

# Гетероциклические лекарственные средства

Производные  
фурана

Производные  
хинолина

Производные  
пиразола

Производные  
изохинолина

Производные  
пиримидина

Производные  
пурина

Производные  
имидазола

Производные  
изоаллоксазина

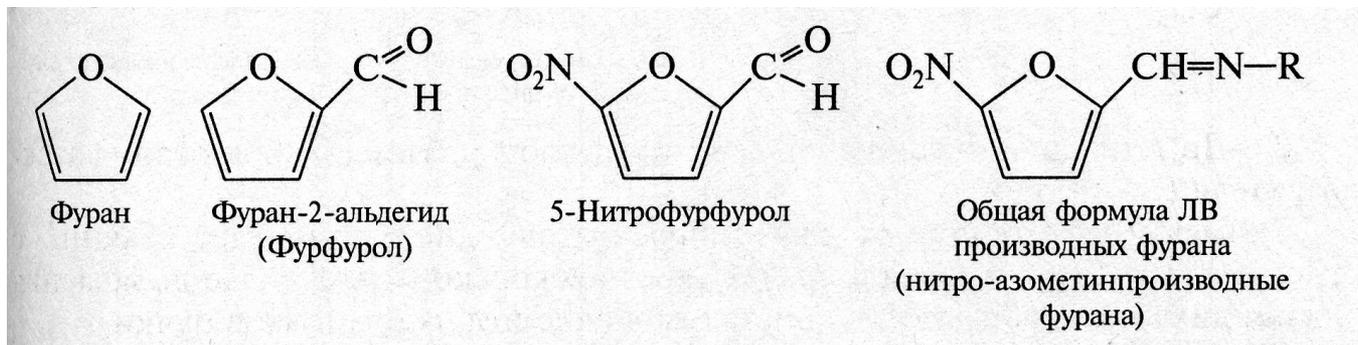
Производные  
тропана

Производные  
пиридина

# Гетероциклические лекарственные средства



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



## Производные пиразола

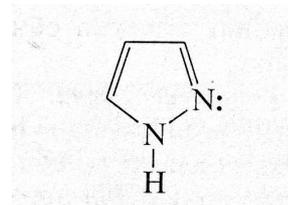
Аминофеназон  
(Амидопирин –  
Amidopyrinum) –  
Aminophenazone –  
Aminophenazonum  
C<sub>13</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O

Феназон  
(антипирин –  
Antipyrinum) –  
Phenazone –  
Fenazonum  
C<sub>11</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O

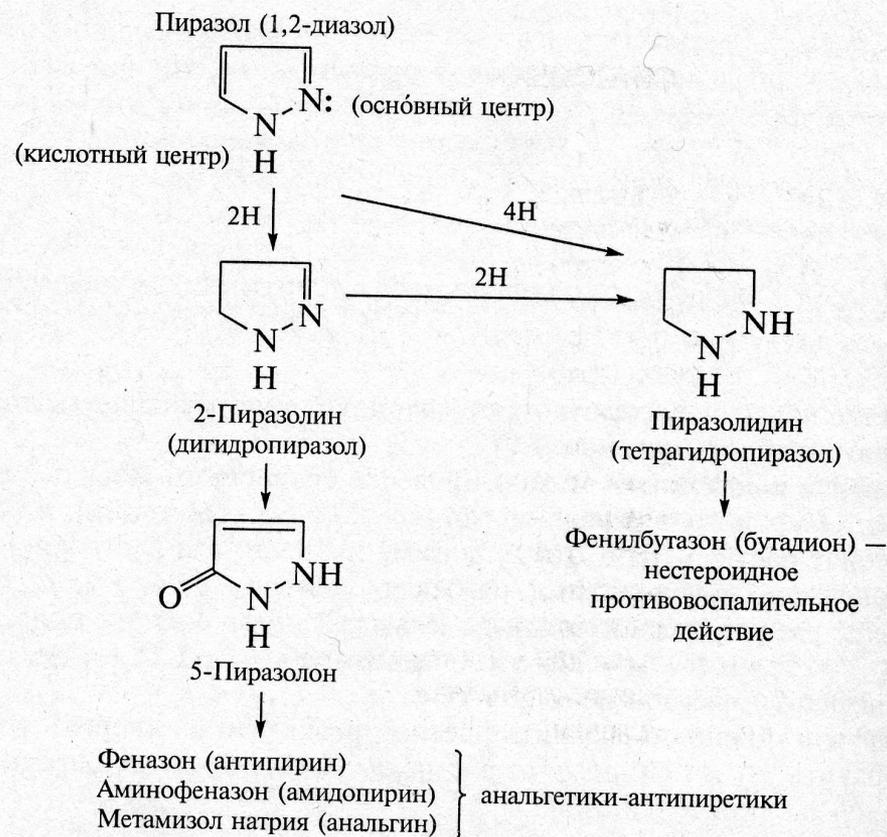
Фенилбутазон  
(бутадион –  
Butadionum) –  
Phenylbutazone  
C<sub>19</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

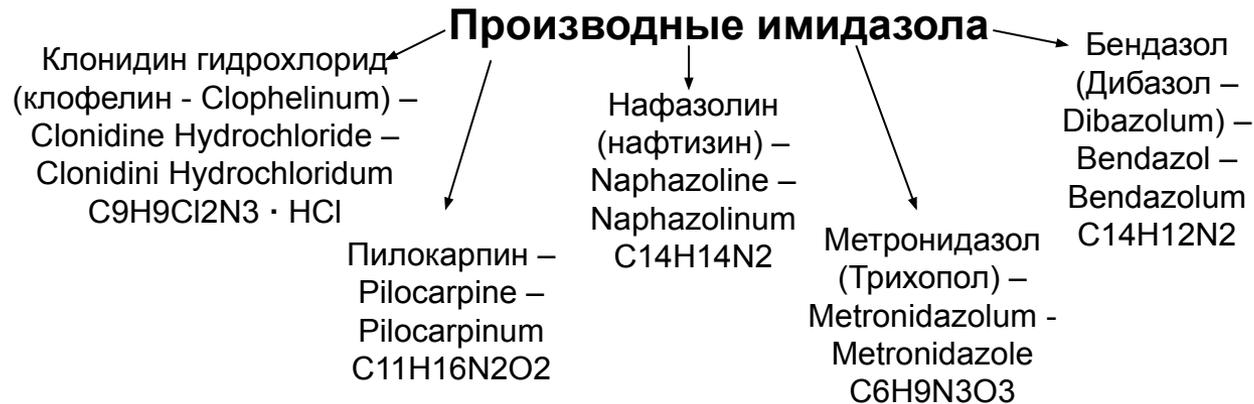
Метамизол натрия  
(Анальгин - Alginum) –  
Metamizole Sodium –  
Sodium Metamizolum  
C<sub>13</sub>H<sub>16</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>NaS

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)





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.

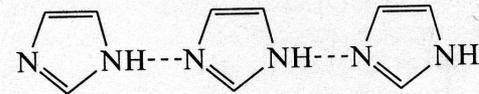
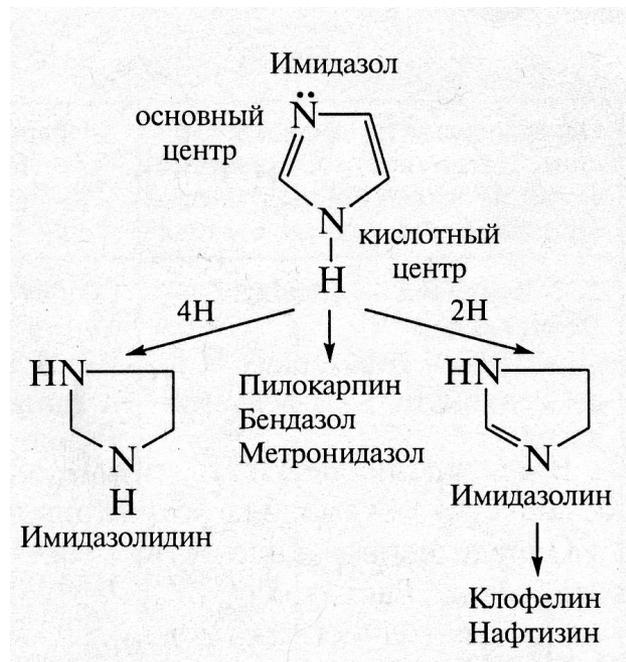


Рис. 11.2. Межмолекулярные ассоциации имидазола

При гидрировании имидазола образуется имидазолин и имидазолидин.





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 пиридина

Тиопентал натрия –  
Thiopental sodium –  
Thiopentalum natriicum  
C<sub>11</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>SNa

Ламивудин –  
Lamivudine –  
Lamivudinum  
C<sub>8</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S

Фенобарбитал  
(Люминал) –  
Phenobarbital –  
Phenobarbitalum  
C<sub>12</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

Флуороурацил  
(Фторурацил) –  
Methyluracil –  
Methyluracilum  
C<sub>4</sub>H<sub>3</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

Барбитал –  
Barbital –  
Barbitalum  
C<sub>8</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

Зерит  
(Ставудин) –  
Zerit –  
Zeritum  
C<sub>10</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>

Бензобарбитал  
(Бензонал) –  
Benzobarbital –  
Benzobarbitalum  
C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>

Гексобарбитал  
(Гексенал) –  
Hexobarbital –  
Hexobarbitalum  
C<sub>12</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

Барбитал натрия –  
Barbital sodium –  
Barbitalum natrium  
C<sub>8</sub>H<sub>11</sub>N<sub>2</sub>NaO<sub>3</sub>

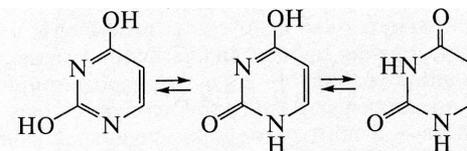
Тевафур  
(Фторафур) –  
Tegafur –  
Tegafurum  
C<sub>8</sub>H<sub>9</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

Зидовудин  
(Тимазид) –  
Zidovudine –  
Zidovudinum  
C<sub>10</sub>H<sub>13</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>

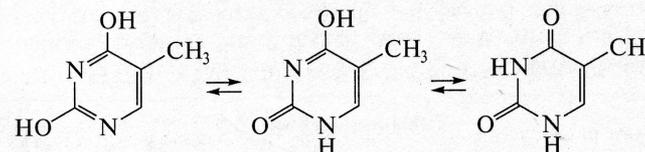
Тиамин  
(Тиамина гидрохлорид) –  
Thiamine – Thiaminum  
C<sub>12</sub>H<sub>17</sub>CIN<sub>4</sub>OS · HCl

Метилурацил –  
Methyluracil –  
Methyluracilum  
C<sub>5</sub>H<sub>6</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

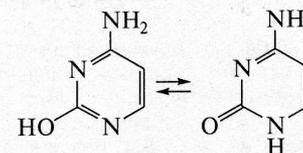
Примидон  
(Гексамидин) –  
Primidone –  
Primidonum  
C<sub>12</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>



Урацил (2,4-дигидроксипиридин)

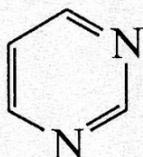


Тимин (2,4-дигидрокси-5-метилпиридин, или 5-метилурацил)



Цитозин (4-амино-2-гидроксипиридин)

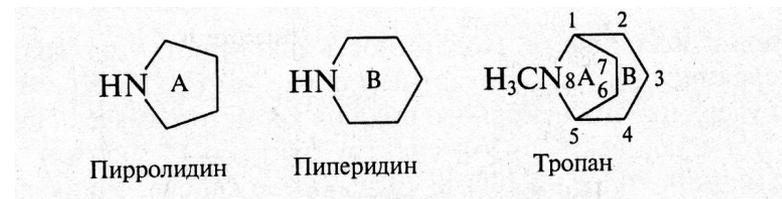
Пиридин – один из изомерных  
диазинов – представляет собой  
шестичленный гетероцикл с  
двумя атомами азота.



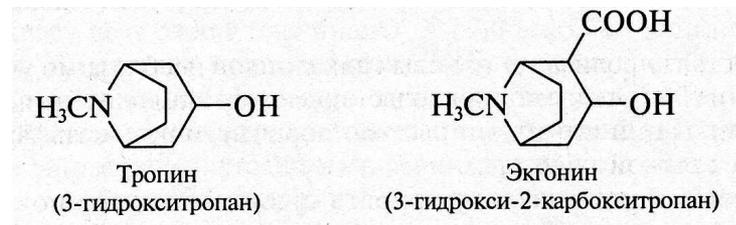
Для соединений и ЛВ  
этой группы характерна  
лаким – лактамная  
таутомерия:



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 эггонина (группа кокаина)



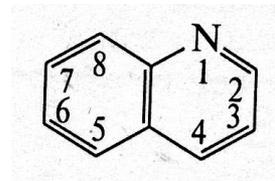
## Производные хинолина

Хинина гидрохлорид –  
Quinine hydrochloride –  
Chinini hydrochloridum  
[C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>] · HCl ·  
2H<sub>2</sub>O

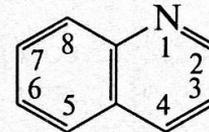
Хинина дигидрохлорид –  
Quinine dihydrochloride –  
Chinini dihydrochloridum  
[C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>] · 2HCl

Хинина сульфат –  
Quinine sulfate –  
Chinini sulfas  
[C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>]<sub>2</sub> · H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> ·  
2H<sub>2</sub>O

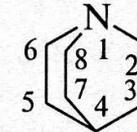
Хинолин (бензопиридин) –  
конденсированная система,  
образованная ароматическим  
бензольным ядром и пиридиновым  
циклом:



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):



Хинолин



Хинуклидин

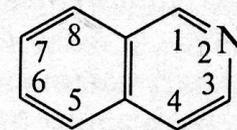
## Производные изохинолина

Папаверина гидрохлорид –  
Papaverine hydrochloride –  
Papaverini hydrochloridum  
C<sub>20</sub>H<sub>21</sub>NO<sub>4</sub>HCl

Дротаверин  
(Но-шпа) –  
Drotaverine –  
Drotaverinum  
C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>NO<sub>4</sub>

Изохинолин – изомер хинолина:

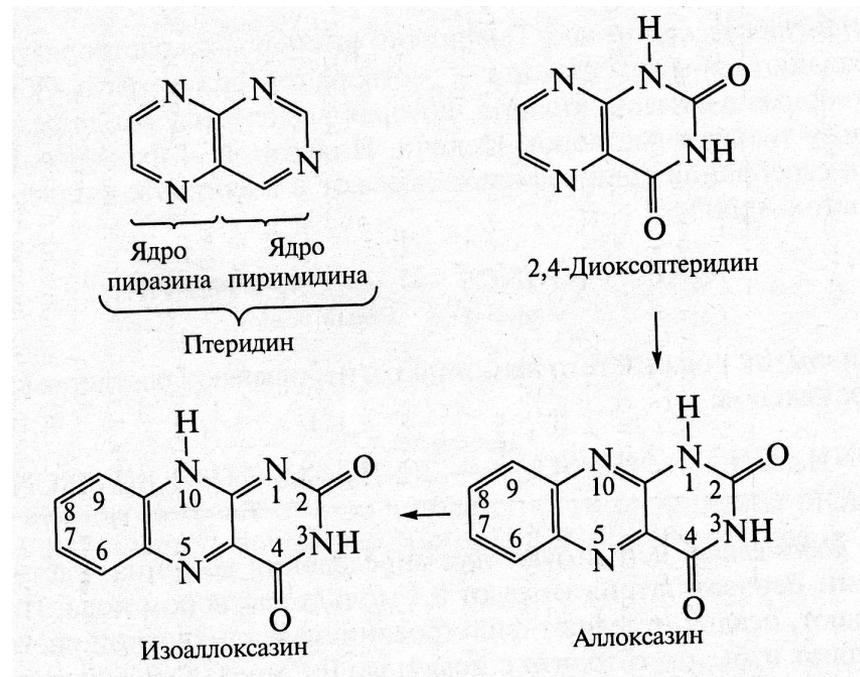
Ядро изохинолина входит в состав  
изохинолиновых алкалоидов.

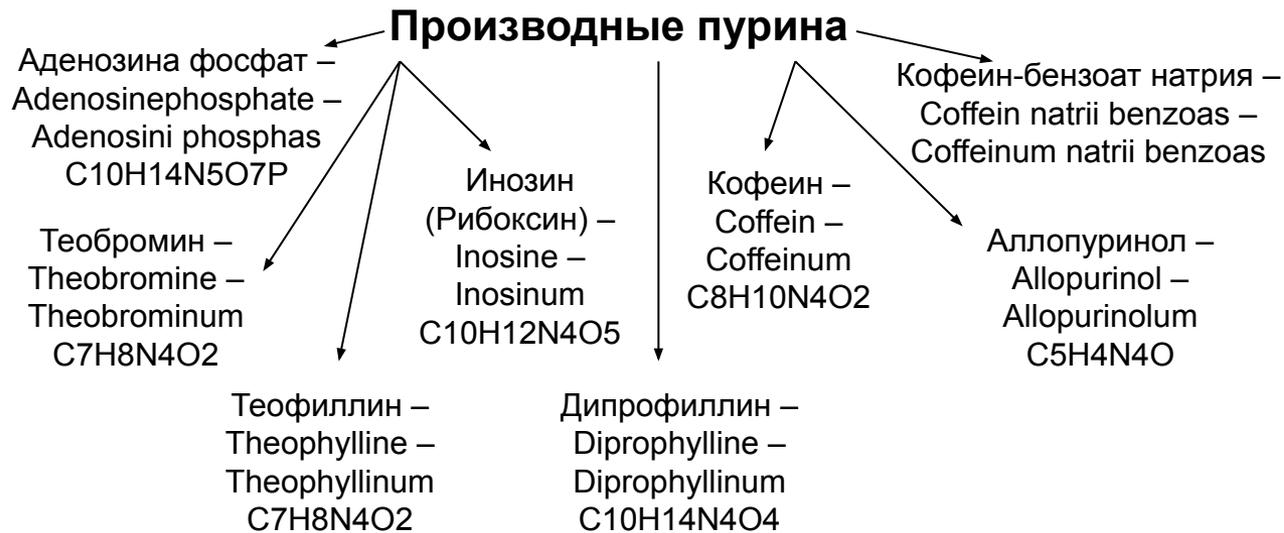


## Производные изоаллоксазина

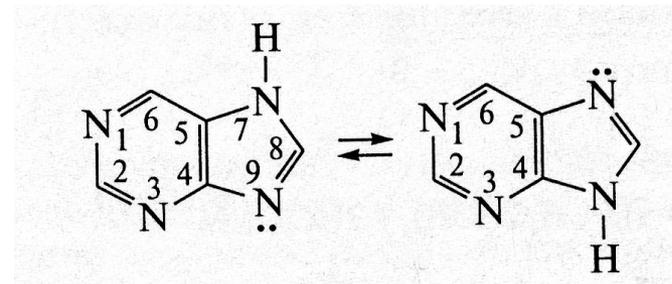
Рибофлавин  
(витамин B<sub>2</sub>) –  
Riboflavine –  
Riboflavinum  
C<sub>17</sub>H<sub>20</sub>N<sub>4</sub>O<sub>6</sub>

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:





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



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

