

# Алкалоїди



# Алкалоїди

1

Алкалоїди - азотовмісні речовини оснóвного характеру, які є вторинними метаболітами переважно рослин. Володіють високою біологічною, фізіологічною активністю.

Відомо більше 10.000 алкалоїдів, з них дуже мало метаболітів тварин, морських організмів, вищих, нищих грибів, водоростей.

Іноді присутні у вигляді четвертинних солей або солей органічних кислот (лимонної, яблуневої, янтарної, щавлевої, рідше – оцтової, пропіонової і т.д.)

Розрізняють істинні алкалоїди (азагетероциклічні сполуки) і протоалкалоїди (нітроген не присутній у циклічному фрагменті молекули, нітрогеновмісна функція знаходиться ззовні основного карбонового скелета молекули).

Здатність алкалоїдів до солеутворення використовують для їх виділення з екстрактів рослинної сировини.

Утворюють інтенсивно забарвлені солі і комплекси з пикриною, фосфорномолібденовою, фосфорновольфрамною кислотами, які використовують для аналітичного (якісного) виявлення алкалоїдів.

## Способи класифікації алкалоїдів:

- 1) Хімічний (за типом гетероциклічного фрагмента);
- 2) Ботанічний (з яких сімейств рослин виділені);
- 3) За характером біологічної дії (знеболюючі, судиннорозширюючі, протизапальні і т.д.).

Найбільш багаті алкалоїдами сімейства бобових (*Fabaceae*), пасленових (*Solanaceae*), макових (*Papaveraceae*), лютикових (*Ranunculaceae*) і деяких інших.

Практично немає в трояндах, папоротниках, лишайниках, мхах. Зовсім немає в бактеріях.

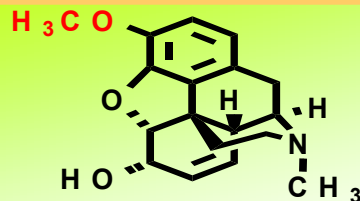
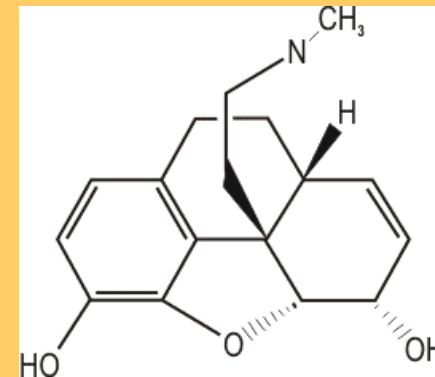
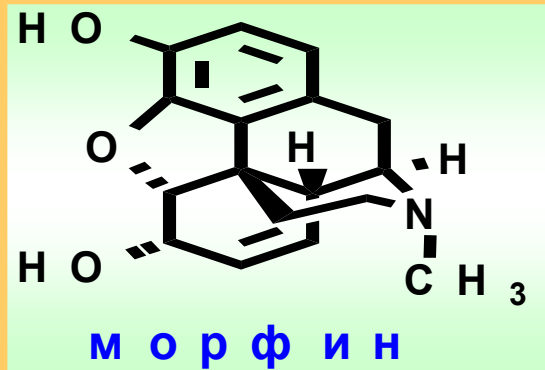
«Ефіроноси», маслянні рослини практично не містять алкалоїдів.

# Група морфіна

3

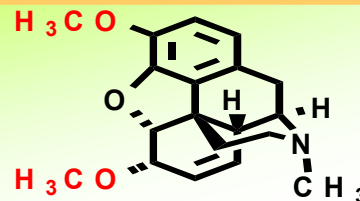
Виділено більше 20 алкалоїдів з маку *Papaver somniferum*. Основний – морфін. За хімічною класифікацією відносяться до групи похідних хіноліна.

Наркотичні анальгетики (болезаспокійливі засоби). Володіють седативним и снотворним ефектами, стимулюють гладку мускулатуру, в більших дозах викликають нудоту, утруднюють діурез, пригнічення дихання, гіпотермію. Викликають звикання (наркоманія).



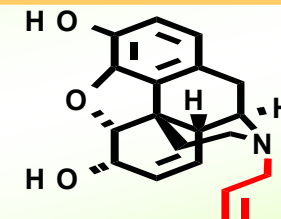
**кодеин**

в опи от 0.2 до 6% ;  
слабое наркотическое  
средство, применяется  
против кашля



**героин**

не обладает  
наркотическим действием ;  
вызывает конвульсии ;  
является вредной  
примесью в опиных  
препаратах



**налорфин**

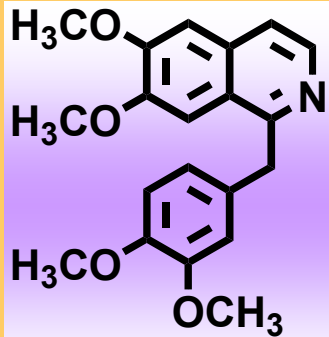
антагонист морфина ;  
применяется при  
лечении наркомании и  
острых отравлениях  
наркотиками

3a

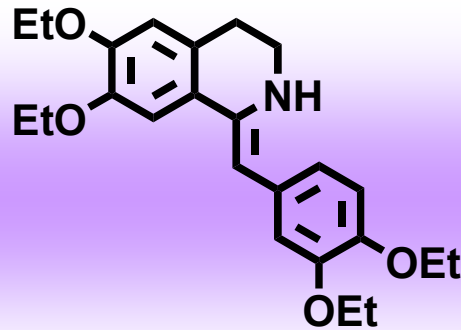


## Група морфіна

4



папаверин

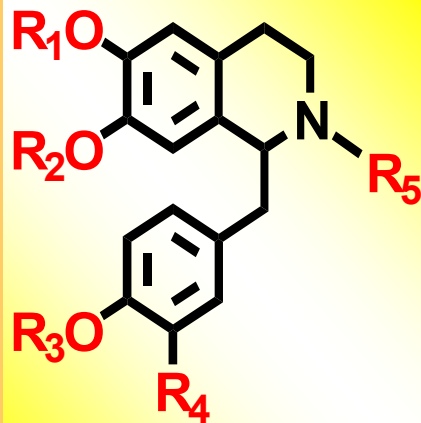


но-шпа

Папаверин виділений з опію, входить до складу спазмолітичних, судинно-розширюючих препаратів; застосовують при гіпертонії, стенокардії, спазмах коронарних судин, судин мозку, гладкої мускулатури брюшної порожнини.

Но-шпа – полусинтетичний аналог папаверина. Використовують як спазмолітик.

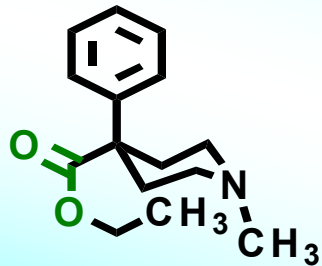
За хімічною класифікацією відноситься до групи похідних ізохіноліна (бензилізохінолінові алкалоїди).



Название	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>
коклаурин	Me	H	H	H	H
ретикулин	Me	H	Me	OH	Me
лаудонозин	Me	Me	Me	OMe	Me
папаверолин	H	H	H	H	H

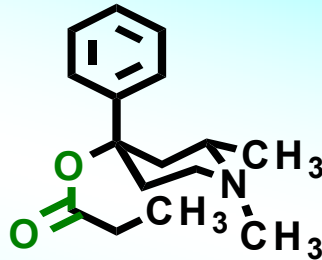
# Синтетичні анальгетики

5



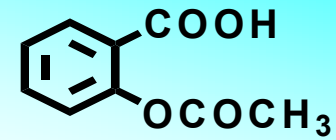
**лидол**

в 10 раз слабее морфина и значительно менее токсичен



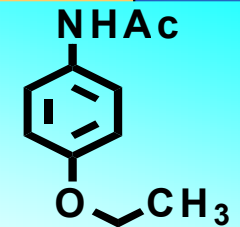
**промедол**

в 2-4 раза слабее морфина



**аспирин**

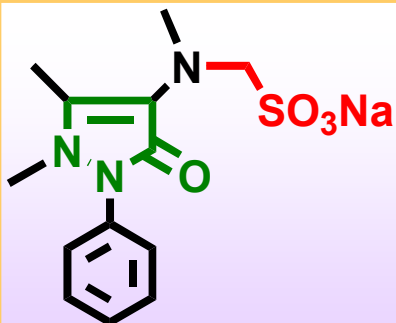
тормозит синтез простагландинов



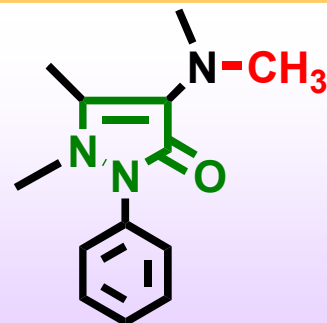
**фенацетин**

Обладают противовоспалительным и жаропонижающим действием

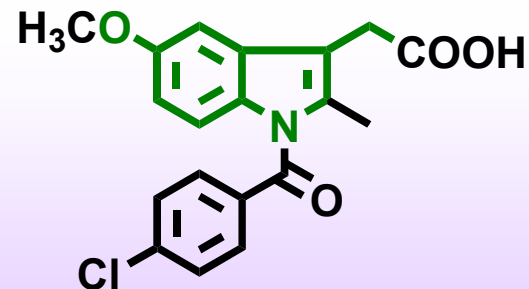
Салициловая кислота у вигляді складних ефірів зустрічається в рослинах, наприклад, в івах (*Salicaceae*), грушанці *Gaultheria procumbens*, гортензії *Hydrangea macrophylla*, підмареннику *Galium aparine*, подорожнику *Plantago major*.



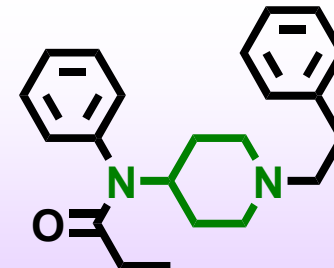
**анальгин**



**амидопирин**



**индометацин**



**фентанил**

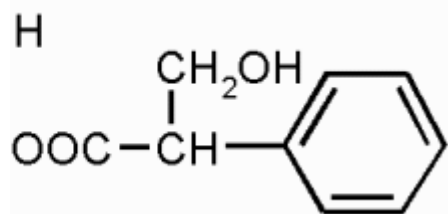
Фентанил – анальгетик наркотичної дії, в 100-400 раз активніше морфіну.



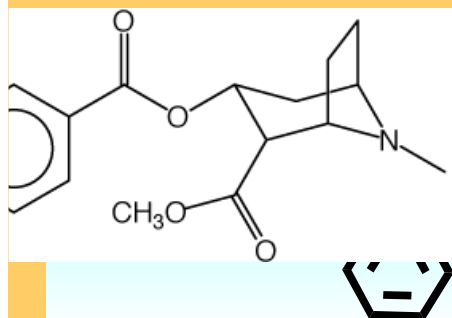


## Група атропіну (група кокаїну, похідні тропана)

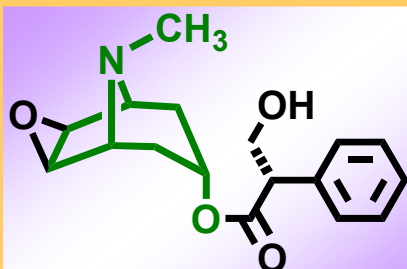
6



атропин  
гиосциамин



кокаин



скополамин

Великий вміст в рослинах сімейства Пасльонових (*Solanaceae*), особливо в красавці (*Atropa belladonna*), дурмані (*Datura stramonium*), білені (*Hyoscyamus niger*).

Головне джерело - *Scopolia carniolica* (сім. пасльонових).

Блокатор м-холінорецепторів. Знижують тонус гладкої мускулатури шлунково-кишкового тракту, жовчного і сечового міхура, бронхів, зменшують секрецію різних залоз, тонус м'язів ока. Застосовують при язвах, для стимулювання серцевої діяльності при інфаркті міокарда, в офтальмології.

Кокаїн виділяють з листків кокаїнового кустарника *Erythroxylon coca*; володіє потужним місцевою знеболюючою дією, наркотик; використовується при хірургічних операціях ока, носа, горла, в зубній практиці.

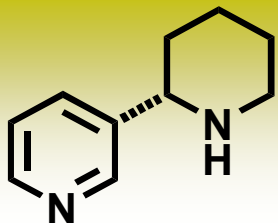
Скополамін за дією близький до атропіну, сильніше впливає на ЦНС; використовується в якості заспокійливого засоба в психіатрії, наркології, для лікування морської хвороби.



## Группа никотина

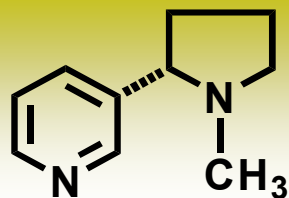
За хімічною класифікацією відносяться до похідних піридина, піперидина, пірролідина.

7



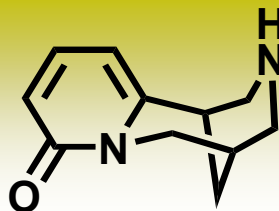
**анабазин**

выделен из ежовника  
безлистного *Anabasis  
aphylla*, инсектицид

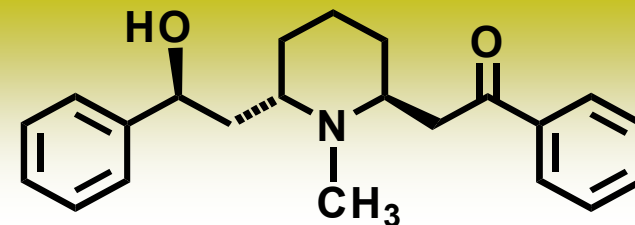


**никотин**

выделен из термопсиса;  
добавляют в противо-  
никотиновые таблетки



**цитизин**

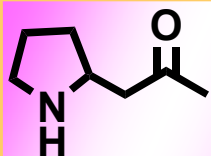


**лобелин**

выделен из *Lobelia inflata*;  
возбуждающее и сосудодвигательное  
действие на дыхательные центры;  
эффективное analeптическое  
средство

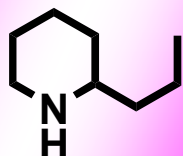
**Никотин** присутствует в листьях *Nicotiana tabacum* (до 8%) и других видов *Nicotiana*; высокотоксичен, действует на вегетативную нервную систему, сужает кровеносные сосуды, является мощным ганглиоблокатором. При остром отравлении наблюдается тошнота, рвота, брадикардия и тахикардия, судороги и угнетение дыхания.

**Никотин** - основное исходное вещество для получения никотиновой кислоты.



**гигрин**

Гигрин выделен из кокаинового куста, является одним из яотрут цикути. Антиспазмолитик. Оказывает общее стимулирующее действие.



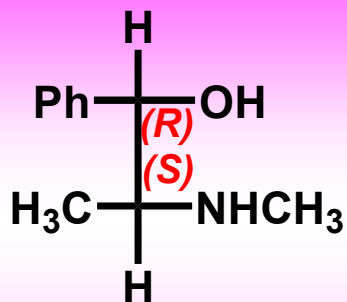
**Кониин**

Кониин выделен из семян болиголова крапчатого (*Conium maculatum*), парализует окончания двигательных и чувствительных осязательных нервов.



## Группа эфедрина (протоалкалоиды).

8

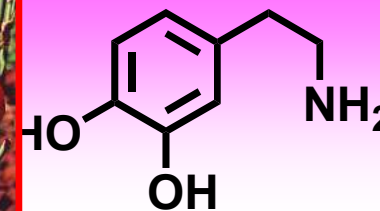


эфедрин

выделен из хвойника  
темного *Ephedra sinica*



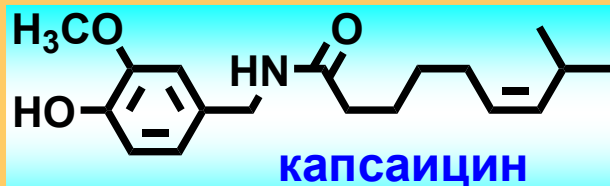
алин



дофамин

алогические  
ергических  
В

**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.



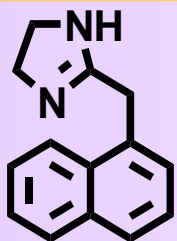
капсаицин

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

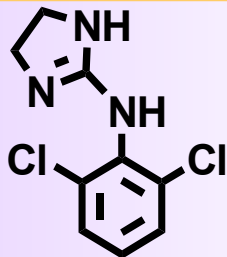
Раздражает верхние дыхательные пути и кожу, используется как отвлекающее и обезболивающее средство, а также в мазях от обморожения. Вызывает массовую гибель злокачественных клеток благодаря воздействию на митохондрии.

# Синтетические аналоги эфедрина (по механизму действия).

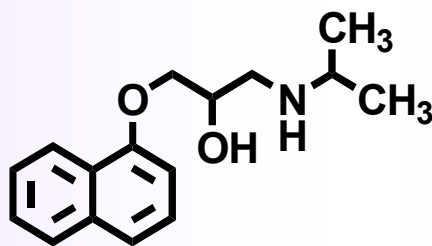
9



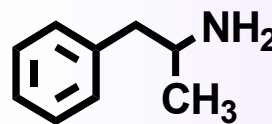
нафтизин



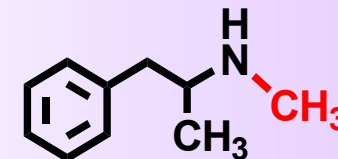
клофелин



анаприлин



фенамин  
(амфетамин)



метамфетамин

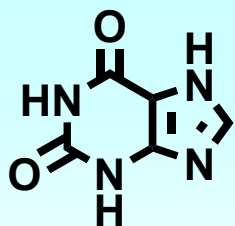
мощное возбуждающее действие на ЦНС

Все указанные соединения действуют на  $\alpha$ - и  $\beta$ -адренорецепторы.

## Группа кофеина.

10

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, зёрнах 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.

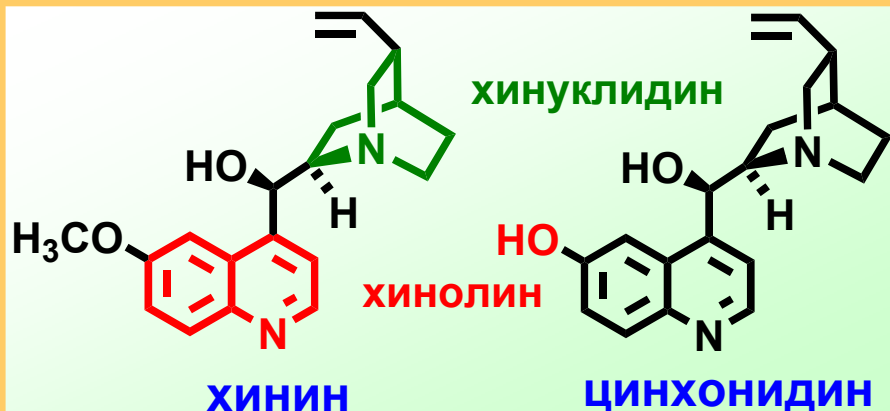


**мочевая кислота**

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

# Хинин.

11



По химической классификации – к производным хинолина и хинуклидина.

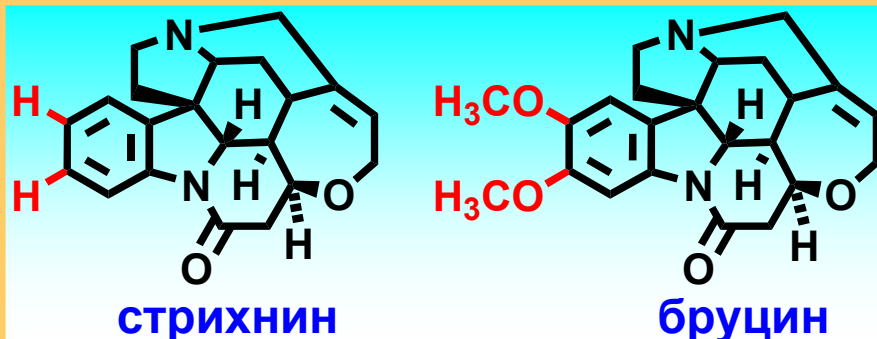
Известно более 20 подобных алкалоидов. Выделяют из коры хининовых деревьев. Был основным средством профилактики малярии (возбудители – организмы малярийных паразитов).



*Strychnos nux-vomica*

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

# Стрихнин, бруцин.



Относятся к индольным 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 курареподобным действием. Используется для разделения рацемических карбоновых кислот.



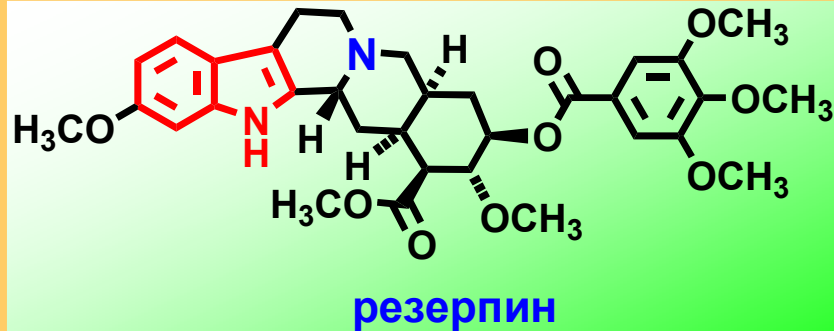
## Индольные алк

12

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

*Rauwolfia serpentina*

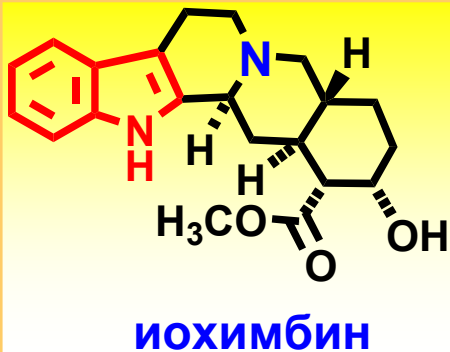
икличес-



Выделен из раувольфии (кроме других алкалоидов). Обладает сильным гипотензивным действием, успокаивает ЦНС. Применяется при гипертонии, психических заболеваниях. Прим

*Corynanthe yohimbe*

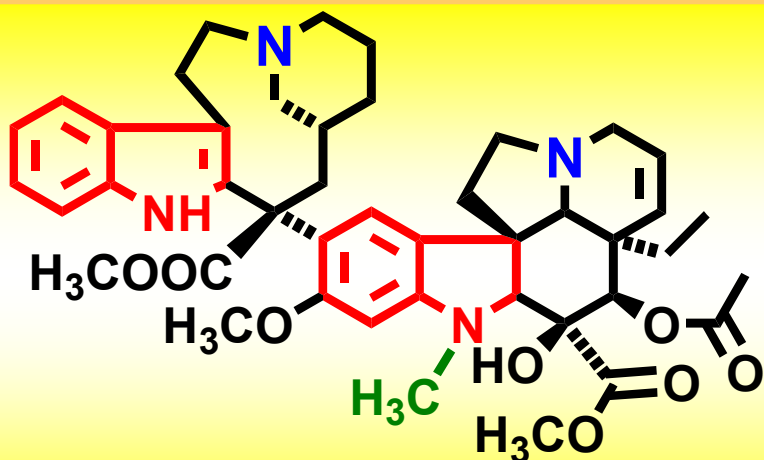
*Rauwolfia* других 20 сичностью (вностью), действием, я лечения логических змей.



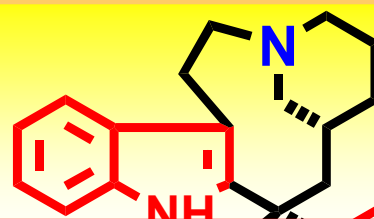
Выделен из коры африканского дерева коринанта (*Corynanthe yohimbe*). Обладает схожим с резерпином биологическим действием, но более известен как составная часть африканских «любовных напитков», возбуждает половую деятельность (афродизак).

# Индольные алкалоиды.

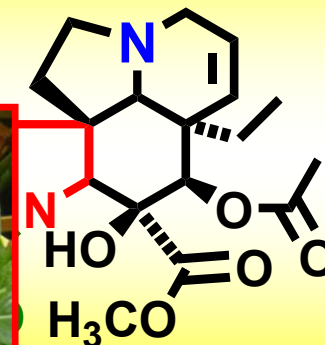
13



винбластин



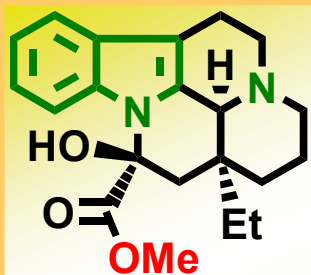
*Vinca rosea*



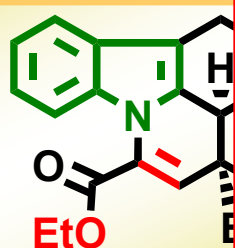
ИСТИН

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.



(+)-винкамин



(+)-винпоцетин



*Vinca minor*

умеренно понижает артериальное давление, расширяя сосуды мозга, и проявляет седативный эффект. Минорин (другой алкалоид *Vinca minor*) селективно улучшает кровообращение головного мозга. Похоже действует препарат винпоцетин.