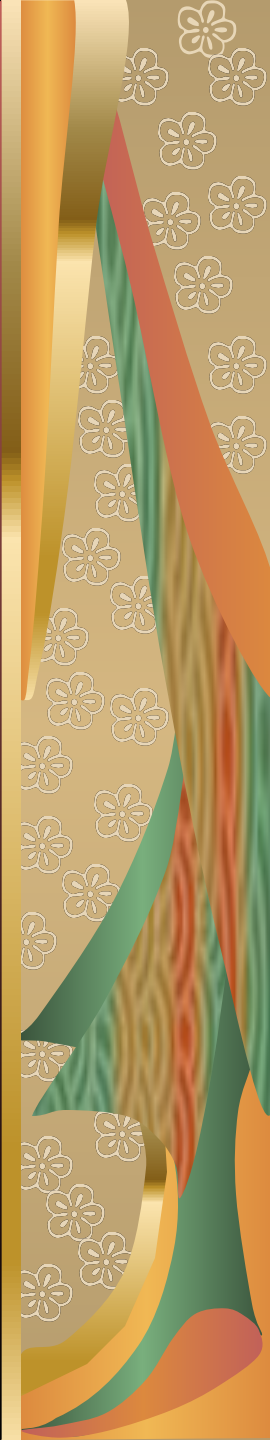


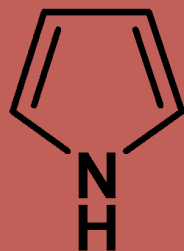
# Химия биологически активных веществ

## Лекция 3

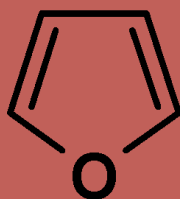
1. Другие химические свойства фурана, пиррола, тиафена
2. Биологически активные производные ряда фурана, пиррола, тиафена



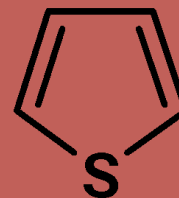
# Ароматические пятичленные гетероциклы с одним гетероатомом



пиррол

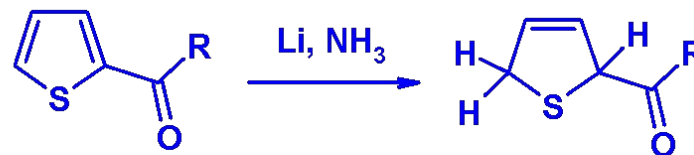
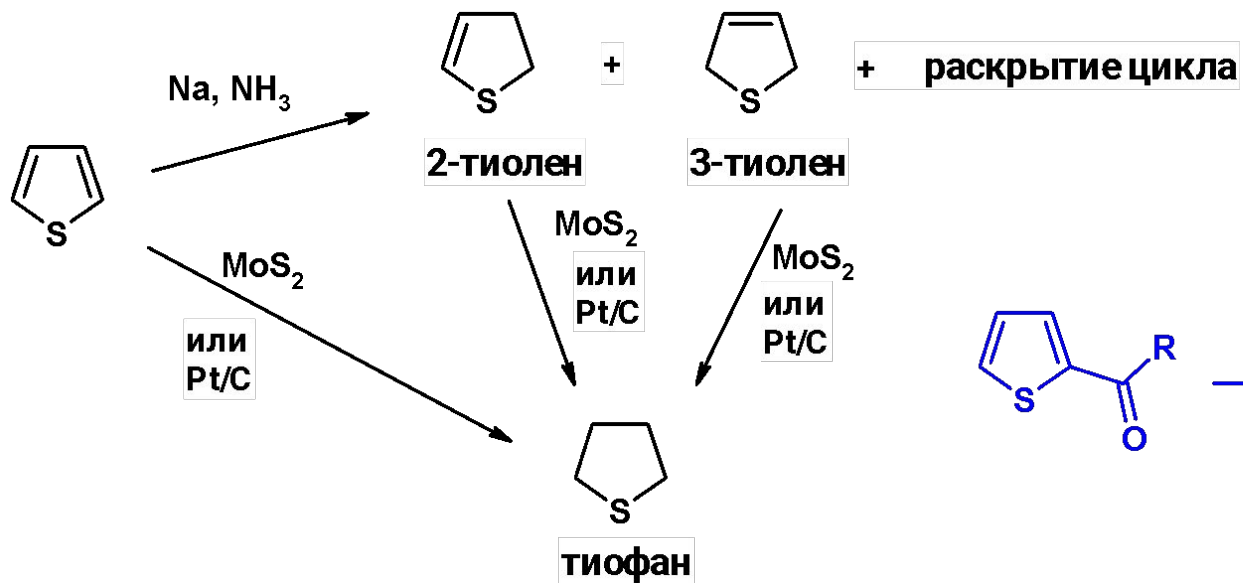
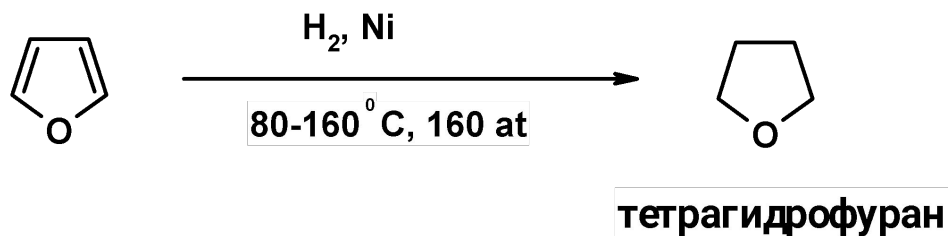
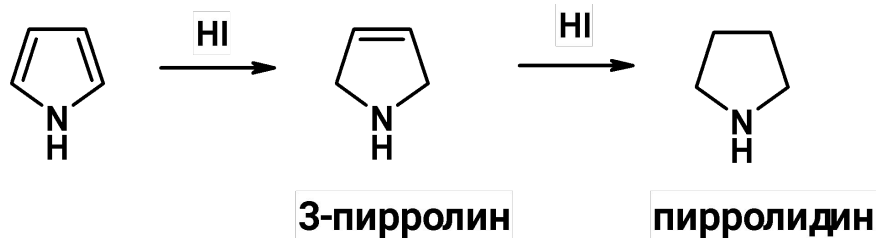


фуран

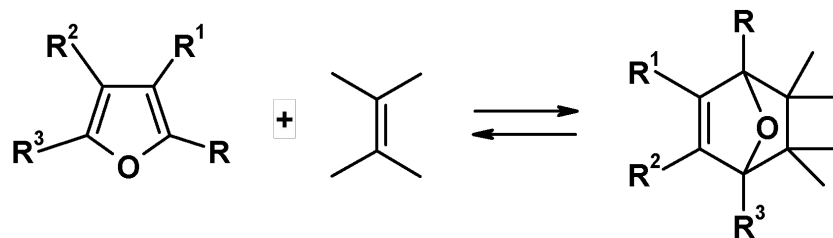


тиофен

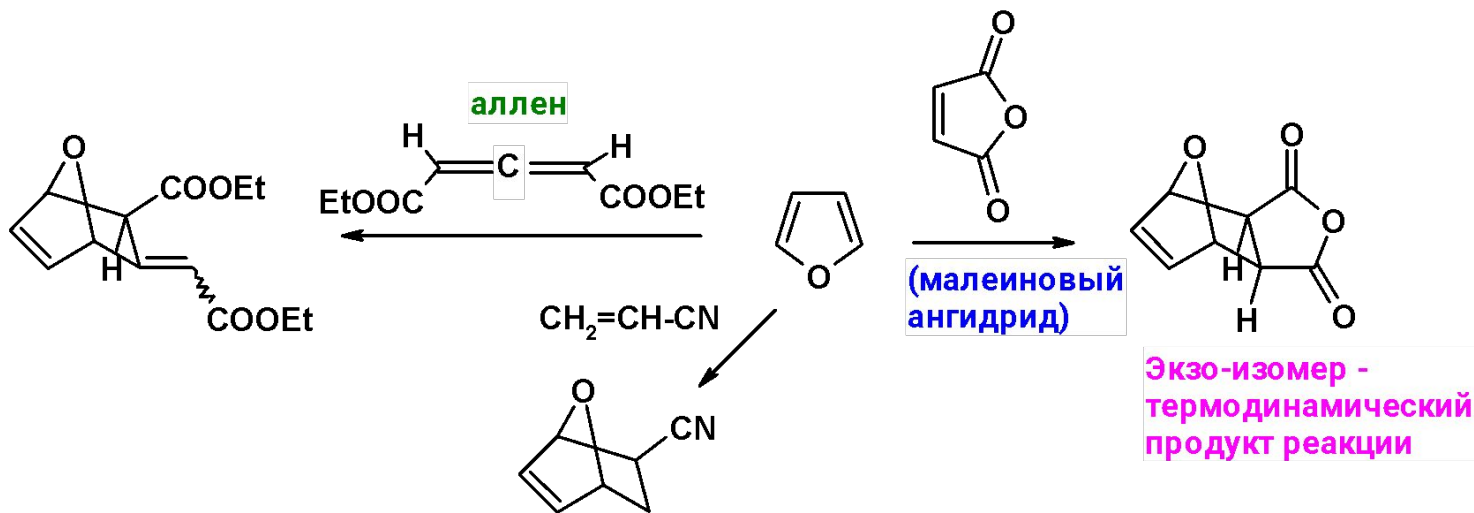
# Реакции восстановления пятичленных гетероароматических соединений



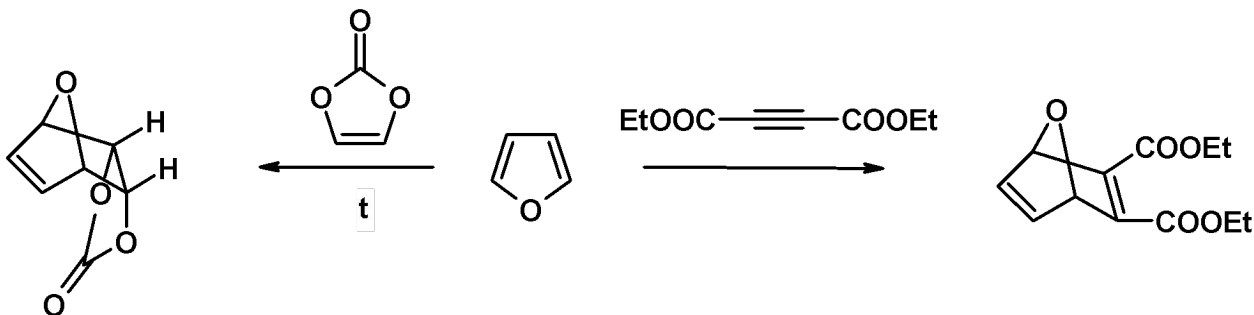
# Фуран в реакциях диенового синтеза



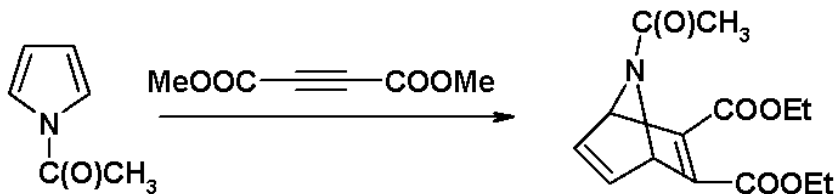
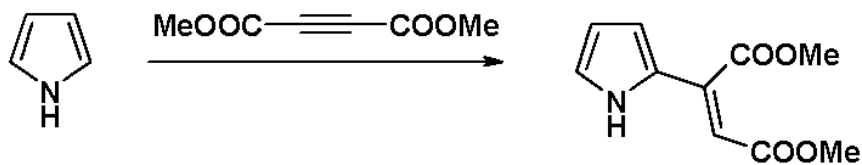
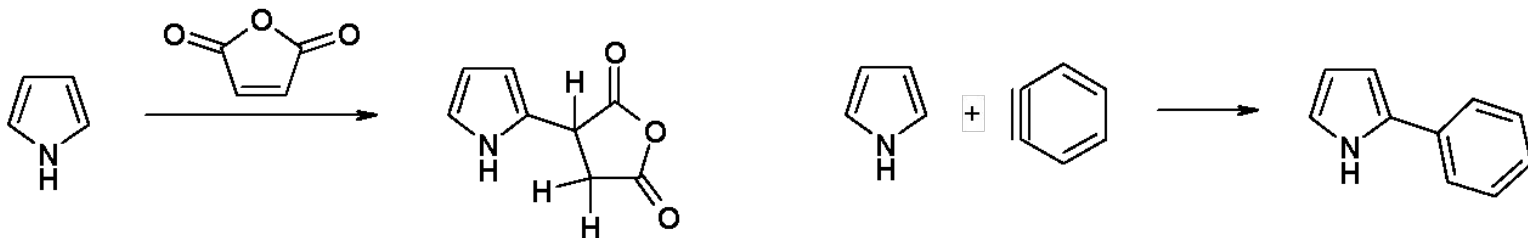
$R, R^1, R^2, R^3 = H, \text{Alk}, \text{Ar}$



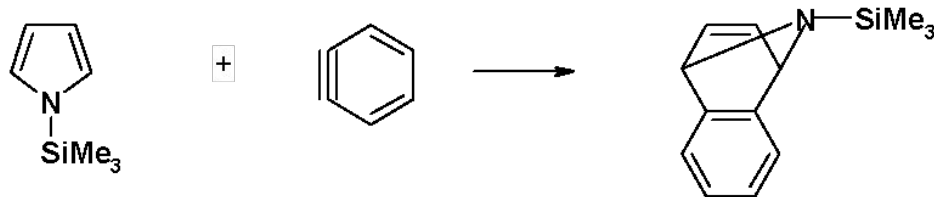
## Реакции с алкинами и электроноизбыточными алкенами



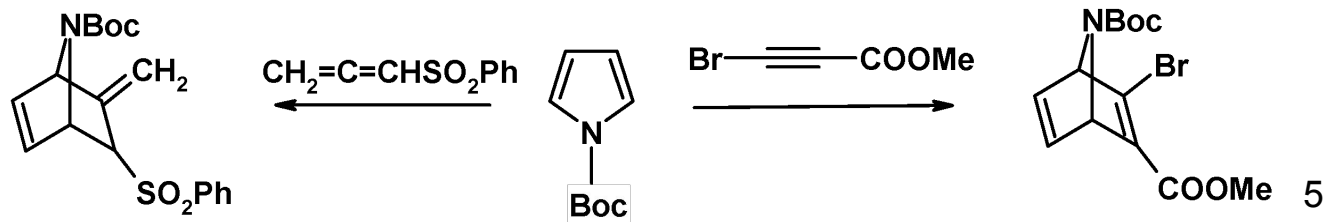
# Особенности реакции Дильса–Альдера в ряду производных пиррола



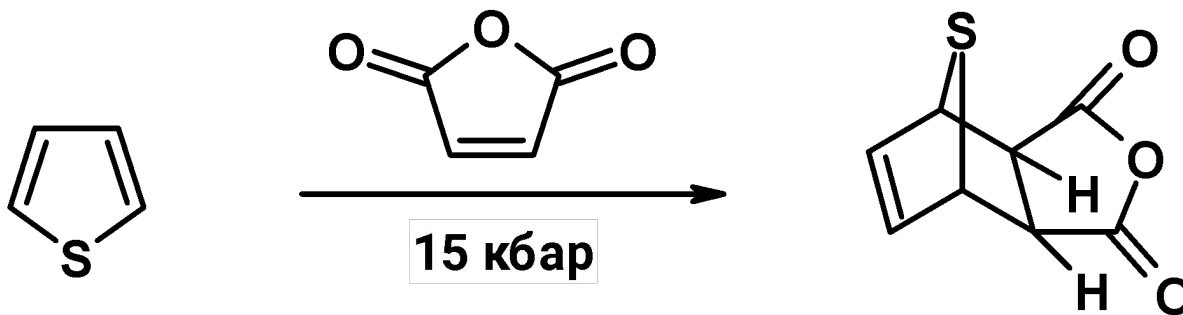
Высокое давление и присутствие  $AlCl_3$  ускоряют реакцию



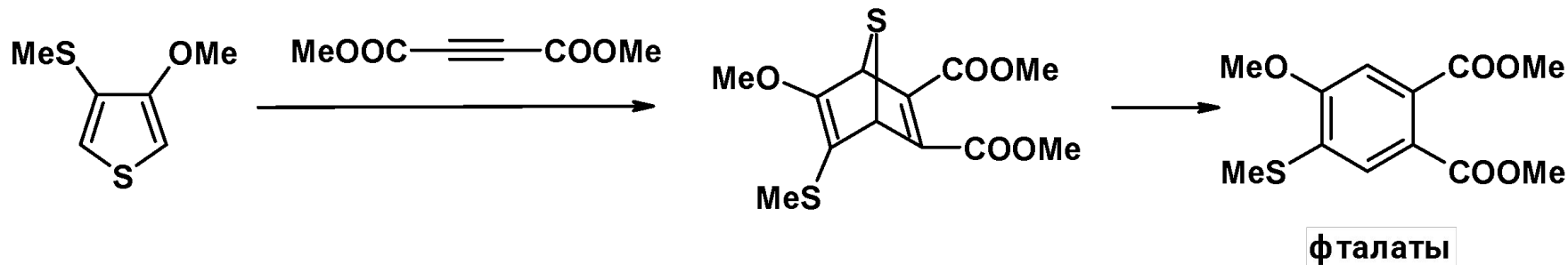
Реакции на основе N-трет-бутилокси-карбонилпиррола



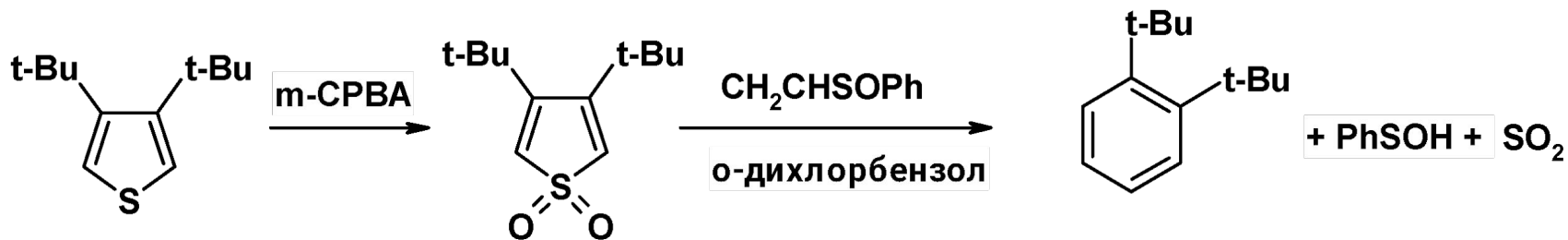
## Особенности реакции Дильса–Альдера в ряду производных тиофена



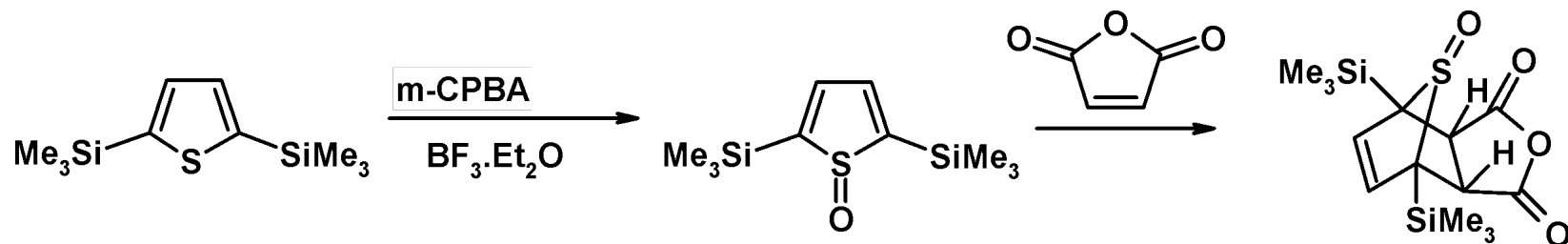
Экструзия атома серы из первоначально образующихся продуктов



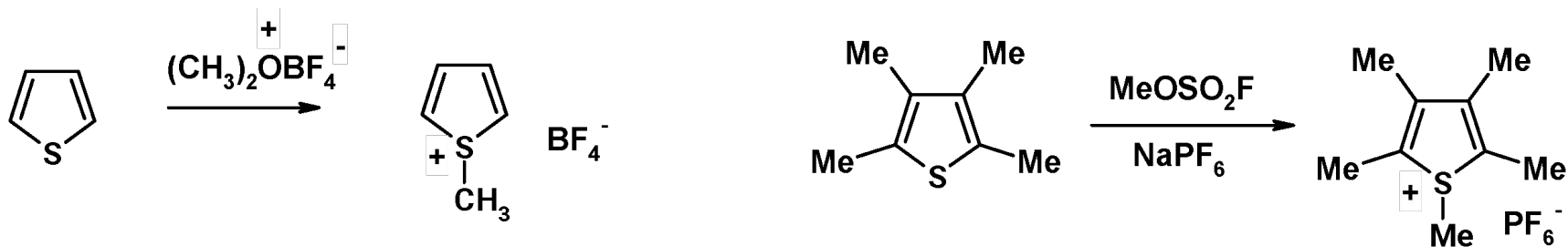
## Реакции окисления, участие оксидов и диоксидов тиофена в реакциях циклоприсоединения



m-CPBA – мета-хлорпербензойная кислота

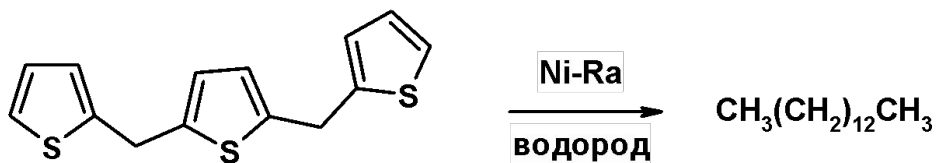
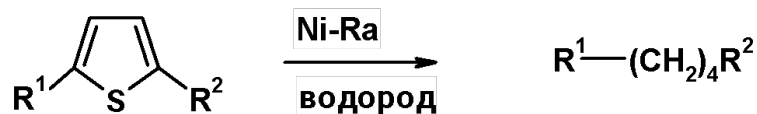


## Взаимодействие тиофена с алкилирующими агентами

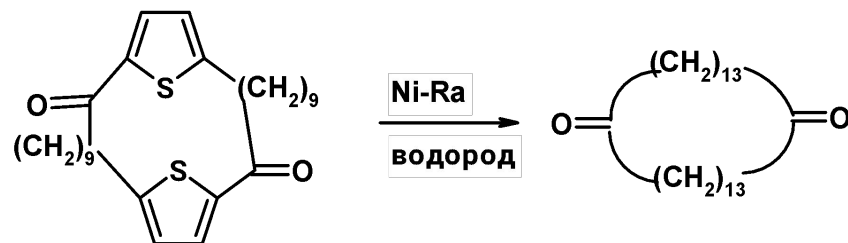
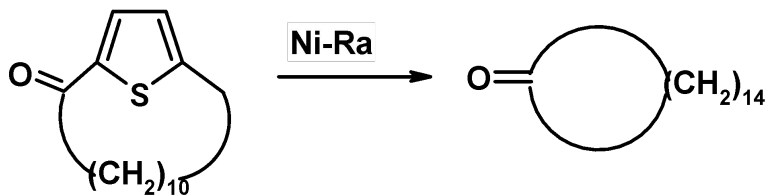


# Восстановительная десульфуризация тиофена

С образованием алифатических соединений

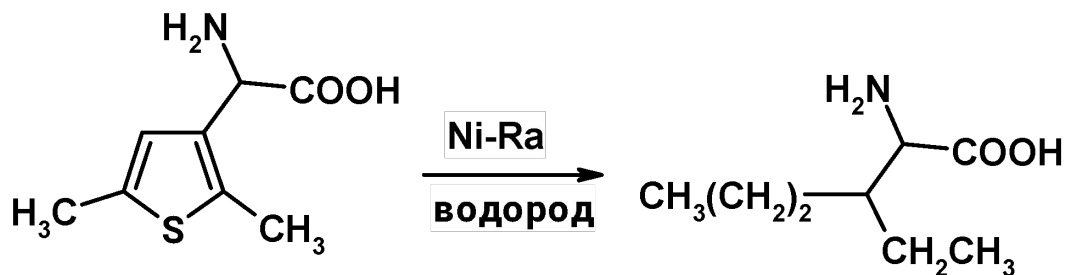
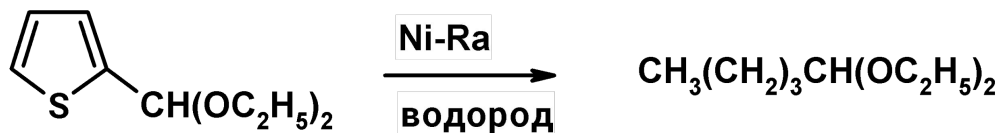


С образованием макроциклических кетонов

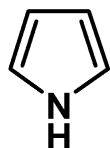




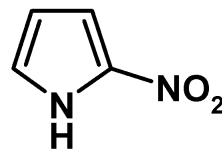
С образованием карбоновых кислот, аминокислот,  
аминоспиртов и других производных



# Свойства пиррольного атома азота

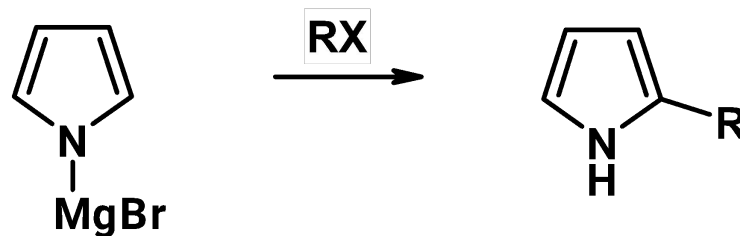


pKa = 17.5

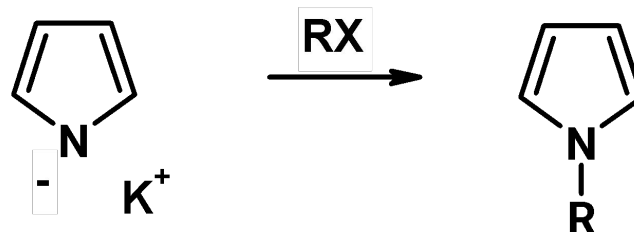


pKa = 10.6

Ковалентные соли  
алкилируются по атому  
углерода

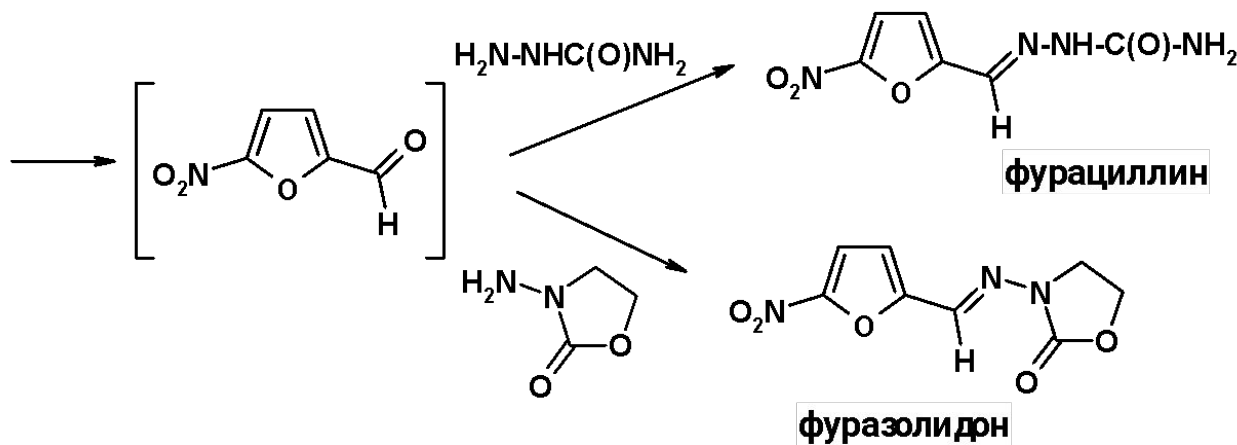
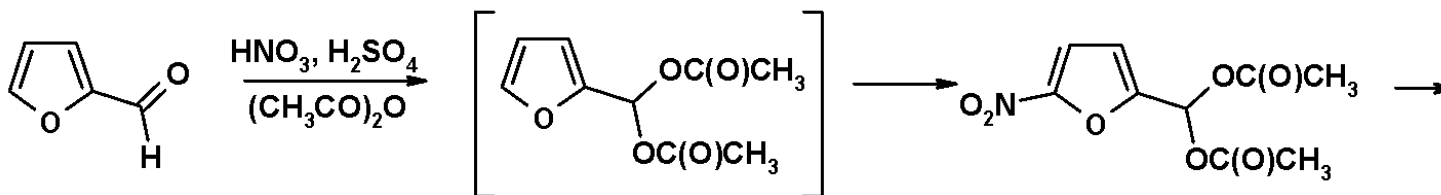


Ионные соли  
алкилируются по атому  
азота

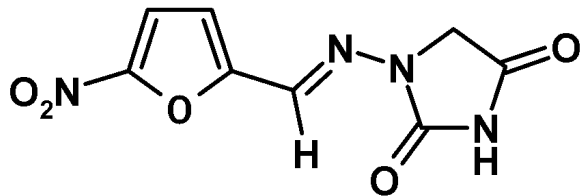


R = Alk, Ar, SiMe<sub>3</sub>

# Применение фурфурола в синтезе антимикробных средств



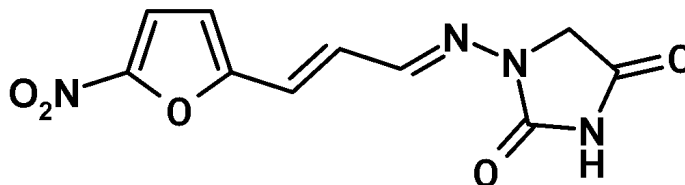
## Другие лекарственные препараты нитрофуранового ряда



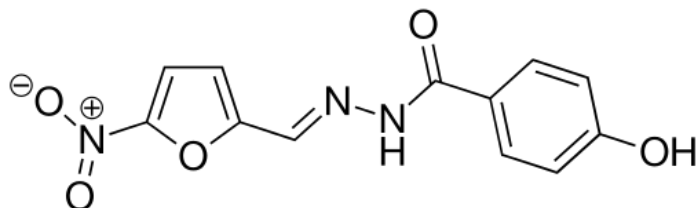
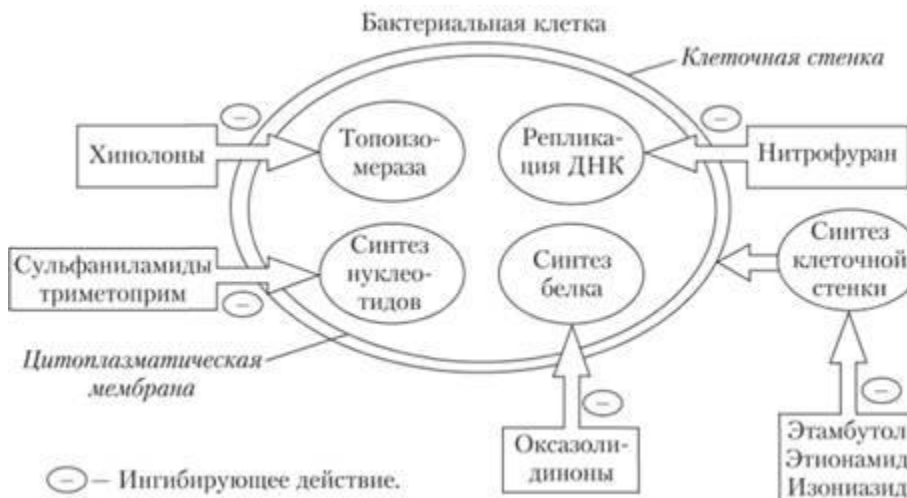
фурадонин

**Фурадонин** - эффективное средство для лечения цистита.

**Фурагин** используют для лечения инфекционно-воспалительных заболеваний мочевыводящих путей (пиелонефрит, цистит, уретрит), инфекций женских половых органов, профилактики инфекций при урологических операциях, цистоскопии, катетеризации.

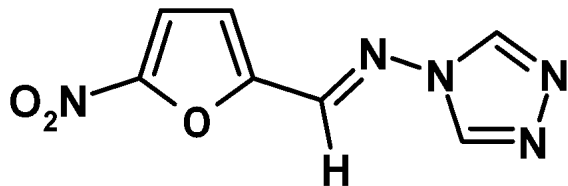


фуразидин (фурагин)

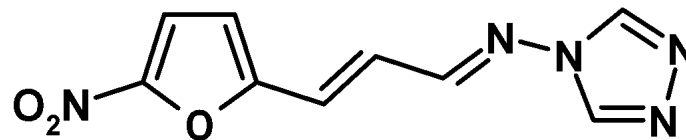


эрсефурил

применяется при кишечных инфекциях



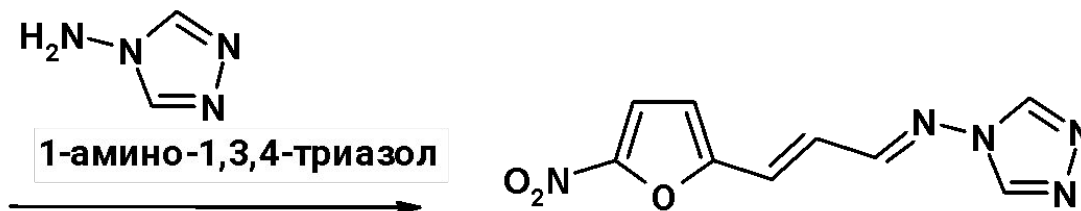
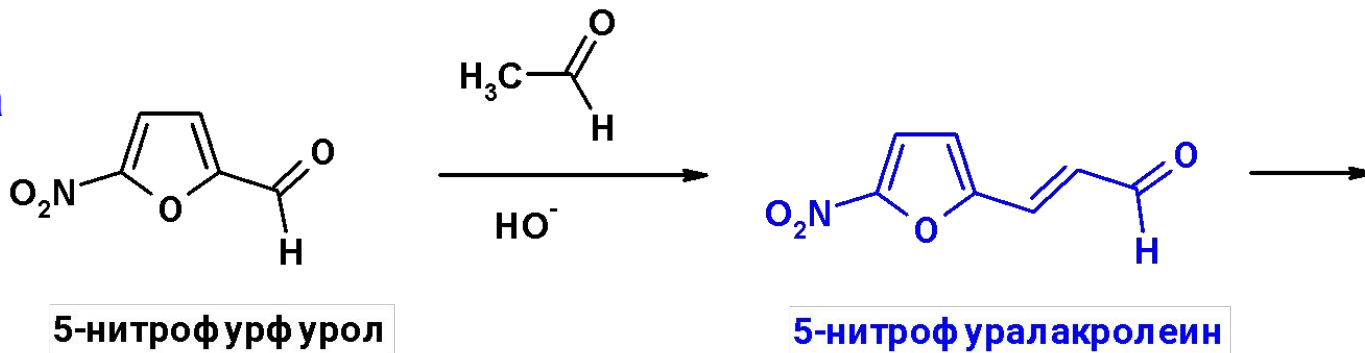
фуразонал



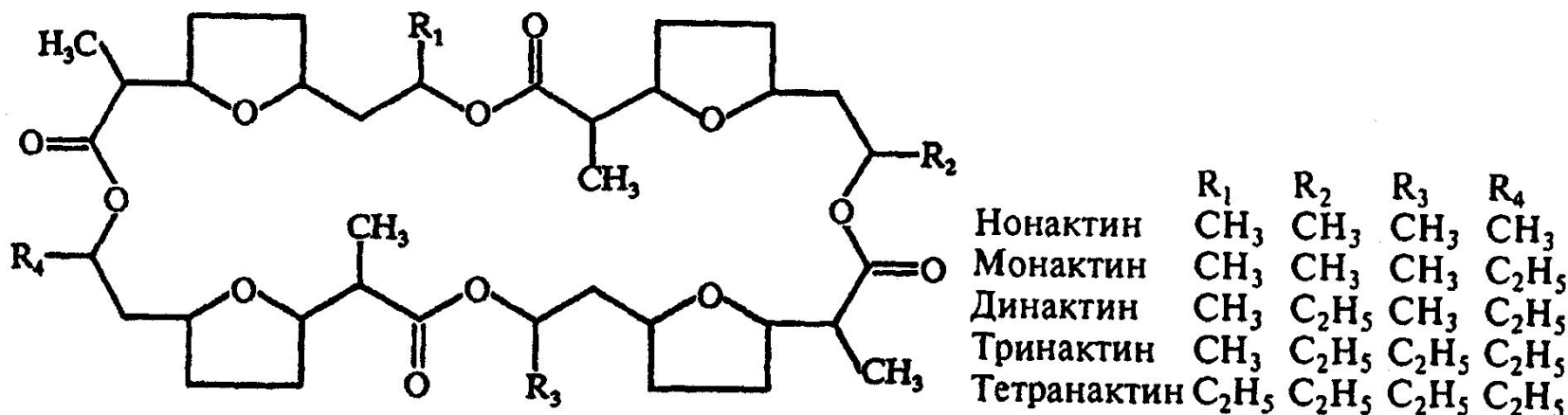
фуракрилин

**Фуразонал** применяют для лечения бактериальной дизентерии. **Фуракрилин** используют в хирургической практике при лечении некротической стадии ран. Фуракрилин превосходит по антимикробной активности близкий к нему по химическому строению фуразонал в 5—25 раз.

### Синтез фуракрилина



## Природные соединения, содержащие фрагменты фурана и тетрагидрофурана



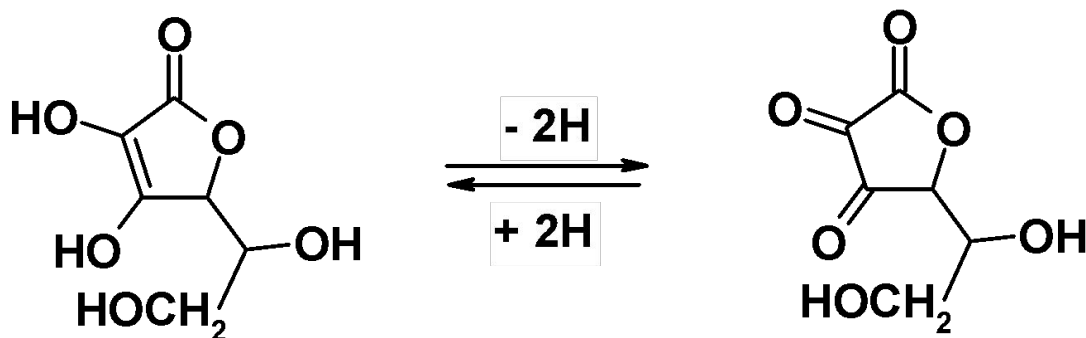
**Макролиды** - лактоны с числом атомов в цикле более 8

Продуцируются стрептомицетами *Streptomyces viridochromogenes*, *Streptomyces griseus*, *Streptomyces chryzomallus*

Подавляют развитие стафилококков (в том числе устойчивых к пенициллину, стрептомицину, эритромицину), гемолитического стрептококка, микобактерий и других организмов.

Обладают инсектицидной активностью, применяются для обработки рисовых плантаций в Японии

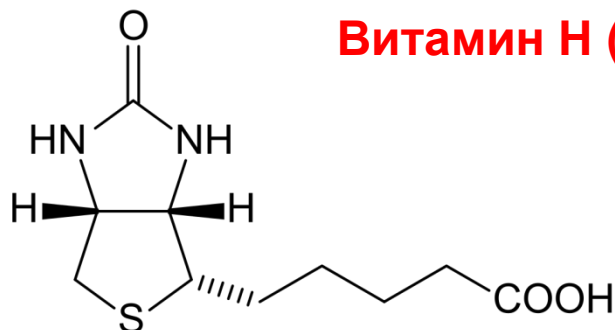
## Аскорбиновая кислота – витамин С



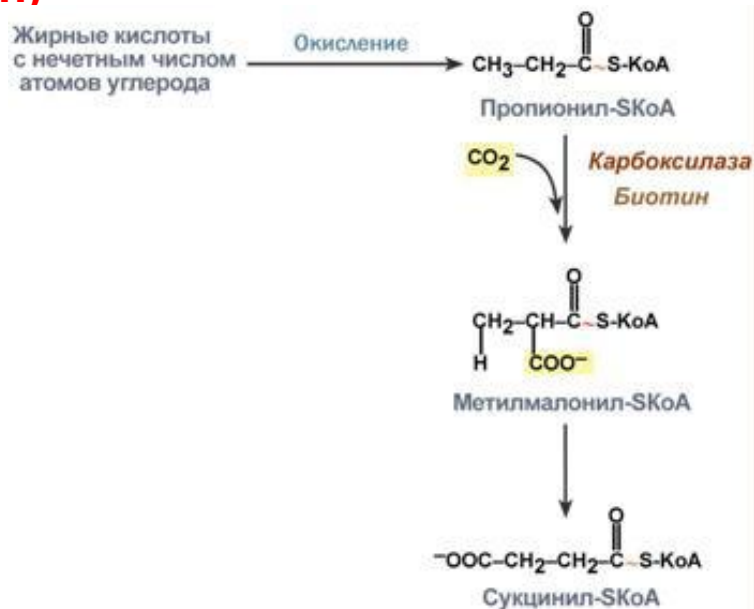
аскорбиновая кислота  
(восстановленная форма)

дегидроаскорбиновая кислота  
(окисленная форма)

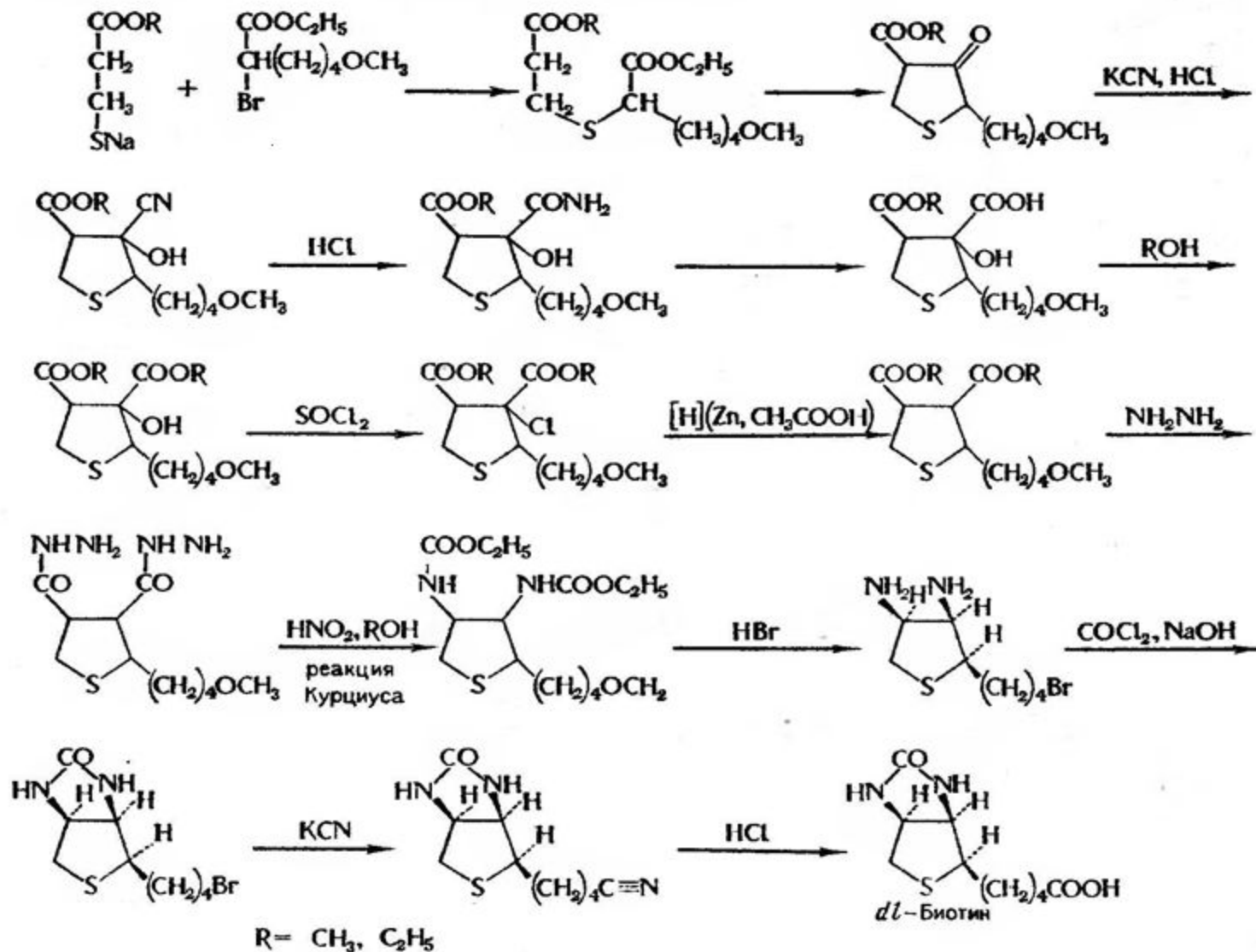
## Витамин Н (биотин)



Молекула биотина состоит из тетрагидроимидазольного и тетрагидротиофенового кольца, в тетрагидротиофеновом кольце один из атомов водорода замещён на валериановую кислоту.



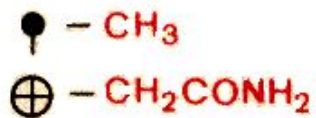
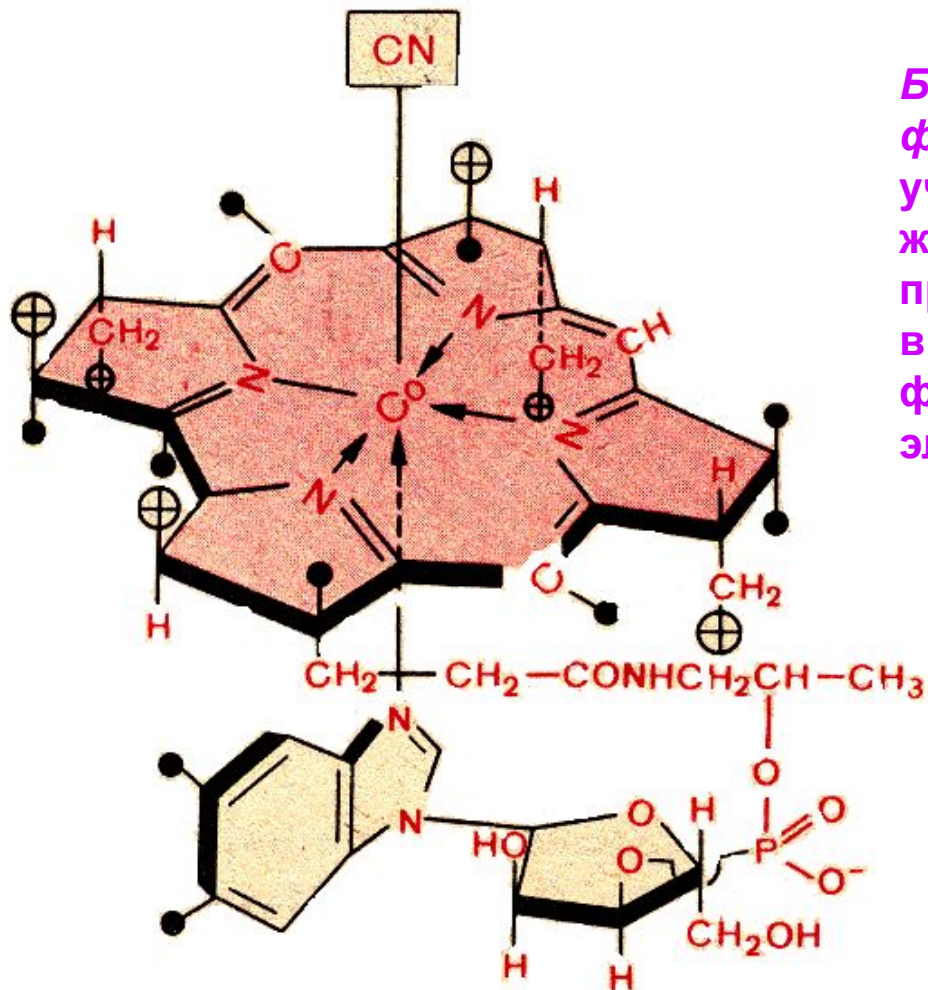
## Полный синтез биотина



Рацемический *dl*-биотин подвергают взаимодействию с L-(+)-аргинином с образованием смеси диастереомерных солей; после разделения и гидролиза получают *d*-(+)-биотин

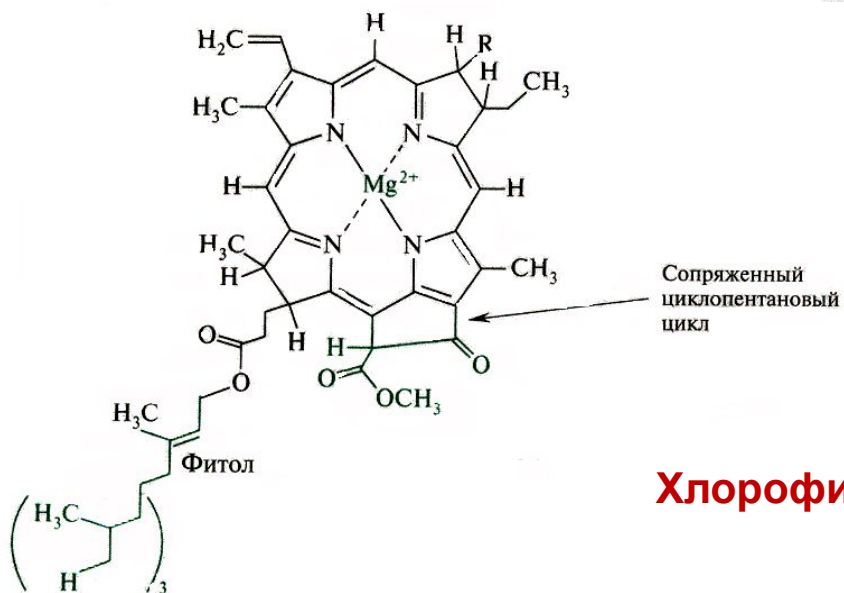
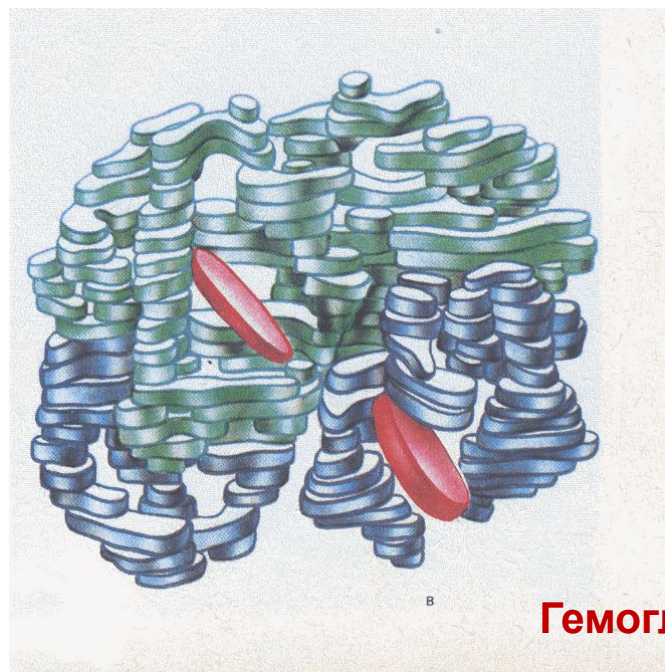
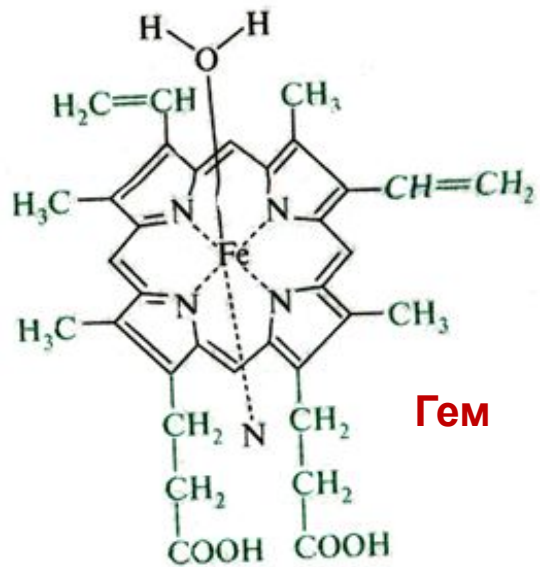


# Витамин В<sub>12</sub> (цианокобаламин)



**Биологические функции:**  
участие в обмене жиров к качестве протектора КоА, в образовании ферментных элементов крови.

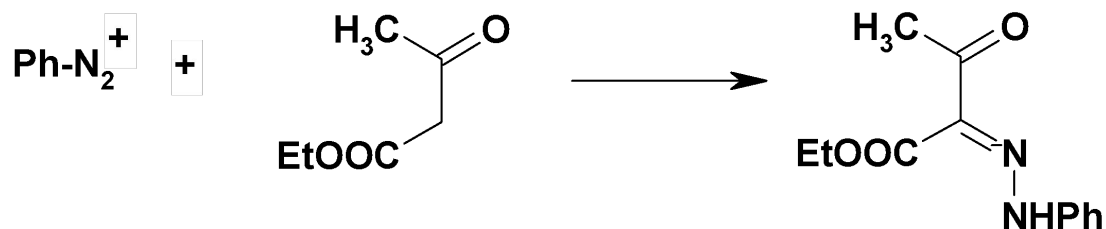
**Продукты:**  
печень, рыба, куриное яйцо



# Лабораторная работа №1

## Синтез пирролов по Кнорру в модификации Трейбса

### I Стадия. Образование гидразона сочетанием соли диазония с СН-кислотным соединением – ацетоуксусным эфиром



### II Стадия. Восстановление гидразона до гидразина, образование енамина, конденсация с ацетоуксусным эфиром



Курс лекций является частью учебно-методического комплекса  
«Химия биологически активных веществ»

автор:

- Носова Эмилия Владимировна, д.х.н., доцент кафедры органической химии УГТУ-УПИ –  
лектор

Учебно-методический комплекс подготовлен на кафедре органической химии  
химико-технологического факультета ГОУ ВПО УГТУ-УПИ

**Никакая часть презентации не может быть воспроизведена в  
какой бы то ни было форме без письменного разрешения авторов**