

Западно-казахстанский

**государственный медицинский
университет имени Марата
Оспанова**



Тема: Алкалоиды

**Кафедра: химических дисциплин с курсом
фармацевтических дисциплин**

Выполнили: Бурпиев Н. Асмаатов.А

Проверила: Бисеналиева З.Т.

Группа: 123А



Цель:

Углубить знания студентов о строении, особенностях химического поведения алкалоидов, обладающих биологической активностью



План:

1. Актуальность
2. Основная часть:
 - 1) Алкалоиды и принципы их классификации.
 - 2) Строение и свойства биологически важных гетероциклических соединений: никотин, кофеин, хинин, морфин.
 - 3) Механизм действия этих соединений на организм человека
3. Заключение
4. Литература

Понятие алкалоиды не является строгим. Принято алкалоидам называть азотсодержащие органические соединения гетероциклического строения, обладающие ярко выраженным физиологическим действием на организм человека и животных. Большинство алкалоидов обладает сложным строением. Лечебные и ядовитые свойства экстрактов многих растений были известны еще в глубокой древности. Термин «алкалоид» («похожий на щелочь») был предложен в 1819 фармацевтом В. Мейснером. Строение первого алкалоид – кониина – было установлено в 1886г., и после этого развитие химии алкалоидов пошло вперед гигантскими шагами. изучение алкалоидов по сей день является актуальным, т.к. их строение и свойства до конца не изучены, в частности - влияния алкалоидов на организм

Основная часть

1) Алкалоиды и принципы их классификации

- **АЛКАЛОИДЫ** (ОТ ПОЗДНЕЛАТ. АЛКАЛИ — ЩЕЛОЧЬ ИЛИ АРАБ. AL-QALI — РАСТИТЕЛЬНАЯ ЗОЛА И ДР.-ГРЕЧ. ΕΪΔΟΣ — ВИД, ОБЛИК) — группа азотсодержащих органических соединений природного происхождения (чаще всего растительного), преимущественно гетероциклических, большинство из которых обладает свойствами слабого основания; к ним также причисляются некоторые биогенетически связанные с основными алкалоидами нейтральные и даже слабокислотные соединения.

АЛКАЛОИДЫ В ХИМИКО-ТОКСИКОЛОГИЧЕСКОМ ОТНОШЕНИИ

Алкалоиды - органические азотистые основания сложного состава, встречающиеся в растениях (реже в животных организмах) и обладающие сильным фармакологическим действием.

Классификация алкалоидов:

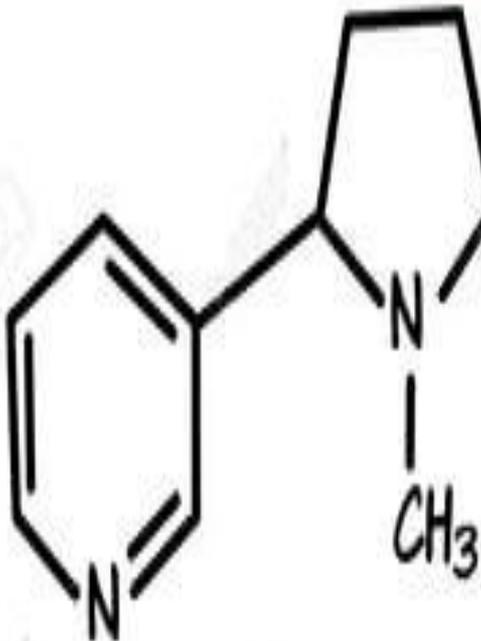
1. Производные пиридина, пиперидина и хинолизидина (жидкие алкалоиды):
 - а) моноциклические (кониин, ареколин)
 - б) бициклические (анабазин, никотин)
 - в) полициклические (пахикарпин)
2. Производные тропана (пиперидил-пирролидина): атропин, гиосциамин, скополамин, кокаин
3. Производные хинолина (α, β -бензопиридина): хинин
4. Производные изохинолина (β, γ -бензопиридина): (группа опийных алкалоидов):
 - а) производные фенантренизохинолина (морфин, кодеин, дионин, апоморфин, героин)
 - б) производные бензилизохинолина (папаверин, наркотин)
5. Производные индола (бензопиррола): стрихнин, бруцин, резерпин
6. Производные пурина: кофеин, теобромин, теофиллин
7. Производные 1-метилпирролизидина: саррацин, платифиллин
8. Ациклические алкалоиды: эфедрин
9. Алкалоиды стероидоподобного строения: вератрин
10. Алкалоиды неустановленного строения: аконитин

2) Строение и свойства биологически важных гетероциклических соединений: никотин, кофеин, хинин, морфин.

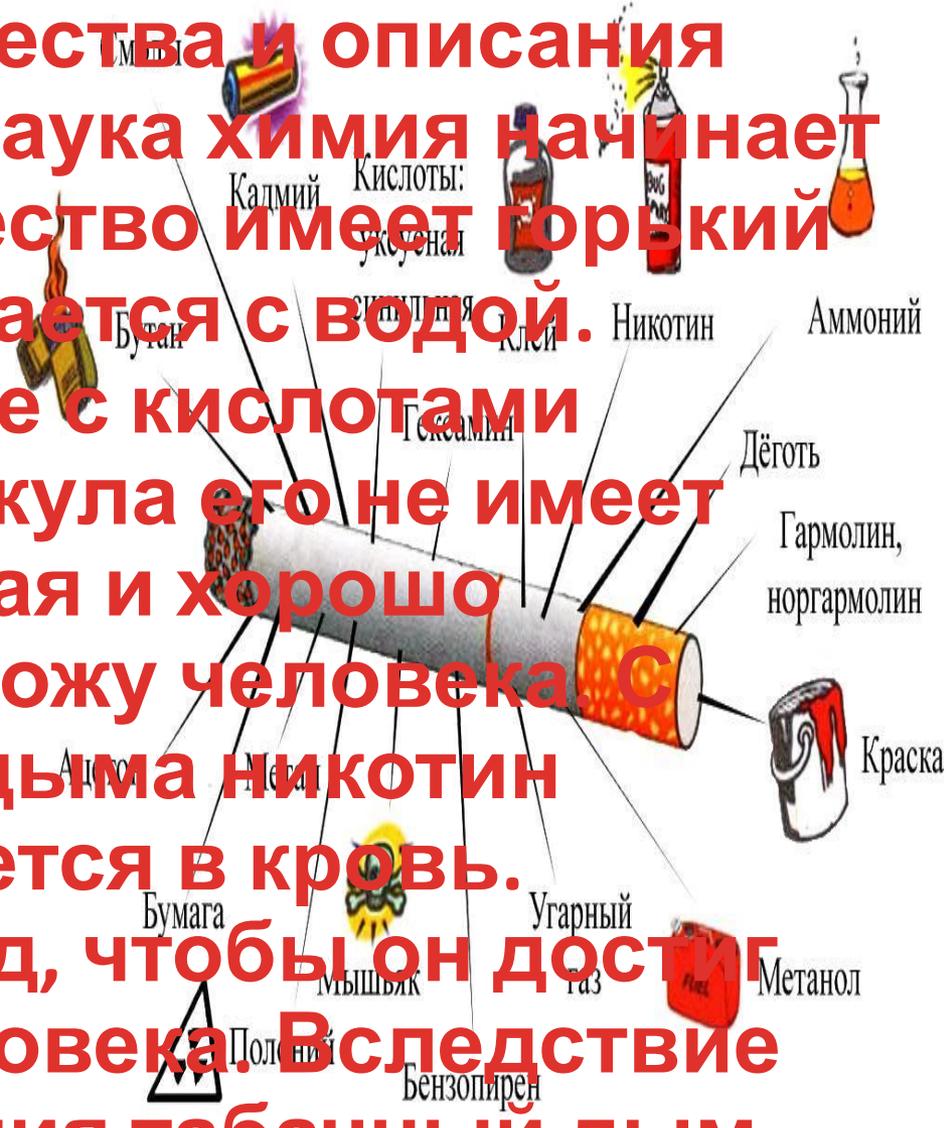
- А) Строение и свойства никотина

Никотин открыли в 1828 году германские научные сотрудники Кристиан Вильгельм Посселтон и Карл Людвиг Райманнон. Химическая формула никотина $C_{10}H_{14}N_2$ была выведена Луи Мельсеном в 1843 году. Современная наука уже хорошо изучила строение данного вещества и готова предоставить обширную информацию о никотине, есть даже классификация его производных и

NICOTINE



- Характеристику вещества и описания свойства никотина наука химия начинает так: это жидкое вещество имеет горький вкус и легко смешивается с водой. Никотин при контакте с кислотами образует соли, молекула его не имеет заряда, малополярная и хорошо всасывается через кожу человека. С момента вдыхания дыма никотин мгновенно всасывается в кровь. Достаточно 10 секунд, чтобы он достиг головного мозга человека. Вследствие постоянного вдыхания табачный дым накапливается в сосудах и сужает их проходимость. Иногда образуются закупорки и тромбы и тогда человеку



Табачный дым содержит около 4000 химических соединений, а табачный дым - около 5000 химических соединений, из которых примерно 60 вызывают рак

Физические и химические свойства

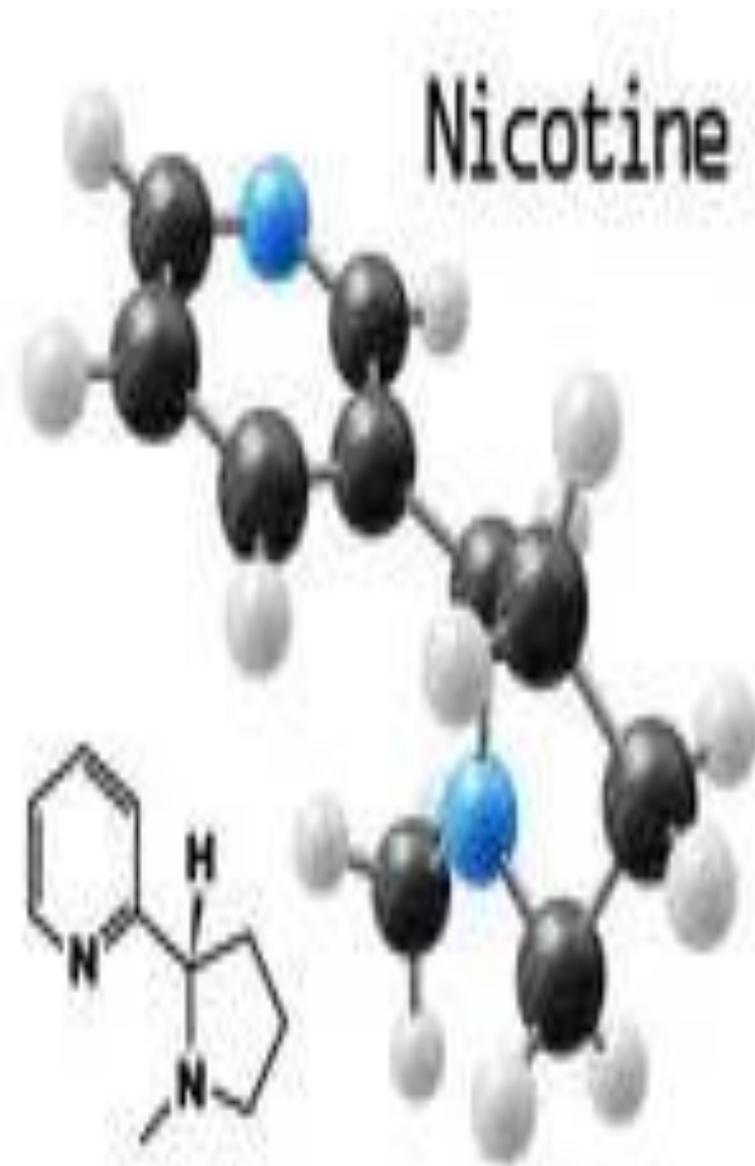
НИКОТИНА

Плотность никотина почти равна плотности воды (1,01 г/см³).

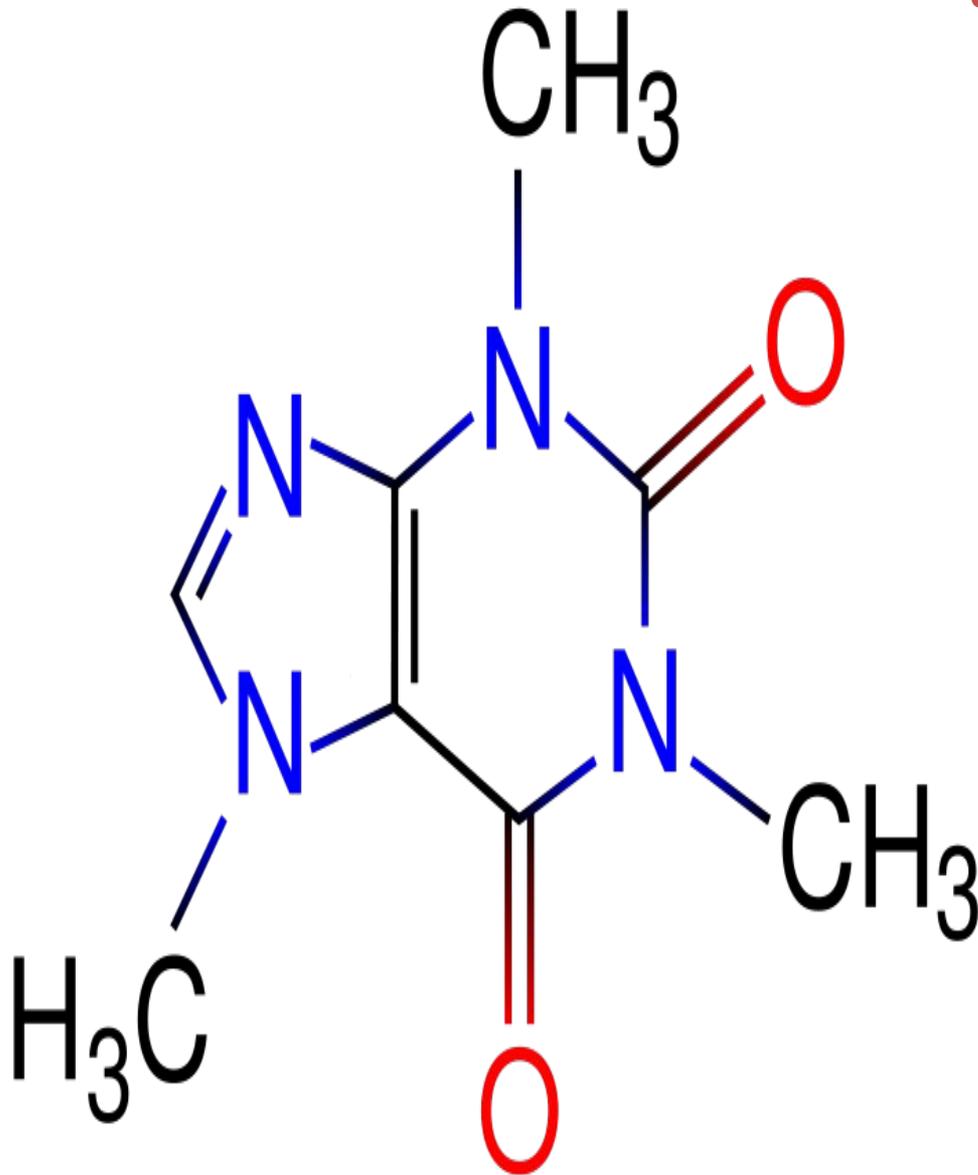
Молекула никотина состоит из пиридинового и пирролидинового циклов.

Пирролидиновый цикл принимает конформацию «конверт» с транс-расположением пиридинового цикла и N-метильной группы. Сорбция никотина через биологические мембраны зависит от pH и для слизистых оболочек ускоряется при высоких значениях pH, когда молекула никотина не имеет заряда. При физиологических значениях pH никотин протонирован на 69 %.

Никотин малополярен и хорошо растворим в средах с низкой полярностью, поэтому он хорошо всасывается через кожу и проникает в ткани мозга через гематоэнцефалический барьер. Никотин легко окисляется до цитотоксической

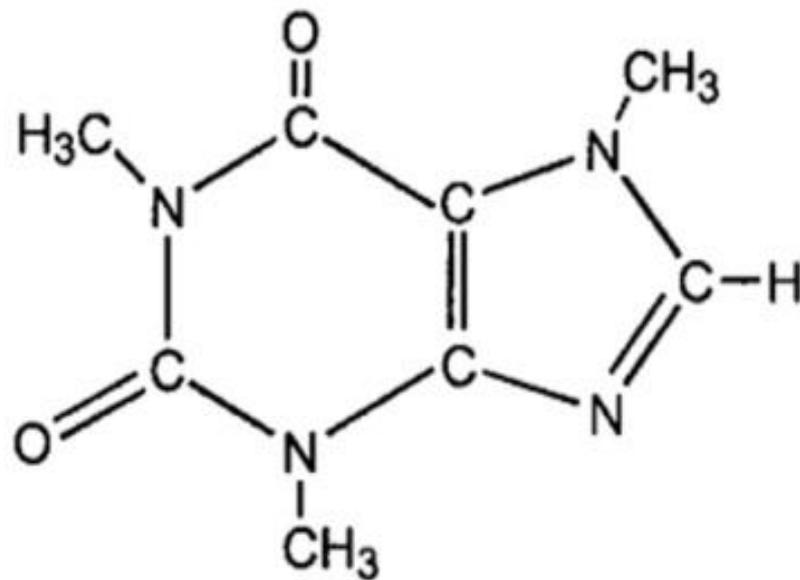
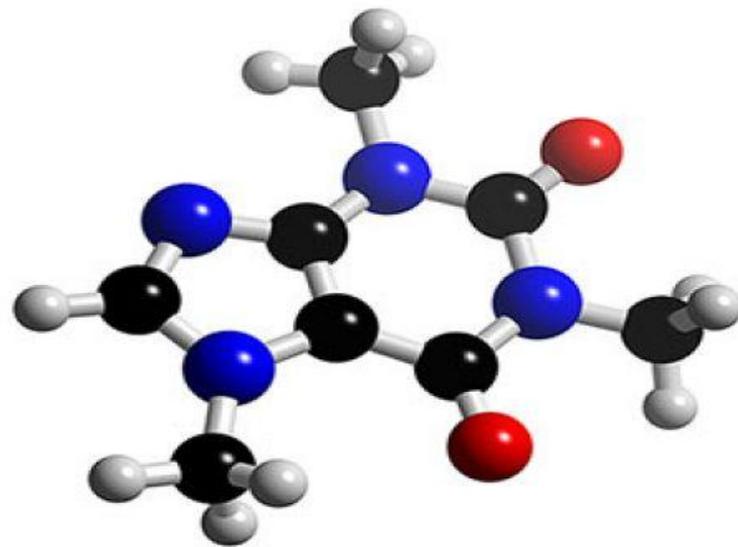


Б) Строение и свойства кофеина



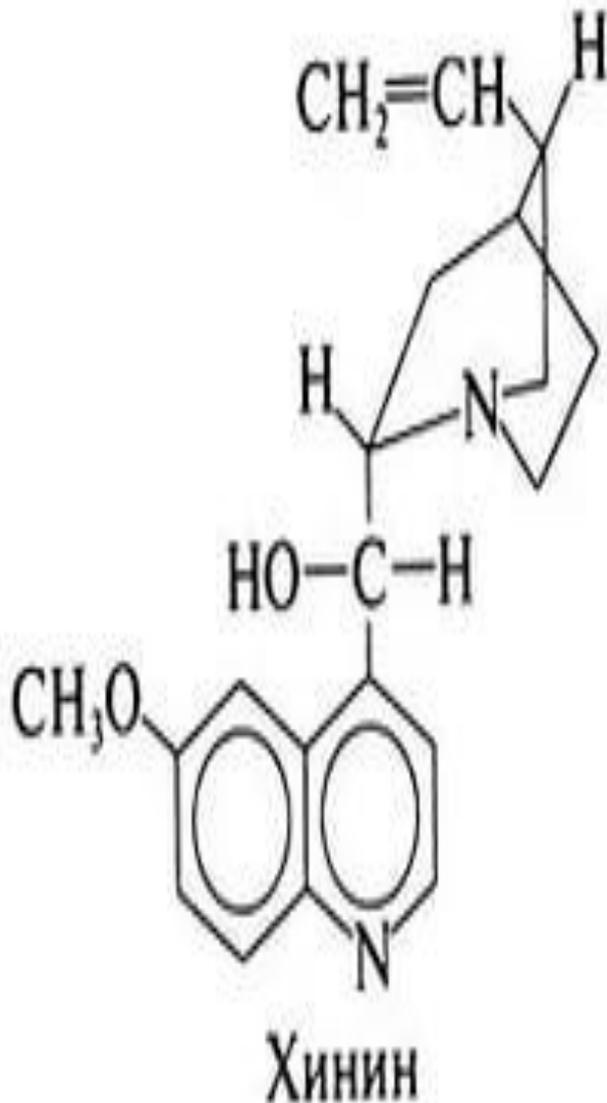
- *Химическое название кофеина — 1,3,7-триметил-ксантин. В щелочной среде (при $pH > 9$), превращается в кофеидин $C_7H_{12}N_4O$. По строению и фармакологическим свойствам кофеин близок к теобромину и теофиллину; все три алкалоида относятся к группе метилксантинов. Кофеин лучше действует на ЦНС, а теофиллин и теобромин — в качестве стимуляторов сердечной деятельности.*

- Кофеин, как и другие пуриновые алкалоиды, даёт положительную мурексидную реакцию, при нагревании с реактивом Несслера кофеин образует красно-бурый осадок, в отличие от теобромина, дающего в таких условиях светло-коричневое окрашивание. Белые игольчатые кристаллы горьковатого вкуса, без запаха. Хорошо растворим в хлороформе, плохо растворим в холодной воде (1:60), легко — в горячей (1:2), трудно растворим в этаноле (1:50). Растворы имеют



Caffeine

В) Строение и свойства хинина



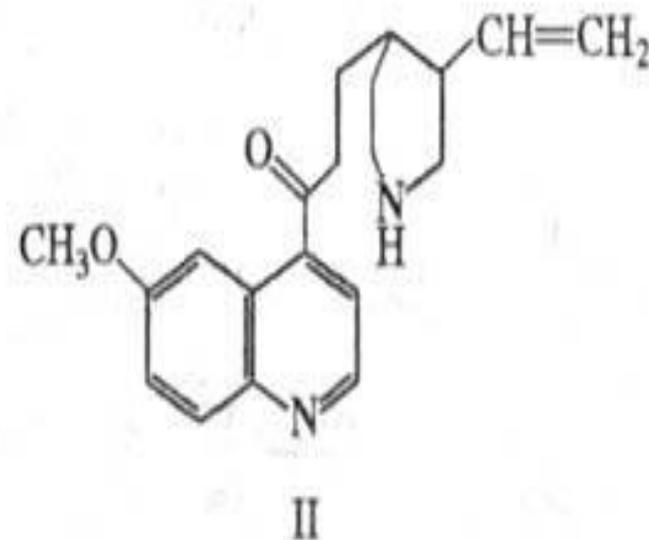
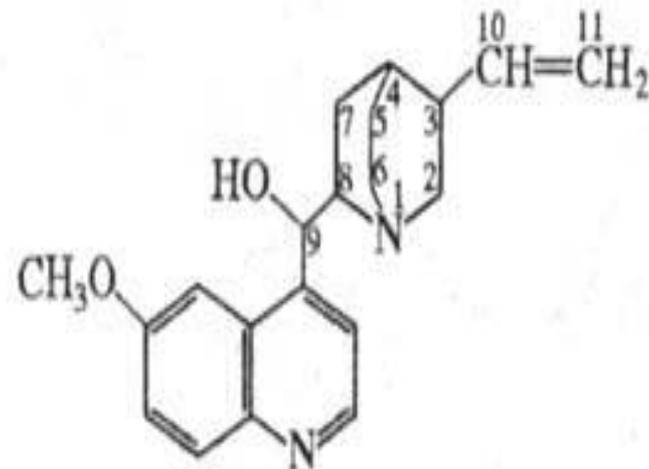
Строение хинина установлено на основании анализа продуктов его окисления хромовой кислотой, главные из которых хинолинкарбоновая (6-метокси-4-хинолинкарбоновая) кислота и мерохинен (3-винил-4-пиперидинуксусная кислота), и подтверждено полным синтезом (1945).

Известны 4 диастереомера хинина; все они синтезированы. Наиб.

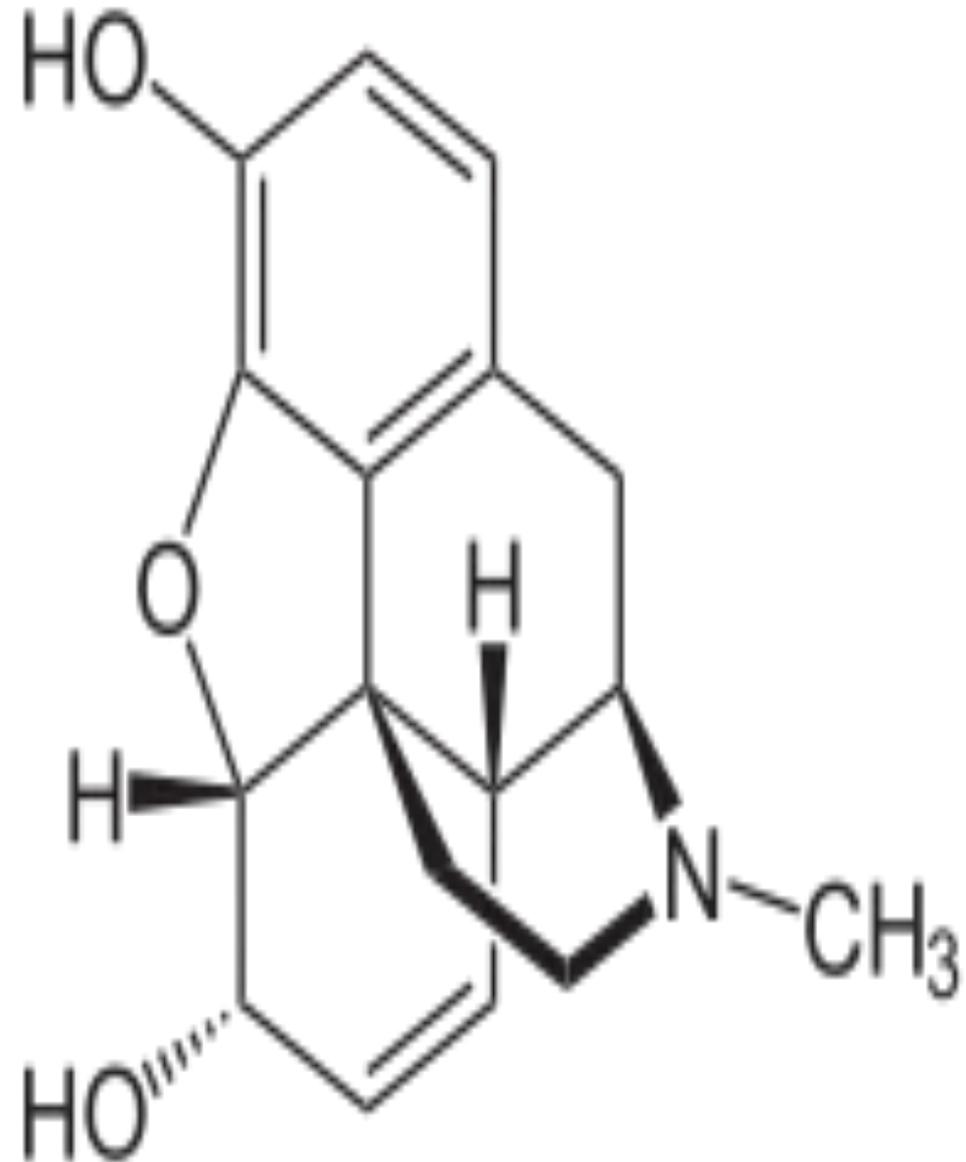
Физические и химические свойства

ХИНИНА

- Хинин - бесцв. кристаллы горького вкуса, мол. м. 324,4, т. пл. 177 °С, 6001-3.jpg -158 °С (этанол), плохо раств. в воде, хорошо - в этаноле, хлороформе, диэтиловом эфире. Из воды кристаллизуется в виде тригидрата, т. пл. 57 °С. Хинин имеет два атома N разной основности, образует два ряда солей, в к-рых протонируется либо хинуклидиновый атом N, либо оба атома азота. Соли представляют собой бесцв. кристаллы горького вкуса. Важнейшие из них: сульфат, т. пл. 205 °С (с разл.), плохо раств. в воде и этаноле; гидрохлорид, т. пл. 158-160 °С, раств. в этаноле, хуже - в воде; дигидрохлорид, хорошо раств. в воде и этаноле.



Г) Строение и свойства морфина



- Морфин-главный алкалоид опия, содержание которого в опиуме составляет в среднем 10 %, то есть, значительно выше всех остальных алкалоидов. Содержится в маке снотворном и в других видах мака. В нем содержится только один стереоизомер — (-)-морфин. (+)-Морфин был получен в результате синтеза и не обладает фармакологическими

Физические и химические свойства морфина гидрохлорида

Бесцветные призматические кристаллы, горького вкуса.

Химическая формула: $C_{17}H_{21}NO_4$
(по системе Хилла)

Молекулярная масса: 303,37 а. е. м.

Температура плавления: 254 °С

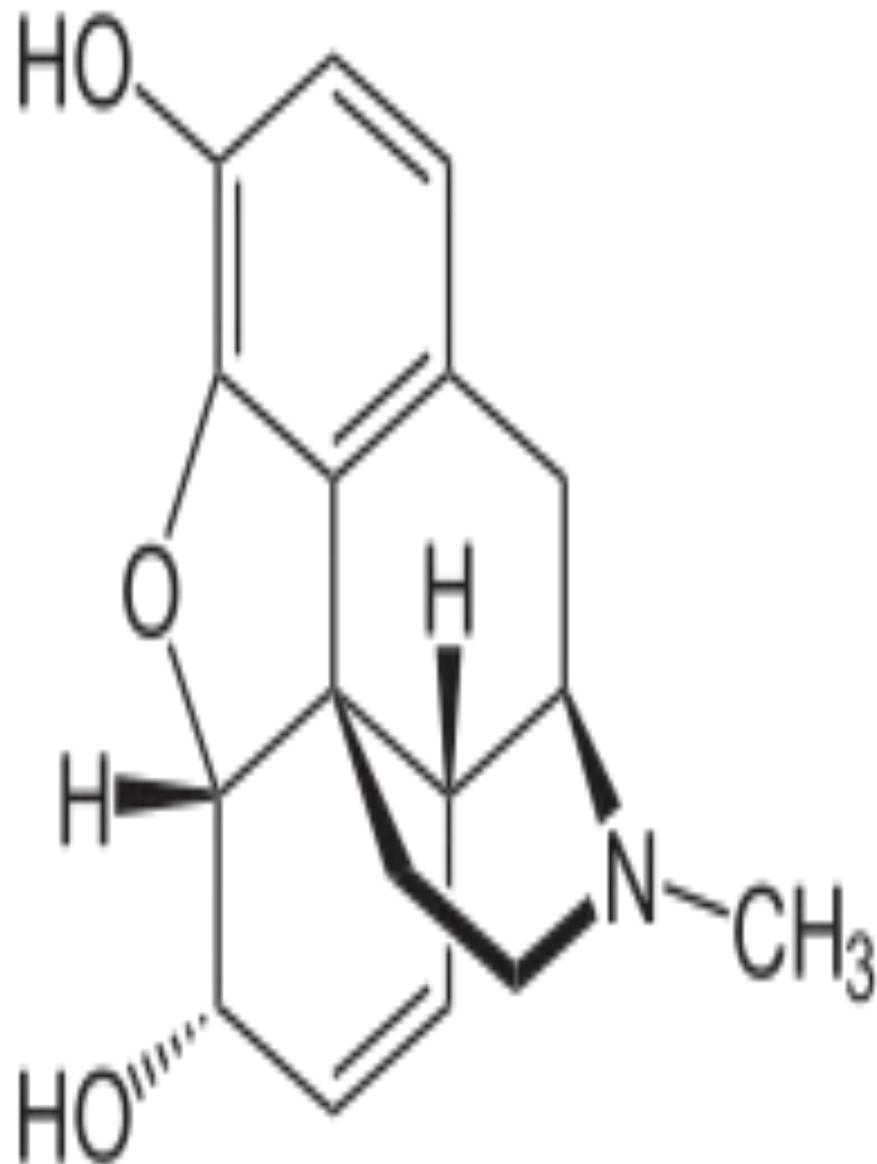
Плотность: 1,317 (20 °С, г/см³).

Белые игольчатые кристаллы или белый кристаллический порошок; слегка желтеющий или сереющий при хранении.

Медленно растворим в воде, трудно растворим в спирте (1:50).

Несовместим со щелочами.

Растворы стерилизуют при +100 °С в течение 30 мин, для стабилизации прибавляют 0,1 н. раствор хлористоводородной кислоты до рН 3,0—3,5.



МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ЭТИХ СОЕДИНЕНИЙ НА ОРГАНИЗМ ЧЕЛОВЕКА

• А) Никотин

Точкой действия никотина является никотиновый ацетилхолиновый рецептор. Ацетилхолиновые рецепторы — одни из самых важных рецепторов у всех позвоночных (в том числе у человека). Они бывают мускариновые и никотиновые.

В головном мозге человека представлены минимум пять вариантов — никотин действует на все, но с разной интенсивностью. Самая высокая чувствительность к никотину у рецепторов, которые в основном расположены на телах дофаминовых нейронов, участвующих в системе вознаграждения. Именно через них реализуется механизм никотиновой зависимости.

Сами по себе Н-холинорецепторы не являются возбуждающими, но они модулируют и влияют на другие активирующие нейромедиаторы. Никотин провоцирует выброс дофамина и глутамата (главный возбуждающий нейромедиатор мозга), в меньшей степени — серотонина и катехоламинов (адреналин и норадреналин).

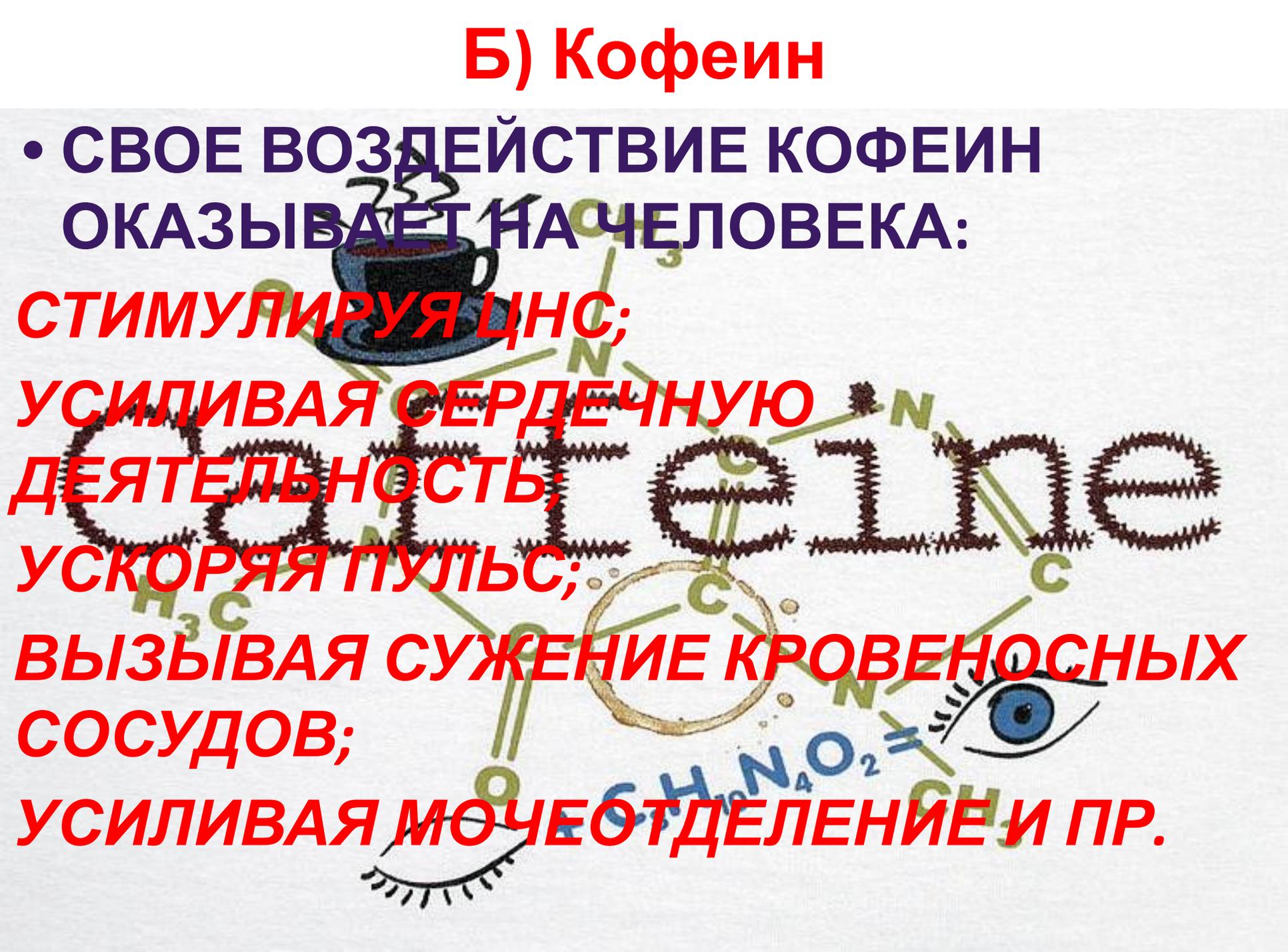
- Таким образом, никотин оказывает небольшое положительное действие на когнитивные процессы и мышление, концентрацию и внимание, стабилизирует эмоциональный фон, повышает устойчивость к стрессовым факторам, оказывает противотревожное действие, ускоряет реакцию, улучшает избирательную



Б) Кофеин

• СВОЕ ВОЗДЕЙСТВИЕ КОФЕИН
ОКАЗЫВАЕТ НА ЧЕЛОВЕКА:

**СТИМУЛИРУЯ ЦНС;
УСИЛИВАЯ СЕРДЕЧНУЮ
ДЕЯТЕЛЬНОСТЬ;
УСКОРЯЯ ПУЛЬС;
ВЫЗЫВАЯ СУЖЕНИЕ КРОВЕНОСНЫХ
СОСУДОВ;
УСИЛИВАЯ МОЧЕОТДЕЛЕНИЕ И ПР.**

The background of the slide is a collage of various elements. At the top left, there is a blue coffee cup with steam rising from it. The central and right portions of the background are filled with green and brown chemical structures, including what appears to be the caffeine molecule (1,3,7-trimethylxanthine) and other related compounds. At the bottom, there are two stylized eyes: one is blue with a black outline, and the other is black with a white outline. The overall theme is the physiological effects of caffeine on the human body.

- **Касаясь вопросы дозировки, оказывается:**

малые дозы действительно помогают стимулировать ЦНС на определенное время;

в дозах превышающих средний уровень вещество приводит к истощению нервной системы и утрачивает свой стимулирующий эффект. Кстати, длительное употребление способно вызвать определенную зависимость, степень которой определяется индивидуальными особенностями организма. Правда, сколько нужно времени для выработки зависимости сказать сложно, так как каждый организм реагирует на раздражитель по-разному;

большие дозы (около 200 мг на 1 кг веса) могут стать летальными и привести к смерти.



В) Хинин

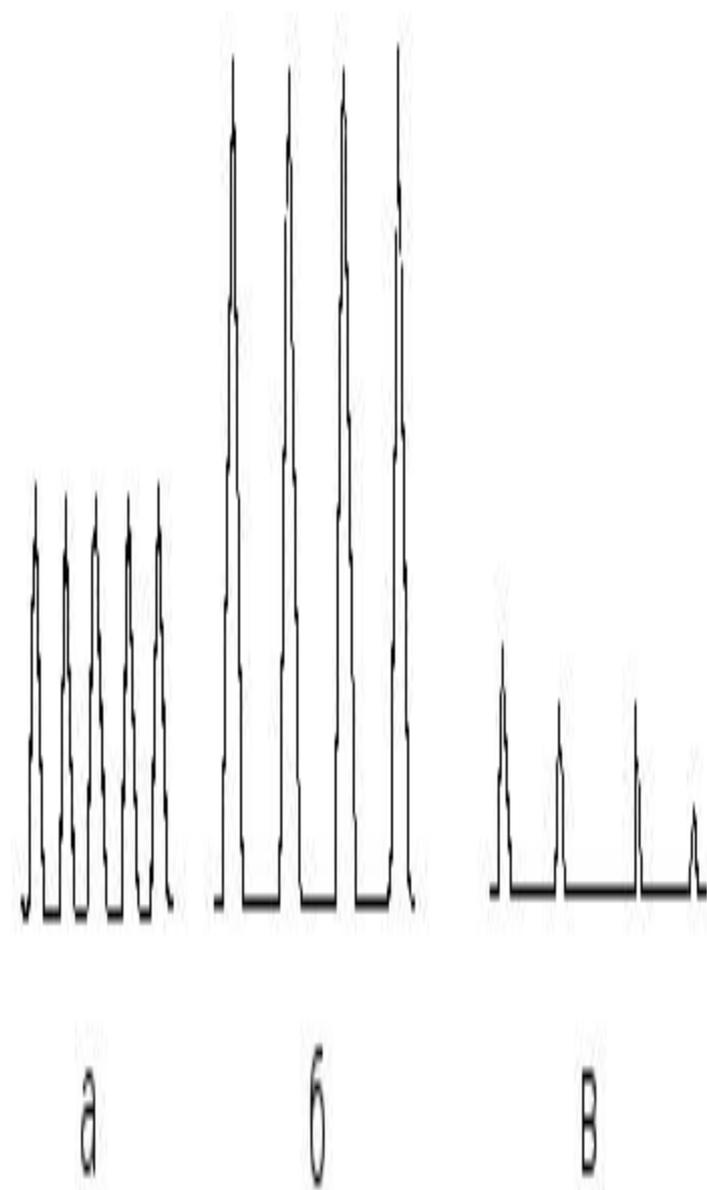
- Еще с самого начала использования этого средства люди знали о его полезных свойствах. Порошок хинного дерева оказывает такое действие на организм: **эффективно понижает температуру; снижает явления интоксикации при лихорадочных состояниях; облегчает боли; повышает аппетит благодаря стимуляции выработки желудочного сока; обладает слабым седативным эффектом; повышает тонус матки; нормализует ритм сердца и снижает возбудимость сердечной мышцы. Но самое главное свойство, из-за которого этот препарат популярен уже несколько сотен лет, - это его способность уничтожать малярийного плазмодия. Только применение хинина помогло справиться с малярией и снизить смертность от**



- **ПРЕПАРАТ ПРИМЕНЯЕТСЯ И В ДРУГИХ СЛУЧАЯХ:**
- **ПРИ СЛАБОЙ РОДОВОЙ ДЕЯТЕЛЬНОСТИ ДЛЯ ПОВЫШЕНИЯ ТОНУСА МАТКИ;**
- **В ПОСЛЕРОДОВОМ ПЕРИОДЕ С ЕГО ПОМОЩЬЮ ЛЕЧАТ ГИПОТОНИЮ МАТКИ;**
- **В КОМПЛЕКСНОЙ ТЕРАПИИ СЕРДЕЧНО-СОСУДИСТОЙ НЕДОСТАТОЧНОСТИ.**

Г) Морфин

- **Весьма выражено угнетающее действие морфина на дыхание. В терапевтических дозах он вызывает урежение и углубление дыхательных движений (рис. 1). При этом явления кислородного голодания организма не наступают, так как уменьшение частоты дыхательных движений компенсируется за счет увеличения их объема (глубины). При применении морфина в токсических дозах урежение дыхания сопровождается уменьшением глубины дыхательных движений (см. рис. 1, в), вентиляция легких снижается и развиваются признаки гипоксии. В случае тяжелого отравления морфином дыхание становится неправильным.**



- *Механизм действия морфина на дыхание обусловлен прямым угнетающим влиянием препарата на дыхательный центр. Под влиянием морфина понижается чувствительность дыхательного центра к содержащейся в крови углекислоте, которая является естественным физиологическим раздражителем этого центра.*
- *Морфин угнетает возбудимость кашлевого центра, оказывая тем самым противокашлевой эффект. Таким образом, на центры болевой чувствительности, а также на дыхательный и кашлевой центры морфин действует угнетающе.*
- *К числу нервных центров, которые возбуждаются под влиянием морфина, относятся центры глазодвигательных и блуждающих нервов, а также рвотный*



ЗАКЛЮЧЕНИЕ

- В данной работе я попытался составить с помощью научной литературы общее представление об алкалоидах.
- Таким образом, можно заключить, что алкалоиды – весьма обширный класс органических соединений, оказывающих самое различное действие на организм человека.
- В этом состоит их важная роль, которую играют алкалоиды в химической науке в целом и в повседневной жизни в частности.

- 1. Органическая химия/ Под ред. Н.А. Тюкавкиной.- М.:Дрофа, 2002.Гл.14 стр 383.
- 2. Н.А. Тюкавкина, Ю.И. Байкова. Биорганическая химия.-М.:Медицина, 1985. Гл.15.7.
- 3. Руководство к лабораторным занятиям по биоорганической химии/ Под ред.Н.А.Тюкавкина.- М.:Медицина, 1985. Часть 4, тема 4.2.
- 4. Большая медицинская энциклопедия/ Под ред. Б. В. Петровского. –М.: Медицина, 1985. Т.15,26.
- 5. В.И. Добрынина, Биологическая химия. – М.1976.
- 6. М.Д. Швайкова. Токсикологическая химия. – М.1975.
- 7. Б.Н. Степаненко. Курс органической химии. – М.: Высшая школа, 1976, Гл.21. стр.275.

Спасибо
за
внимание!!!

