

Алкалоиды



Алкалоиды.

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

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

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

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

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

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

Алкалоиды.

Способы классификации алкалоидов:

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

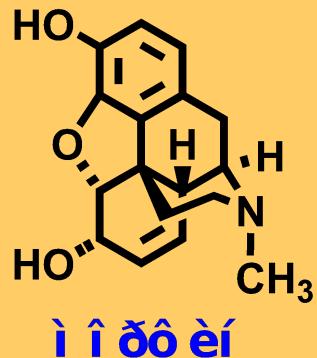
Наиболее богаты алкалоидами семейства бобовых (*Fabaceae*), паслёновых (*Solanaceae*), маковых (*Papaveraceae*), лютиковых (*Ranunculaceae*) и некоторых других.

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

Эфироносые и масличные растения почти не содержат алкалоидов.

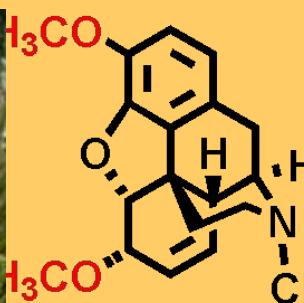
Группа морфина.

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

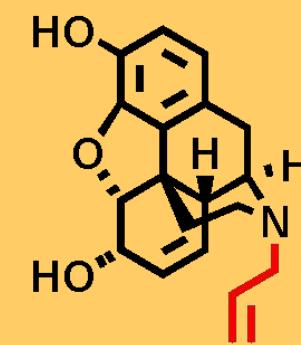
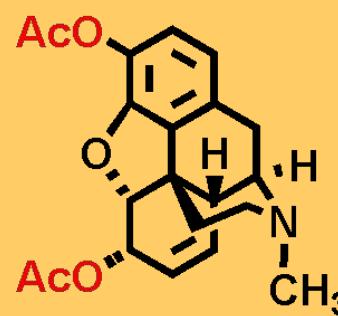


По химической классификации – к группе производных хинолина.

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

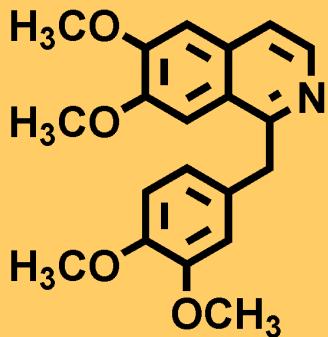


Í á î áëàäàåò
ïéí ðè-+åñéèí äåéñòâèåí ;
û çú âàåò ëí í âóëüñèè;
ÿâëüåñý âðåäí î é
ðèí añüþ â î i èéí û ô
í ðaï àðaðaðo

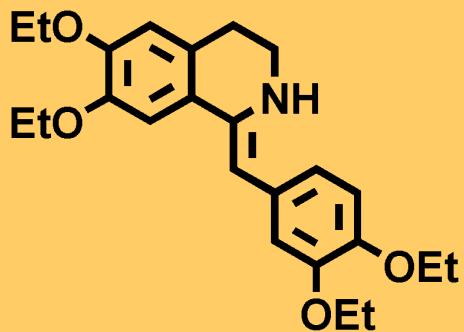


àí òàâí í èñò ì î ڈô ےí à;
í ðèí áí ýâðñý í ðè
ëå-åí èè í àðeí ì àí èè è
í ñòðû ô í òðââëåí èýö
í àðeí ðeëâí è

Группа морфина.



І аї аâåðèí



І î -ø ï à

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

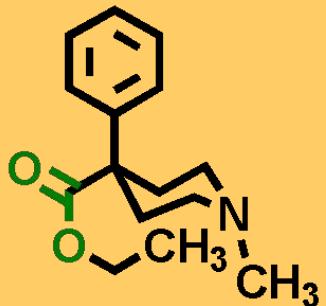
Но-шпа – полусинтетический аналог папаверина. Используется как спазмолитик.

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



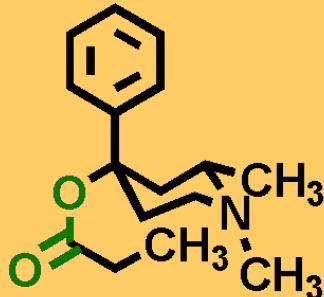
Название	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅
коклаурин	Me	H	H	H	H
ретикулин	Me	H	Me	OH	Me
лаудонозин	Me	Me	Me	OMe	Me
папаверолин	H	H	H	H	H

Синтетические анальгетики.



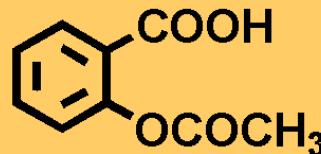
ëèäî ë

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

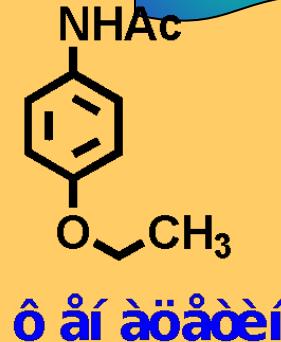


ï ðî ì åäî ë

â 2-4 ðàçà
ñëàáåå ì î ðô èí à



àñii èðèí
òí ðì î çèò ñèí ðåç
í ðî ñòàææàí äèí î á



ô áí àöåðèí

î áëàäàþò

ï ðî ðèäî âî ñí àëèòåëüí û ì è
æàðî ï î í èæàþ ù èí áåéñòåèäí

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



*Gaultheria
procumbens*



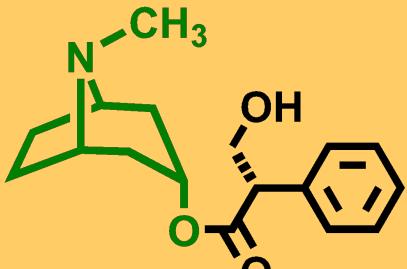
*Hydrangea
macrophylla*



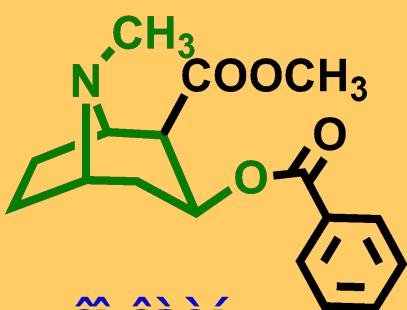
Galium aparine

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

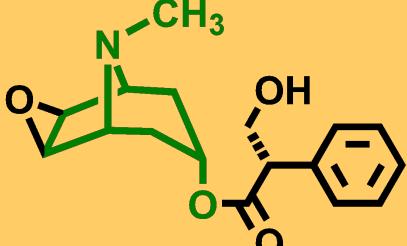
Группа атропина (группа кокаина, производные тропана).



әօðî ї ےí
әےî ںöےàì ےí

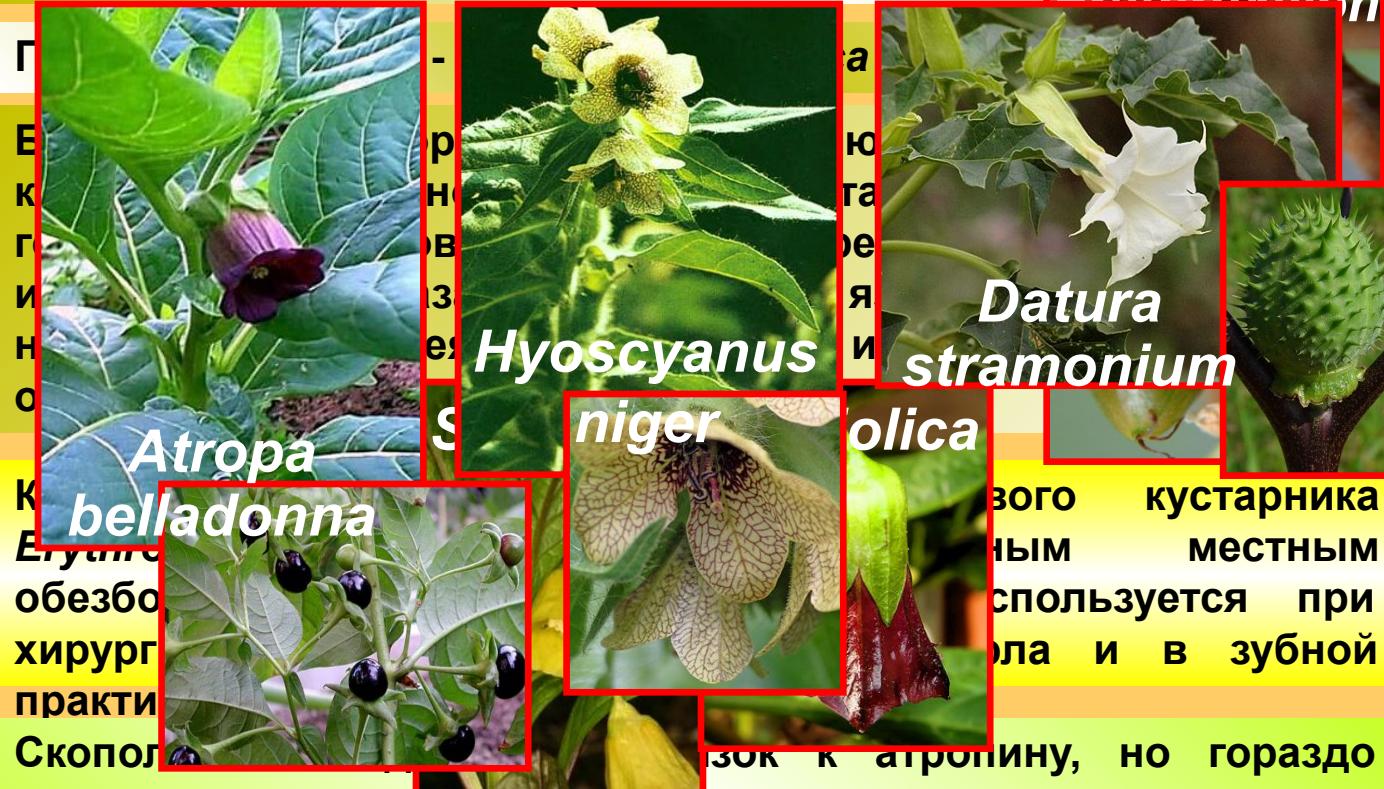


ےî ےàےí



ںê ٹ ۱ ےàì ےí

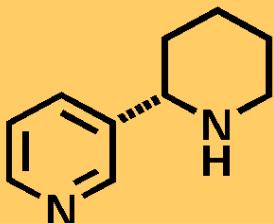
Большое содержание в растениях семейства Паслёновых (*Solanaceae*), особенно в красавке (белладонна, *Atropa belladonna*), дурмане (*Datura stramonium*) и белене (*Hyoscyamus niger*).



Большое содержание в растениях семейства Паслёновых (*Solanaceae*), особенно в красавке (белладонна, *Atropa belladonna*), дурмане (*Datura stramonium*) и белене (*Hyoscyamus niger*).
Atropa belladonna
Hyoscyamus niger
Datura stramonium
 зого кустарника
 ным местным
 используется при
 ола и в зубной
 зок к атропину, но гораздо
 сильнее воздействия
 успокаивающего средства в
 С; используется в качестве
 психиатрии, наркологии и для
 лечения морской болезни.

Группа никотина.

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

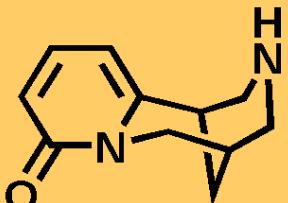


àí àáàçèí

âû äåéäí èç åæí âí èéà
ååçéèñòí î ã Anabasis
aphylla, èí ñåéðøëä

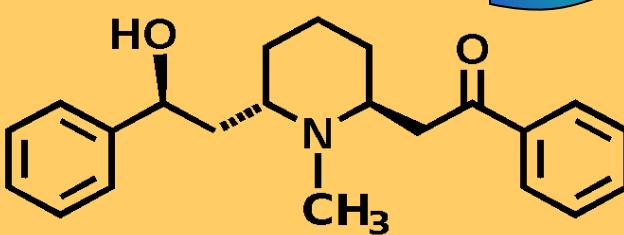
í èéí ðèí

âû äåéäí èç ðåðí î í ñèñà;



öèðèçèí

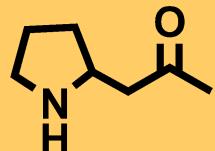
âû äåéäí èç ðåðí î í ñèñà;
âî áàåéýþ ò â í ðí ðèäí -
í èéí ðèí î âû å ðåééåðéè



ëî áåéëí

âû äåéäí èç Lobelia inflata;
âî çáóæäþ ù åå è ñí ñóäí ååééåðéüí î å
ååéñòåèå í à åû õåðåéüí û å öåí ðóú;
ýó ô åéðèäí î å àí àéäí ðé:åñéí å
ñðååñòåí

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

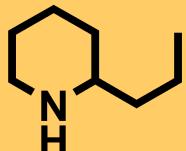


гигрин

Гигрин выделен из
Антиспазмолитиков.

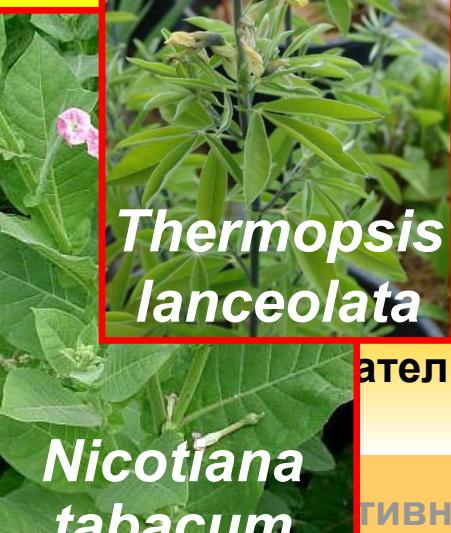


Thermopsis lanceolata



конинин

Конинин выделен из табака, парализует нервов.



Nicotiana tabacum



Lobelia inflate

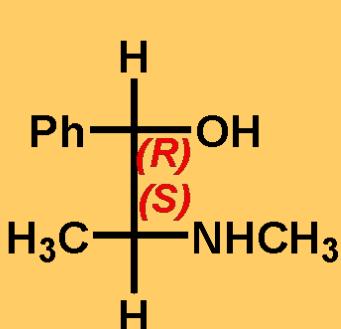


Conium maculatum

Многие
растения
насекомо-
захвати-
тели.

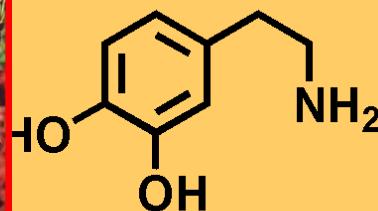
Природные алкалоиды, содержащиеся в растениях, являются производными пирролидина, пиперидина и пиридинового ядра. Никотин – это производное пиридинового ядра, которое является основным алкалоидом табака. Он обладает сильным стимулирующим действием на ЦНС, способен вызывать судороги и паралич. Конинин – производное пиперидина, выделенное из табака, которое парализует нервную систему. Гигрин – производное пирролидина, выделенное из некоторых растений, обладающее спазмолитическим действием. Алкалоиды из группы никотина играют важную роль в медицине и фармакологии, они используются как лекарственные средства и в производстве табака.

Группа эфедрина (protoалкалоиды).



ýô åäðèí

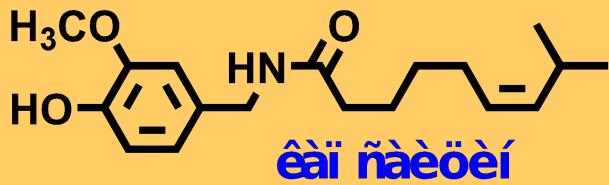
âû ääéäí èç õâî éí èéà
ðåì í î à Ephedra sinica



äî ô àì èí

âû ääéäí èç õâî éí èéà
ðåì í î à Ephedra sinica
âû ääéäí èç õâî éí èéà
ðåðæðåñêèò â

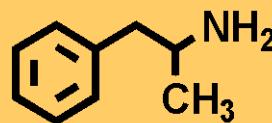
Эфедрин используется в лечении бронхиальной астмы и других аллергических заболеваний, для сужения сосудов и уменьшения воспалительных явлений, для повышения кровяного давления, при отравлении снотворными и наркотическими веществами.



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

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

Синтетические аналоги эфедрина (по механизму действия).



Í àô ðèçéí

êëí ô åëëí

àí àí ðèëëí

ô åí àí èí
(àí ô åòàí èí)

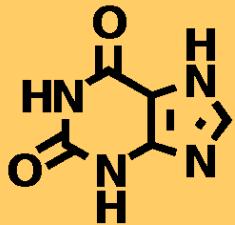
ì åòàí ô åòàí èí

ì î ùí î å âî çáóæäàþùåå äåéñòâèå í à Öí Ñ

Âñå óéàçàí í û å ñî åëèí åí èý äåéñòâóþò í à α- è β-åäðåí î ðåöåí ðû .

Группа кофеина.

По химической классификации – к пуриновым алкалоидам.



**ксантин
(дигидроксипурин)**

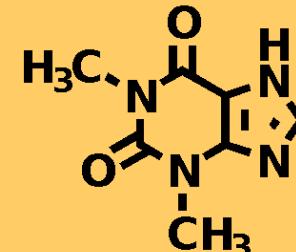


кофеин

в бобах кофе - до 1.5%, в чае - до 5%



**теобромин
(3,7-диметил-
ксантин)**



теофиллин

бронхолитическое и мочегонное действие

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

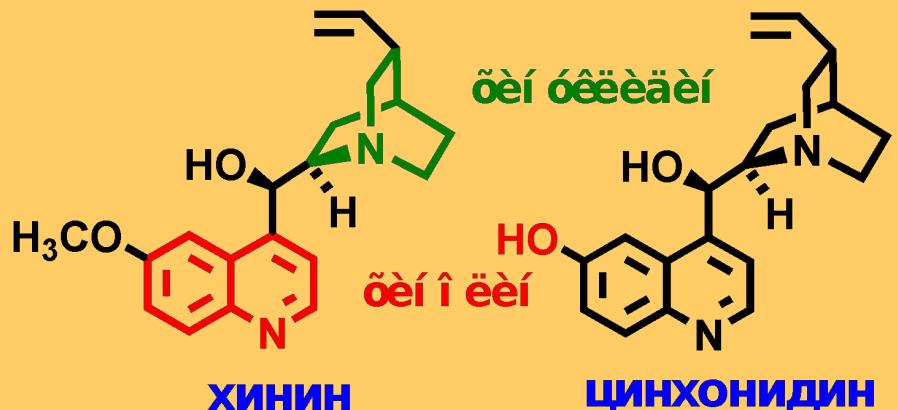
Кофеин является психостимулятором, возбуждает сердечную деятельность и ЦНС, расширяет коронарные сосуды, усиливает двигательную активность и диурез.



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

І 1 -ååàÿ êèñëî òà

Хинин.



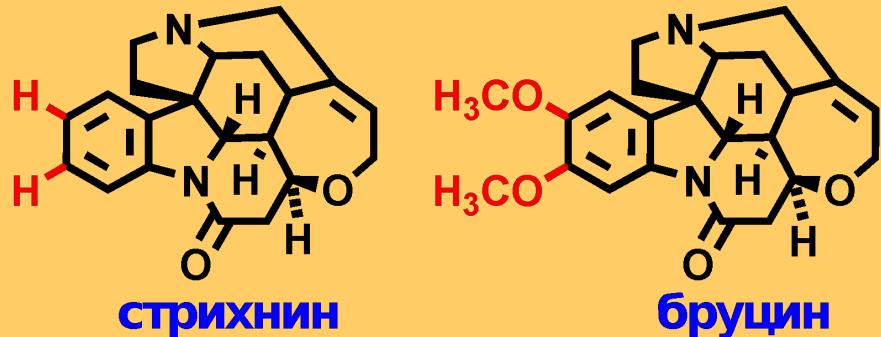
По химической классификации – к производным хинолина и хинуклидина.

Известно более 20 подобных алкалоидов. Выделяют из коры хинного дерева, был основным средством борьбы с малярией (возбудители – организмы малярий-



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

Стрихнин, бруцин.

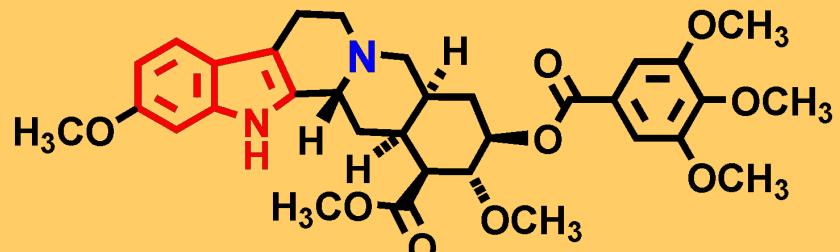


Относят к индолальным алкалоидам. Выделены из чилибухи (рвотные орешки, *Strychnos nux-vomica*). Использовались в качестве яда для наконечников стрел. Сильные судорожные яды, поражают спинной мозг, затем ЦНС, зрение, слух и обоняние. Смерть наступает от удушья.

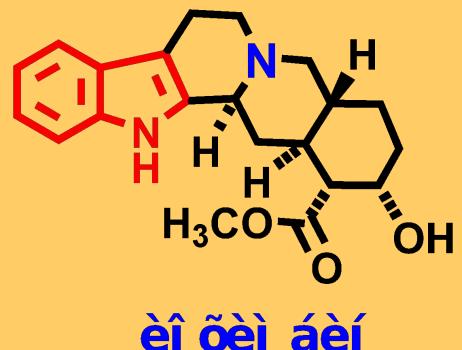
Стрихнин в малых дозах стимулирует центры кровообращения и дыхания, усиливает рефлекторные реакции (аналептик). Бруцин менее ядовит, обладает куареподобным действием. Используется для разделения рацемических карбоновых кислот.

Индольные алкалоиды

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



ðåçåðï èí



èí õèí áèí

Выделен из раувольфии *Rauwolfia serpentina* (кроме этого растения включает в себя другие 20 видов). Обладает сильным гипотензивным действием, успокаивает ЦНС. Применяется в лечении гипертонии, психических заболеваний. Применяется в африканских «любовных напитках».

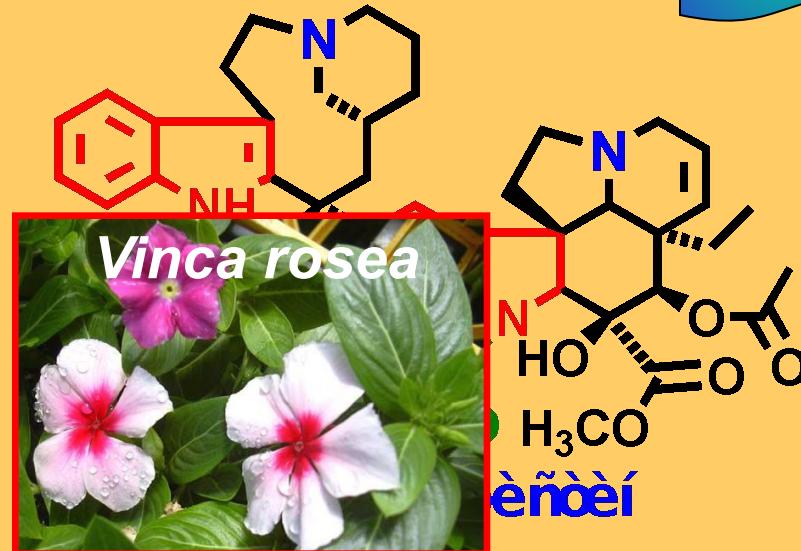
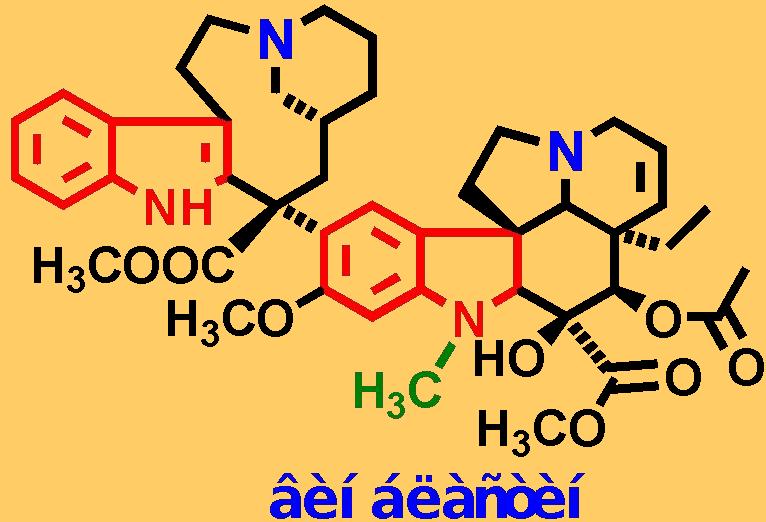
Rauwolfia serpentina



Corynanthe yohimbe

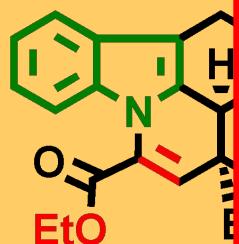
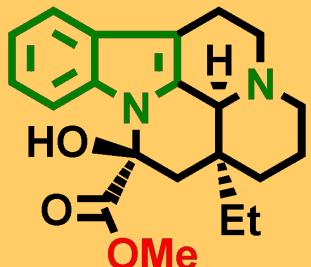
Выделен из коры африканского дерева коринанта (*Corynanthe yohimbe*). Обладает схожим с резерпином биологическим действием, но более известен как составная часть африканских «любовных напитков», возбуждает половую деятельность (афродиазик).

Индольные алкалоиды.



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

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



А.М. Чибиряев "Биология соединений живых организмов", 2009



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