

Тема: Биологически важные гетероциклические соединения.

I. Цель: Сформировать знания строения и особенностей химического поведения гетероциклических соединений, обладающих биологической активностью.

Гетероциклические соединения лежат в основе биологически важных соединений. Химия их многообразна и сложна, ее знания необходимы для изучения лекарственных средств, в состав которых входят гетероциклы. Конденсированные системы гетероциклов – аденин и гуанин являются компонентами нуклеиновых кислот.

Алкалоиды – органические азотсодержащие соединения растительного происхождения. Благодаря высокой биологической активности многие алкалоиды используются в качестве лекарственных средств.

Гетероциклические соединения отличаются разнообразием химических свойств, что обусловлено различиями в химической природе гетероатомов (азот, кислород, сера и т.д.), и количестве гетероатомов (1,2, 3, 4) и расположением их колец, различием в строении циклов (циклы 5-ти, 6-тичленные, конденсированные) и строением боковых цепочек, связанных с циклами. Поэтому изучение свойств гетероциклических соединений является трудным, но совершенно необходимым для медика, так как многие из этих соединений играют важную биологическую роль и многие лекарственные препараты являются только гетероциклическими соединениями.

II. Исходный уровень

1. Сопряжение и ароматичность.
2. Электронное строение пиридинового и пиррольного атомов азота
3. Реакции электрофильного и нуклеофильного замещения.
4. Водородная связь.
5. Таутомерия.

III. Теоретическая часть

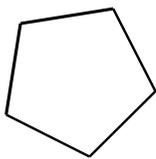
Гетероциклическими называются соединения, в образовании циклов которых принимают участие другие атомы (гетероатомы).

Преимущественное положение среди биологически важных гетероциклов занимают 5-ти и 6-ти гетероциклы, содержащие гетероатомы.

I. Гетероциклы с одним гетероатомом

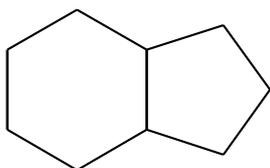
Допишите формулы, пронумеруйте атомы в гетероциклах

1. Пиррол

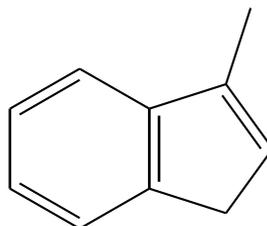


Производные пиррола:

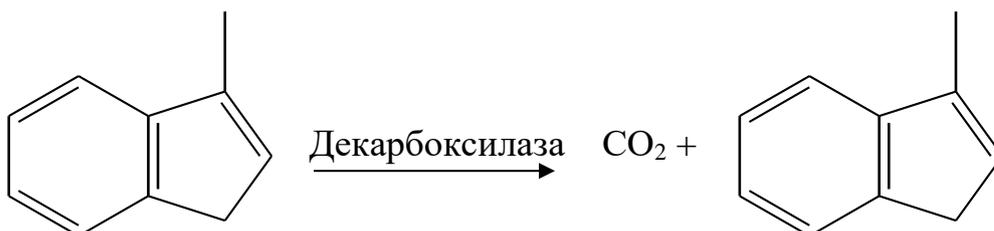
Индол (бензпиррол)



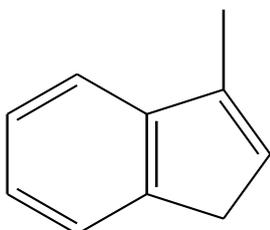
Триптофан (незаменимая α -аминокислота по РФН _____)



При декарбоксилировании триптофана образуется биогенный амин _____.



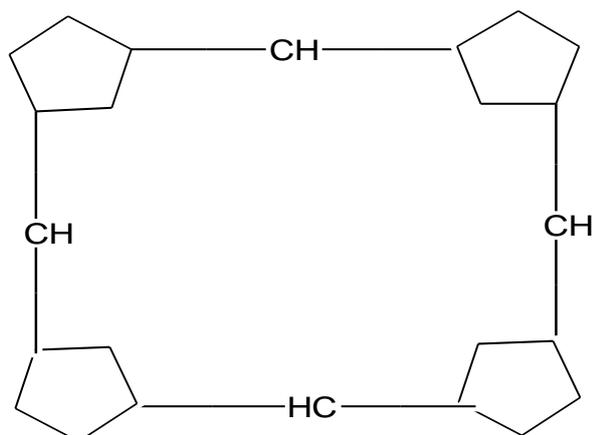
В организме триптамин претерпевает различные метаболические превращения, образуя ряд соединений, участвующих в процессах жизнедеятельности. Например, серотонин (_____, назовите по ЗН), который является одним из _____.



Допишите формулу

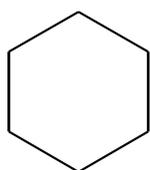
Четыре пиррольных кольца образуют циклическую сопряженную систему - порфин. Порфиновое ядро обладает высокой термодинамической

устойчивостью. Его $E_{\text{сопр}} =$ _____, единое π электронное облако включает _____ π электроны.



Допишите строение порфина.

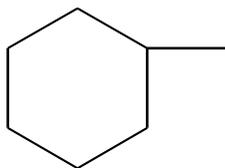
2. Пиридин



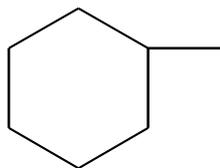
Допишите формулу и пронумеруйте атомы.

Производные пиридина:

Никотиновая кислота

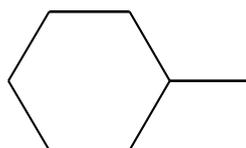
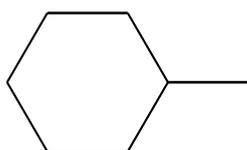


Никотинамид

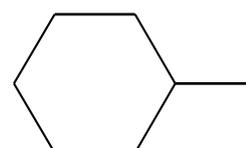


Изоникотиновая кислота и ее производные:

Тубазид

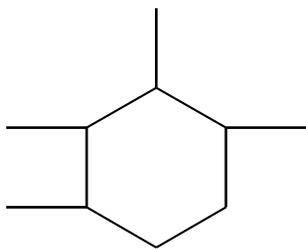


Фтивазид

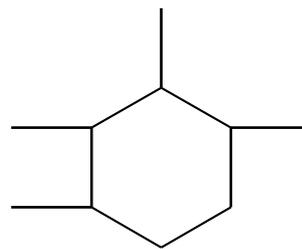


Пиридиновое кольцо входит в состав коферментов (допишите формулу):

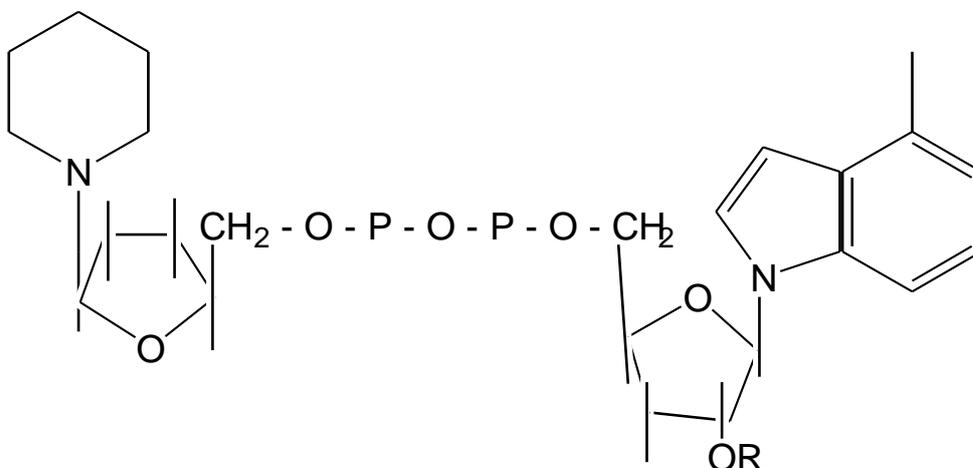
Пиридоксаль



Пиридоксальфосфат



НАД⁺ и НАДФ⁺

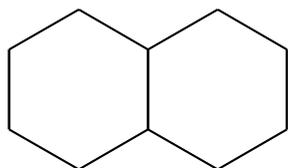


Если R = H, то это _____.

Если R = $-\text{O}-\text{P}(\text{OH})_2$, то это _____.

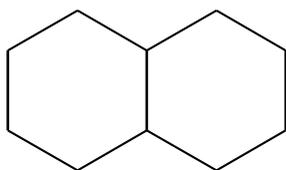
Участие НАД⁺ и НАДФ⁺ в процессах окисления – восстановления обусловлено способностью пиридиниевого катиона обратимо принимать _____.

Хинолин – конденсированная система пиридина и бензола. Его ядро входит в состав лекарственных средств.



Допишите формулу и пронумеруйте атомы.

Производные 8-гидроксихинолина – антибактериальные средства комплексобразующего действия.

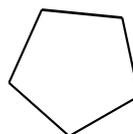
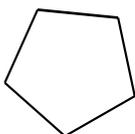


Допишите строение 8-гидроксихинолина и пронумеруйте атомы в молекуле.

II. Гетероциклы с двумя гетероатомами

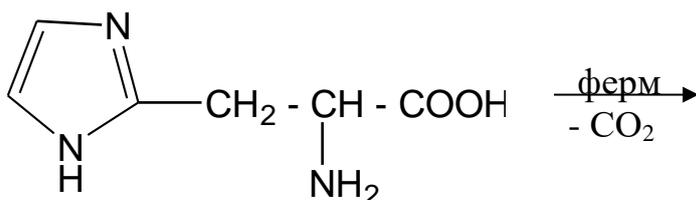
1. Пиразол

2. Имидазол



Допишите формулы и пронумеруйте атомы в молекуле.

При декарбоксилировании гистидина образуется биогенный амин - _____ . Допишите уравнение реакции.



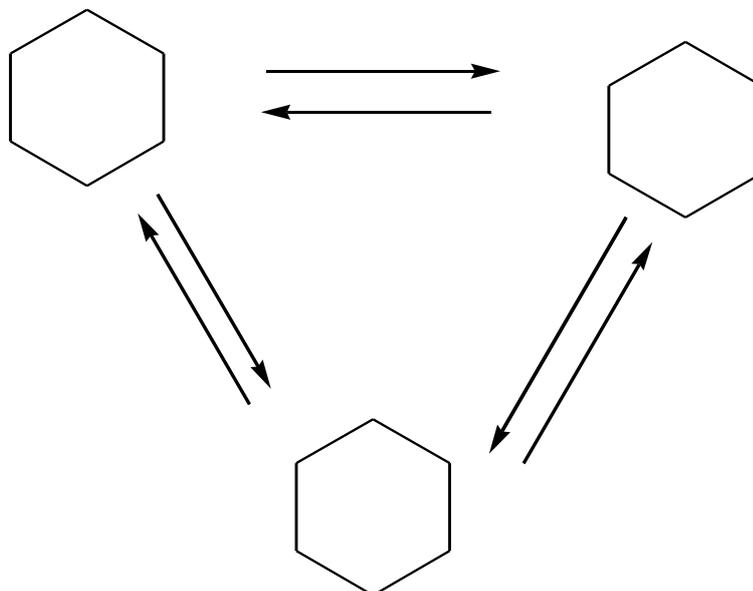
2. Пиримидин



Допишите формулу и пронумеруйте атомы в молекуле.

Из производных пиримидина наибольшее значение имеют гидрокси- и аминопроизводные. Урацил, тимин, цитозин – компоненты нуклеиновых кислот. Приведите их лактим-лактамы таутомеры.

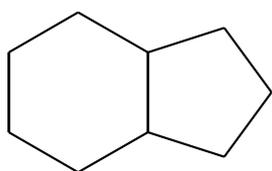
Барбитуровая кислота. Допишите формулы. Назовите таутомеры, пронумеруйте атомы в молекуле и назовите по ЗН.



Производные барбитуровой кислоты называются _____ и применяются как снотворные и противосудорожные средства. Допишите формулы и назовите препараты по ЗН.

III. Конденсированные системы из гетероциклов

1. Пурин



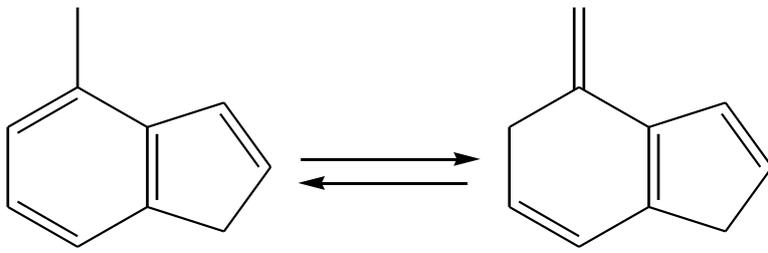
Допишите строение и пронумеруйте атомы в молекуле.

Молекула состоит из двух гетероциклов: _____ и _____
 _____. Из производных пурина наибольшее значение имеют
 гидрокси- и аминопроизводные.

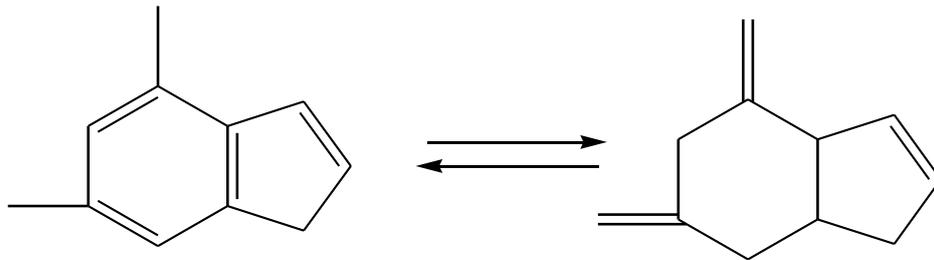
Гидроксипроизводные пурина:

Напишите лактим-лактамные таутомеры.

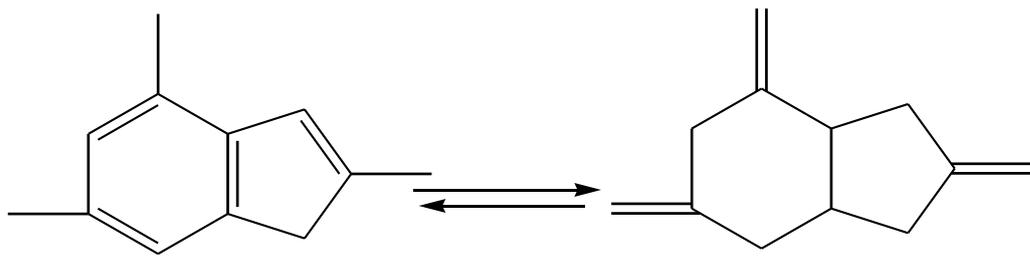
Гипоксантин



Ксантин

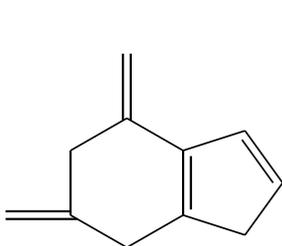


Мочевая кислота



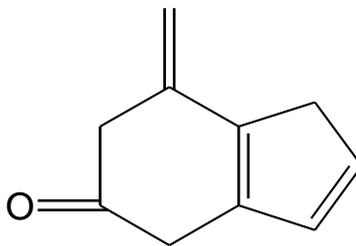
2. Производные пурина – метилированные по азоту ксантины. Напишите формулы.

Теofilлин
(1,3-диметилксантин)



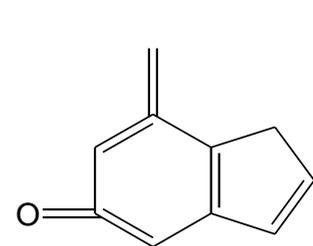
Содержится в чае, обладает сильным мочегонным действием

Теобромин
(3,7-диметилксантин)



Содержится в бобах какао, чае. Обладает мочегонным действием. Возбуждает и стимулирует ЦНС.

Кофеин
(1,3,7-триметилксантин)



Много содержится в кофе, еще больше - в чае. Действует возбуждающее на ЦНС, в небольших дозах повышает работоспособность

