Гетероциклические лекарственные средства

- Производные фурана
- Производные хинолина
- Производные пиразола
- Производные изохинолина
- Производные пиримидина
- Производные пурина
- Производные имидазола
- Производные изоаллоксазина
- Производные пиридина
- Производные тропана

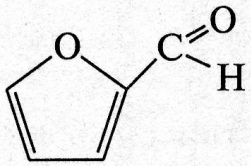
Гетероциклические лекарственные средства

Производные фурана

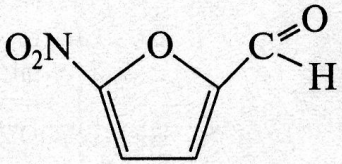
- Нитрофурантоин (фурадонин – Furadononum) – Nitrofurantoin – Nitrofurantoinum $C_8H_6N_4O_5$
- Нитрофурал (Фурацилин – Furacillinum) – Nitrofural – Nitrofuralm $C_6H_6N_4O_4$
- Фуразидин (Фурагин – Furaginum) – Furazidin – Furazidinum $C_{10}H_8N_4O_5$
- Фуразолидон – Furazolidone – Furazolidonum $C_8H_7N_3O_5$

Основу химической структуры лекарственных средств, производных фурана, составляет пятичленный кислородосодержащий гетероцикл. В медицинской практике используют ЛС производные 5-нитрофурфурола (фурфурола, 2-фуранкарбальдегида):

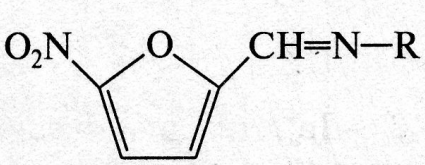
Фуран



Фуран-2-альдегид (Фурфурол)



5-Нитрофурфурол



Общая формула ЛВ производных фурана (нитро-азометинпроизводные фурана)

Производные пиразола

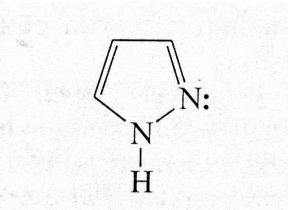
Аминофеназон (Амидопирин – Amidopyrinum) – Aminophenazone – Amunophenazonum C13H17N3O

Феназон (антипирин – Antipyrinum) – Phenazone – Fenazonum C11H12N2O

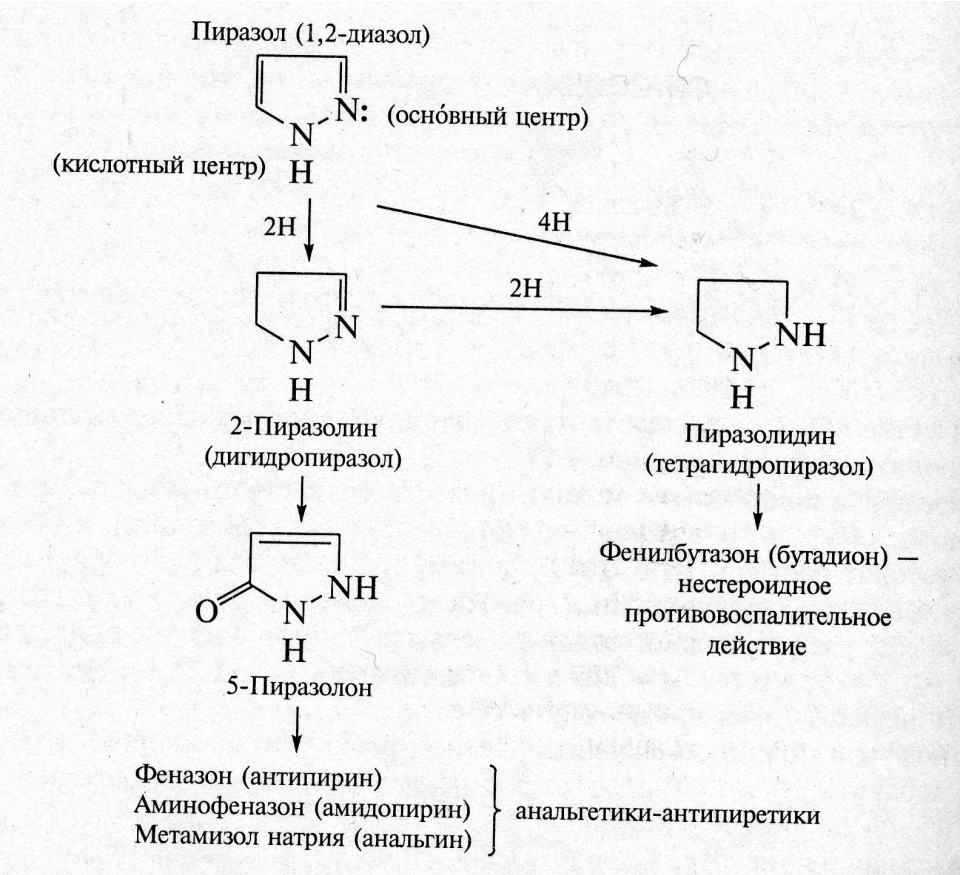
Фенилбутазон (бутадион – Butadionum) – Phenylbutazone C19H20N2O2

Метамизол натрия (Анальгин - Analginum) – Metamizole Sodium – Sodium Metamizolum C13H16N3O4NaS

Пиразол представляет собой пятичленный ароматический гетероцикл с двумя атомами азота:



Один из атомов азота относится к пиррольному типу (кислотный центр), другой – к пиридиновому типу (основной центр)



Производные имидазола

Клонидин гидрохлорид (клофелин - Clophelinum) – Clonidine Hydrochloride – Clonidini Hydrochloridum $C_9H_9Cl_2N_3 \cdot HCl$

Пилокарпин – Pilocarpine – Pilocarpinum $C_{11}H_{16}N_2O_2$

Нафазолин (нафтизин) – Naphazoline – Naphazolinum $C_{14}H_{14}N_2$

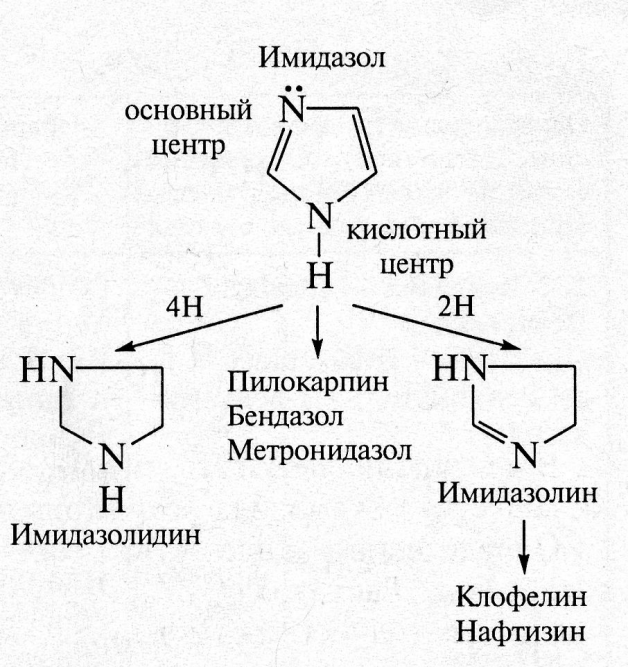
Метронидазол (Трихопол) – Metronidazolum - Metronidazole $C_6H_9N_3O_3$

Бендазол (Дибазол – Dibazolum) – Bendazol – Bendazolum $C_{14}H_{12}N_2$

Имидазол представляет собой пятичленный гетероцикл с двумя атомами азота в положении 1 и 3, неравноценные по своей природе, а следовательно и свойствам. Имидазол обладает способностью к межмолекулярной ассоциации за счет образования водородных связей между атомом пиридинового центра и водородом пиррольного центра.

Рис. 11.2. Межмолекулярные ассоциаты имидазола

При гидрировании имидазола образуется имидазолин и имидазолидин.



Производные пиридина и пиперидина.

Пиридоксальфосфат – Pyrodoxalphosphate – Pyrodoxalphosphas C8H12NO6P

Изониазид – Isoniazide – Izoniazidum C6H7N3O

Пиридоксин (витамин В6) – Pyridoxine – Pyridoxinum C8H11NO3

Фтивазид – Phthivazide – Phtivazidum C14H13N3O3

Нифедипин – Nifedipine – Nifedipinum C17H18N2O6

Ниаламид – Nialamide – Nialomidum C16H19N4O2

Никотинамид – Nicotinamide – Nicotinamidum C6H6NO2

Никотиновая кислота (витамин РР) – Nicotinic acid – Acidum Nicotinicum C6H5NO2

Никетамид (Кордиамин – Cordiaminum) – Nikethamide – Nicetamidum C10H14N2O

Пиридин – это шестичленный гетероцикл с одним атомом азота, который участвует в образовании единой замкнутой системы из 6 **π**-электронов. По химическому строению ЛВ рассматриваемой группы можно разделить на следующие группы:

1. Производные пиридин-3-карбоновой (никотиновой) кислоты
2. Производные пиридин-4-карбоновой (изоникотиновой) кислоты
3. Производные пиридинметанола
4. Производные дигидропиридина.

Производные пиримидина

Тиопентал натрия – Thiopental sodium – Thiopentalum natricum $C_{11}H_{17}N_2O_2SNa$

Ламивудин – Lamivudine – Lamivudinum $C_8H_{11}N_3O_3S$

Фенобарбитал (Люминал) – Phenobarbital – Phenobarbitalum $C_{12}H_{12}N_2O_3$

Флуороурацил (Фторурацил) – Methyluracil – Methyluracilum $C_4H_3FN_2O_2$

Барбитал – Barbital – Barbitalum $C_8H_{12}N_2O_3$

Зерит (Ставудин) – Zerit – Zeritum $C_{10}H_{12}N_2O_4$

Бензобарбитал (Бензонал) – Benzobarbital – Benzobarbitalum $C_{19}H_{16}N_2O_4$

Гексобарбитал (Гексенал) – Hexobarbital – Hexobarbitalum $C_{12}H_{16}N_2O_3$

Барбитал натрий – Barbital sodium – Barbitalum natrium $C_8H_{11}N_2NaO_3$

Тегафур (Фторафур) – Tegafur – Tegafurum $C_8H_9FN_2O_3$

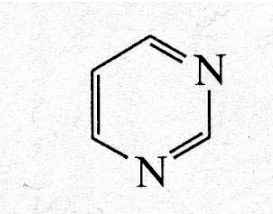
Зидовудин (Тимазид) – Zidovudine – Zidovudinum $C_{10}H_{13}N_5O_4$

Тиамин (Тиамина гидрохлорид) – Thiamine – Thiaminum $C_{12}H_{17}ClN_4OS \cdot HCl$

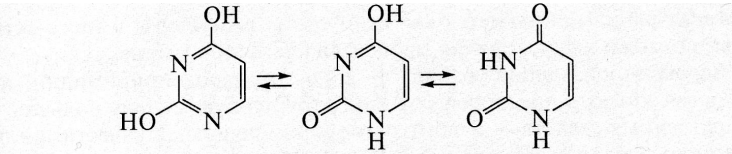
Метилурацил – Methyluracil – Methyluracilum $C_5H_6N_2O_2$

Примидон (Гексамидин) – Primidone – Primidonum $C_{12}H_{14}N_2O_2$

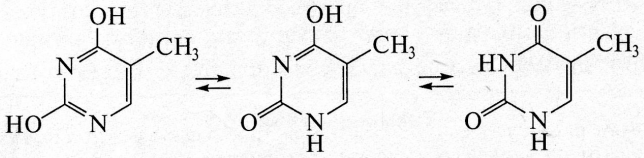
Пиримидин – один из изомерных диазинов – представляет собой шестичленный гетероцикл с двумя атомами азота.



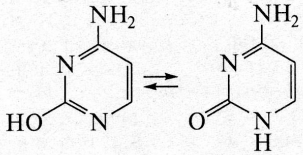
Для соединений и ЛВ этой группы характерна лактим – лактамная таутомерия:



Урацил (2,4-дигидроксипиримидин)



Тимин (2,4-дигидрокси-5-метилпиримидин, или 5-метилурацил)



Цитозин (4-амино-2-гидроксипиримидин)

Производные тропана

Гоматропина гидробромид –
Homatropine hydrobromide –
Homatropini hydrobromidum
$C_{16}H_{21}NO_3 \cdot HBr$

Скополамин –
Scopolamine –
Scopolaminum
$C_{17}H_{21}NO_4$

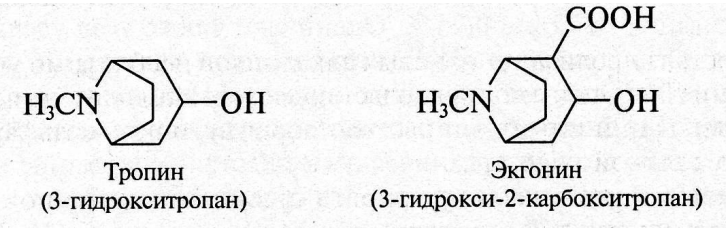
Атропин –
Atropine –
Atropinum
$C_{17}H_{23}NO_3$

Троподифен –
Tropodifene –
Tropodifenum
$C_{24}H_{29}NO_4$

Кокаин гидрохлорид –
Cocaine hydrochloride –
Cocaini hydrochloridum
$C_{17}H_{21}NO_4$

Тропан – бициклическое основание, содержащее два конденсированных цикла : пятичленный пирролидин и шестичленный пиперидин.

ЛС на основе тропана могут быть разделены на две группы: производные спирта тропина (группа атропина) и производные оксикарбоновой кислоты экгонина (группа кокаина)



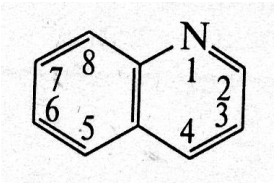
Производные хинолина

Хинина гидрохлорид – Quinine hydrochloride – Chinini hydrochloridum $[C_{20}H_{24}N_2O_2] \cdot HCl \cdot 2H_2O$

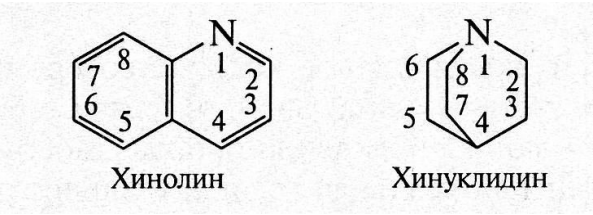
Хинина дигидрохлорид – Quinine dihydrochloride – Chinini dihydrochloridum $[C_{20}H_{24}N_2O_2] \cdot 2HCl$

Хинина сульфат – Quinine sulfate – Chinini sulfas $[C_{20}H_{24}N_2O_2]_2 \cdot H_2SO_4 \cdot 2H_2O$

Хинолин (бензопиридин) – конденсированная система, образованная ароматическим бензольным ядром и пиридиновым циклом:



Наибольшее значение имеют 4 алкалоида, выделенные из хинной корки, - хинин, хинидин, цинхонин и цинхонидин. Их структурной основой служат две гетероциклические системы: хинолин и хинуклидин (конденсированная система, состоящая из двух пиперидиновых циклов):

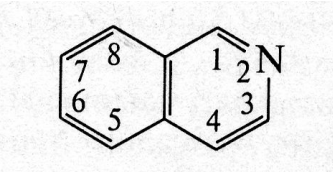


Производные изохинолина

Папаверина гидрохлорид –
Papaverine hydrochloride –
Papaverini hydrochloridum
C20H21NO4HCl

Дротаверин
(Но-шпа) –
Drotaverine –
Drotaverinum
C24H31NO4

Изохинолин – изомер хинолина:

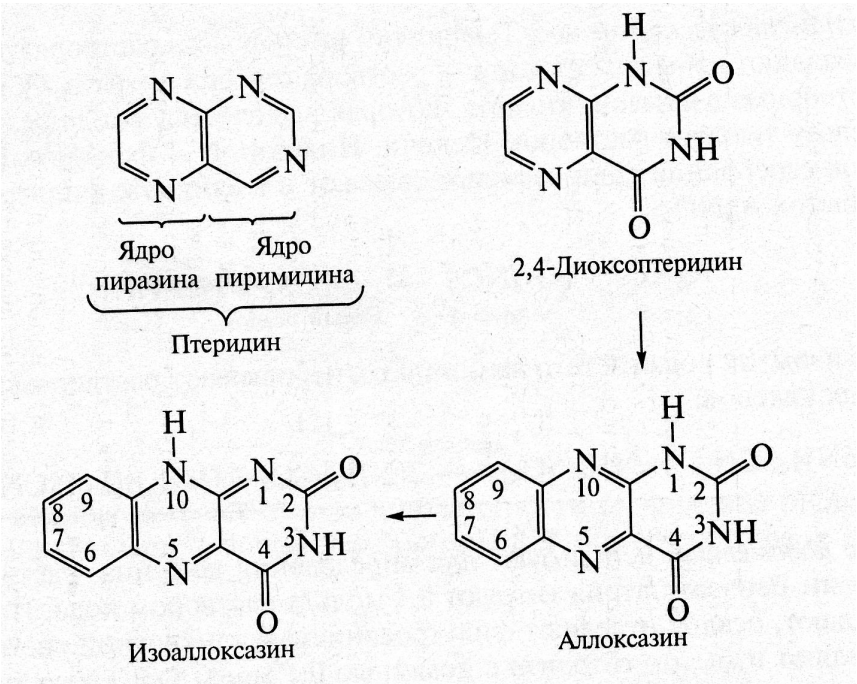


Ядро изохинолина входит в состав изохинолиновых алкалоидов.

Производные изоаллоксазина

Рибофлавин
(витамин В2) –
Riboflavine –
Riboflavinum
C17H20N4O6

Аллоксазин – сопряженная гетероциклическая система, включающая ядро диоксоптеридина и бензольного цикла. В отличие от аллоксазина изоаллоксазин содержит не полностью гидрированный цикл диоксопиримидина и только одну имидную группу:



Производные пурина

Аденозина фосфат – Adenosinephosphate – Adenosini phosphas $C_{10}H_{14}N_5O_7P$

Теобромин – Theobromine – Theobrominum $C_7H_8N_4O_2$

Теофиллин – Theophylline – Theophyllinum $C_7H_8N_4O_2$

Инозин (Рибоксин) – Inosine – Inosinum $C_{10}H_{12}N_4O_5$

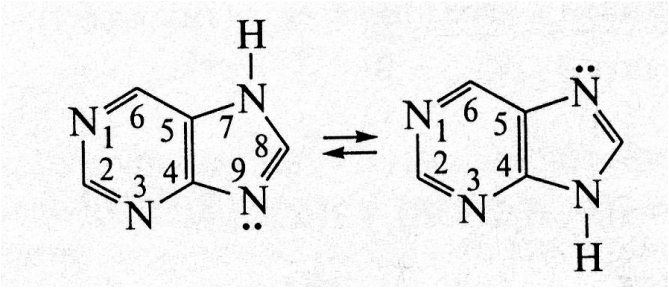
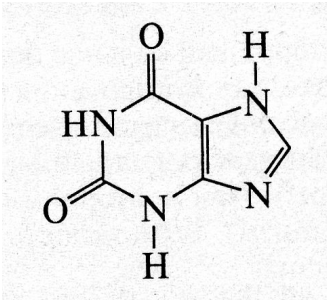
Дипрофиллин – Diprophylline – Diprophyllinum $C_{10}H_{14}N_4O_4$

Кофеин – Coffein – Coffeinum $C_8H_{10}N_4O_2$

Кофеин-бензоат натрия – Coffein natrii benzoas – Coffeinum natrii benzoas

Аллопуринол – Allopurinol – Allopurinolum $C_5H_4N_4O$

Пурин – гетероароматическая дициклическая конденсированная система, включающая ядро имидазола и пиримидина.



Среди ЛС – производных пурина, большую группу составляют производные ксантина (2,6-пуриндиона)