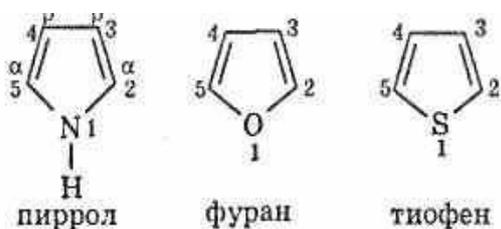


ЛЕКЦИЯ 11
БИОЛОГИЧЕСКИ
АКТИВНЫЕ
ГЕТЕРОЦИКЛЫ..
ГЕТЕРОЦИКЛЫ-замкнутые
органические соединения в
состав кольца которых
входят гетероатомы N,O, S
идр.

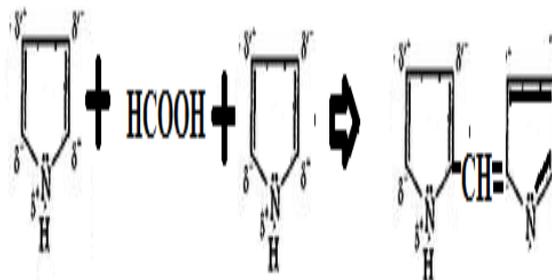
ПЯТИЧЛЕННЫЕ
гетероциклы с 1 гетероатомом.



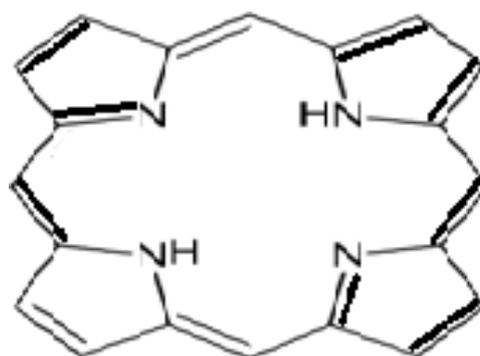
Эти соединения проявляют ароматический характер ненасыщенных гетероциклов. При рассмотрении электронного строения молекулы пиррола видно, что электронная пара пиррольного азота участвует в образовании шестиэлектронной структуры, поэтому этот азот практически не обладает основными свойствами. Это **ПИ-избыточные системы**. Они могут образовываться по реакции **ЮРЬЕВА**. Легко вступают в реакции электрофильного замещения и легко окисляются.

Из биолог. активных соединений пиррола наибольший интерес представляют

тетрапиррольные соединения. Тетрапиррольные соединения содержат два дипирилметеновых фрагмента которые образуются конденсацией 2х пирролов и муравьиной кислоты

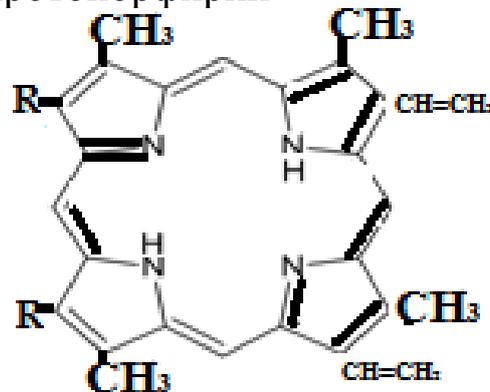


Затем 2 дипирилметеновых фрагмента образуют **ПОРФИН**



и через ряд промежуточных стадий

Протопорфирин

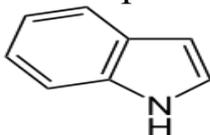


КотОрый входит в гемоглобин, цитохромы, каталазу, пероксидазу хлорофил и витамин В12. Это сопряженная

ароматическая система содержит 26π электронов и очень устойчива

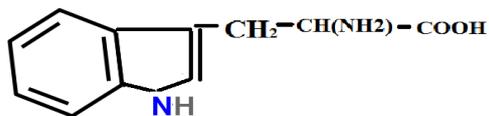
Хлорофилл-магний, витамин В12-кобальт гемоглобин – железо

ИНДОЛ содержит 10 π электронов, ароматичен



Более 4000 алкалоидов содержат индол

Триптофан самая редкая в белках аминокислота не синтезируется в организме человека. Вызывает чувство сытости.



Из триптофана получается биологически активный амин **СЕРОТОНИН**

ТРИ→5
оксиТРИ→СЕРОТОНИН

один из основных нейромедиаторов.

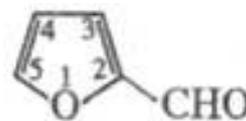
По химическому строению серотонин относится к биогенным аминам, классу триптаминов. Серотонин часто ошибочно называют «гормоном хорошего настроения» и «гормоном счастья».

Физиологические функции серотонина чрезвычайно

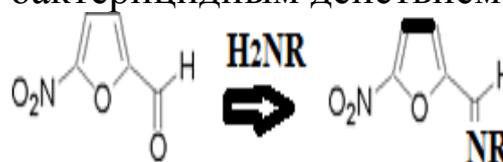
многообразны. Сокращение гладкой мускулатуры, свертываемость крови, регуляция функции гипофиза итп. Серотонин участвует в процессах аллергии и воспаления. Серотонин «руководит» очень многими функциями ЦНС. При снижении серотонина повышается чувствительность болевой системы организма, то есть даже самое слабое раздражение отзывается сильной болью.

Производными триптофана являются галлюциногены в том числе ЛСД-50 алкалоиды орыньи, стрихнин, резерпин, бруцин, каннабидиол, **ПСИЛОБИЦИН**.

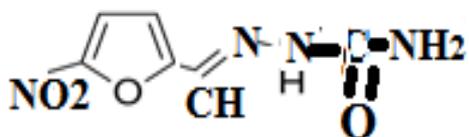
ФУРАН. из производных фурана наибольший интерес представляет α-фуран-2-альдегид-**фурфурол**



При нитровании которого получается 5-нитрофурфурол и далее его производные обладающие сильным бактерицидным действием

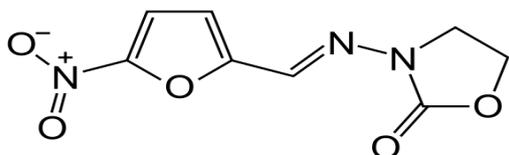


НИТРОФУРАНЫ ФУРАЦИЛИН

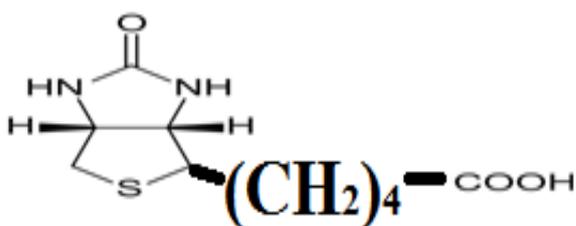
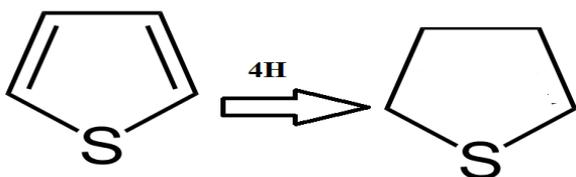


И

ФУРАЗОЛИДОН



Восстановление ТИОФЕНА приводит к образованию тетрагидротирфена, который лежит в основе БИОТИНА (вит Н).

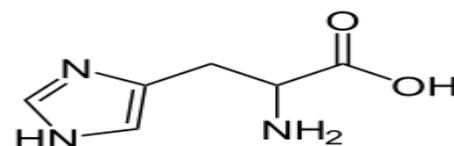
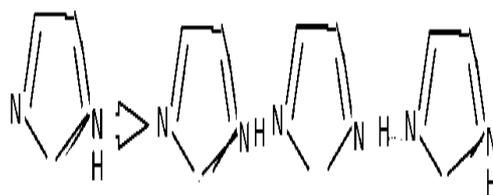


осуществляет реакции транскарбоксилирования
 $\text{БИОТИН} + \text{CO}_2 = \text{КАРБОКСИБИОТИН}$
 $\text{БИОТИН} + \text{Y} = \text{БИОТИН} + \text{Y-COOH}$

ПЯТИЧЛЕННЫЕ
гетероциклы с 2 гетероатомами
 Наличие нескольких гетероатомов в пятичленном

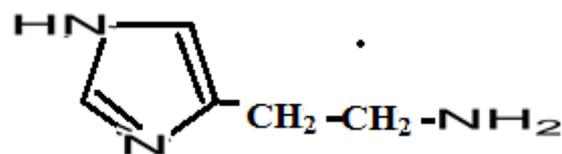
цикле приводит к неравномерному распределению электронной плотности, что определяет направление электрофильной и нуклеофильной атак. Эти соединения более стабильны и менее активны в реакциях электрофильного замещения. Они проявляют способность к таутомерным превращениям и склонность к образованию межмолекулярных водородных связей.

ИМИДАЗОЛ



ГИСТИДИН

Декарбоксилируется в гистамин основной агент аллергических реакций

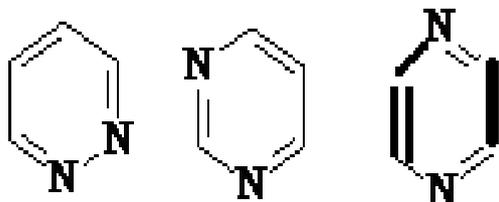


Свободный гистамин обладает высокой активностью: он вызывает спазм гладких мышц (включая мышцы бронхов),

расширение капилляров и понижение артериального давления; застой крови в капиллярах и увеличение проницаемости их стенок; вызывает отёк окружающих тканей и сгущение крови. В связи с рефлекторным возбуждением мозгового вещества надпочечников выделяется адреналин, суживаются артериолы и учащаются сердечные сокращения. Гистамин вызывает усиление секреции желудочного сока.

ШЕСТИЧЛЕННЫЕ С 2 ГЕТЕРОАТОМАМИ

в эту группу входят три изомера с общим названием ДИАЗИНЫ



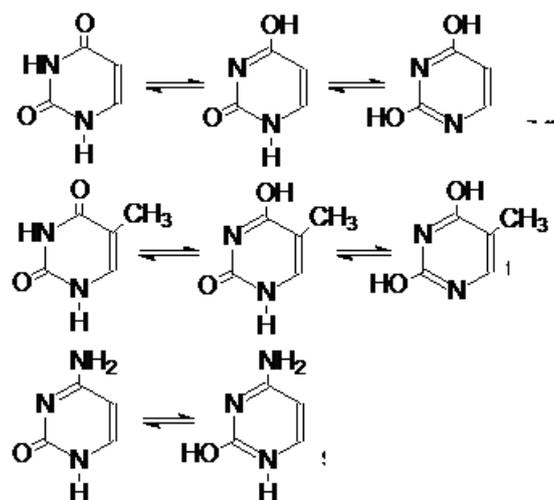
пиридазин

пиримидин

пиразин

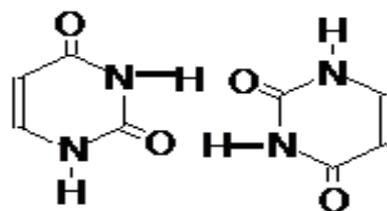
наибольший интерес пиридин как основоположник мримидиновых азотистых рснований **урацил, тимин цитозин**

Для них характерна **ЛАКТАМ-ЛАКТИМНАЯ ТАУТОМЕРИЯ**



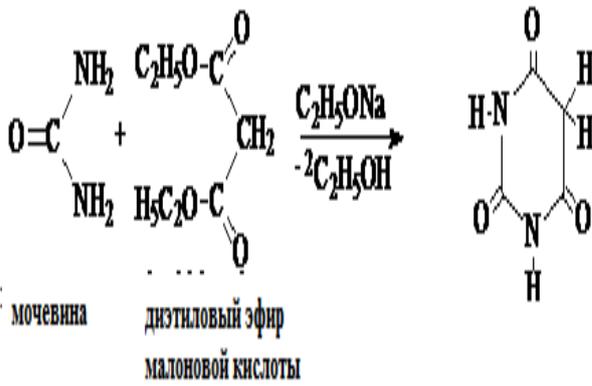
СПОСОБНОСТЬ

пиридиновых как и пуриновых оснований образовывать водородные связи лежит в основе нашей формы жизни – двойной спирали ДНК

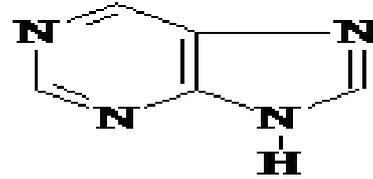


используются и как лекарственные вещества **5 метилурацил, фторурацил, оротат калия**.

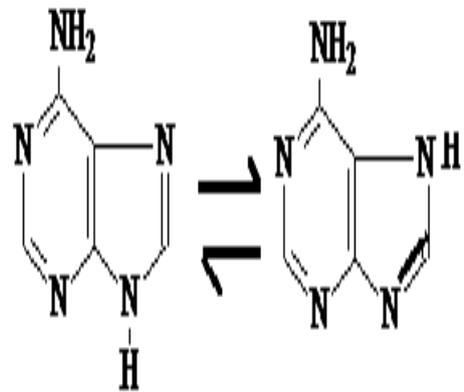
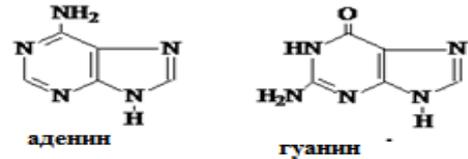
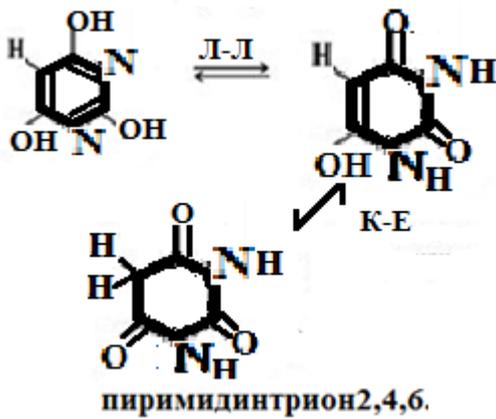
Присутствие гидроксильных групп в производных пиридина придает им **КИСЛЫЕ** свойства. Наиболее кислый характер имеет **2,4,6-тригидроксипиридин (БАРБИТУРОВАЯ кислота)**



КОНДЕНСИРОВАННЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛЫ пурины амина и гидроксипурины

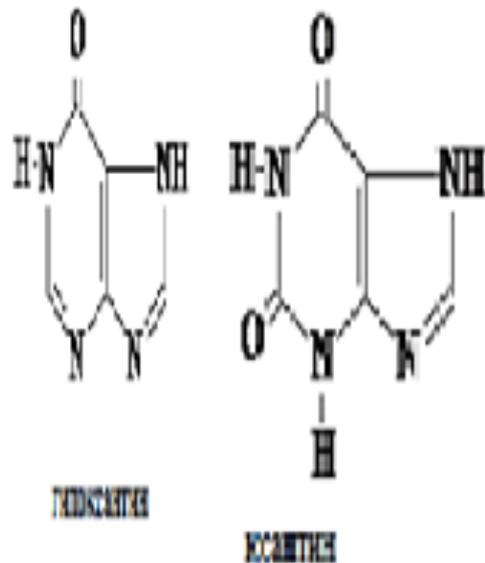
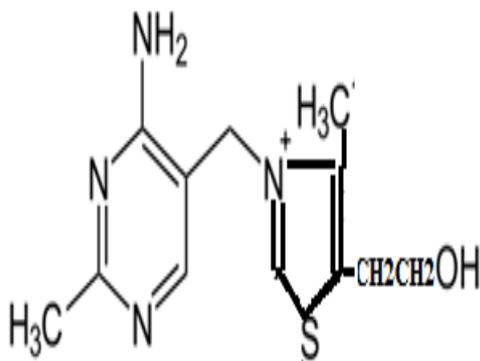


БАЙЕР 1864 год

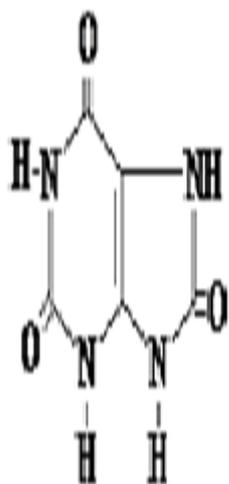


ВИТАМИН В-1 содержит два гетероцикла пиридин и тиазол

прототропная таутомерия НАД, ФАД



участвует в реакциях декарбоксилирования пировиноградной и альфа кетоглутаровой кислот. Влияет на углеводный обмен, АЛКОГОЛИЗМ, БЕРИ-БЕРИ. полинейропатия.



МОЧЕВАЯ КИСЛОТА

Мочевая кислота как фактор стимуляции мышления

кристаллическое вещество, двухосновная, плохорастворимая в воде и не растворима в эфире и спирте. Она выделяется с мочой в количестве 0,5 – 1 г в сутки. Соли мочевой кислоты называют уратами. При некоторых нарушениях в организме они откладываются в суставах, например, при подагре, а также в виде почечных камней.

Огромное значение в медицине имеют метилированные ксантины: **кофеин, теобромин, теофиллин**

Кофеин – эффективное средство, возбуждающее ЦНС, стимулирует работу сердца. У теофилина и теобромина эти действия выражены меньше, однако они обладают довольно

сильными мочегонными свойствами, т.е. являются диуретиками.