

Қарағанды Мемлекеттік медицина университеті
Фармацевтикалық пәндер және химия кафедрасы

Дәрістің тақырыбы:

Гетероциклдық қосылыстардың туындылары

Медициналық химия пәні

«Жалпы медицина», «Стоматология» мамандықтары

Лектор – х.ғ.к., доцент Кокжалова Б. З.

Лекцияның жоспары

1. Биологиялық белсенді гетероциклдық қосылыстардың жалпы сипаттамасы және жіктелуі
2. Бес мүшелік бір гетероатомды циклдар
3. Бес мүшелік екі және одан да көп гетероатомды циклдар
4. Алты мүшелік бір гетероатомды циклдар
5. Алты мүшелік екі гетероатомды циклдар
6. Бициклдық конденсацияланған қосылыстар

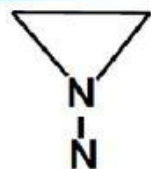
Гетероциклдық қосылыстардың жалпы сипаттамасы және жіктелуі

- Гетероциклдық қосылыстар (ГЦҚ) – құрамында көміртегі атомдарынан басқа бір немесе бірнеше басқа элементтердің атомдары (гетероатомдар) болатын органикалық циклдық қосылыстар.
- ГЦҚ гетероатомның табиғатына байланысты жіктелуі: азотты – пиррол, пиридин, пиримидин; оттекті – фуран; күкіртті – тиофен.
- Барлық гетероциклдар қанығу дәрежесіне байланысты қаныққан, қанықпаған және ароматты болып жіктеледі.
- Қаныққан гетероциклдар: циклдық қарапайым эфирлер мен иминдер, лактондар мен лактамдар, циклдық ангидридтер.
- Қанықпаған гетероциклдар, мысалы 1,4-диоксен, пирролин (дигидропиррол) және пиразолин (дигидропиразол) сияқты қосылыстар, олар тұрақсыз болып келеді.

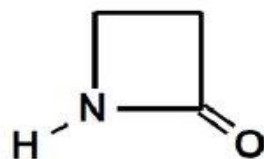
Классификация

I. По числу атомов в цикле различают:

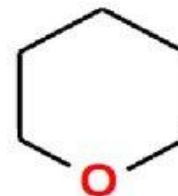
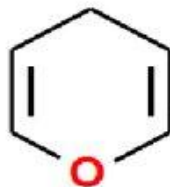
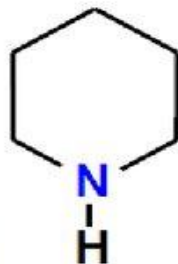
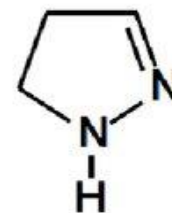
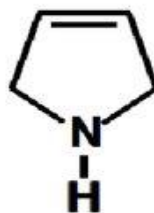
трёх-, четырёх-, пяти-, шестичленные гетероциклы
(наибольшее значение имеют пяти- и шестичленные).



этиленимин
(азиридин)

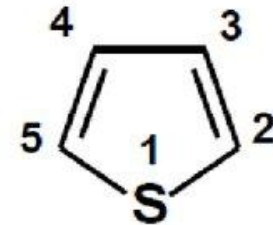
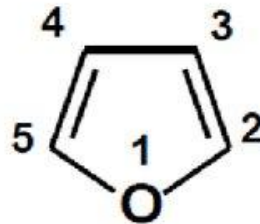
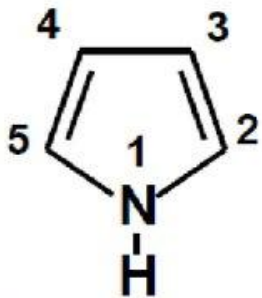


β -лактам



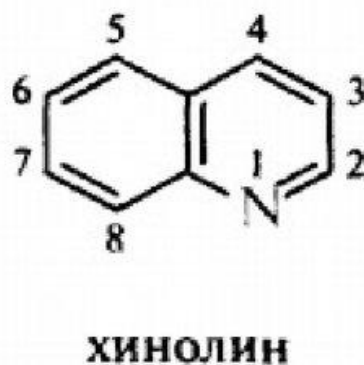
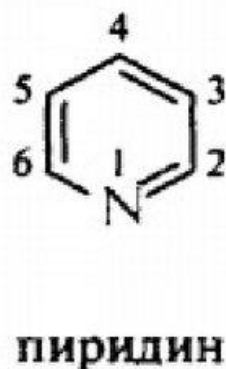
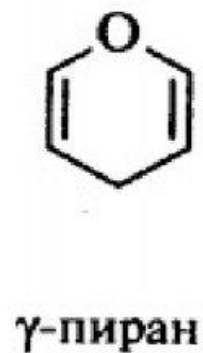
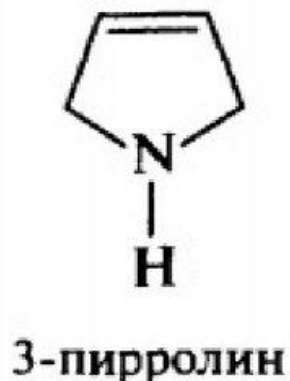
Гетероциклические соединения (ГЦ). Классификация.

**II. По природе гетероатома различают:
кислород-, азот-, серусодержащее ГЦ.**



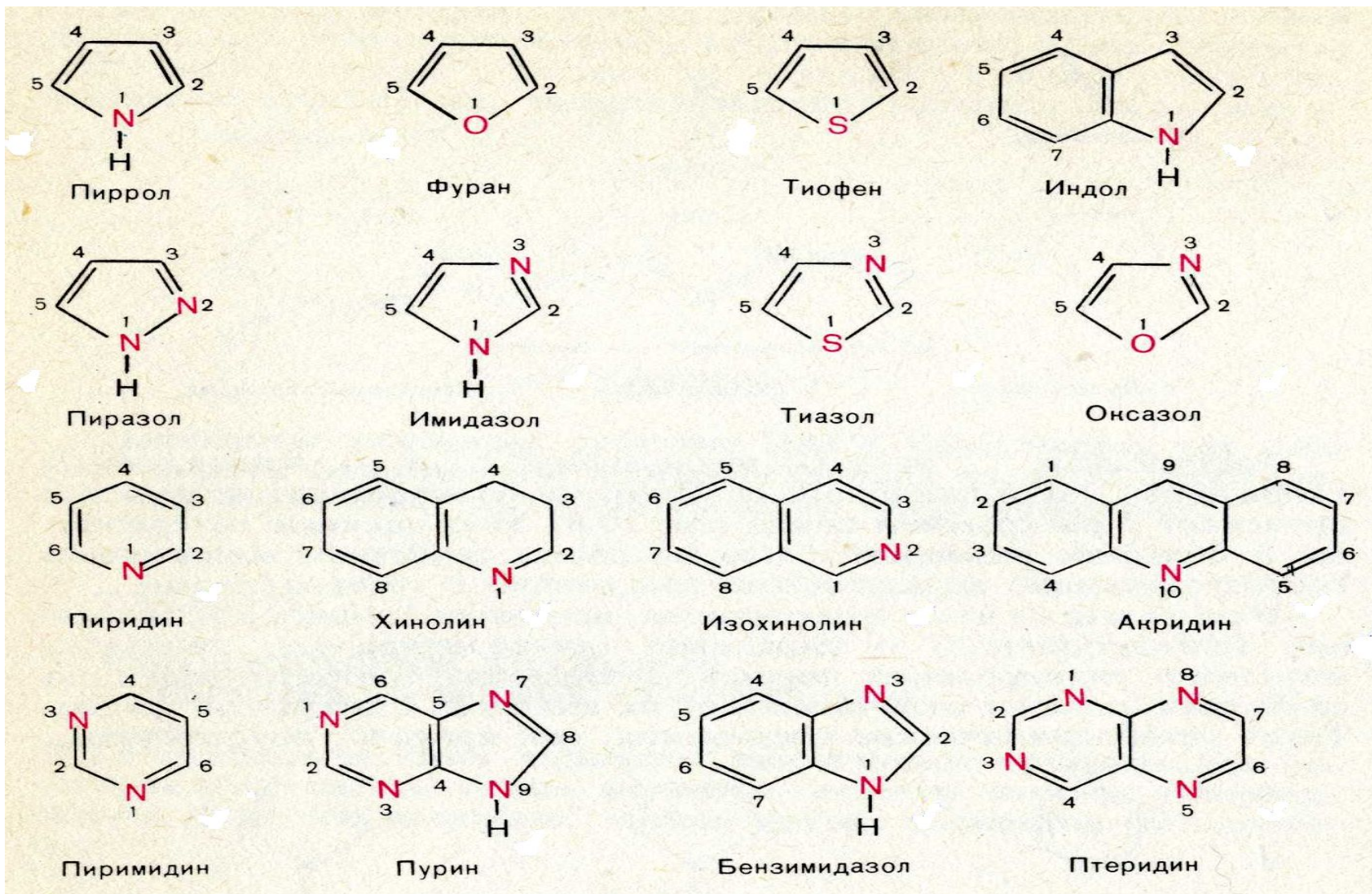
Гетероциклические соединения (ГЦ). Классификация.

**III. По степени насыщенности различают:
насыщенные, ненасыщенные, ароматические ГЦ.**



Гетероциклдық қосылыстардың жалпы сипаттамасы және жіктелуі

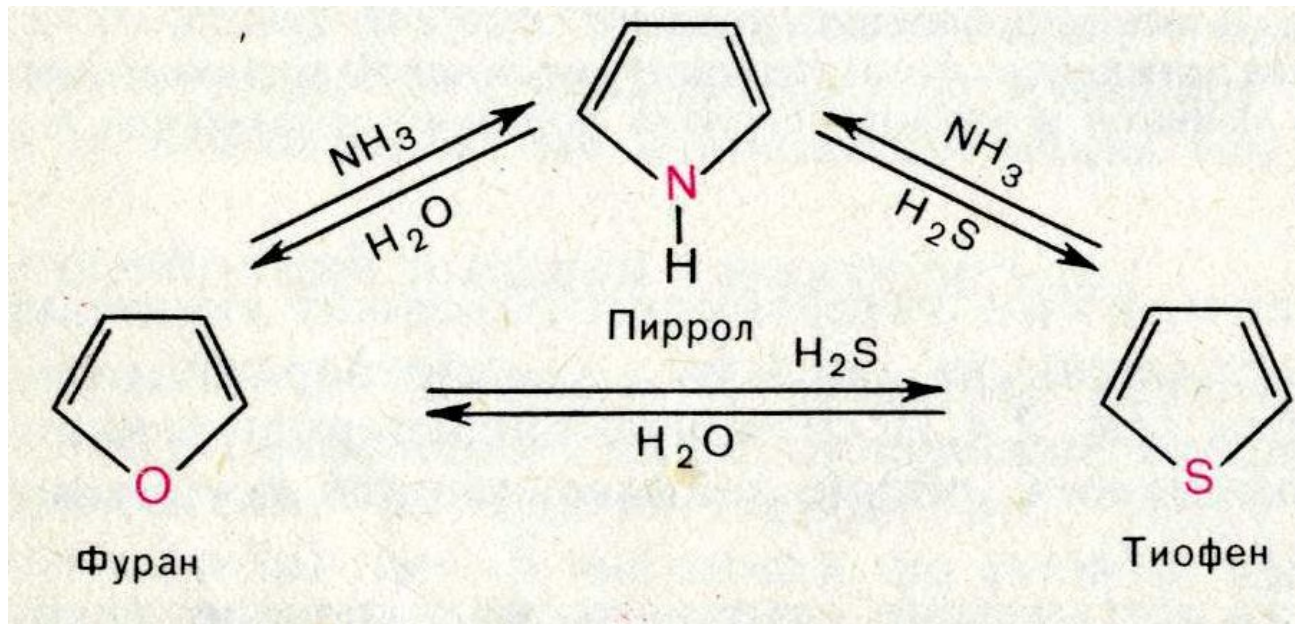
- ГЦҚ-дың ішінде биологиялық және медициналық маңыздылары: бес және алты мүшелік ароматты гетероциклдар.
- Ароматты гетероциклдардың құрамында ароматтылық шарттарына жауап беретін гетероатомды қабысқан жүйе болады.
- Осындай гетероциклдық қосылыстар табиғи физиологиялық белсенді заттардың және дәрілік қосылыстардың негізін құрайды.
- Мысалдары: пиррол, фуран, тиофен, пиразол, имидазол, тиазол, пиридин, хинолин, пиримидин, пурин және т.б. дәрілік туындылары.



Бес, алты мүшелік және конденсацияланған ароматты гетероциклдар

БІР ГЕТЕРОАТОМДЫ БЕС МҮШЕЛІК ГЕТЕРОЦИКЛДАР

- Ароматты гетероциклдар: пиррол, фуран, тиофен.



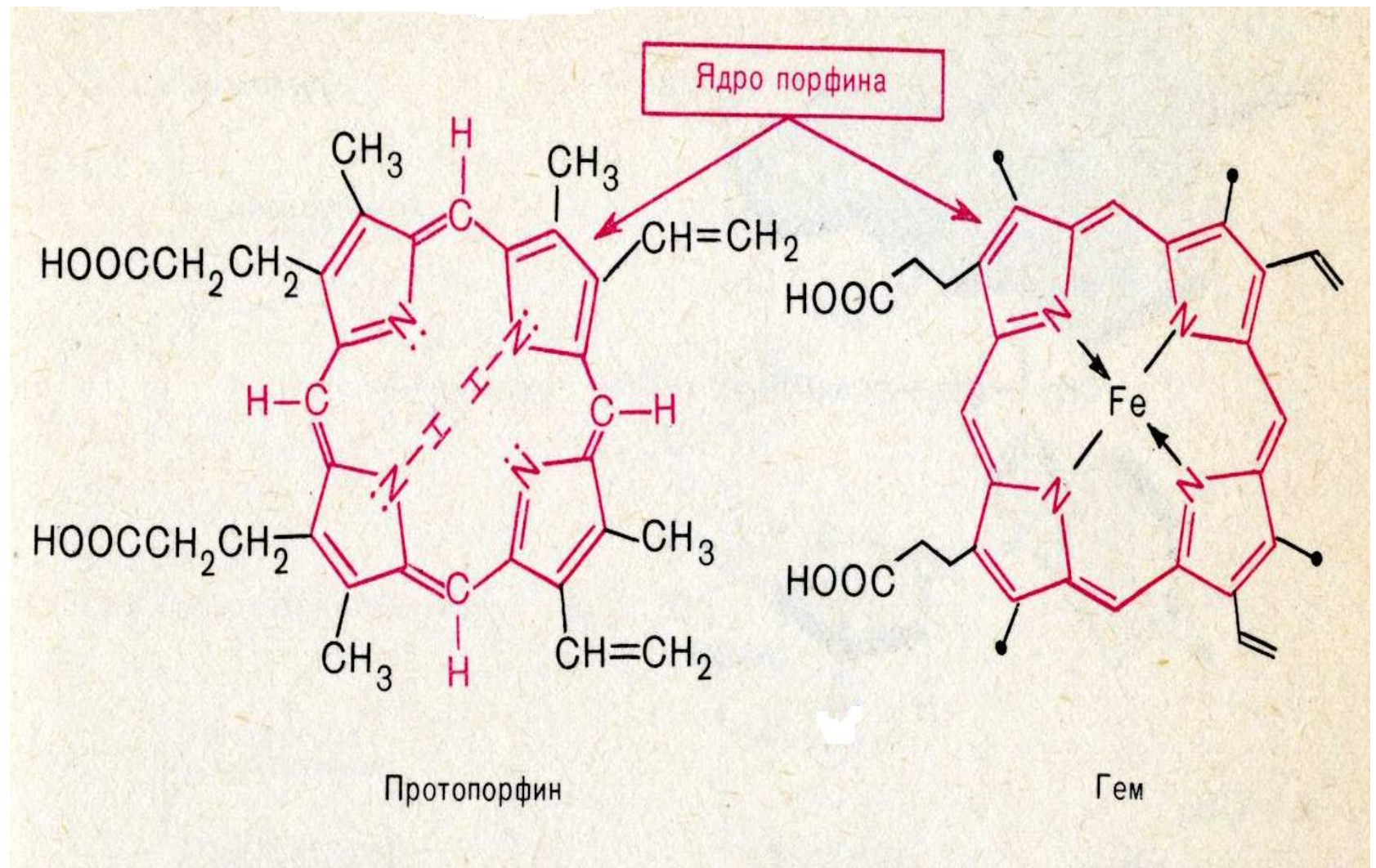
Бір гетероатомды бес мүшелік гетероциклдар

ПИРРОЛ

- Пиррол – азотты гетроцикл, түссіз сұйық, суда ерімейді, ауада тез қараяды.
- Пирролдың ароматтылығы, бензолдікі сияқты, алты электрондық жайпақ жүйеге байланысты болады. Азоттың бөлінбеген электрон жұбы ароматты жүйенің бір бөлігі болып табылады, сол себепті протонды қосып алуға қабылетсіз болады да, негіздік қасиеттер көрсетпейді, қарама-қарсы қышқылдық сипатты болып келеді.
- Пиррол – ацидофобты, яғни қышқылдық ортаға төзімсіз қосылыс.

ПИРРОЛДЫҢ ҚОСЫЛЫСТАРЫ

- Азотты табиғи қосылыстардың маңызды тобын құрамында төрт пиррол сақинасы болатын тетрапирролдық қосылыстар құрайды. Көптеген тетрапирролдық қосылыстарда тұрақты ароматтық жүйеге жататын макроциклдық сақина – порфин түзіледі.
- Пирролдық циклдардағы толық немесе жартылай алмасқан порфиндер порфириндер деп аталады. Порфириндердің мысалына қан гемоглобинінің құрамына енетін протопорфирин жатады.



Протопорфиннің құрылысы

ПОРФИРИНДЕРДІҢ КОМПЛЕКСТЕРІ

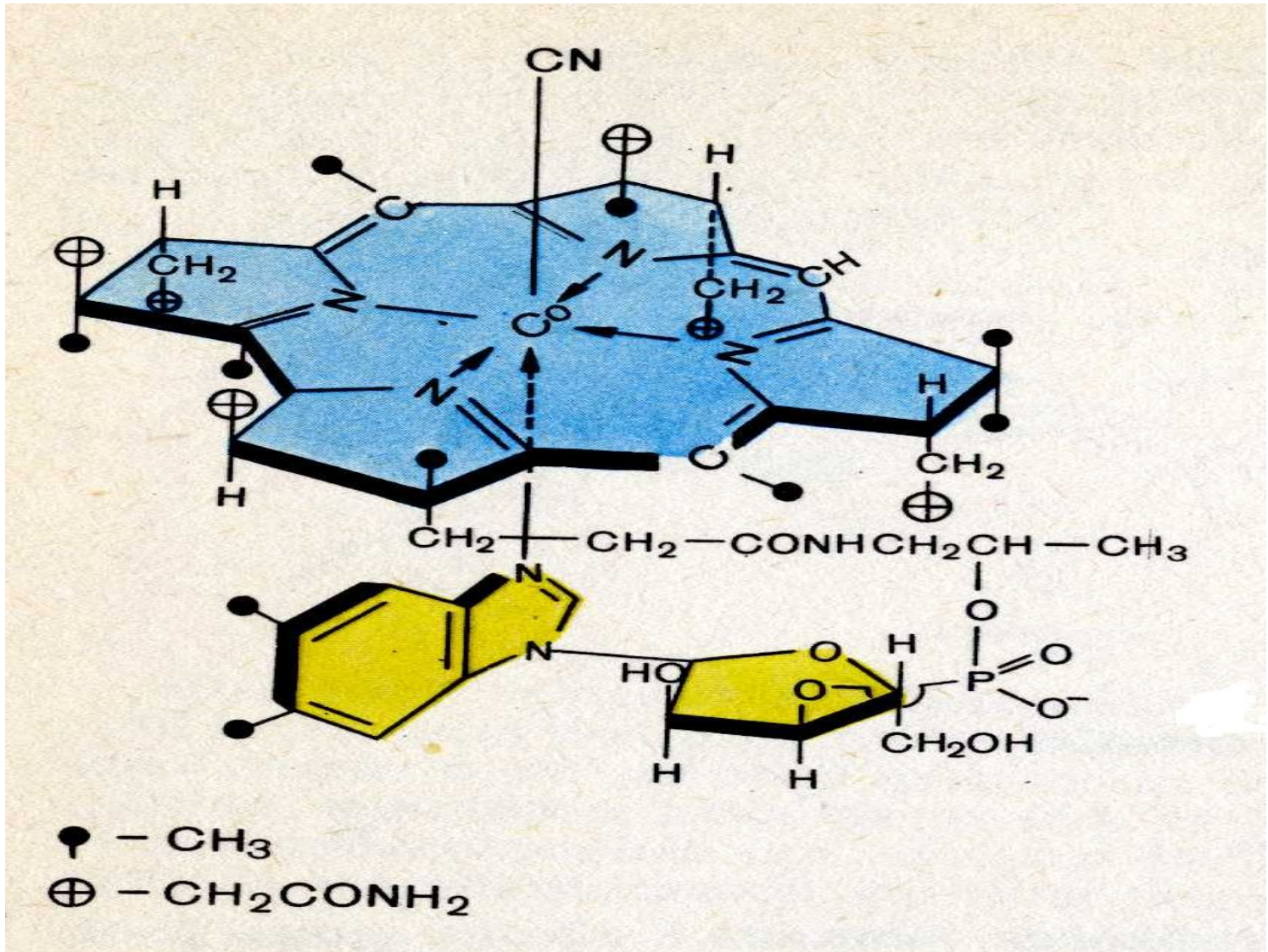
- Порфириндер табиғатта металдармен түзілетін комплекстер түрінде кездеседі. Мысалы:
- Порфириннің магниймен түзетін комплексі хлорофилл молекуласының негізін құрайды.
- Темірмен түзетін комплекстері гемопротейдтердің қарапайым топшасын түзеді, оларға оттегі тасымалдаушы белоктар, мысалы, гемоглобин, цитохромдар және кейбір ферменттер (каталаза, пероксидаза) жатады.
- Порфириндердің құрамында екі валентті темір иондары болатын туындылары гемдер деп аталады. Мысалы протогем – гемоглобиннің қарапайымдалған топшасы.
- Қан өндіру үшін қажетті витамин В12 (цианкоболамин) құрылымы бойынша металдардың порфириндік комплекстеріне жуық.



Хлорофилл

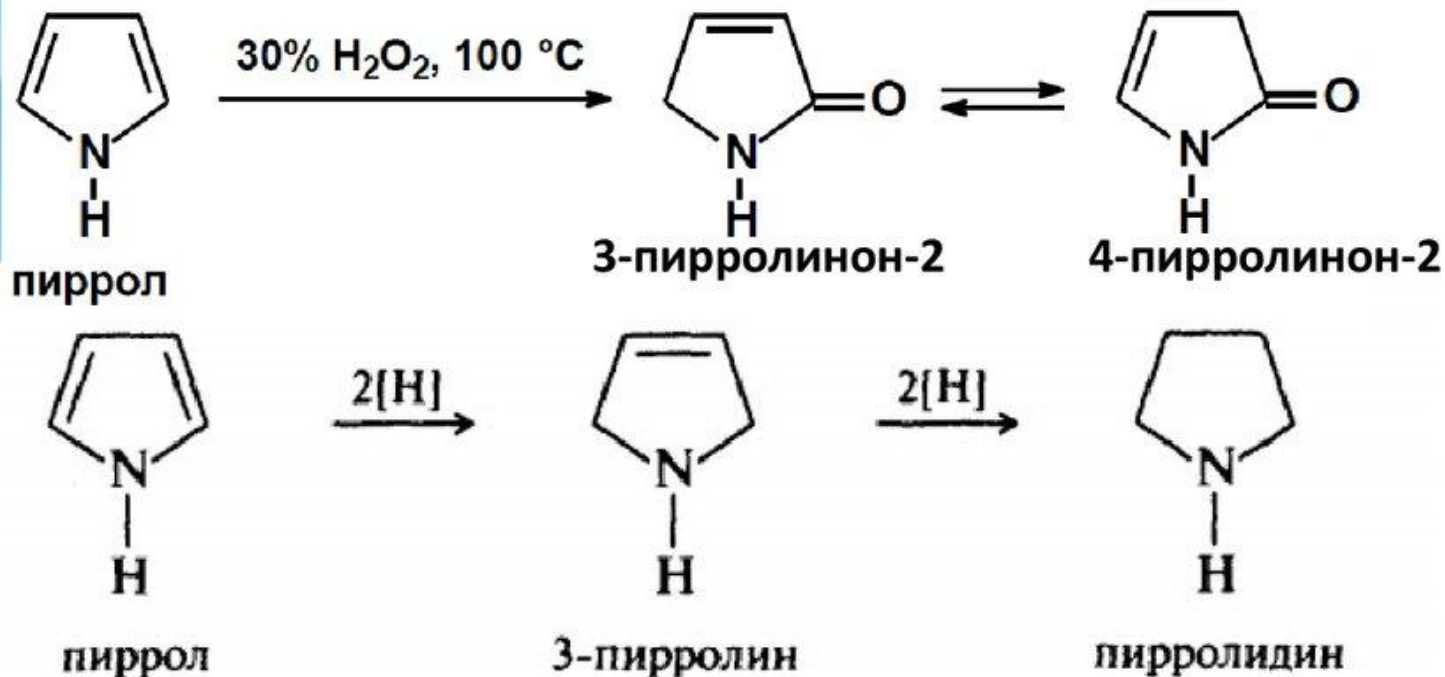


Гемоглобин



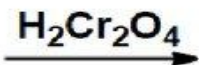
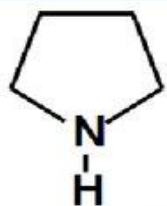
Витамин В 12

3. Реакции окисления и восстановления



Конечный продукт восстановления – пирролидин обладает сильноосновными свойствами, его ядро входит в состав лекарственных средств, некоторых алкалоидов

Биологически важные производные пиррола



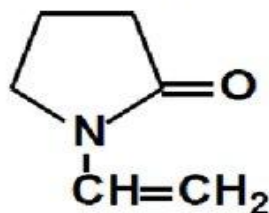
пирролидин

4-аминомасляная кислота
(ГАМК, аминолон)

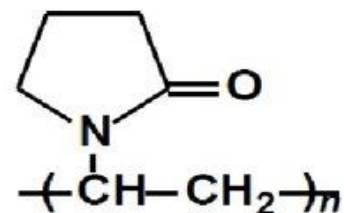


пролин (R = H)

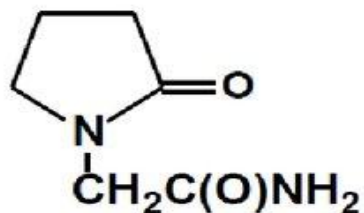
4-гидроксипролин (R = OH)



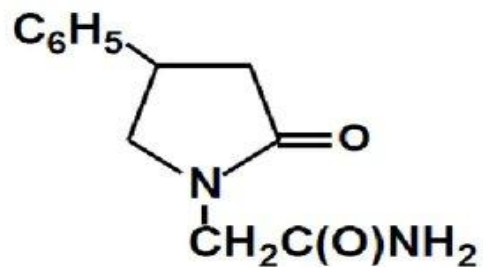
1-винилпирролидон-2



поливинилпирролидон



пирацетам



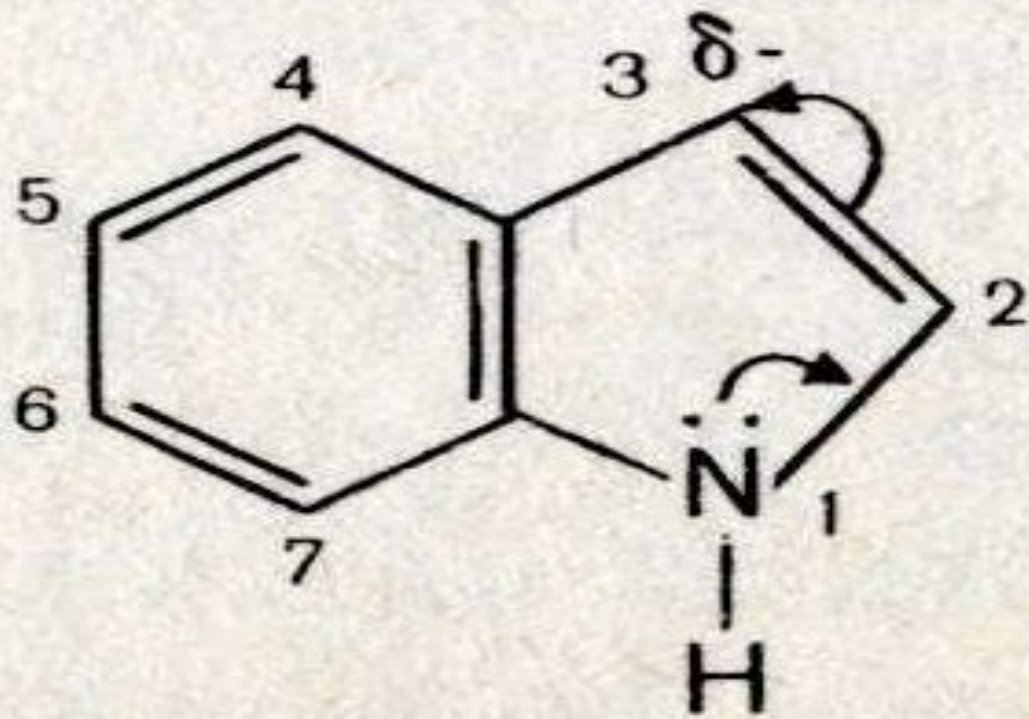
фенотропил

ИНДОЛ (БЕНЗОПИРРОЛ)

- Оның табиғатта кездесетін көптеген туындылары әртүрлі биологиялық белсенділік көрсетеді. Мысалы, триптофан және одан түзілетін триптамин.

Синтетикалық дәрілік заттарының үлкен тобы:

- триптофан;
- серотонин;
- индометацин, ибупрофен, ортофен, пироксикам, напроксен және басқалары;
- арбидол;
- алкалоидтар (физостигмин, неостигмин, винпоцетин)



Индол

Медико-биологическое значение производных пятичленных ГЦ с одним гетероатомом.



триптофан

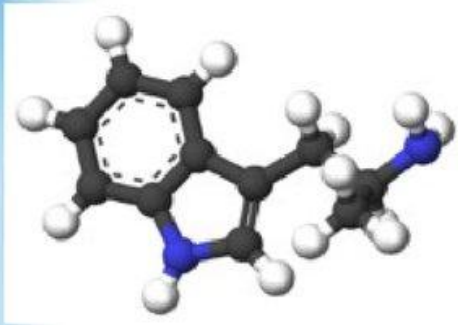
5-гидрокситриптофан



5-гидрокситриптамин
(серотонин)

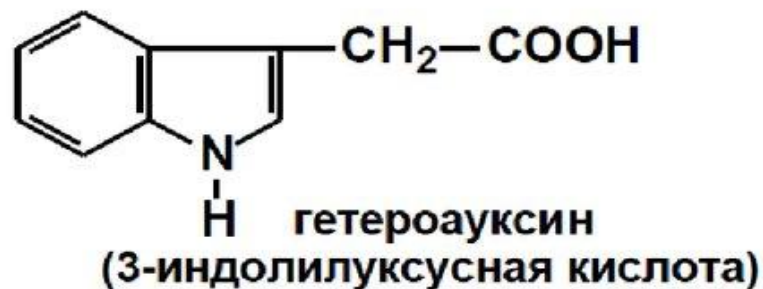
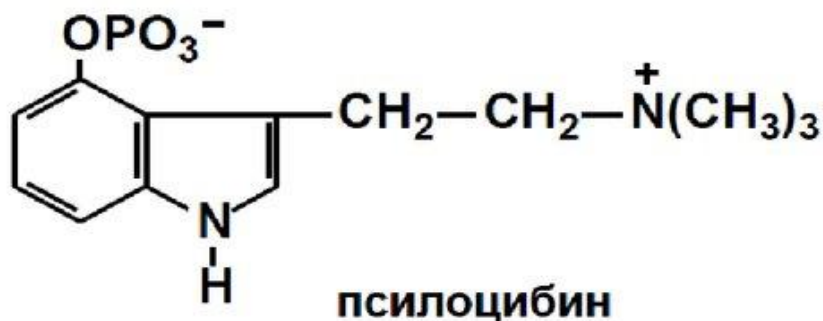
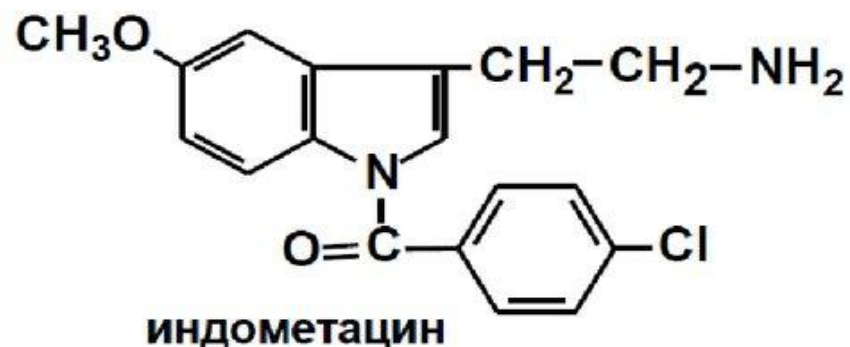
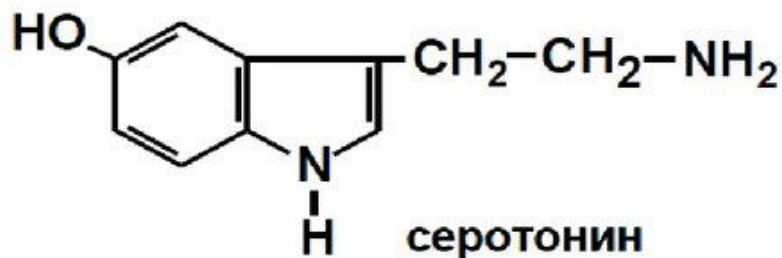
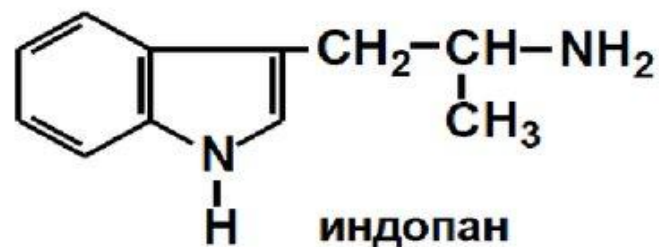
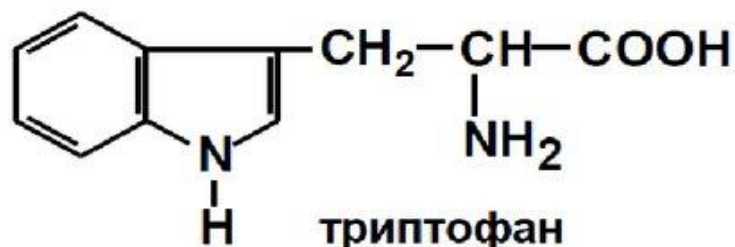
Медико-биологическое значение производных пятичленных ГЦ с одним гетероатомом.

Синтетическое лекарственное средство индольного ряда α -метилтриптамин (индопан) – соединение, оказывающее антидепрессивное и психоактивирующее действие.

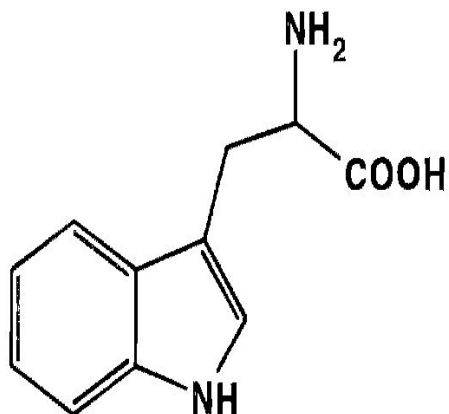


**α -метилтриптамин
(индопан)**

Биологически важные производные индола



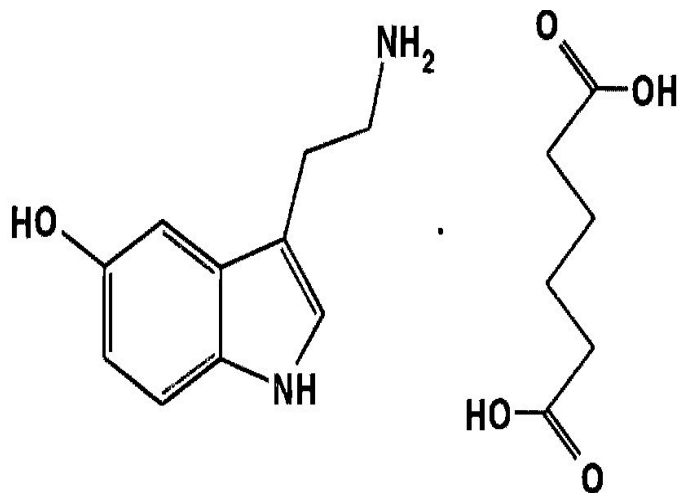
Индолдың дәрілік туындылары



L-2-амино-3-индолилпропионовая кислота

L-триптофан

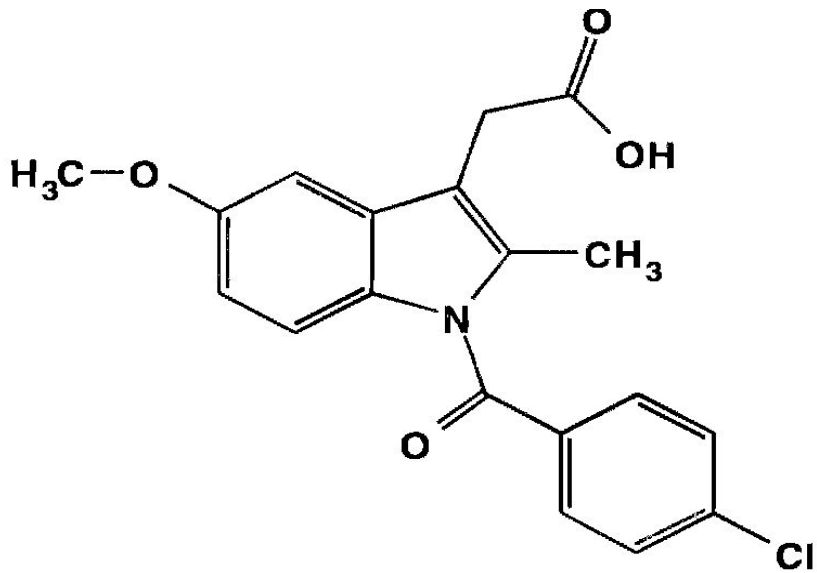
Жеңіл сарғыш реңді ақ кристалданған ұнтақ немесе пластинкалар



5-окситриптамина адипинат

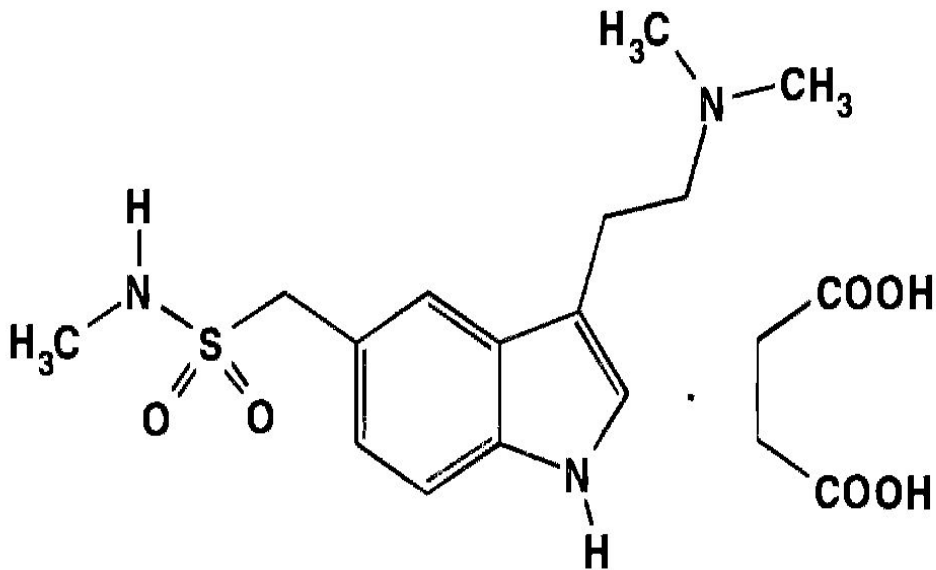
Серотонин адипинаты

Ақ немесе крем реңді кристалданған ұнтақ



1-(*para*-хлорбензоил)-5-метокси-2-метилиндол-3-уксусная кислота

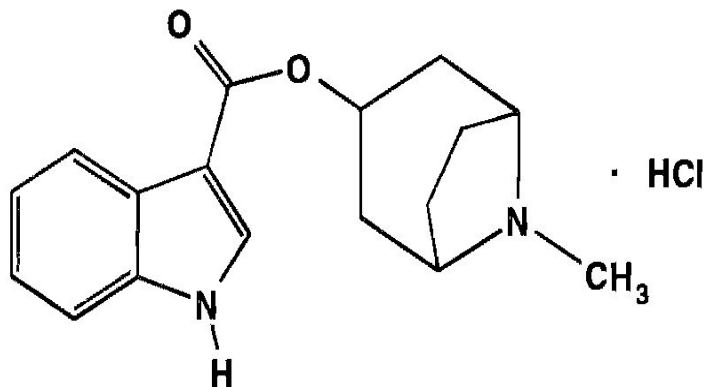
Индометацин
 ақтан сарыға дейін
 боялған
 кристалданған ұнтақ



3-[2-(диметиламино)этил]-N-метилиндол-5-метансульфонамида сукцинат

Суматриптан
(имигран)

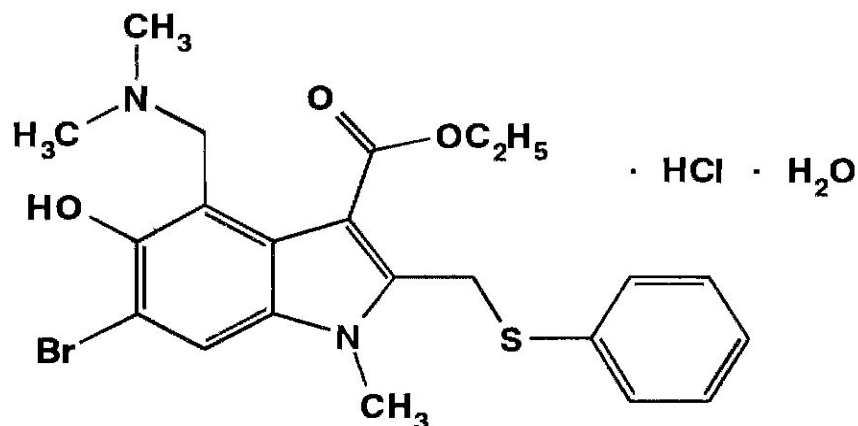
Ақ
кристалданған
ұнтақ



8-метил-8-азабидикло-[3,2,1]-окт-3α-иловый эфир-индол-3-карбоновой кислоты гидрохлорид

трописетрон (навобан)

сарғыш немесе крем
рендес ақ кристалданған
ұнтақ



этилового эфира 6-бром-5-гидрокси-1-метил-4-диметиламинометил-2-фенилтиометил-индол-3-карбоновой кислоты гидрохлорид, моногидрат

Арбидол

Жасыл-сары ренді
ақтан жасыл ренді
ақшыл-сарыға
дейін боялған
кристалданған
ұнтақ

Индометацин

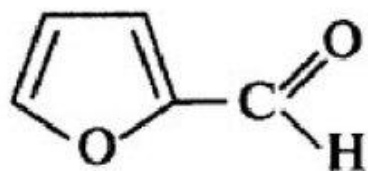
- Индометацин – дәрілік зат, стероидты емес қабынуға қарсы препарат, индолилсірке қышқылының туындысы. Қабынуға қарсы, ауырсынуды басатын, ыстықты төмендететін препарат.



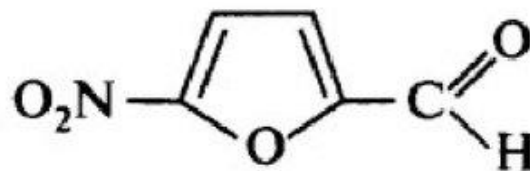
ФУРАН

- Фуран және оның туындылары пирролдық қосылыстарға ұқсас. Фуран ацидофобты.
- Оның туындылары:
 - фуран-2-альдегид немесе фурфурол туындысы нитрофурфурол, ал одан бактерицидтік әсер жасайтын иминді туындылар алынады. Мысалы:
- фурацилин,
- фуразолидон,
- фурагин,
- фурадонин.

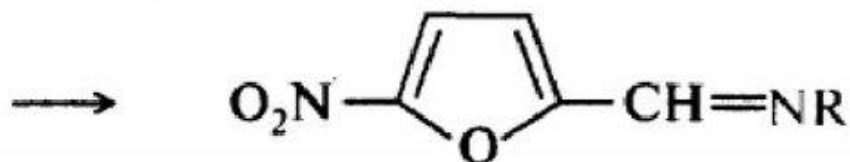
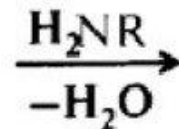
Медико-биологическое значение производных пятичленных ГЦ с одним гетероатомом.



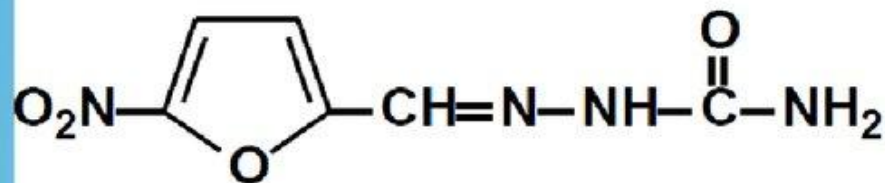
фурфурол



5-нитрофурфурол

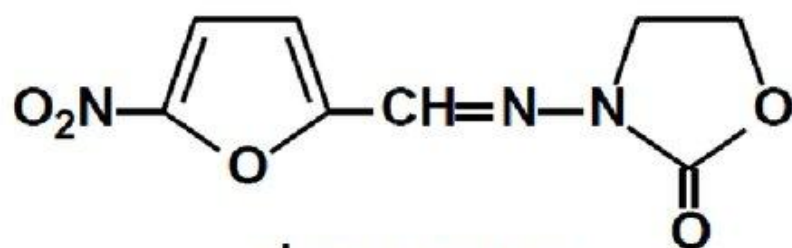


общая структура
5-нитрофурановых производных,
обладающих бактерицидным действием



фурацилин

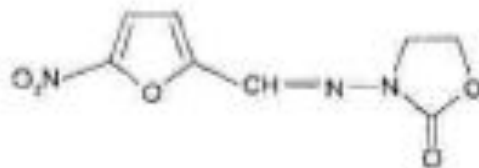
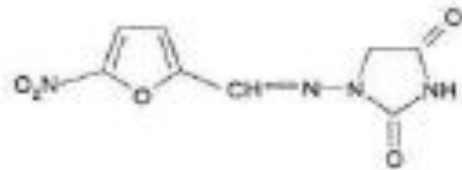
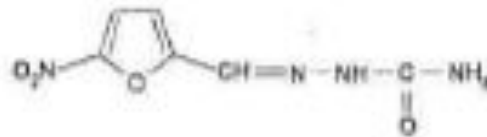
семикарбазон 5-нитрофурфуrolа



фуразолидон

5-нитрофуранның туындылары

Химиялық құрылымы



Баяндау

Фурацилин – Fugacilinum

5-нитрофуранды семикарбазон.

Сары немесе жасылдау – сары ұсақ кристалды ұнтақ. Суда өте аз ериді, 95% -ті спиртке нашар ериді, эфирде таза ерімейді, негізде ериді.

Дәрілік түрі: таблеткалар (мөлшерлі қатырылған дәрі), жақпамай.

Бактерияға қарсы зат.

Фуродонин – Fugadonin

N-(5-Нитро-2-фурфурилиден)-1-аминогидантонин.

Сары немесе қызғылт-сары ұсақ кристалды ұнтақ. 95%-ті спиртке және суда нашар ериді, ацетонда аз ериді.

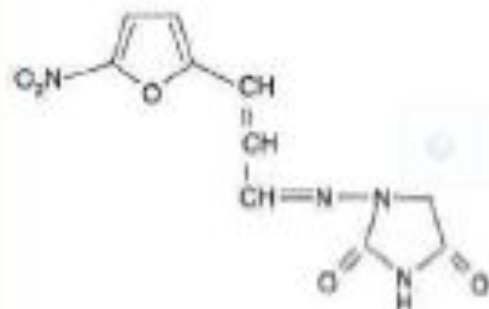
Дәрілік түрі: таблеткалар (мөлшерлі қатырылған дәрі).

Фуразолидон – Fugazolidonum

N-(5-Нитро-2-фурфурилиден)-3-аминооксазолидон-2.

Сары немесе жасыл-сары ұнтақ. Суда және эфирде таза ерімейді, 95%-ті спиртке нашар ериді.

Дәрілік түрі: таблеткалар (мөлшерлі қатырылған дәрі).



Бактерияға және протозойтка қарсы зат.

Фурагин – Fugaginum

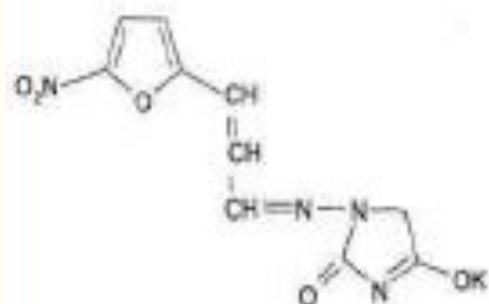
N-(5-Нитро-2-фурил)-аллилденаминногидантонин.

Сары немесе қызғылт-сары ұсақ кристалды ұнтақ.

Суда және 95%-ті спиртке таза ерімейді.

Дәрілік түрі: таблеткалар (мөлшерлі қатырылған дәрі).

Бактерияға қарсы зат.



Ерігіш Фурагин – Fugaginum solubile (Солафур)

Фурагиннің калий тұзы.

Дәрілік түрі: таблеткалар, капсулалар. Сыртқы ортада қолданылатын ертінді дайындау үшін (құрамында 10%-ті фурагин және 90%-ті натрий хлориді ертіндісі болу керек).

ТИОФЕН

- Тиофен және оның туындылары қабынуға қарсы, антисептикалық және жергілікті жансыздандырғыш әсер жасайтын ихтиол майының құрамында болады.
- Тиофеннен түзілетін тетрагидротиофеннің туындысына биотин жатады, оның ағзада жетіспеуі белоктар мен майлардың алмасуын бұзады және тері ауруларына әкеледі.

Ихтиол майы (сланц майы сульфоқышқылдарының аммонийлы тұзы)

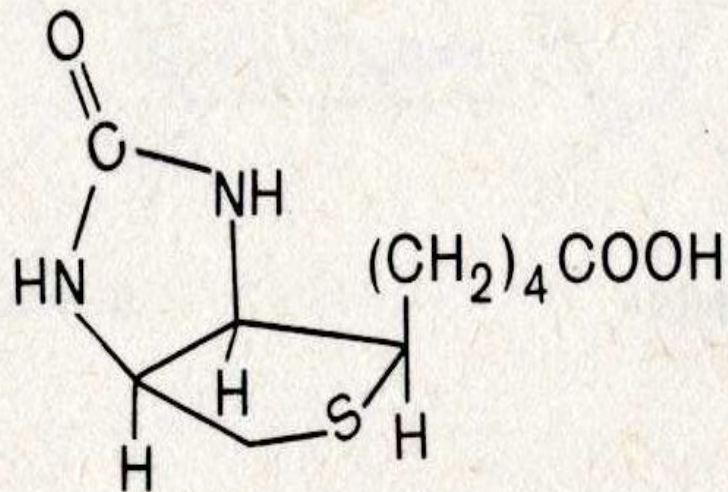


- Терінің микробты және парзитарлық дерттерінде жақпа май және линименттер түрінде қолданылады;
- Жұқпалы жараларды, күйіктерді, ұзақ жатқан науқастардың денесінде пайда болатын жараларды, ойық жараларды, геморройды емдеу үшін қолданылады;

Остаток мочевины



Биотин



Пространственная конфигурация биотина



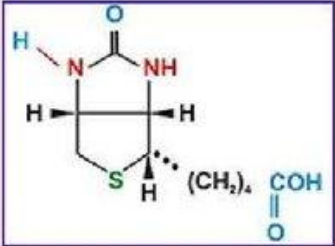
ВИТАМИН

H

Влияет на сон и аппетит, состояние кожи и волос, уровень холестерина в крови



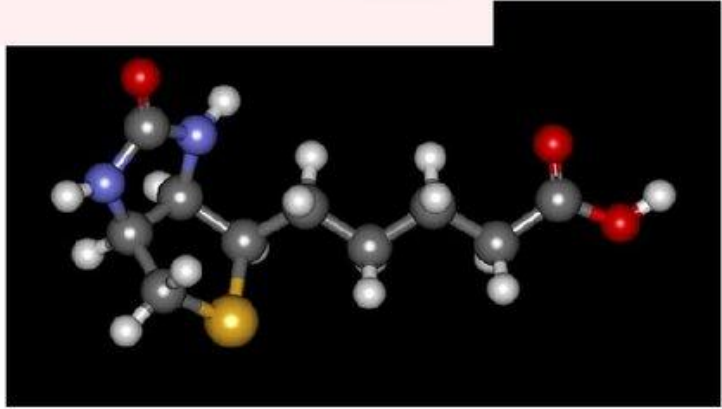
Содержится: в капусте, грибах, бобовых, землянике, кукурузе, мясе



БИОТИН



Источники витамина H (биотина)

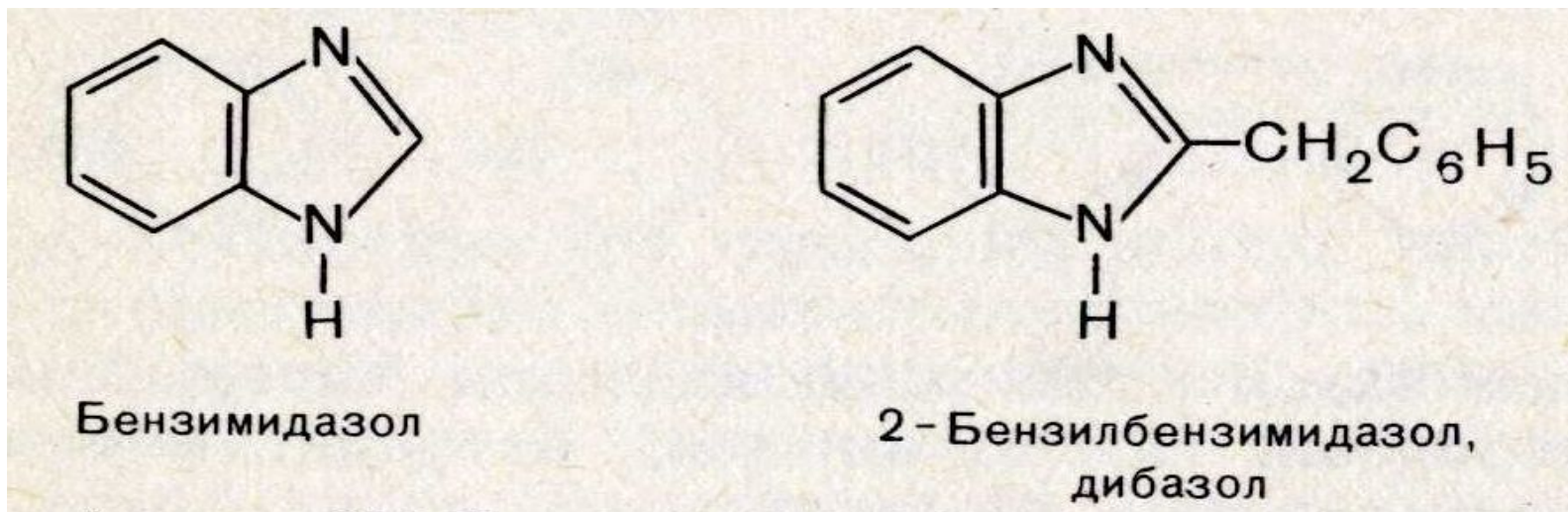


ЕКІ ЖӘНЕ ОДАН ДА КӨП ГЕТРОАТОМДЫ БЕС МҮШЕЛІК ЦИКЛДАР

- Имидазол – екі атом азотты, бес мүшелік гетероцикл, амфотерлік қосылыс. Имидазолдың көптеген туындылары табиғатта кездеседі және биологиялық маңызды болып есептеледі. Мысалы: гистидин және оның декарбоксилдену өнімі гистамин.
- Бензимидазол – имидазол сақинасы бензолмен конденсацияланған гетероцикл, көптеген табиғи заттардың, мысалы, В витаминінің, сол сияқты қан қысымын төмендететін дибазолдың құрамына енеді.
- Пиразол – имидазолдың изомері. Оның туындылары табиғатта анықталмаған, бірақ оның негізінде көптеген маңызды дәрілік препараттар алынған. Олардың көбісі пиразолон туындылары, мысалы, ыстықты төмендететін, ауырсынуды азайтатын және тыныштандыратын антипирин мен амидопирин. Амидопириннің сульфотуындысы анальгин.



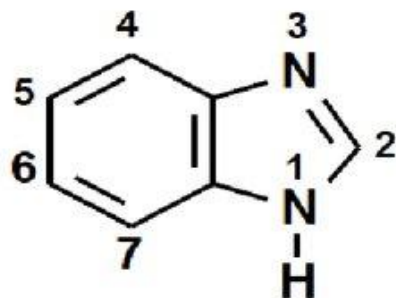
Имидазол



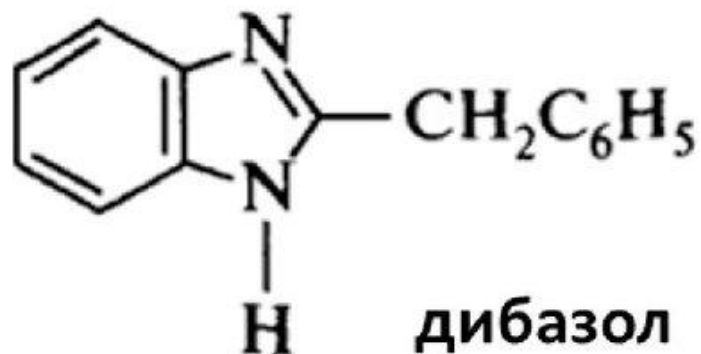
Бензимидазол

2-Бензилбензимидазол,
дибазол

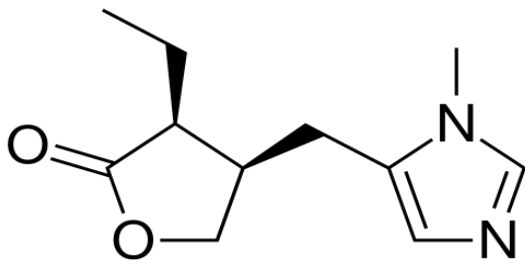
2) Бензимидазол



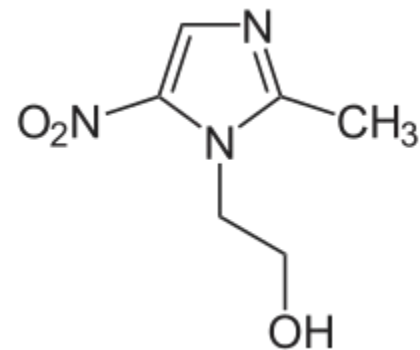
Входит в состав витамина B_{12} , а также препарата дибазола (2-бензилбензимидазола), понижающего артериальное давление.



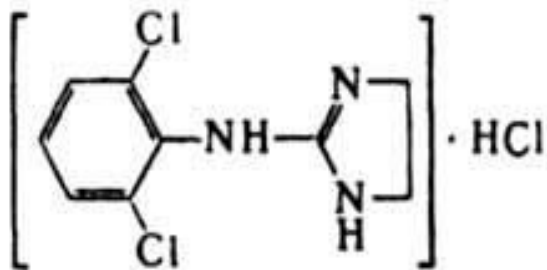
Имидазолдың дәрілік туындылары



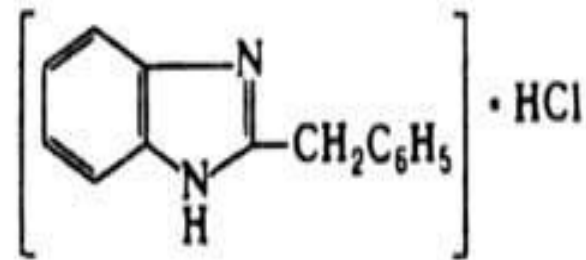
Пилокарпин гидрохлорид



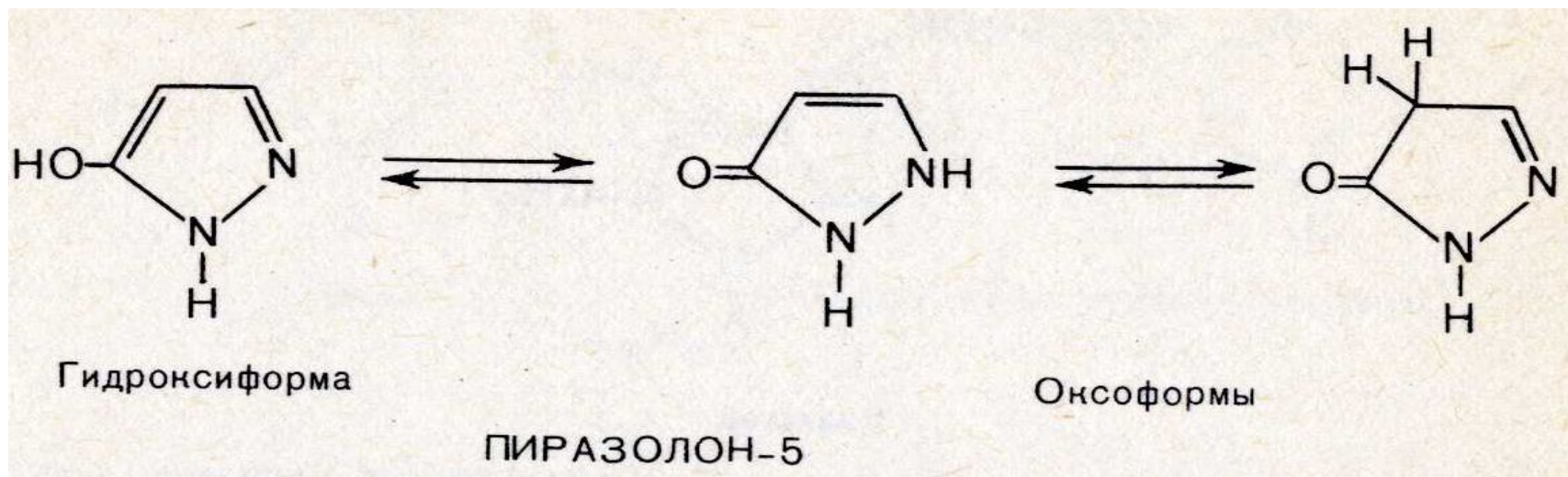
Метронидазол



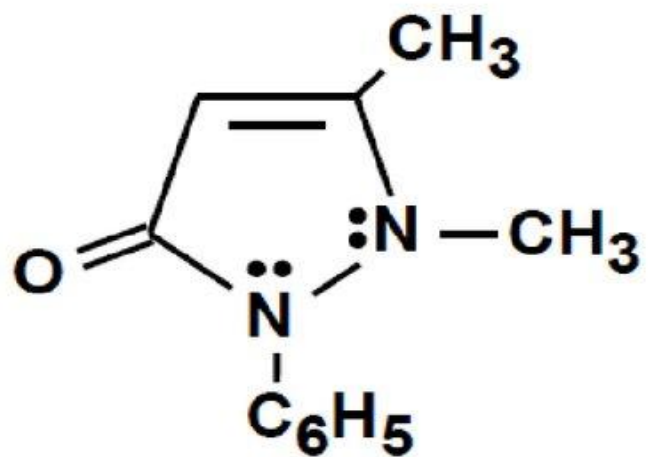
Клофелин



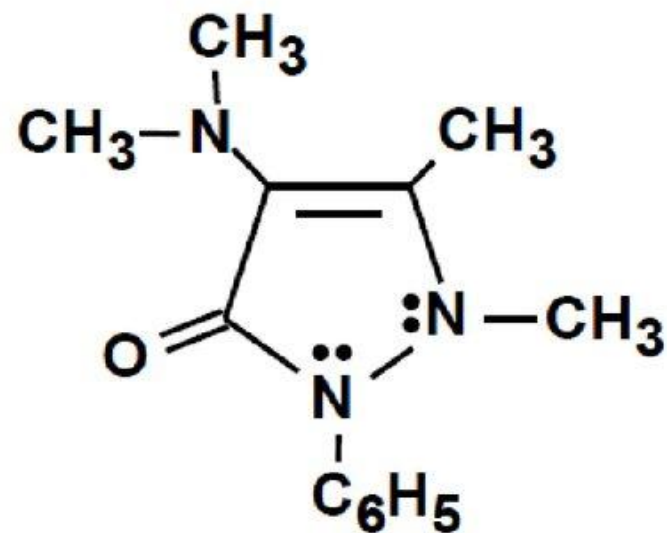
Дибазол



Медико-биологическое значение производных пятичленных ГЦ с двумя гетероатомами. Лекарственные средства на их основе.

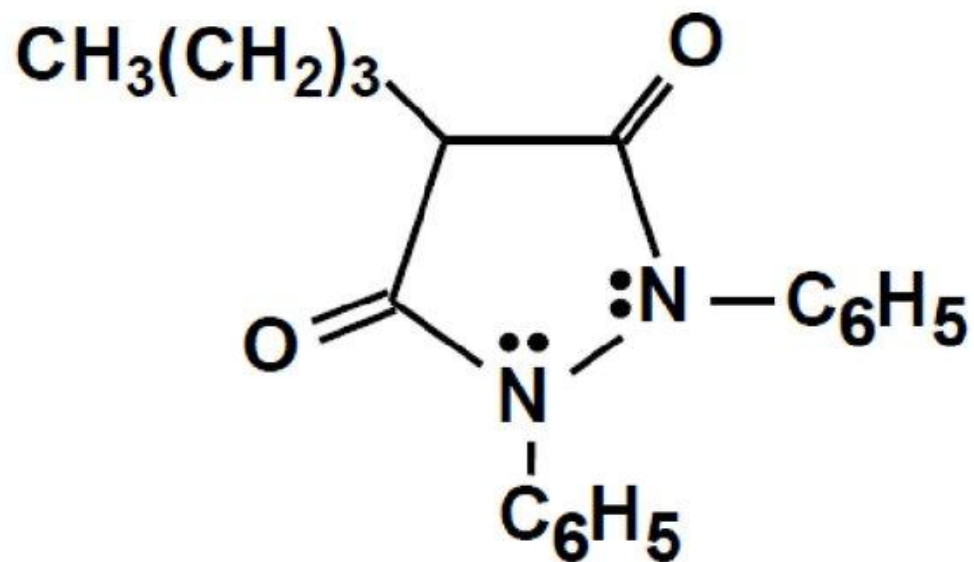


Антипирин



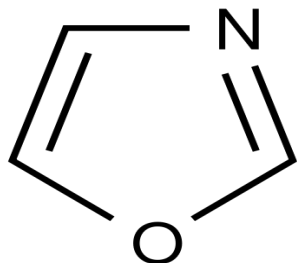
амидопирин

Противовоспалительным действием обладает также бутадион — диоксоаналог пиразолона-3 :

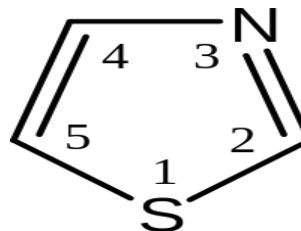


ОКСАЗОЛ ЖӘНЕ ТИАЗОЛ

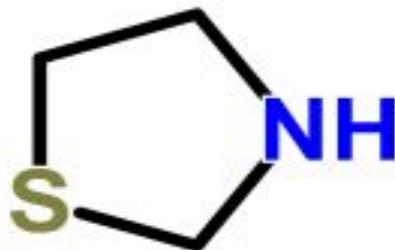
- Оксазол және тиазол – екі түрлі гетероатомды бес мүшелік гетероциклдардың өкілдері.
- Оксазол және тиазол әлсіз негіздерге жатады.
- Тиазолдық тұйық тізбек В витаминінің (тиамин) және кокарбоксилаза ферментінің, сол сияқты кейбір дәрілік заттардың, мысалы норсульфазолдың құрамына енеді.
- Толық гидрленген тиазолдық цикл – тиазолидин – пенициллин антибиотиктерінің құрылымдық бөлігіне жатады.



Оксазол



Тиазол

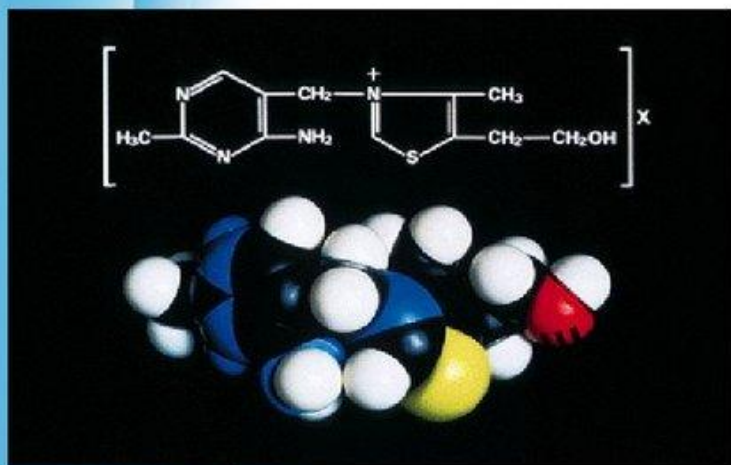
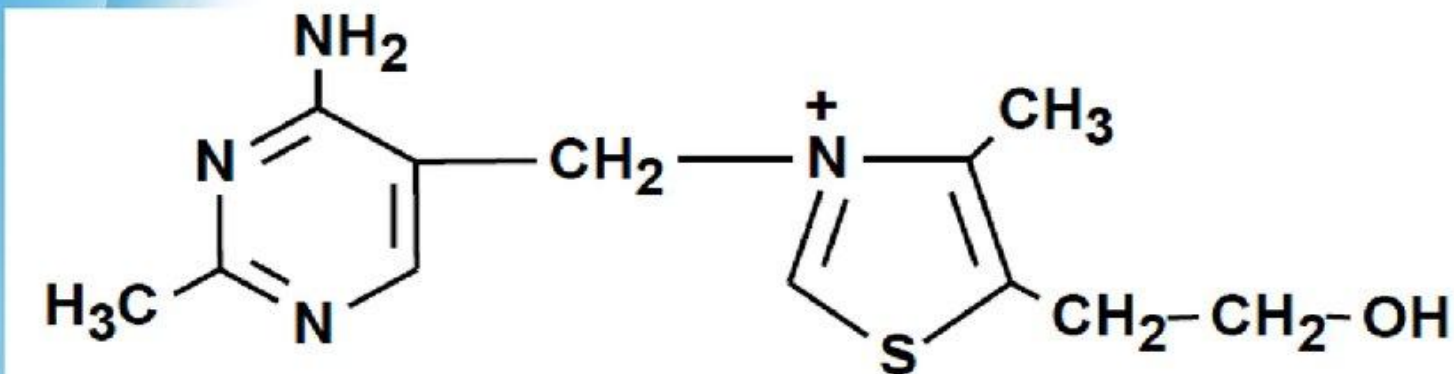


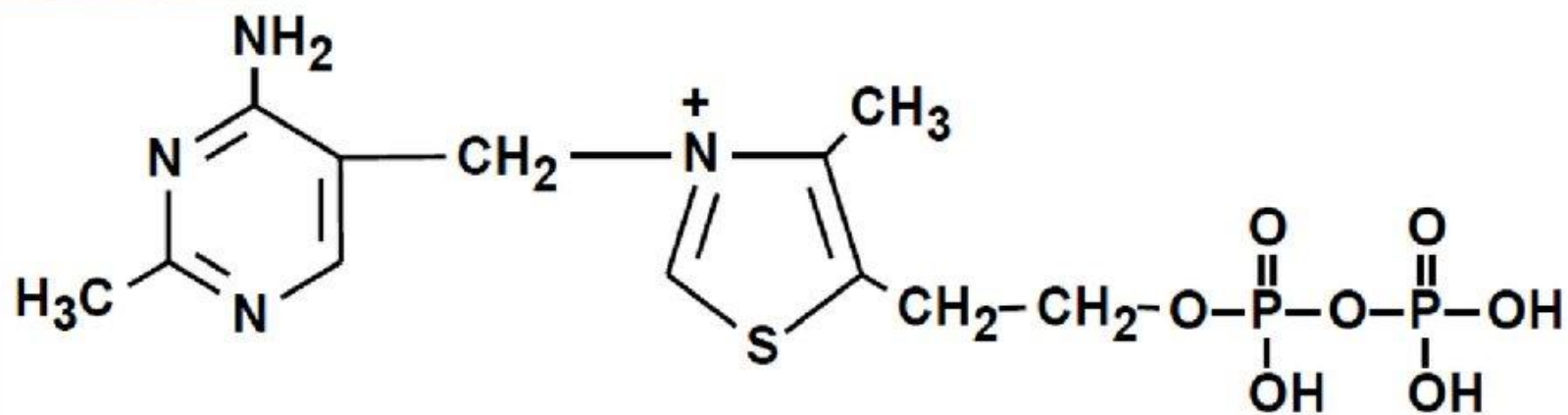
Тиазолидин

Бес мүшелік әртүрлі гетероатомды қосылыстар

Медико-биологическое значение производных пятичленных ГЦ с двумя гетероатомами. Лекарственные средства на их основе.

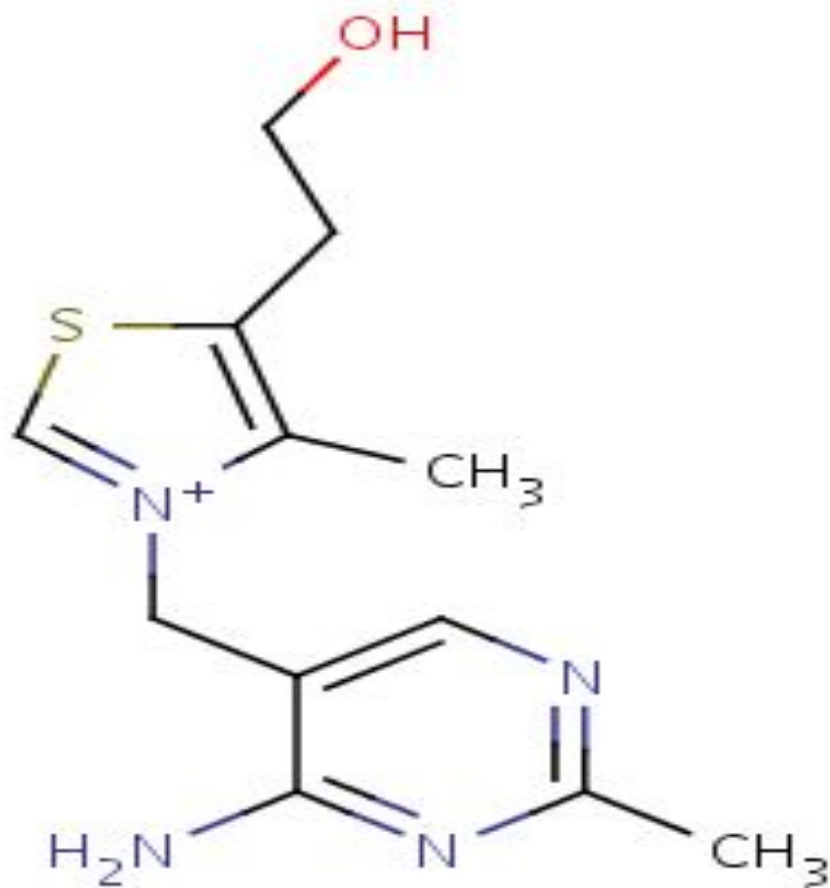
Тиазольный цикл входит в состав витамина В₁ (тиамина) и кофермента кокарбоксилазы.





Тиаминдифосфат (кокарбоксилаза)

Тиаминнің құрылысы



Вильямс 1934 жылы күріш кебегінен витамин В₁ алды, ал 1936 жылы оның құрылысын дәлелдеді.

Жануарлар мен адамның ағзасы В₁ витаминінің (тиамин) ағзадан тыс қорекпен түсуін қажет етеді.

Тиамин нан дақылдарының кебегінде, ашытқының құрамында болады.



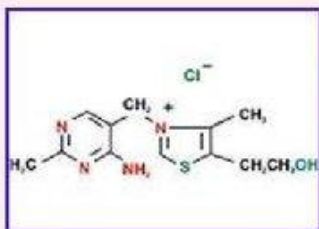
ВИТАМИН

B₁

Участвует в обмене веществ, регулирует циркуляцию крови и кроветворение, работу гладкой мускулатуры, активизирует работу мозга. При недостатке-заболевание Бери-бери (поражение нервной системы, отставание в росте, слабость и паралич конечностей).



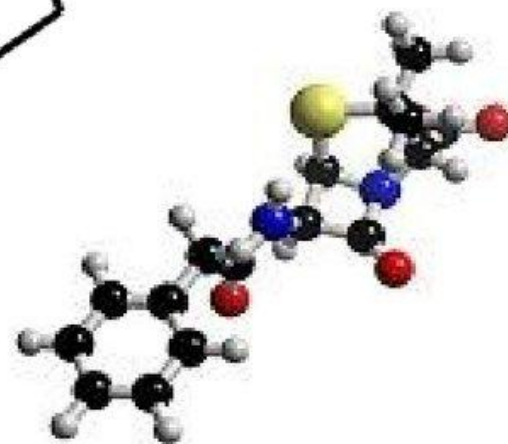
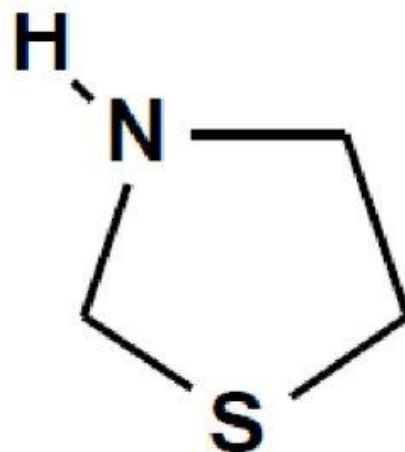
**Т
И
А
М
И
Н**



Содержится:
в орехах,
апельсинах,
хлебе
грубого помола,
мясе птицы,
зелени.



Цикл полностью гидрированного тиазола – тиазолидин - является структурным фрагментом антибиотиков-пенициллинов.

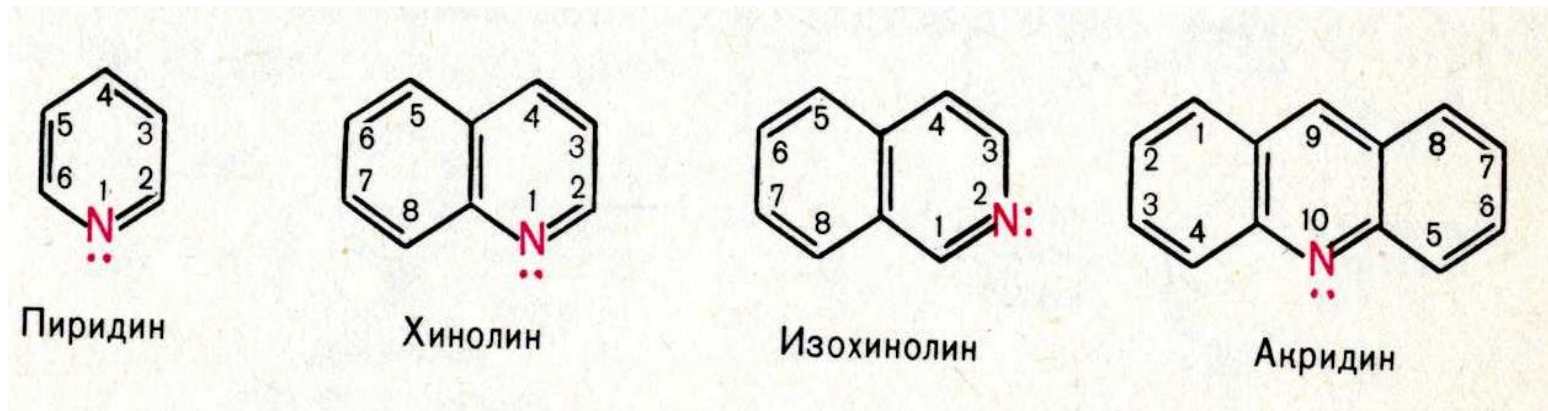


В основе структуры пенициллинов лежит пенициллановая кислота, содержащая два конденсированных гетероциклических кольца – пятичленное тиазолидиновое (B) и четырехчленное лактамное (A):



БІР ГЕТРОАТОМДЫ АЛТЫ МҮШЕЛІК ГЕТЕРОЦИКЛДАР

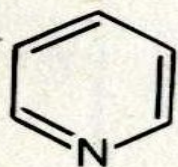
- Бұл топқа ароматталған азотты гетероциклдар жатады: пиридин, хинолин, изохинолин және акридин.



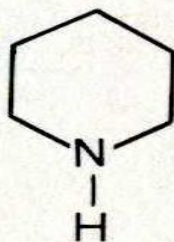
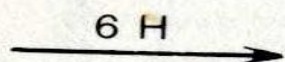
18-сурет. Бір гетероатомды алтымүшелік гетроциклдар

ПИРИДИН

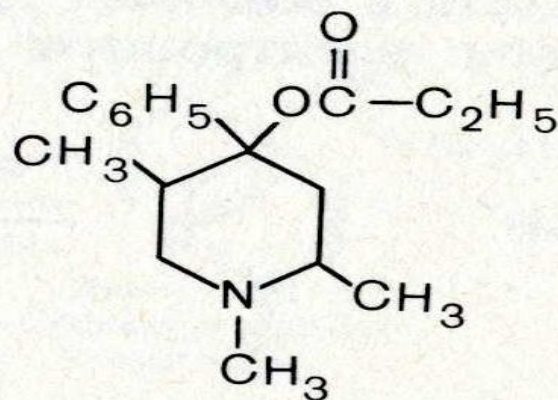
- Пиридин - түссіз сұйық, сумен және органикалық еріткіштермен жақсы араласады, жағымсыз сипатты исі бар, өте улы. Пиридин – негіздік қасиеттер көрсететін ароматты гетероциклдық қосылыс.
- Пиридиннің гомологтары сәйкес келетін пиридинкарбон қышқылдарына дейін оңай тотығады және пиридин тұйық тізбегі бұзылмайды. Олардың ішіндегі маңыздысы – изомерлік метилпиридиндердің (пиколиндердің) тотығуы. Мысалы, бета-пиколин бета-пиридин қышқылы немесе никотин қышқылына айналады.
- Никотин қышқылы және оның амиді (никотинамид) – РР витаминінің екі формасы.
- Никотин қышқылының диэтиламиді – кордиамин орталық жүйке жүйесінің әсерлі стимуляторы.



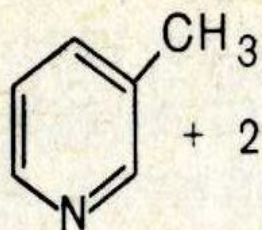
Пиридин



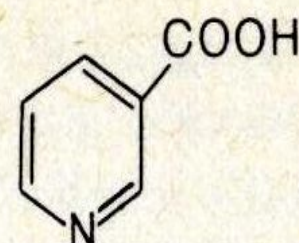
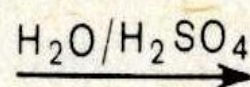
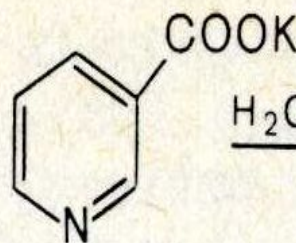
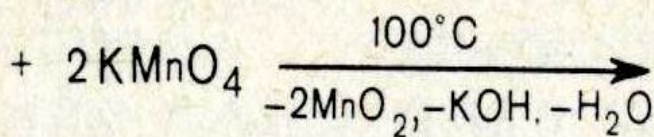
Пиперидин



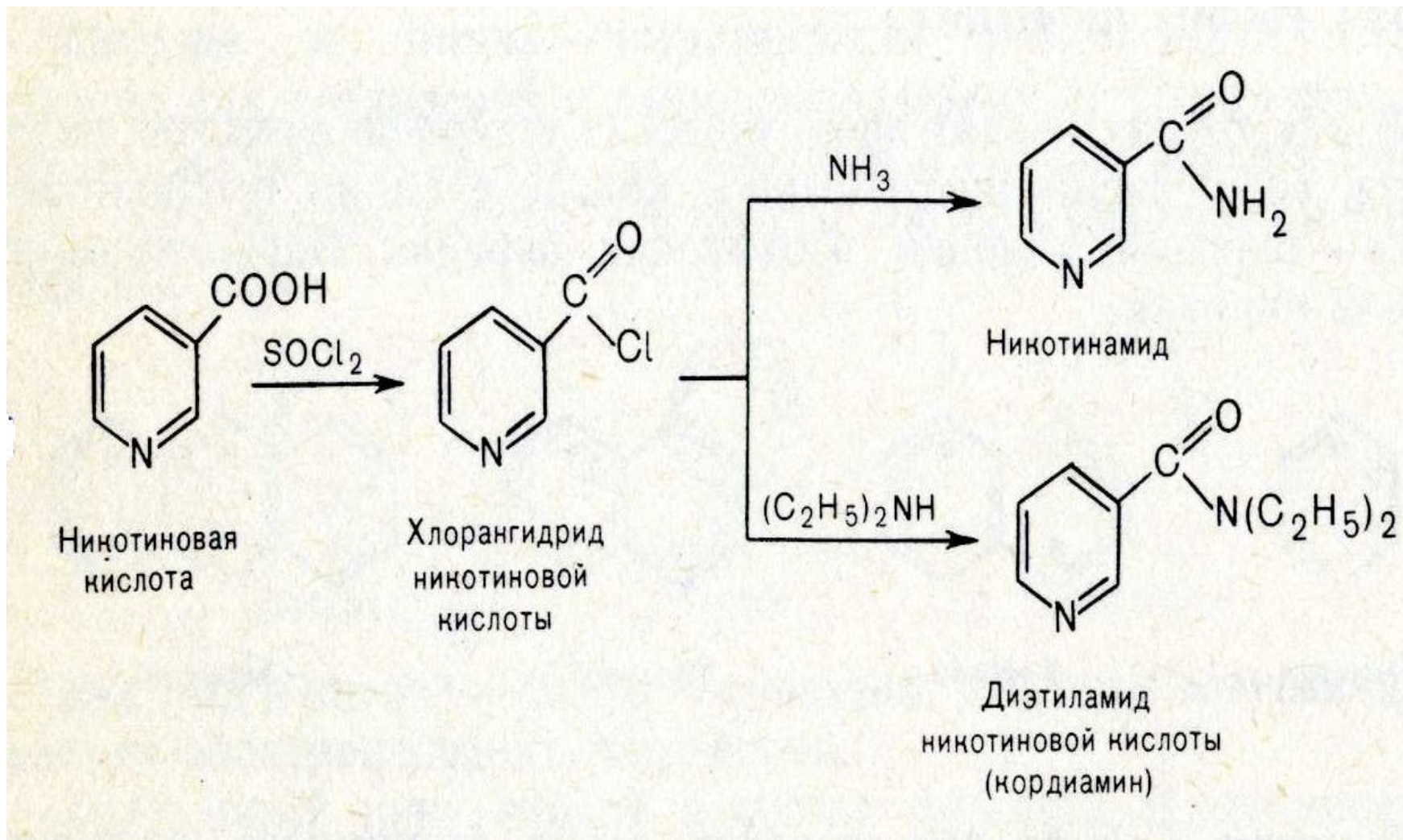
Промедол



β -Метилпиридин
(β -пиколин)



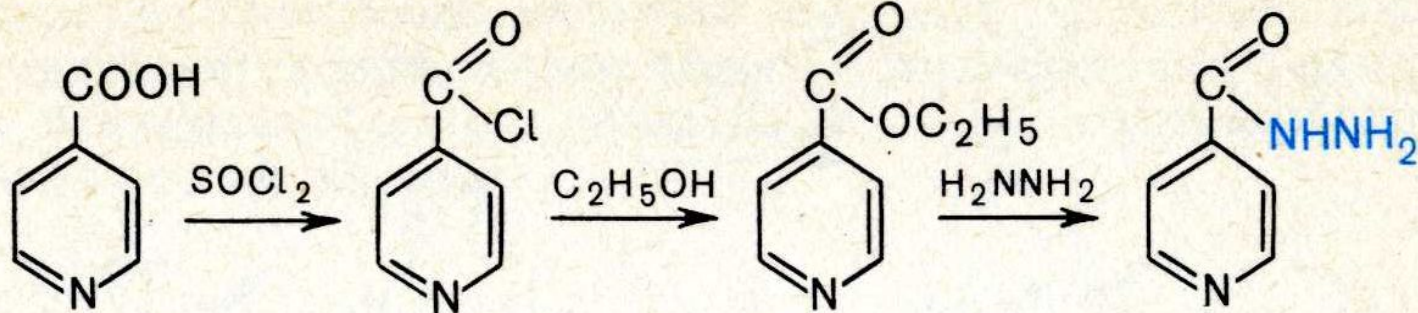
β -Пиридинкарбоновая,
никотиновая кислота
(витамин PP)



Никотин қышқылының туындылары

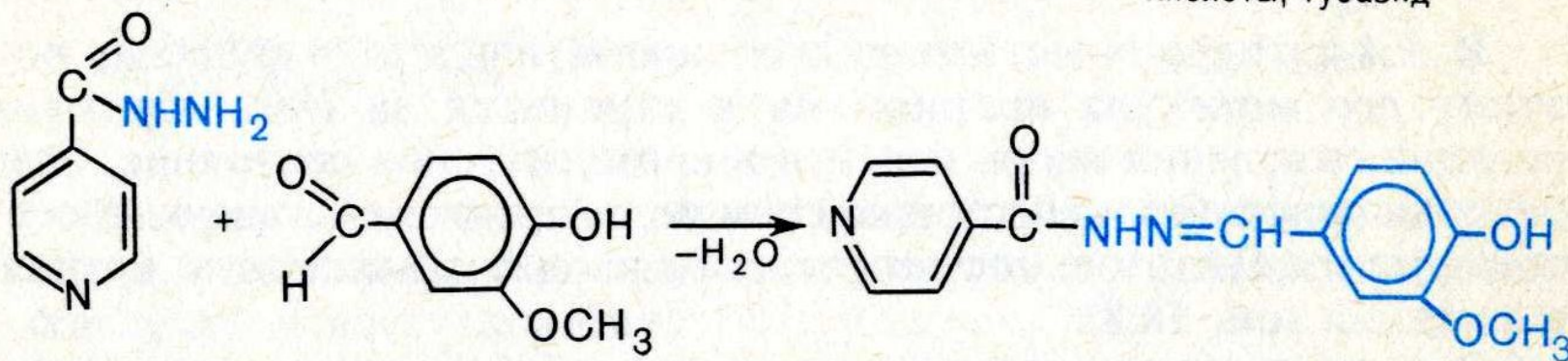
ИЗОНИКОТИН ҚЫШҚЫЛЫ

- Гамма-пиколиндердің тотығуы нәтижесінде изоникотин қышқылы деп аталатын гамма-пиридинкарбон қышқылдары пайда болады.
- Изоникотин қышқылы туберкулезге қарсы қолданылатын тубазид (изониазид) және фтивазид алу үшін қолданылады.
- Пиридин тотықсызданғанда, пиперидин түзіледі, ал пиперидин сақинасы анестетик промедолдың құрамында болады.



Изоникотиновая
кислота

Гидразид
изоникотиновой
кислоты, тубазид



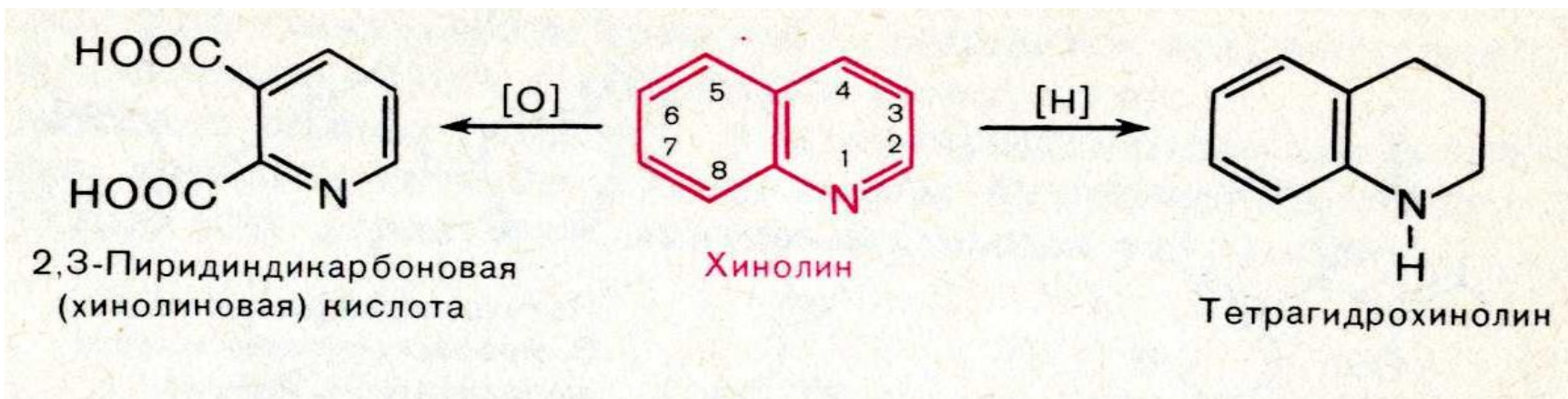
Тубазид

Ванилин,
4-гидрокси - 3 - метокси -
бензальдегид

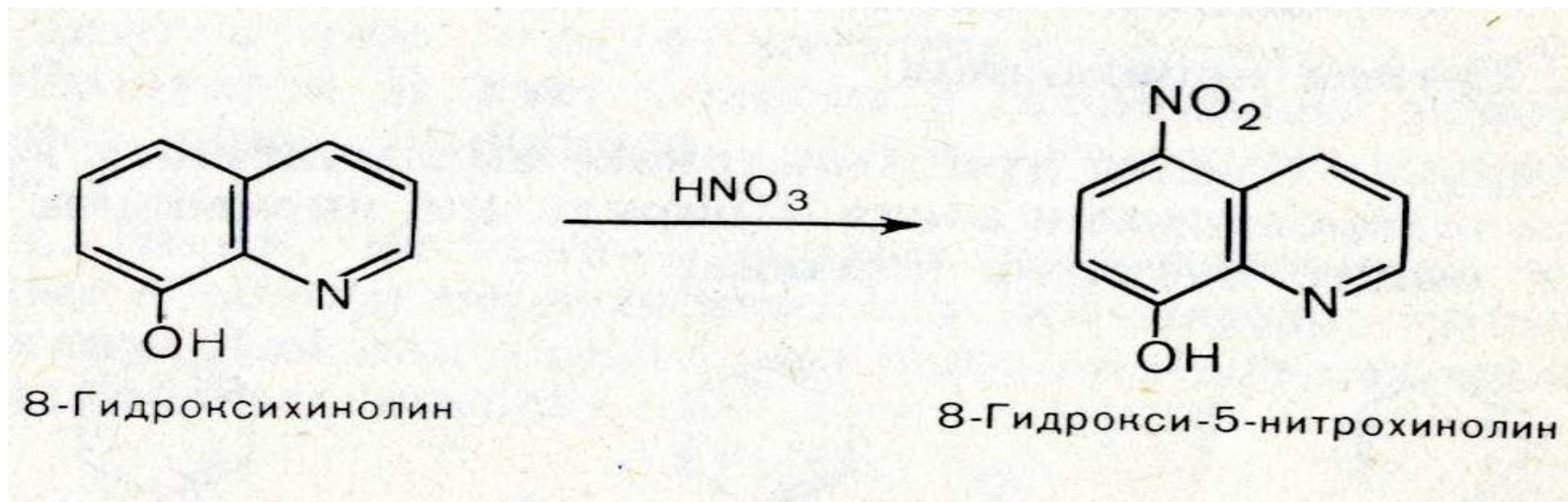
Фтивазид

ХИНОЛИН, ИЗОХИНОЛИН, АКРИДИН

- Хинолин пиридинге ұқсас, негіздік қасиеттер көрсетеді.
- Хинолин ядросы кейбір алкалоидтардың және дәрілік заттардың құрамына енеді. Мысалы, хинолиннің туындысы 8-гидроксихинолин сульфаттар (хинозол) түрінде антисептиктің ролін атқарады. 8-гидроксихинолиннің нитрленген туындысы – 8-гидроки-5-нитрохинолин (5-НОК) күшті бактерицидтік әсер жасайды.
- Изохинолин – хинолиннің изомері, морфин және папаверин алкалоидтарының құрамына енеді.
- Акридин және оның туындылары уытты заттар, олардың кейбіреулері күшті бактерицидтік қасиеттер көрсетеді. Мысалы, заласыздандыру үшін қолданылатын этакридин немесе риванол.



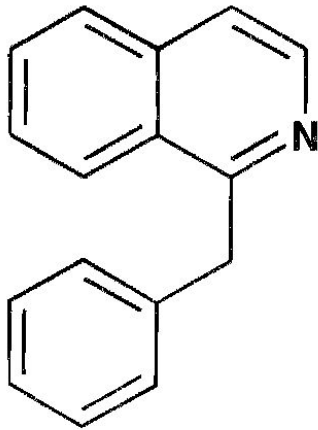
Хинолиннің туындылары



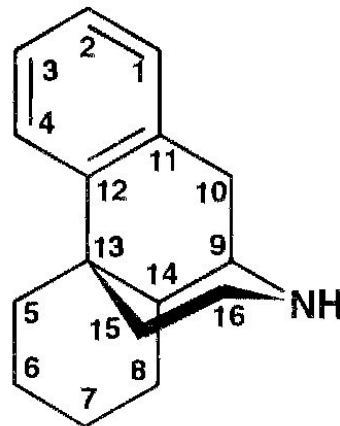
Хинолиннің туындылары

Изохинолин туындылары:

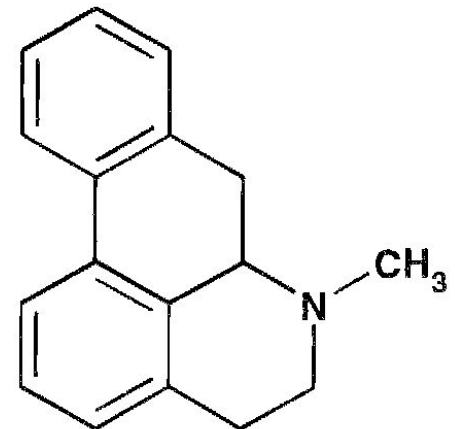
- 1-Бензилизохинолин
- Морфинан
- Апорфин



1-бензилизохинолин

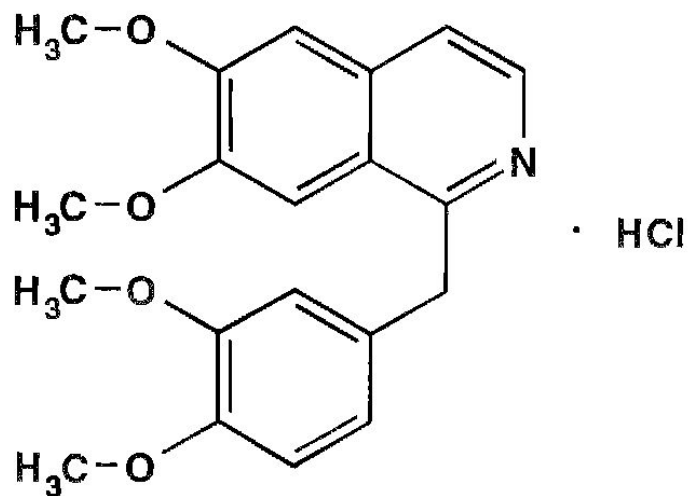


морфинан



апорфин

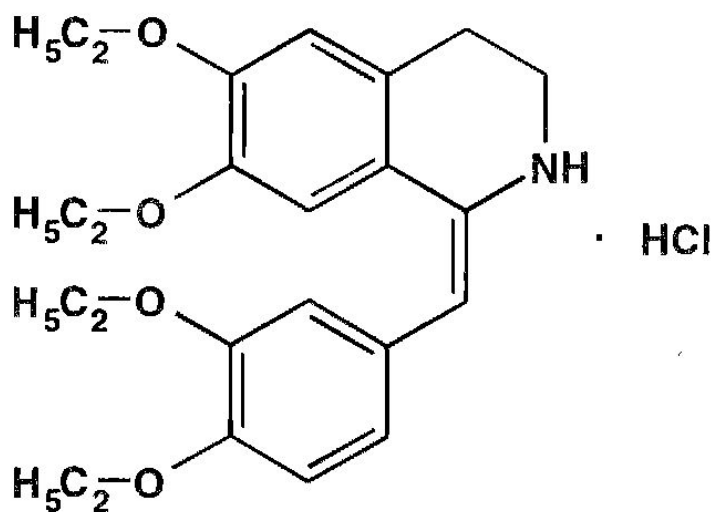
Бензилизохинолин туындылары



Papaverine Hydrochloride – папаверин гидрохлориді

- Ақ кристалданған ұнтақ, иіссіз.
- Хлороформда ериді, суда жеткілікті ериді, спиртте аз ериді.
- Дәрілік формалар: ұнтақ, таблеткалар, инъекцияға арналған ерітінді.
- Спазмолитик

Бензилизохинолин туындылары



Drotaverine Hydrochloride – дротаверин гидрохлориді (Но-Шпа)

- Ақшыл-сары немесе жасылдау-сары кристалданған ұнтақ, әлсіз иісті.
- Дәрілік формалар: таблеткалар, инъекцияға арналған ерітінді
- Спазмолитик

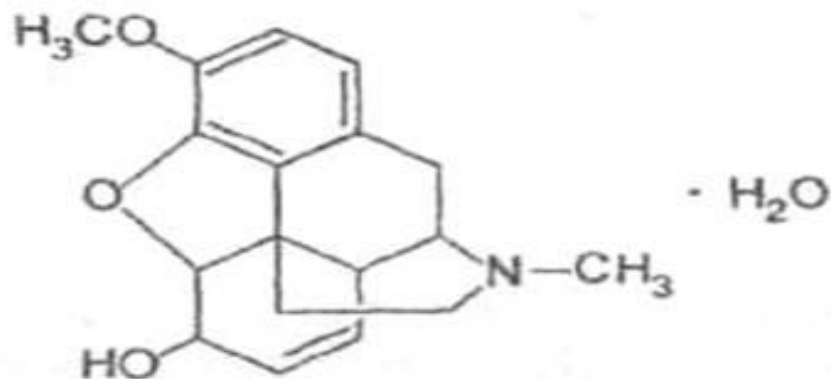
Морфинан туындылары

- Морфин гидрохлориді
- Кодеин (Codeinum)
- Кодеин фосфаты (Codeini phosphas)
- Этилморфин гидрохлориді (Aethylmorphini hydrochloridum)

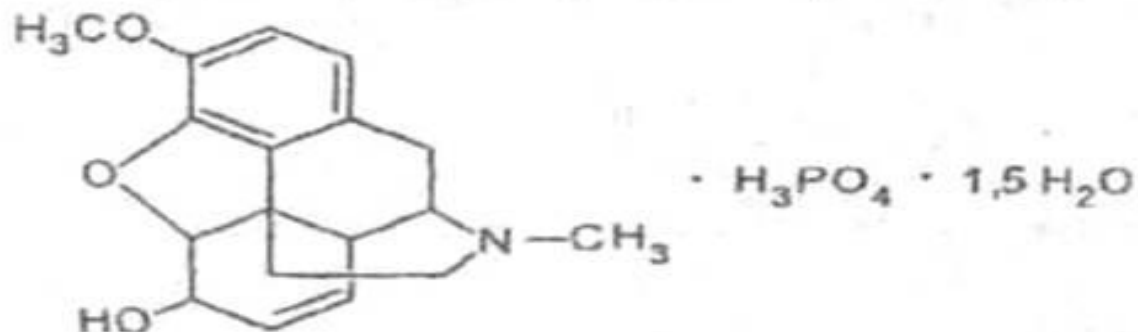
Апорфин туындылары

- Апоморфина гидрохлорид
(Aromorphinihydrochloridum)
- Глауцина гидрохлорид (Glaucinihydrochloridum)

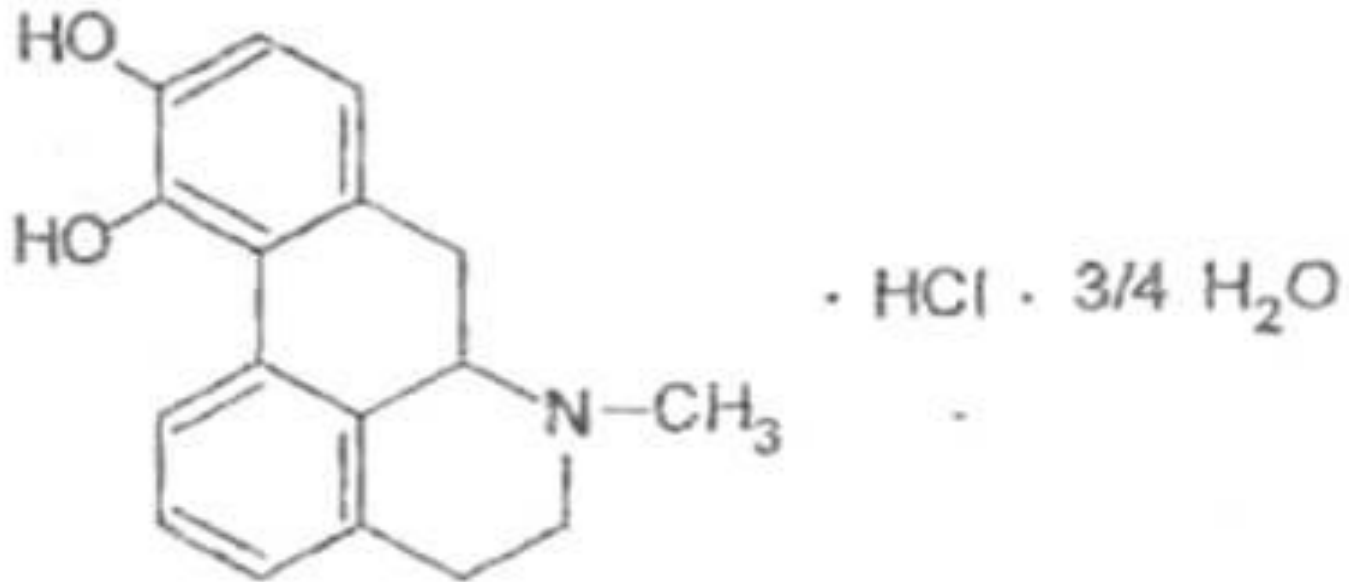
Кодеин (Codeimim) и кодеин фосфат (Codeini phosphas)



Кодеина фосфат (Codeini phosphas)

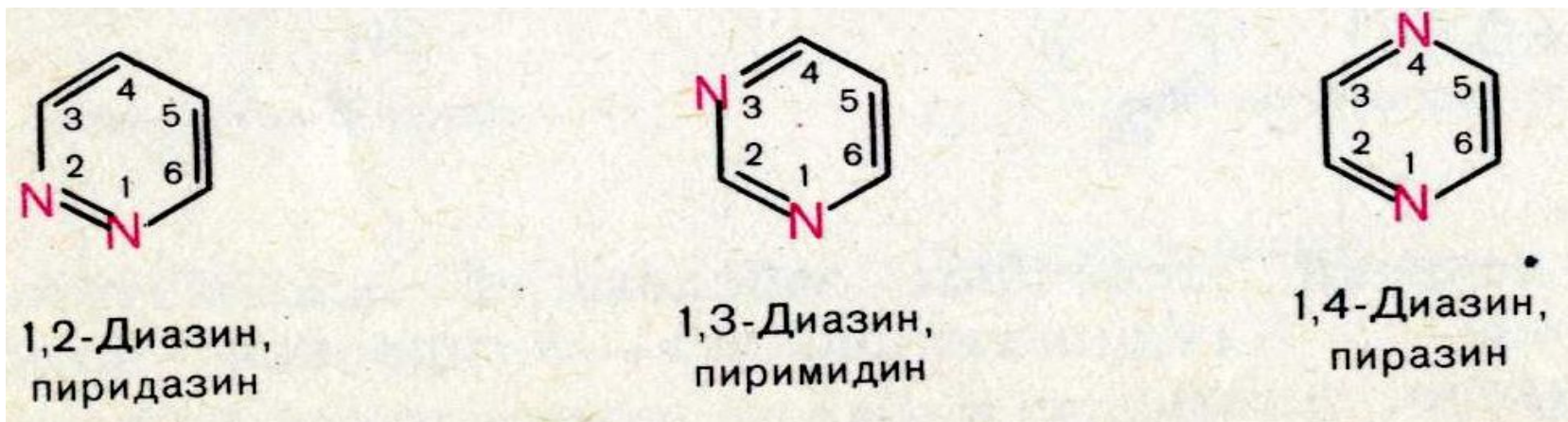


Апоморфин гидрохлориді (Aromorphinihydrochloridum)



ЕКІ ГЕТРОАТОМДЫ АЛТЫ МҮШЕЛІК ЦИКЛДАР

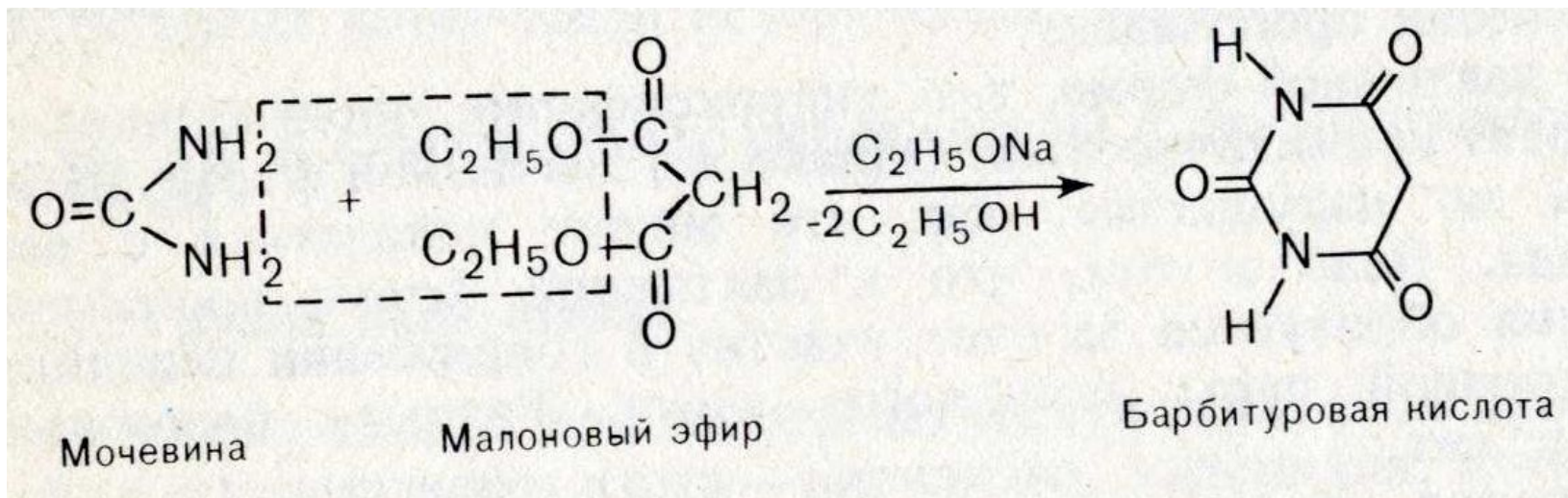
Екі гетероатомды алты мүшелік циклдар диазиндер деп аталады: пиридазин, пиримидин, пиразин.



Екі гетероатомды циклдық қосылыстар

ПИРИМИДИННІҢ ТУЫНДЫЛАРЫ

- Пиримидин туындылары құрамындағы гидроксил тобына байланысты қышқылдық қасиеттер көрсетеді. Мысалы, 2,4,6-тригидроксипиримидин – барбитур қышқылы (малон қышқылының тұйықталған уреиді).
- Барбитур қышқылының 5,5-диалмасқан туындылары – барбитураттар ұйықтатқыш және күйзеліске қарсы препарат ретінде қолданылады.
- Тиамин витаминінің құрамында метилен тобы арқылы жалғасқан екі сақина – пиримидиндік және тиазолдық сақиналар болады.
- Тиамин витамині тиамин мен дифосфор (пирофосфор) қышқылының эфирі (тиаминдифосфат) болып есептелетін кокарбоксилаза коферментін түзу үшін қажет.



Пиримидиннің туындысы – барбитур қышқылы

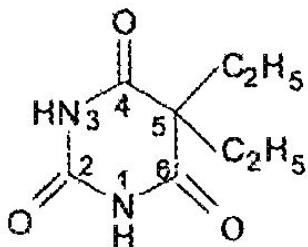


Барбитураттардың жалпы формуласы

Препараттардың құрылымы мен қасиеттері

Химиялық құрылымы

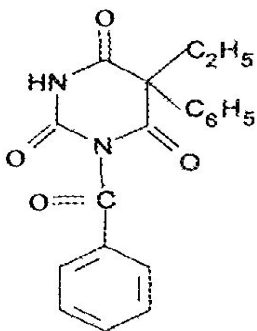
Сипаттамасы



Барбитал – Barbitalum.

5,5 – диэтилбарбитур қышқылы немесе 5,5 – диэтил – 2,4,6, (1Н,3Н,5Н) пиримидинтрион.

Ақ кристалды, иіссіз, ащы дәмді ұнтақ, суда, спиртке ериді, сулы ертіндісі рН=7 көрсетеді. Ұйықтатқыш дәрі.



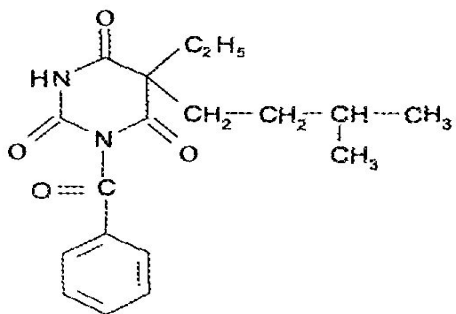
Бензонал – Benzonalum.

1 –Бензоил – 5 – этил – 5 – фенилбарбитур қышқылы.

Ақ кристалды ұнтақ.

Суда аз ериді, хлороформда өте жеңіл ериді, эфирде ериді, спиртке нашар ериді.

Дәрілік түрі: ұнтақ, таблетка. Эпилепсияға қарсы дәрілік зат.



Бензобамил – Benzobamilum.

1 –Бензоил – 5 – этил – 5 – азоамилбарбитур қышқылы.

Ақ кристалды ұнтақ. Суда іс жүзінде ерімейді, спиртке жеңіл ериді.

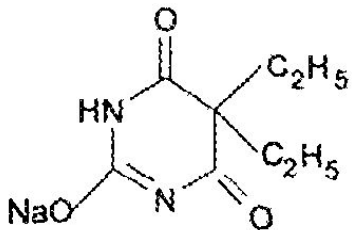
Дәрілік түрі: таблетка.

Эпилепсияға қарсы дәрілік зат.

Препараттардың құрылымы мен қасиеттері

Химиялық құрылымы

Сипаттамасы



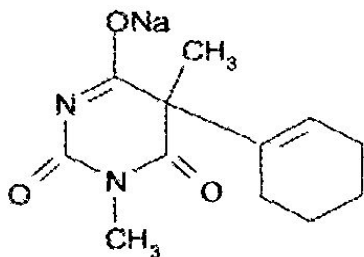
Барбитал – натрий – *Barbitalum – natrium*.

5,5 – Диэтилбарбитурат натрий немесе 5,5 – диэтил – 2,4,6, (1Н,3Н,5Н) пиримидинтрион моносодий тұзы.

Иссіз ақ түсті ұнтақ, ащы дәмді. Судағы ерітіндісі фенолфталеин бойынша сілтілік реакцияға ие.

Суда жеңіл ериді, эфирде аз ериді.

Дәрілік түрі: ұнтақ, таблетка. Ұйықтатқыш дәрі.



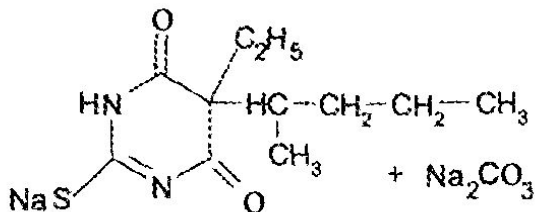
Гексенал – *Hexenalum*.

1,5 – Диметил – 5 - (циклогексен – 1 ил) – барбитурат натрий немесе

1,5 – Диметил – 5 - (циклогексен – 1 ил) -2,4,6 (1Н,3Н,5Н) – пиримидинтрион моносодий тұзы. Ақ көбік тәрізді масса. Гигроскопиялы (су тартқыш)

95 % спиртте және суда жақсы ериді, эфир мен хлороформда іс жүзінде ерімейді.

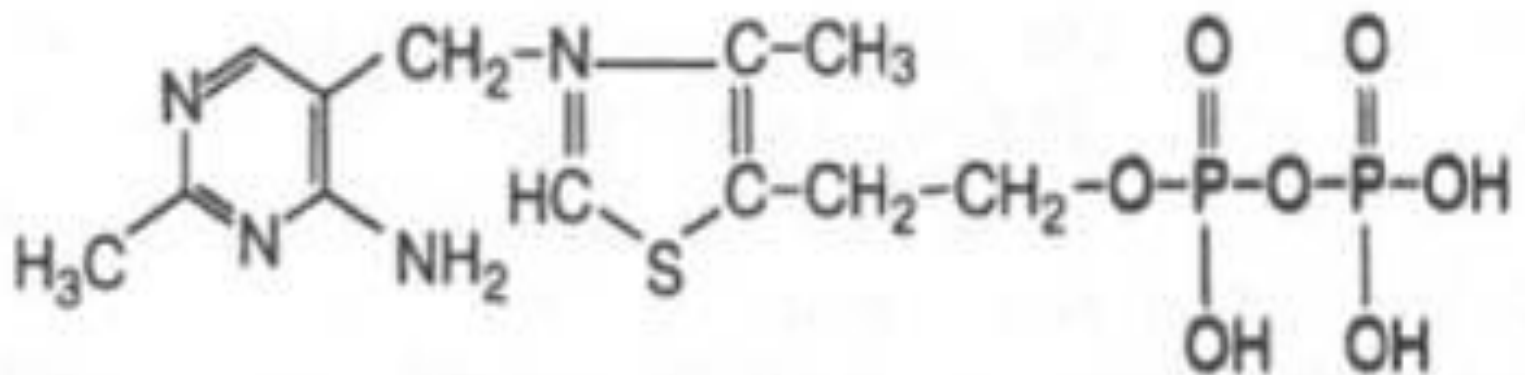
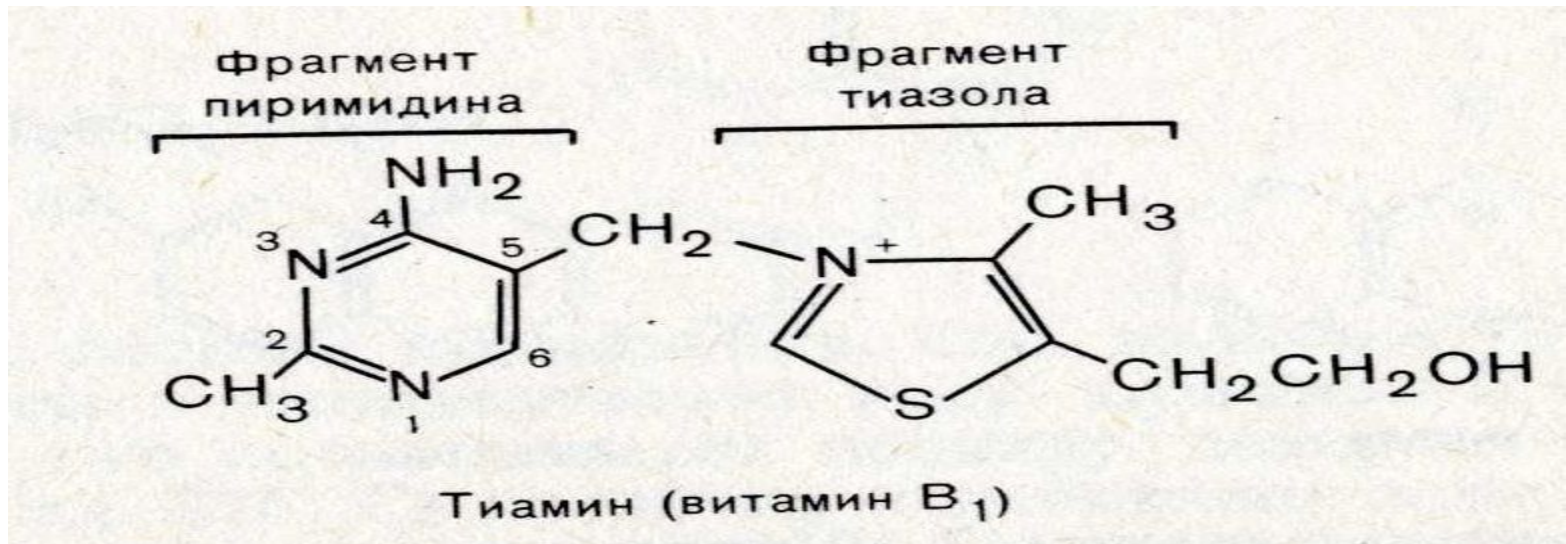
Дәрілік түрі: ұнтақ, Ішкі гаркоза үшін дәрілік зат



Тиопентал – натрий – *Thiopentalum – natrium*.

Қоспа натрий тұзы 5 – этил -5 – (1 - метилбутил) – 2 – тиобарбитур қышқылы сусыз натрий карбонатымен. Өзіне тән иісі бар сары немесе сары-жасыл түсті құрғақ масса. Гигроскопиялы. Судағы ерітіндісі сілтілік реакция көрсетеді.

Суда жеңіл ериді, бензол мен эфирде іс жүзінде ерімейді, Дәрілік түрі: ұнтақ. Ішкі гаркоза үшін дәрілік зат.



Тиаминпирофосфат (тиаминдифосфат)

БИЦИКЛДЫҚ ГЕТЕРОЦИКЛДАР

- Бициклдық қосылыстардың жиі кездесетін табиғи өкілдері: пуриндік және птериндік қосылыстар.
- Пурин – пиримидин және имидазол ядроларының конденсациялануы нәтижесінде түзілген бициклды гетероциклдық қосылыс.
- Пурин – суда жақсы еритін амфотерлі ароматты жүйе, тотықтырғыштардың әсеріне төзімді.
- Маңызды дәрілік туындылары: кофеин, теобромин, эуфиллин, рибоксин, АТФ.



29-сурет. Пурин

Пуриннің туындылары

- Пуриндік алкалоидтар;
- Нуклеин қышқылдарының құрылымдық фрагменттері болатын нуклеотидтер;
- Антибиотиктер (нуклеозидтік антибиотиктер);
- Витаминдер.

Пуриннің дәрілік заттарының фармакологиялық қасиеттері:

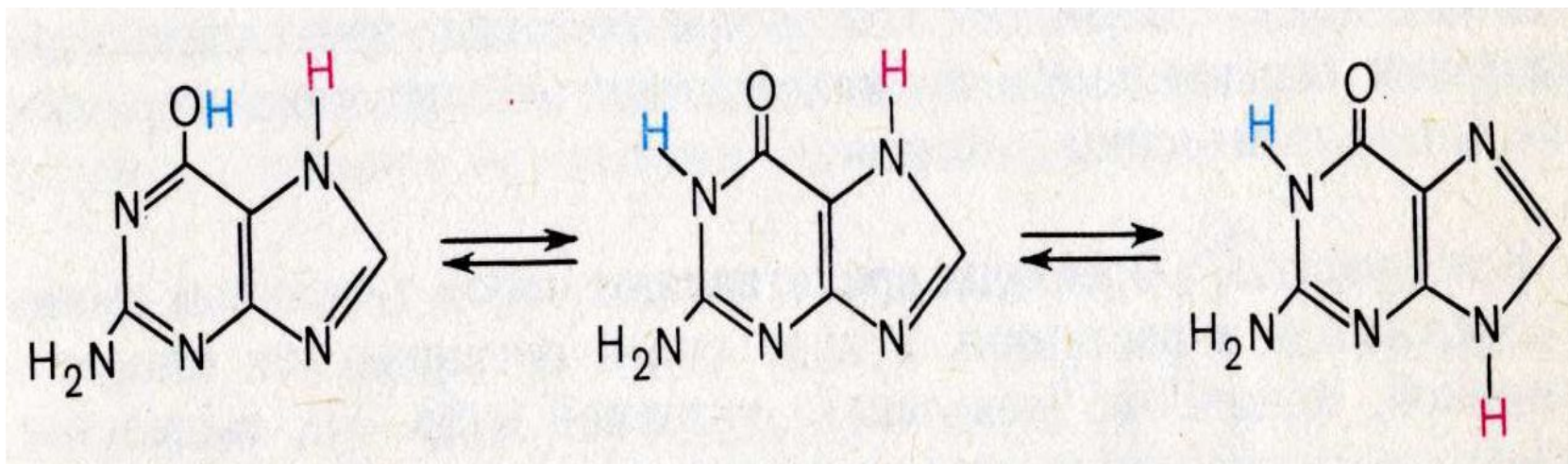
- Ынталандырушы әсер (кофеин);
- Бронхолиттік әсер (теобромин, теофиллин, эуфиллин);
- Ісікке қарсы
- Вирусқа қарсы
- Аллергиялық белсенділікке қарсы.

АМИНДІПУРИНДЕР

- 6-аминпурин немесе аденин
- 2-амин-6-гидроксипурин немесе гуанин.
- Аденин мен гуанинге азотты қышқылмен әсер ететін болса, дезаминделу процесі орындалып, сәйкес гипоксантин және ксантин түзіледі.



33-сурет. Адениннің таутомерлік формалары

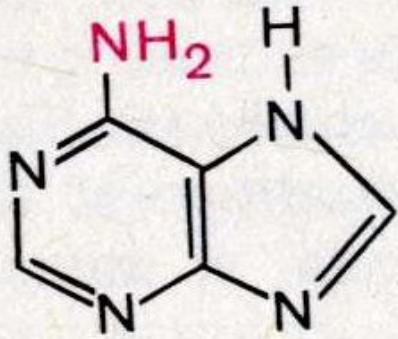


34-сурет. Гуаниннің таутомерлік формалары

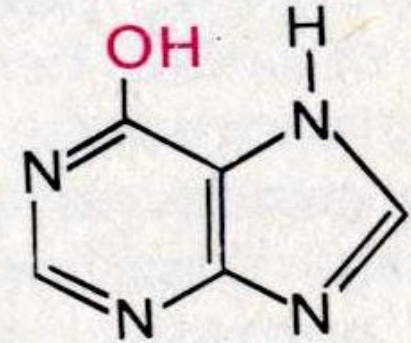
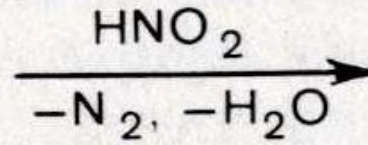
ГИДРОКСИПУРИНДЕР

Ағзада нуклеин қышқылдарының метаболизмі нәтижесінде пайда болатын заттар:

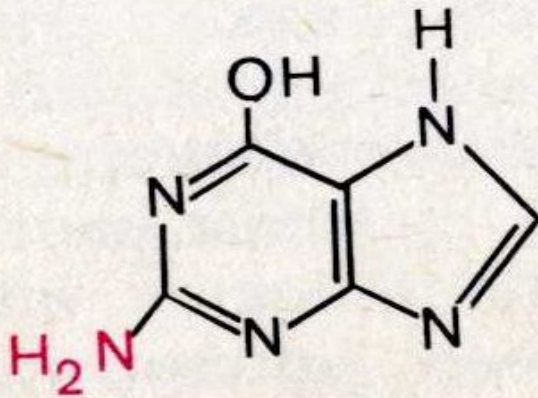
- 6-гидроксипурин немесе гипоксантин
- 2,6-дигидроксипурин немесе ксантин
- 2,6,8-тригидроксипурин немесе несеп қышқылы.
- Несеп қышқылының тұздары ураттар деп аталады.



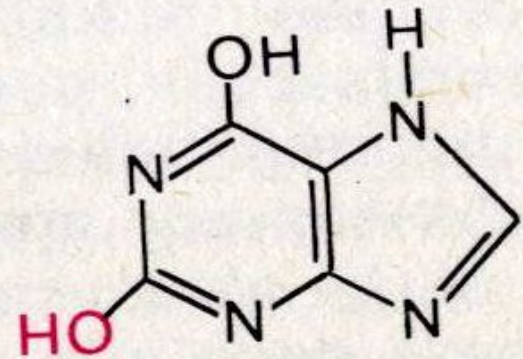
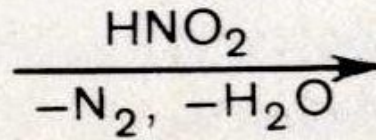
Аденин



Гипоксантин

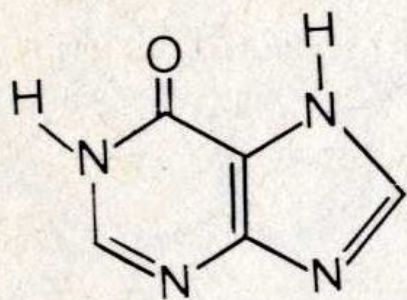


Гуанин

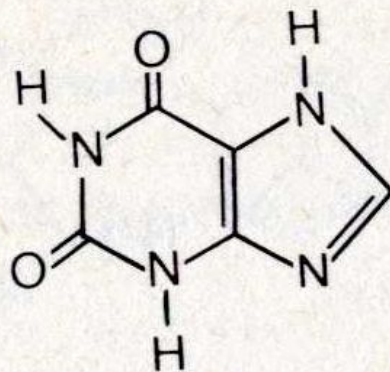


Ксантин

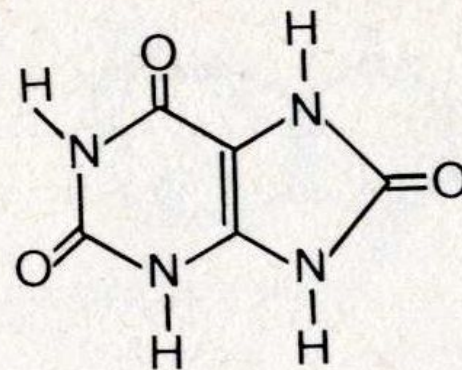
Пуриннің туындылары



Гипоксантин



Ксантин



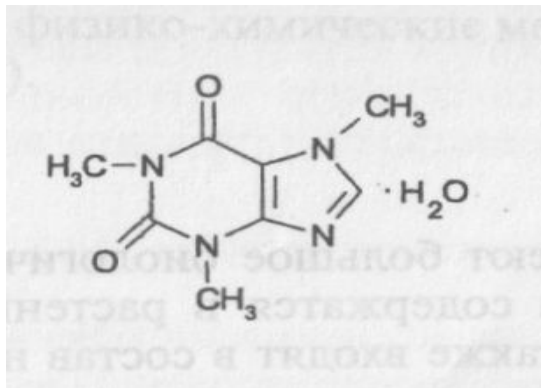
Мочевая кислота

Пуриннің гидрокситуындылары

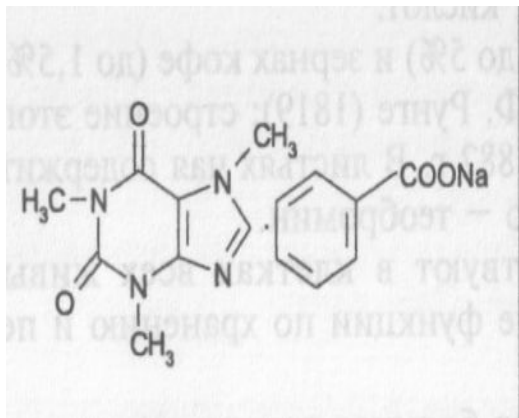
Ксантин туындылары

(N-метилалмасқан ксантиндер, 7Н пуриндар)

- пуриндік алкалоидтар:



Кофеин



Кофеин-бензоат натрия

Психостимулятор және тыныс стимуляторы. Психикалық және физикалық жұмысқа қабылеттілікті жоғарылату, ұйқышылдықты жою үшін қолданылады.

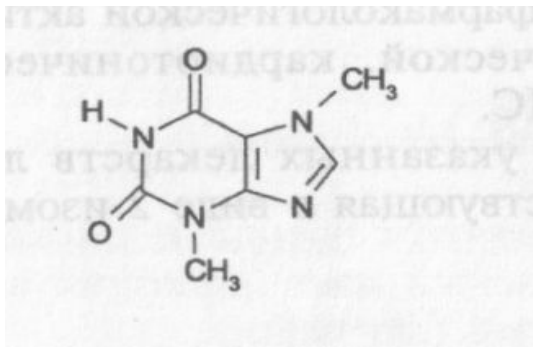
Ұнтақ; таблеткалар («Кофетамин») 0,1 г кофеиннен және эрготамин тартраты 0,001 г-нан (1 мг);

Сақталуы: Б тізімі бойынша, жарықтан қорғалған жерде.

Психостимулдаушы зат.

Ұнтақ және таблеткалар 0,1 және 0,2 г-нан (үлкендер үшін) және 0,075 г-нан (балалар үшін); ампуладағы 100 % және 20 % ерітінділер 1 және 2 мл-ден және шприц-тюбиктерде 1 мл-ден.

Сақталуы: Б тізімі бойынша жақсы тығындалған ыдыста, бекітілген ампулаларда.



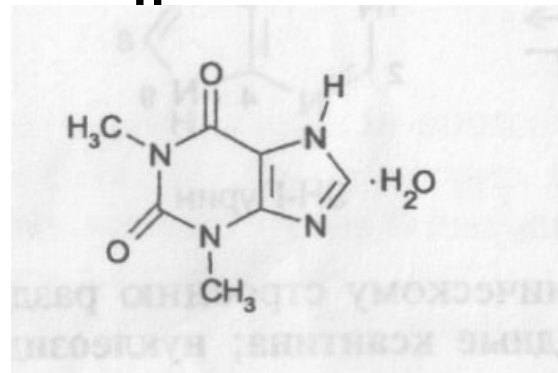
Теоброми

Бронхолиттік зат.

Бас миы тамырларының аздаған қысылыстарында, жүрек және бүйрек жетіспеушілігінен болатын ісінулерде.

Ұнтақ, таблеткалар 0,25 г-нан;

Сақталуы: Б тізімі бойынша



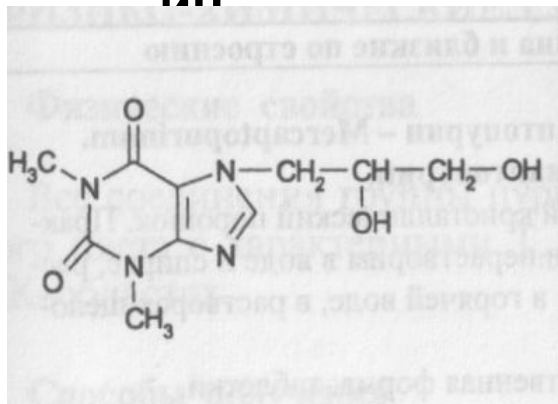
Теofilл

Бронхолиттік зат.

Жүрек пен бүйректе туындайтын созылмалы құбылыстарда жеткілікті әсер жасайтын кардиотоникалық және диуретикалық зат.

Ұнтақ; балауыздар 0,2 г-нан.

Сақталуы: Б тізімі бойынша және жарықтың әсерінен қорғайтын жақсы тығындалған ыдыста.



Дипрофилл

ИН

Бронхолиттік зат.

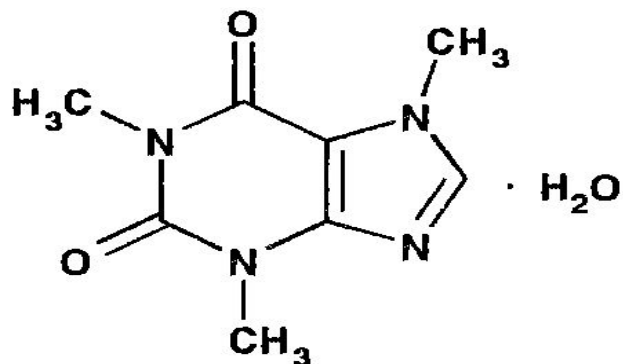
Фармакологиялық әсері бойынша теофиллинге және эуфиллинге жуық, бірақ уыттылығы төмен.

Ұнтақ; таблеткалар 0,2 г-нан; ампуладағы 10% ерітінді 5 мл-ден; балауыздар, препарат 0,5 г-нан.

Сақталуы: Б тізімі бойынша, жарықтың әсерінен қорғайтын салқын жерде.

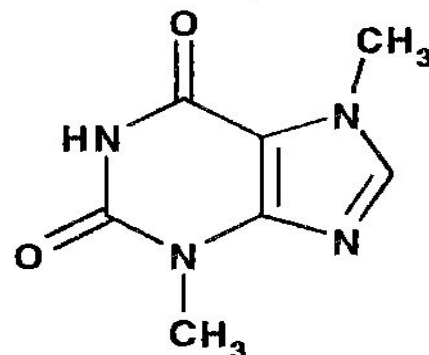
МФХ енген препараттар: кофеин, теобромин, теофиллин

Кофеин

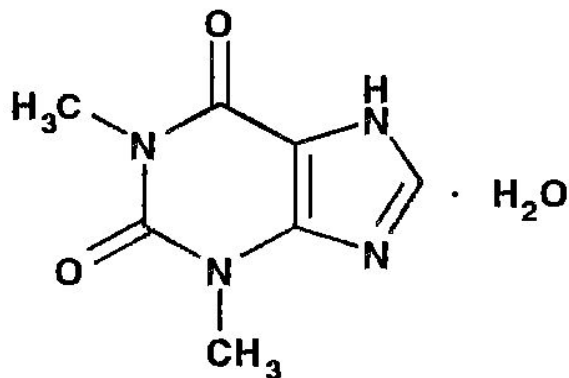


1,3,7-триметилксантин

Теобромин

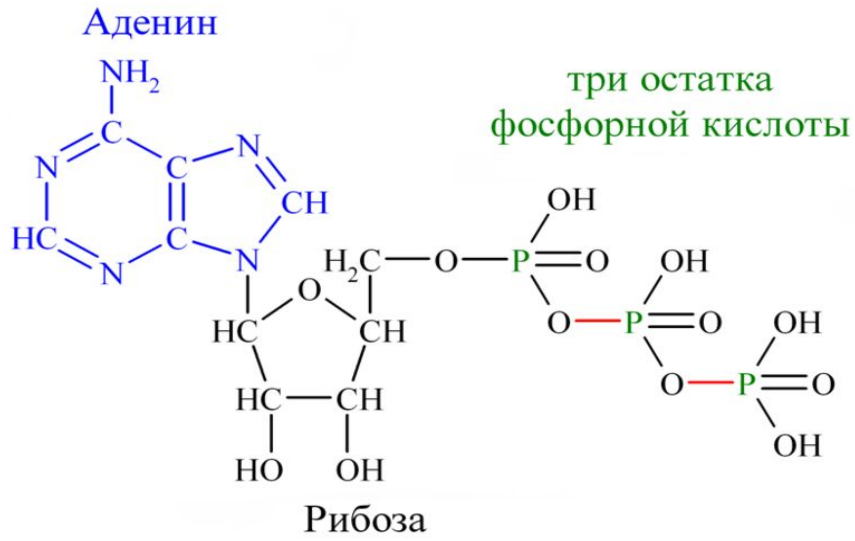


3,7-диметилксантин

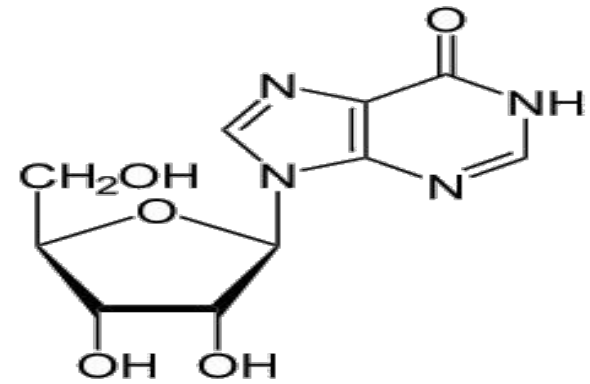
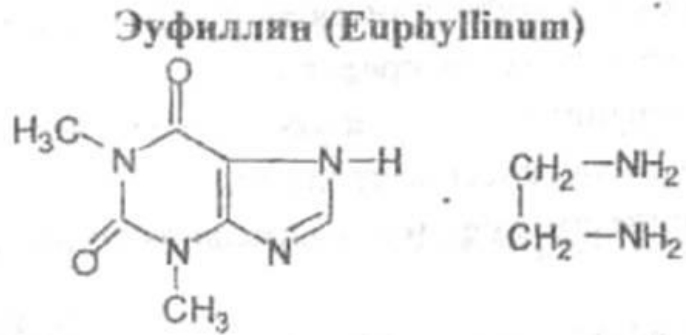


1,3-диметилксантина моногидрат

Теофиллин



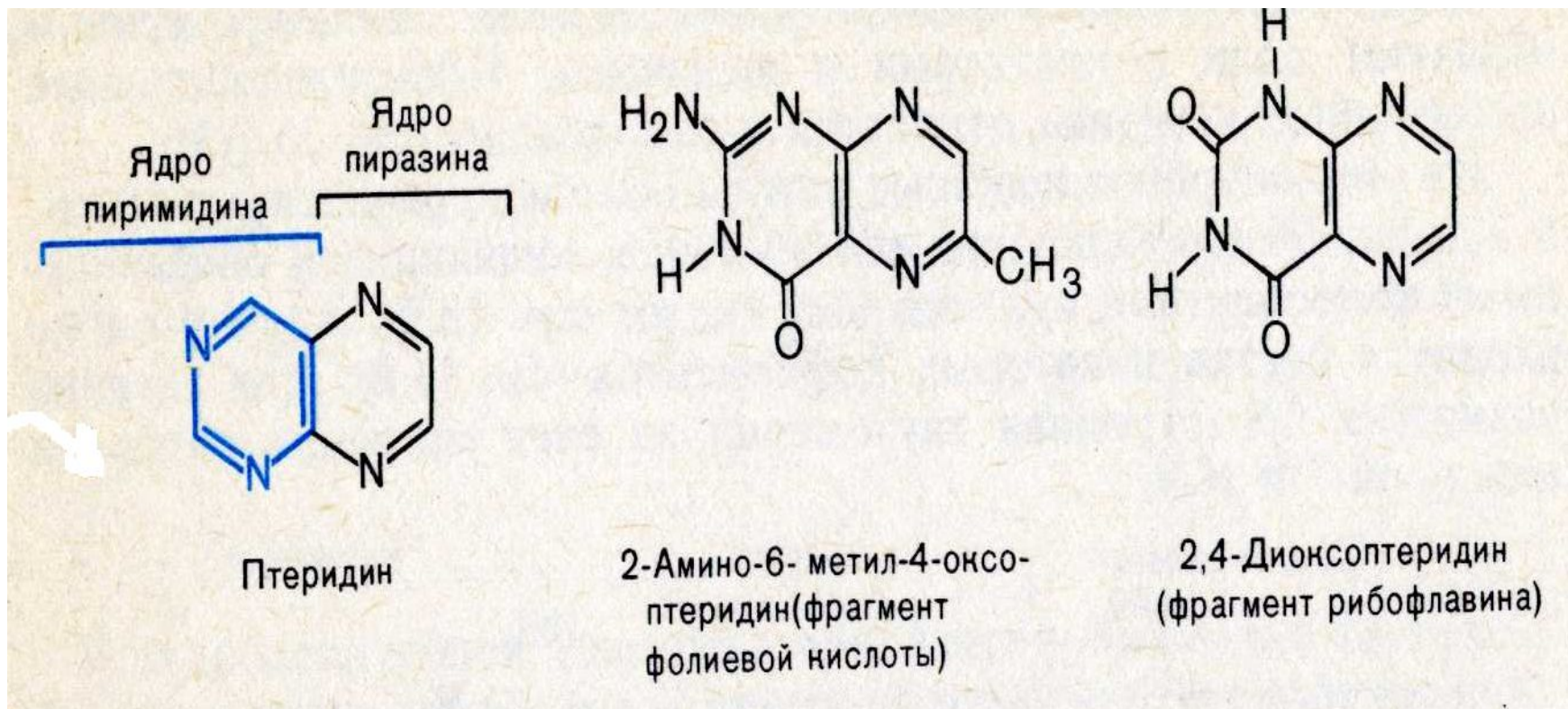
АТФ – аденозинтрифосфор қышқылы



Рибоксин инозин

Птеридин тобы

- Птеридин – пиримидин мен пиразин ядроларының конденсациялануы нәтижесінде пайда болатын бициклдық гетероцикл. Птеридин жүйесі ароматты, тотықтырғыштардың әсеріне төзімді, негіздік қасиеттер көрсетеді.
- Табиғатта кең тарағандары: гидроксид және аминді птеридиндер. Мысалы, 2-амин-6-метил-4-оксоптеридин фоль қышқылының құрамына енеді, ал 2,4-диоксоптеридин жанды ағзалардың өсу факторына жататын маңызды витамин рибофлавиннің құрамында болады.

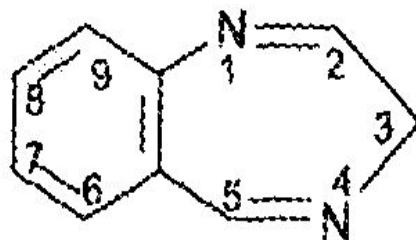


33-сурет. Птеридин және оның туындылары

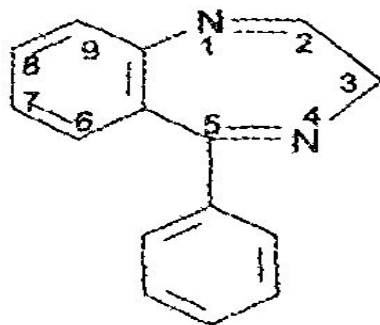
1,4-бензодиазепин туындылары

- Аталған топтың дәрілік заттарының құрамындағы С5 атомында фенилдық радикал болады және 5-фенил-3Н-1,4-бензодиазепин (хлозепид) және 1,2-дигидро-3Н-1,4-бензодиазепин-2-онның (сибазон, нитразепам, нозепам, феназепам) туындылары болып есептеледі.
- Бензодиазепин туындылары фармакологиялық әсері бойынша седативтік препараттарға, яғни қозғалу және ойлау қызметтеріне минимум әсер жасалғанда, тыныштандырғыш қабілет жасайды.

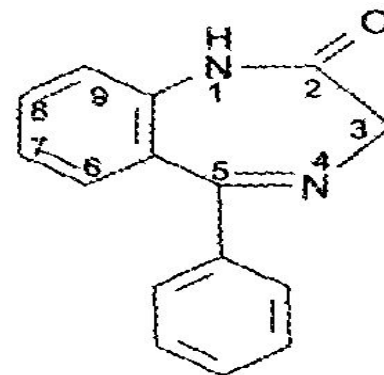
Құрылымдық формулалары



3H-1,4-Бензодиазепин

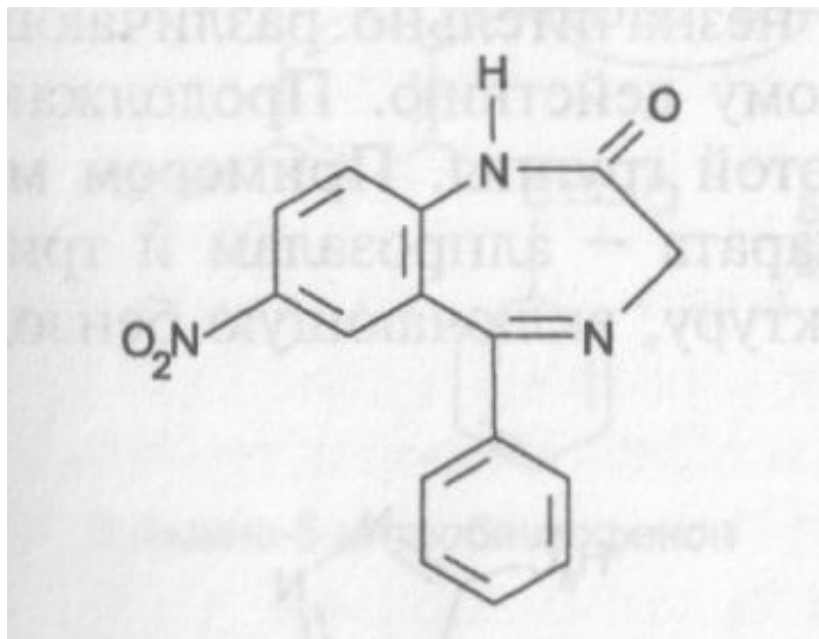


5-Фенил-3H-1,4-бензодиазепин

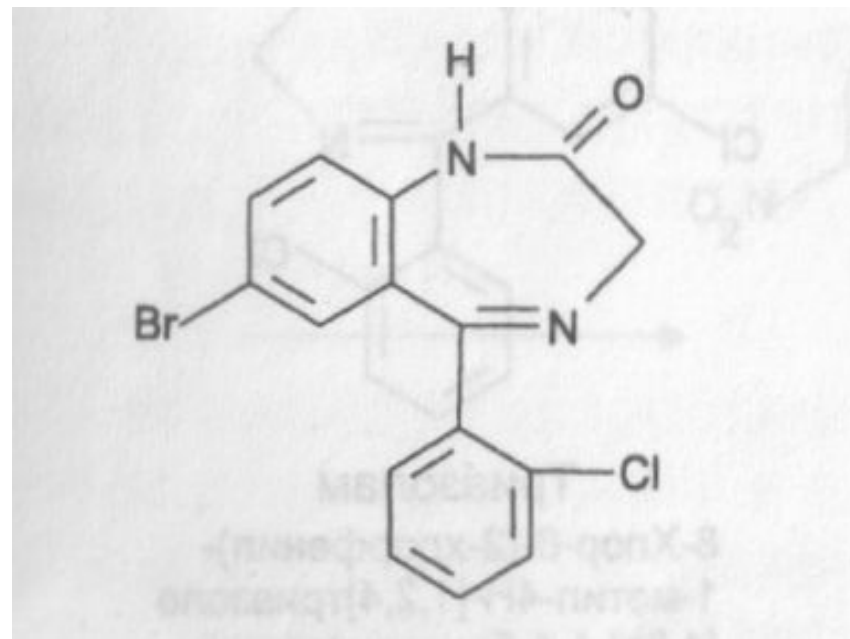


1,2-Дигидро-3H-1,4-бензодиазепин-2-он

Дәрілік туындылары



35а-сурет. Нитразепам



35б-сурет. Феназепам

Оқулықтар

1. Тюкавкина Н.А., Бауков Ю.М. Биоорганическая химия. Москва. Медицина. 1985. 480б.
2. Тюкавкина Н.А., Бауков Ю.М. Практикум по биоорганической химии. Москва. Медицина. 1985. 120б.
3. Шайқұтдінов Е.М., Төреханом Т.М., Шәріпханов А.Ш. Органикалық химия. Алматы. Білім. 1999.
4. Патсаев Ә.Қ. Биоорганикалық химия. Алматы. 2004.
5. Патсаев Ә.Қ., Дәуренбеков К.Н. Биоорганикалық химияның тәжірибелі - зертханалық сабақтарына қолданба. Шымкент. 2006.