявити алкалоїди, достатньо нанести на фільтрувальний папір краплю водної витяжки або соку рослини. Пляма світиться в ультрафіолетовому світлі. Цей спосіб можна використовувати як експрес-метод, тому що в цьому випадку виявити алкалоїди можна протягом декількох секунд, що важливо при масових аналізах.

У якості досить високоспецифічної реакції на індольні алкалоїди використовують тест Ерліха - реакцію виннокислої солі алкалоїду з розчином п-диметиламінобензальдегіду у 65% сульфатній кислоті. Після впливу світла ртутної лампи або в присутності слідів ферум хлориду розвивається інтенсивне забарвлення, що варіює в залежності від типу алкалоїду від пурпурового до яскраво-синього.

Однак найбільш тонким і селективним методом аналізу є паперова або тонкошарова хроматографія.

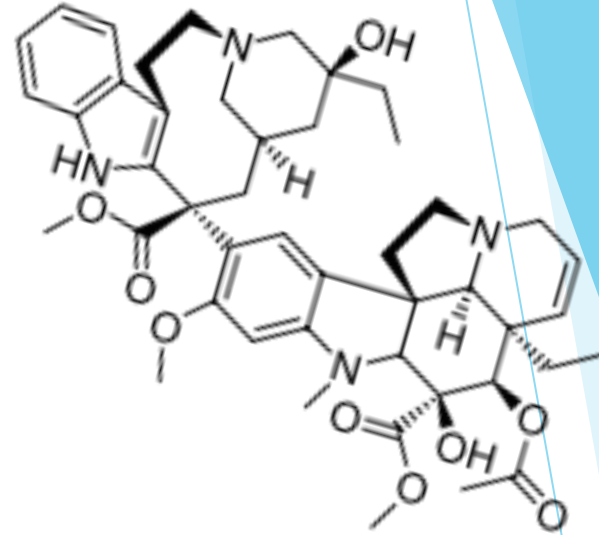
# Представники

Атропін - оптично неактивна форма гіосціаміну, широко застосовується в медицині як ефективний антидот при отруєннях антихолінестеразними речовинами, такими, як фізостигмін і фосфорорганічні інсектициди. Він ефективно знімає спазми бронхів, розширює зіницю і т.д. Токсичні дози викликають порушення зору, придушення слиновиділення, розширення судин, гіперпірексію (підвищення температури), порушення і стан делірію (потьмарення свідомості).



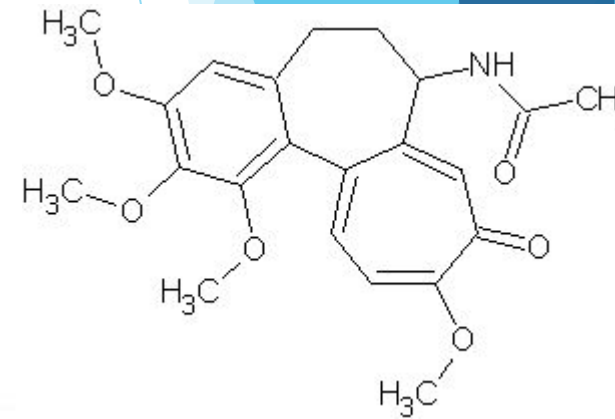
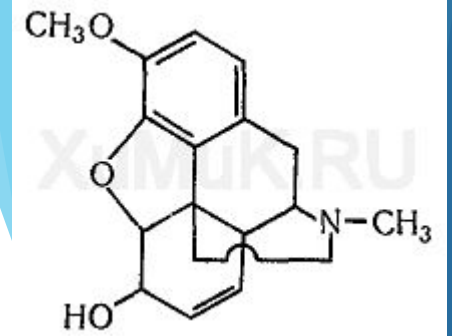


**Вінбластин і вінкристин.** Барвінок (*Catharanthus roseus*, раніше відомий як *Vinca rosea*) містить безліч складних алкалоїдів, серед яких сильні протиракові засоби вінбластин і вінкристин. Оскільки концентрація активних алкалоїдів у барвінку незначна, для їхнього промислового одержання необхідні величезні кількості рослинної сировини. Так, для виділення 1 г вінкристину потрібно переробити 500 кг коренів. Вінбластин застосовується для лікування різних форм раку й особливо ефективний при хворобі Ходжкіна (лімфогранулематоз) і хоріонкарциномі. Вінкристином лікують гостру лейкемію, а в комбінації з іншими препаратами - лімфогранулематоз.



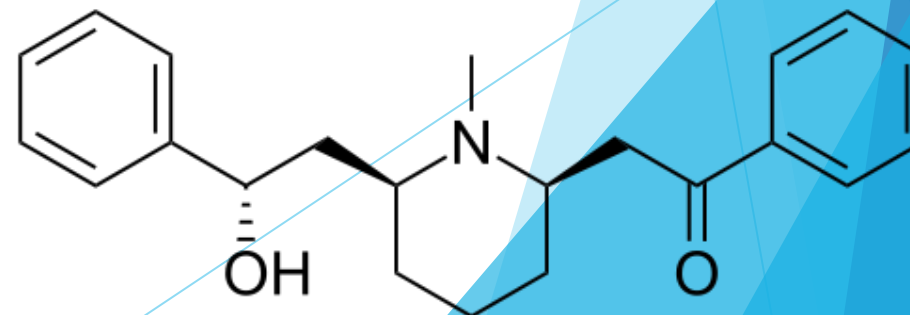
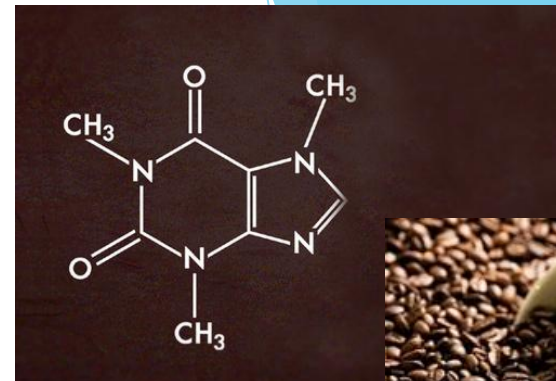
**Кодеїн** – найпоширеніший опійний алкалоїд. Його можна виділити з опіуму (від 0,2 до 0,7%), приготувати метилювання морфіну або відновленням і деметилюванням тебаїну. Кодеїн – наркотичний анальгетик і протикашлевий засіб. Він менш токсичний і в меншому ступені викликає звикання, ніж морфін.

**Колхіцин** виділений із коренецибулин і насіннь різних видів *Colchicum*, звичайно *Colchicum autumnale*. Це нейтральний алкалоїд, використовуваний для лікування подагри і для одержання клітин рослин з подвоєним набором хромосом.



**Кофеїн** міститься в каві, чаї, какао, колі і парагвайському чаї. У складі багатьох напоїв його споживають мільйони людей в усьому світі. Кофеїн звичайно витягають з чаю, чайного пилу, чайних відходів або виділяють сублімацією при підсмажуванні кави. Його також можна синтезувати з теоброміну. Кофеїн чинить збудливу дію на центральну нервову і серцево-судинну системи, використовується для стимуляції серцевої діяльності, подиху і як протиотрута при отруєнні морфіном і барбітуратами. Він входить до складу продуктів з торговельними назвами емпірин, фіоринол, кафергот, віграїн.

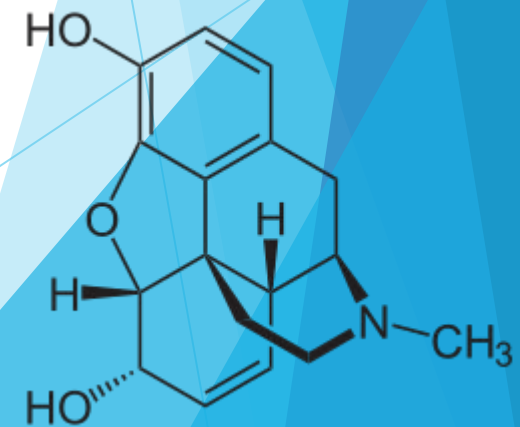
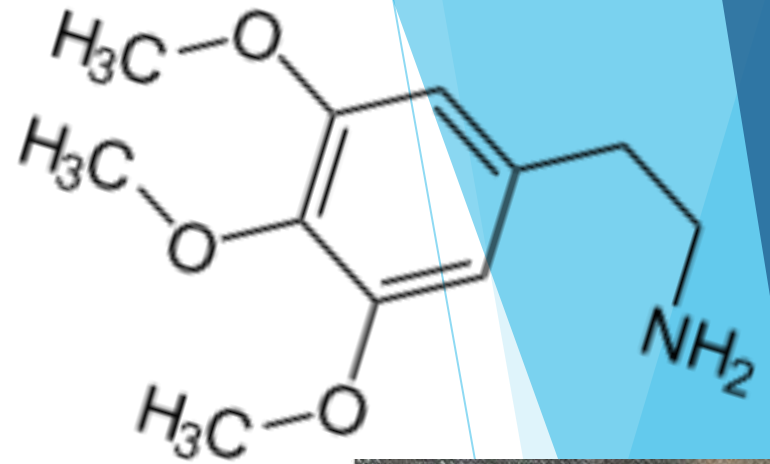
**Лобелін** міститься в лобелії (*Lobelia inflata*) і має дію, подібну до дії нікотину. З цієї причини його вводять до складу таблеток, що полегшують відвикання від паління. У малих дозах здатний збуджувати подих, у зв'язку з чим його застосовують у випадках удушення, отруєння газами, тобто коли потрібно стимулювати подих. Великі дози, навпаки, паралізують подих.





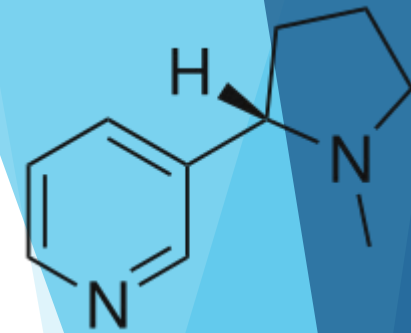
**Мескалін** міститься в лофофорі Вільямса (*Lophophora williamsii*, мексиканська назва – пейот або мескаль) род. кактусових і є галюциногеном. Пейот здавна використовувався в обрядах мексиканських і американських індіанців. Поїдання пейоту викликає розширення зіниці, супроводжуване незвичайним і вигадливим сприйняттям кольору. Миготливі вогні і мінливі образи характеризують початкову стадію бачень. Потім кольори блякнуть, людина стає млявою і засипає. Мескалін виявляє ту ж дію, що і необроблений рослинний матеріал.

**Морфін** є найважливішим опійним алкалоїдом. Його екстрагують з висушеного молочного соку, що виступає з надрізів на незрілій голівці опійного маку (*Papaver somniferum*). Морфін містить фенольні і спиртову гідроксильні групи. Він являє собою наркотичний анальгетик і застосовується для знеболювання. Однак тривале його вживання приведе до звикання і викликає нудоту, блювоту, запори.

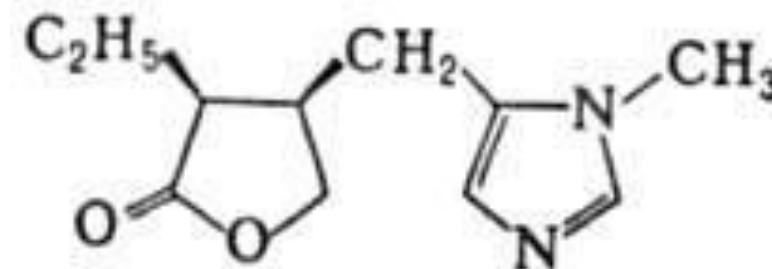




**Нікотин.** Цей рідкий алкалоїд у чистому виді виділений у 1828 Поссельтом і Рейманом. Його основне джерело – тютюн (*Nicotiana tabacum*), річне виробництво листків якого перевищує 5 млн. т. Нікотин зустрічається також у різних видах плауна, хвоці польовому і деяких інших рослинах. При палінні більша частина нікотину руйнується або випаровується. Нікотин – сильна отрута. У малих кількостях він стимулює подих, але у великих – пригнічує передачу імпульсу в симпатичних і парасимпатичних нервових вузлах. Смерть настає від припинення дихання. Нікотин сильно впливає на серцево-судинну систему, викликаючи звуження периферичних судин, тахікардію і підйом систолічного і діастолічного кров'яного тиску. Нікотин (звичайно у виді сульфату) використовується як інсектицид в аерозолях і порошках.

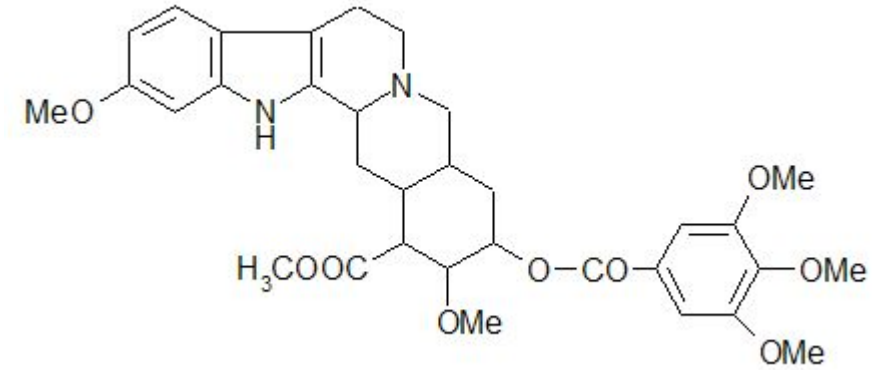


**Пілокарпін.** Цей імідазольний алкалоїд одержують з листків різних видів африканського чагарнику *Pilocarpus*. Його гідрохлорид і нітрат – холіноміметичні (дія аналогічна порушенню холінорецепторів) і міотичного (звужують зіницю з одночасним зниженням внутріочного тиску) засобу. Головне ж використання пілокарпіну – для лікування глаукоми. Він застосовується також для посилення діяльності потових і слинних залоз, при водянці на ґрунті нефриту, при деяких отруєннях (ртуттю або свинцем) і ін. Пілокарпін також вводять перорально або підшкірно, паралельно з уведенням гангліоблокаторів, щоб стимулювати слиновиділення.

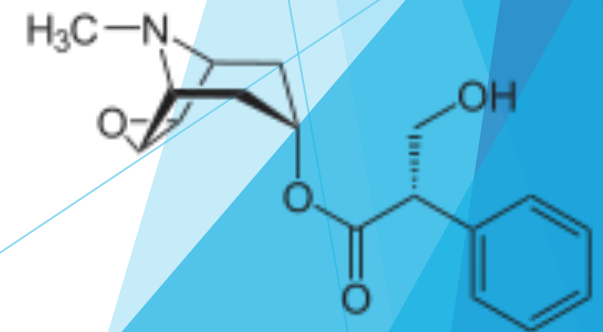


**Резерпін.** Раувольфія – древня лікарська рослина; відомості про її використання датуються 1000 до н.е. В індуїстській Аюрведі вона рекомендується для лікування дизентерії, зміїних укусів і як жарознижуюче. Гіпотензивна (снижуюча кров'яний тиск) активність коренів *Rauwolfia serpentina*, виявлена в 1933, пояснюється присутністю алкалоїду резерпіну. Резерпін виявляє також заспокійливу дію. Тому його іноді використовують для зниження високого кров'яного тиску і підвищеної збудливості при неврозах, істерії і стресах. Побічні ефекти включають сонливість, брадикардію (зменшення частоти серцевих скорочень), надлишкове слиновиділення, нудоту, понос, посилене відділення шлункового соку і депресію.

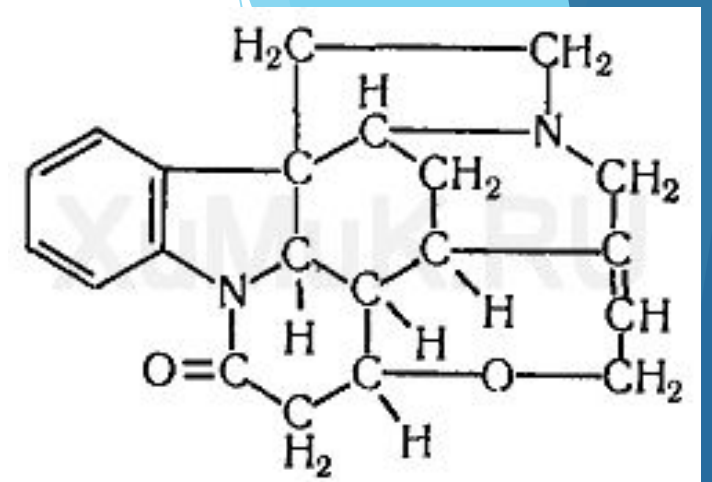
**Скополамін** є антихолінергічним агентом. Його часто використовують для зняття спазмів кишечника при спастичному коліті, гастроентериті і виразці шлунка, у якості заспокійливих при психічних порушеннях. Завдяки антисекреторній дії скополаміну його застосовують для зниження мокротовиділення при анестезії (для переднаркозу і при операціях), для придушення секреції шлункового соку при лікуванні виразки шлунка і для зменшення виділень слизової оболонки носа при застуді й алергійних захворюваннях



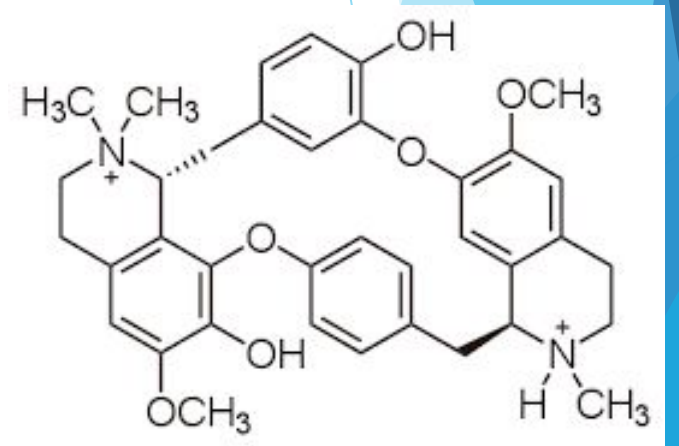
Скополамин



**Стрихнін.** Блювотний горіх (чилібуха, *Strychnos nux-vomica*) містить від 1,5 до 5% алкалоїдів, головним чином стрихніну або бруцину (диметоксистрихніну). Стрихнін надзвичайно токсичний, діє головним чином на спинний мозок, приводячи до конвульсій (судомам), і використовується для винищування шкідливих тварин. Він застосовується в медицині при паралічах, пов'язаних з ураженнями ЦНС, при хронічних розладах ШКТ і головним чином як загальне тонізуюче при різних станах розладу харчування і слабості, а також для фізіологічних і нейроанатомічних досліджень.

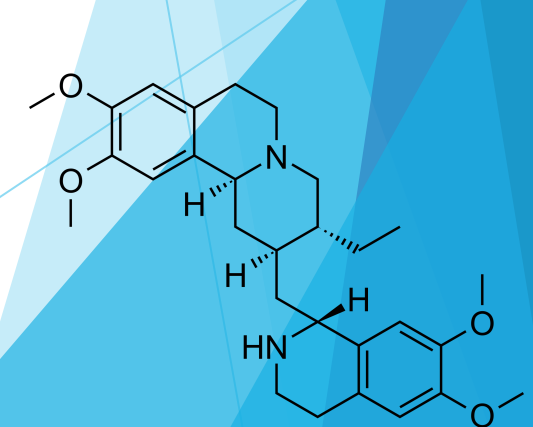
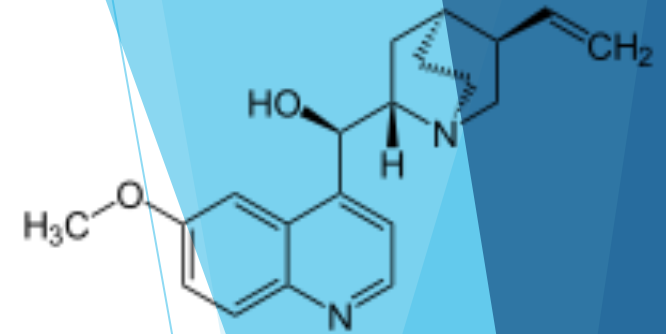


**Тубокурарин.** Кураре, відома отрута, якою південноамериканські індіанці начиняють стріли, є сухим екстрактом з кори і стебел деяких видів *Strychnos* (*S. toxifera* і ін.). Розрізняють чотири сорти кураре, що одержали свою назву в залежності від способу розфасовки: калабаш-кураре («гарбузовий», упакований у невеликих висушених гарбузах, тобто калібасах), кураре («горшочний», тобто зберігається в глиняних горщиках), «мішечний» (у невеликих плетених мішечках) і кураре («трубковий», упакований у бамбукові трубки 25 см довжиною). Оскільки кураре, розфасований у бамбукових трубках, мав найсильнішу фармакологічну дію, головний алкалоїд був названий тубокурарином. Його гідрохлорид застосовується в хірургії для розслаблення кістякових м'язів. Тубокураринхлорид використовують також для лікування правця і конвульсій при отруєнні стрихніном.



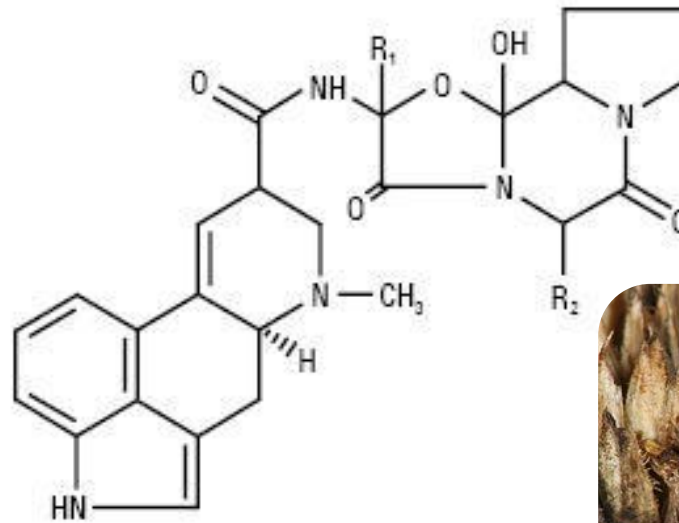
**Хінін**. До Другої світової війни хінін був єдиним антималярійним препаратом. Коли доставка хінної кори з Яви була перервана війною, були початі надзвичайні заходи для одержання синтетичних антималярійних препаратів. Хінін застосовують також для готування шипучих тонізуючих напоїв. Недавно хінін знову набув значення як антималярійний препарат – для лікування стійкої до хлорохіну форми малярії (блискавичної триденної малярії).

**Еметин** – головний алкалоїд кореня іпекакуани (*Serphaelis ipecacuanha* або *Serphaelis acuminata*) і був виділений П.Пельтьє і Ф.Мажанді в 1817. Його застосовують для лікування амебної дизентерії, альвеолярної піореї та інших амебних хвороб. Еметин є блювотним і відхаркувальним засобом.

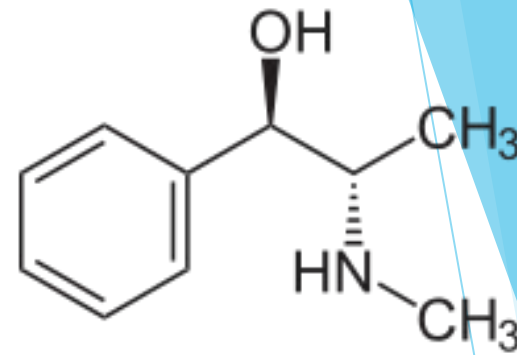




**Ергоновін** (ергометрин, ергобазин). У Європі протягом більш ніж 1000 років (аж до 20 ст.) спостерігалися періодичні спалахи ерготизму. Хвороба характеризується перемежованими відчуттями жару і холоду в кінцівках з наступним онімінням, судомами і конвульсіями. Уражену кінцівку доводилося ампутувати через розвиток сухої гангрені. Тепер відомо, що епідемії викликаються алкалоїдами ріжка *Claviceps purpurea*, що паразитує на житі (*Secale cereale*). Один з цих алкалоїдів – ергоновін – стимулює м'язи матки. Його застосовують для попередження і лікування післяпологових запалень, викликаних атонією матки (тобто відсутністю фізіологічного тону).



**Ефедрин.** Китайці більш 5000 років використовують ма-хуан – суміш надземних частин рослин *Ephedra equisentina*, *E. sinica* і *E. distachya*. Головний діючий початок ма-хуана – алкалоїд ефедрин. Він застосовується як мідріатик і для розширення бронхів. Він збуджує симпатичну нервову систему, викликає звуження судин, стимулює серцеву діяльність і на тривалий час забезпечує підйом кров'яного тиску. Розчин ефедрину (0,5–1,0%) використовують при нежиті. Ефедрин застосовують також при бронхіальній астмі, сінній лихоманці, нестримному кашлі, міастенії і зупинці серця.





# ЛРС, що містить алкалоїди:



Стручковий перець (*Capsicum*)  
Родина Пасльонові (*Solanaceae*)



Ефедрa хвоцова (*Ephedra*)  
Ефедрові (*Ephedraceae*)





Ефедрa двоколоса (*Ephedra distachya*)  
Родина: Ефедрові (Ephedraceae)



Термопсис ланцетовидний (*Thermopsis lupinoides*)  
Родина Бобові (Fabaceae)



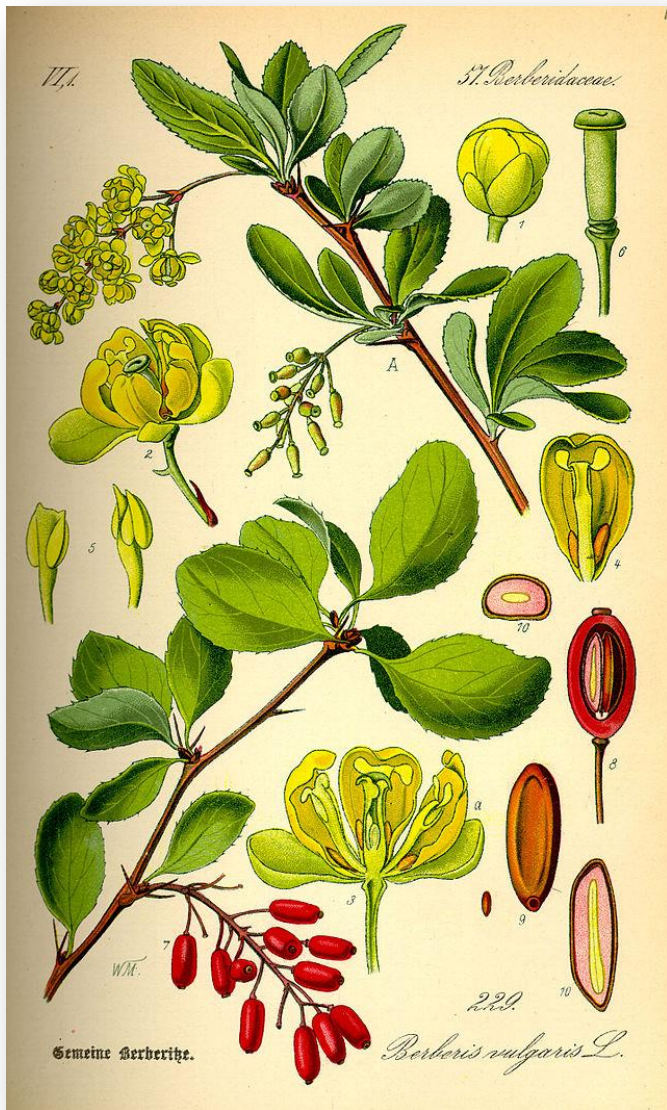


Мак снодійний (*Papaver somniferum*)  
Родина Макові (Papaveraceae)



Чистотіл великий (*Chelidonium majus*)  
Родина Макові (Papaveraceae)





Барбарис звичайний (*Berberis vulgaris*)  
Родина Барбарисові (Berberidaceae)



Барвінок малий (*Vinca minor*)  
Родина Барвінкові (Aporcupaceae)







## Висновки

Серед алкалоїдів ми знаходимо і найсильніші отрути (стрихнін, бруцин, нікотин), і корисні ліки (пілокарпін - засіб для лікування глаукоми, астропін - засіб для розширення зіниці, хінін - препарат для лікування малярії, папаверин - судинорозширювальний засіб, що допомагає при гіпертонії). До алкалоїдів відносяться і широко застосовувані збудливі речовини - кофеїн, теобромін, теофілін.

Цікаво, що деякі алкалоїди є протиотрутами відносно своїх родичів. Так, у 1952 р. з однієї індійської рослини був виділений алкалоїд резерпін, що дозволяє лікувати не тільки людей що отруїлися, але і хворих, що страждають шизофренією.

Таким чином, можна сказати, що алкалоїди - досить великий клас органічних сполук, що чинять різноманітну дію на організм людини. У цьому полягає їхня важлива роль, яку грають алкалоїди в хімічній науці в цілому й у повсякденному житті зокрема.





# Дякую за увагу

