

Гетероциклические лекарственные средства

Производные
фурана

Производные
хинолина

Производные
пиразола

Производные
изохинолина

Производные
пиримидина

Производные
пурина

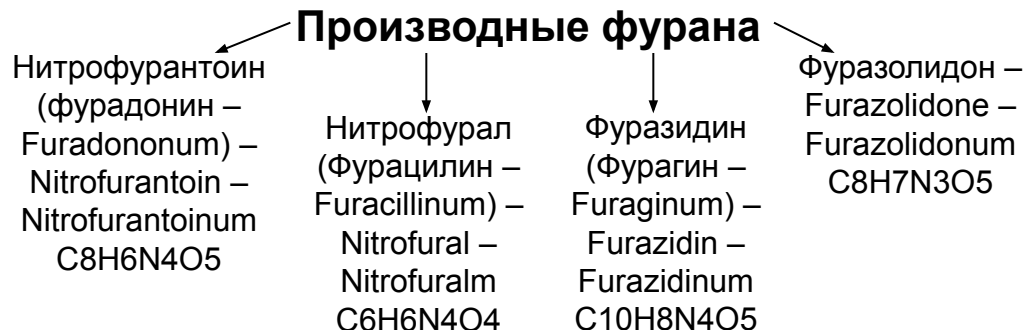
Производные
имидазола

Производные
изоаллоксазина

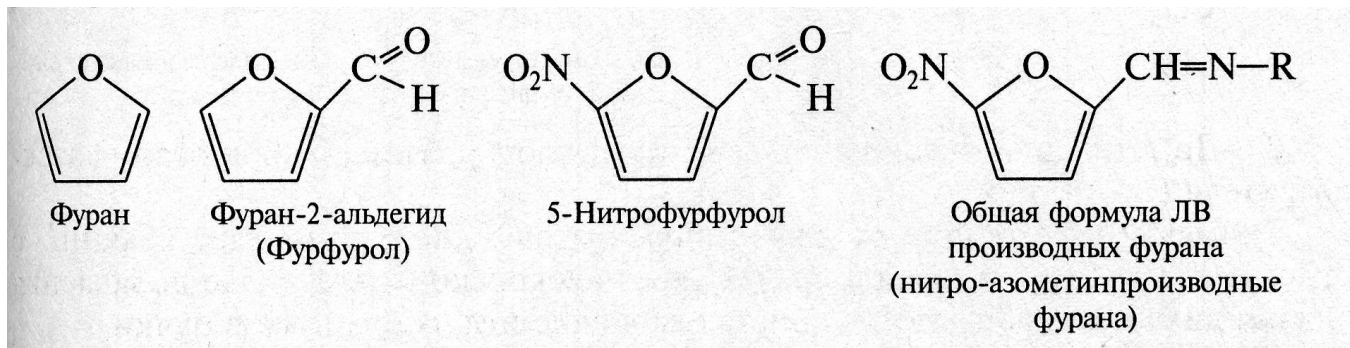
Производные
тропана

Производные
пиридина

Гетероциклические лекарственные средства



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



Производные пиразола

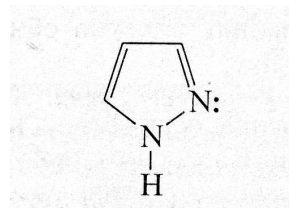
Аминофеназон
(Амидопирин –
Amidopyrinum) –
Aminophenazone –
Aminophenazonum
C₁₃H₁₇N₃O

Феназон
(антипирин –
Antipyrinum) –
Phenazone –
Fenazonum
C₁₁H₁₂N₂O

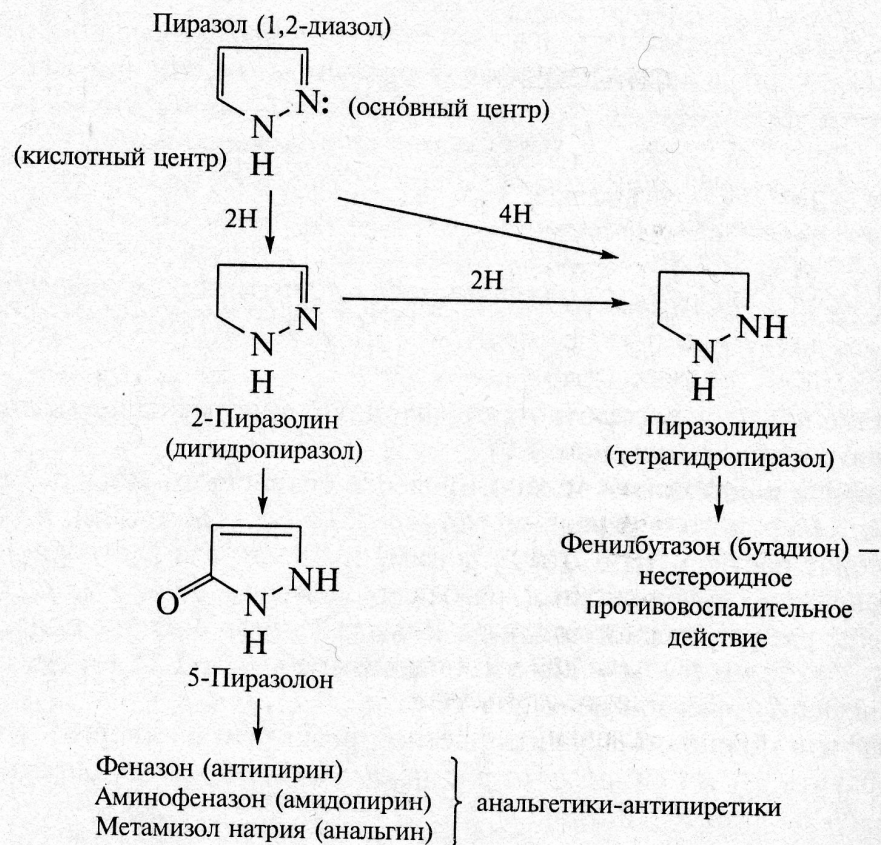
Фенилбутазон
(бутадион –
Butadionum) –
Phenylbutazone
C₁₉H₂₀N₂O₂

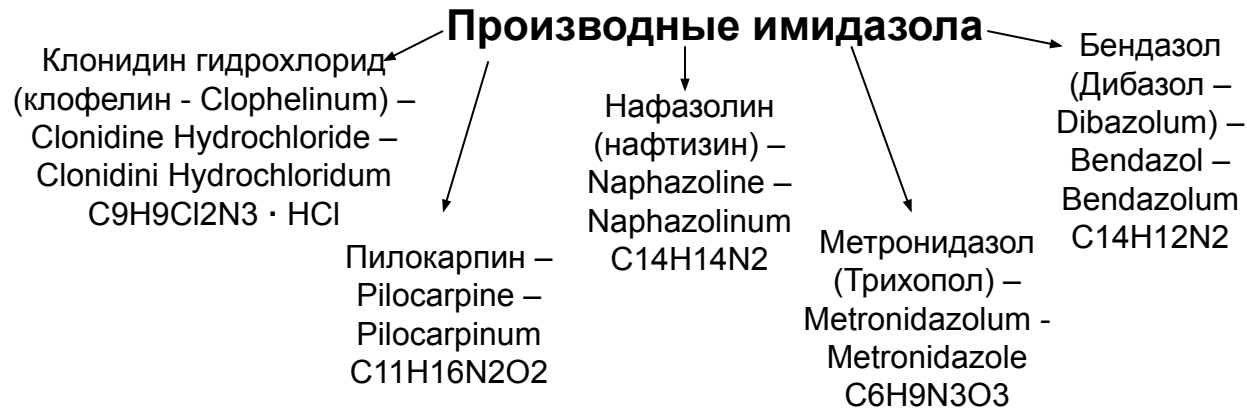
Метамизол натрия
(Анальгин - Alginum) –
Metamizole Sodium –
Sodium Metamizolum
C₁₃H₁₆N₃O₄NaS

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)





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.

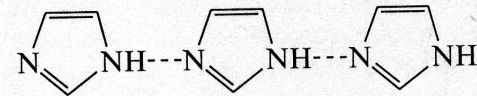
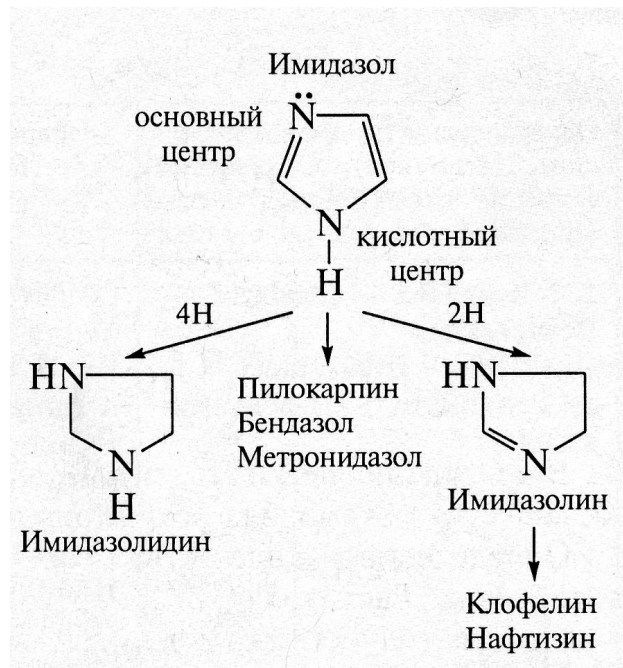
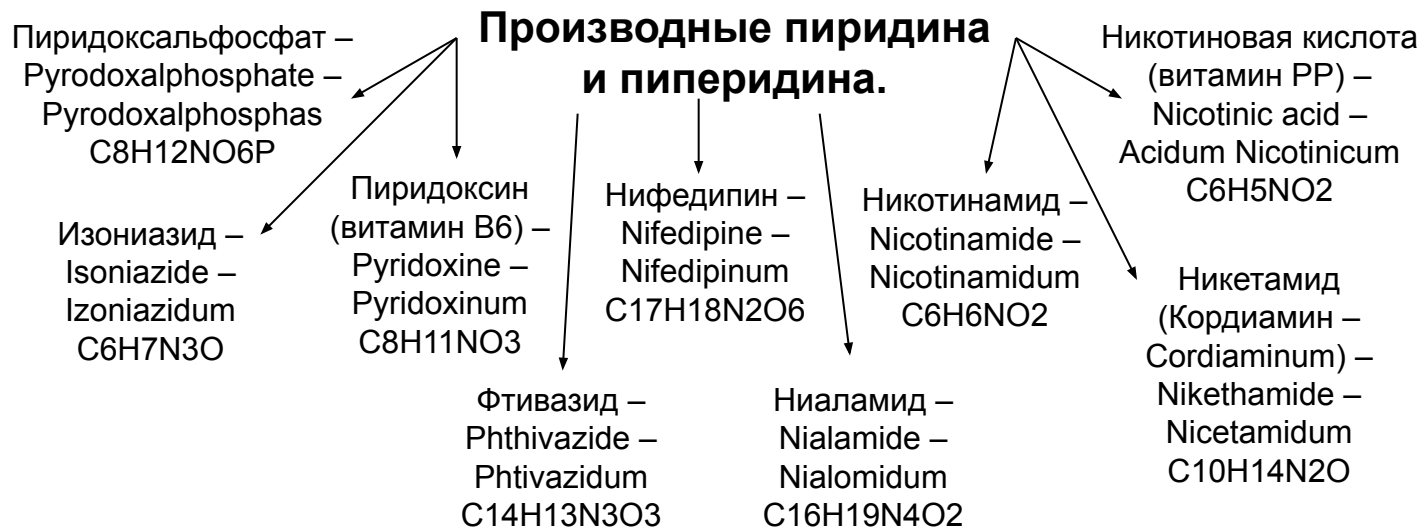


Рис. 11.2. Межмолекулярные ассоциации имидазола

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
C₁₁H₁₇N₂O₂SNa

Ламивудин –
Lamivudine –
Lamivudinum
C₈H₁₁N₃O₃S

Фенобарбитал
(Люминал) –
Phenobarbital –
Phenobarbitalum
C₁₂H₁₂N₂O₃

Флуороурацил
(Фторурацил) –
Methyluracil –
Methyluracilum
C₄H₃FN₂O₂

Барбитал –
Barbital –
Barbitalum
C₈H₁₂N₂O₃

Зерит
(Ставудин) –
Zerit –
Zeritum
C₁₀H₁₂N₂O₄

Бензобарбитал
(Бензонал) –
Benzobarbital –
Benzobarbitalum
C₁₉H₁₆N₂O₄

Гексобарбитал
(Гексенал) –
Hexobarbital –
Hexobarbitalum
C₁₂H₁₆N₂O₃

Барбитал натрия –
Barbital sodium –
Barbitalum natrium
C₈H₁₁N₂NaO₃

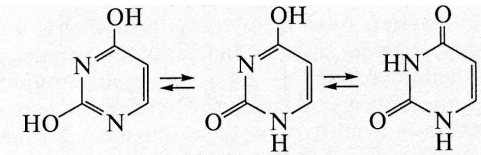
Тевафур
(Фторафур) –
Tegafur –
Tegafurum
C₈H₉FN₂O₃

Зидовудин
(Тимазид) –
Zidovudine –
Zidovudinum
C₁₀H₁₃N₅O₄

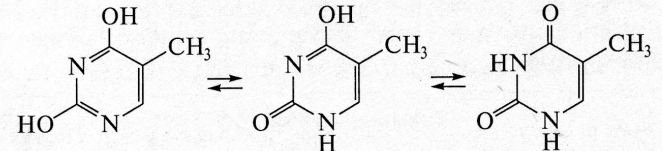
Тиамин
(Тиамина гидрохлорид) –
Thiamine – Thiaminum
C₁₂H₁₇CIN₄OS · HCl

Метилурацил –
Methyluracil –
Methyluracilum
C₅H₆N₂O₂

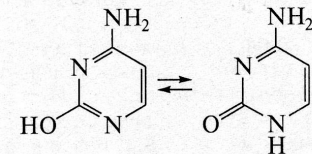
Примидон
(Гексамидин) –
Primidone –
Primidonum
C₁₂H₁₄N₂O₂



Урацил (2,4-дигидроксипиридин)



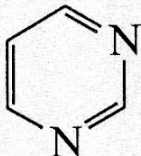
Тимин (2,4-дигидрокси-5-метилпиридин, или 5-метилурацил)

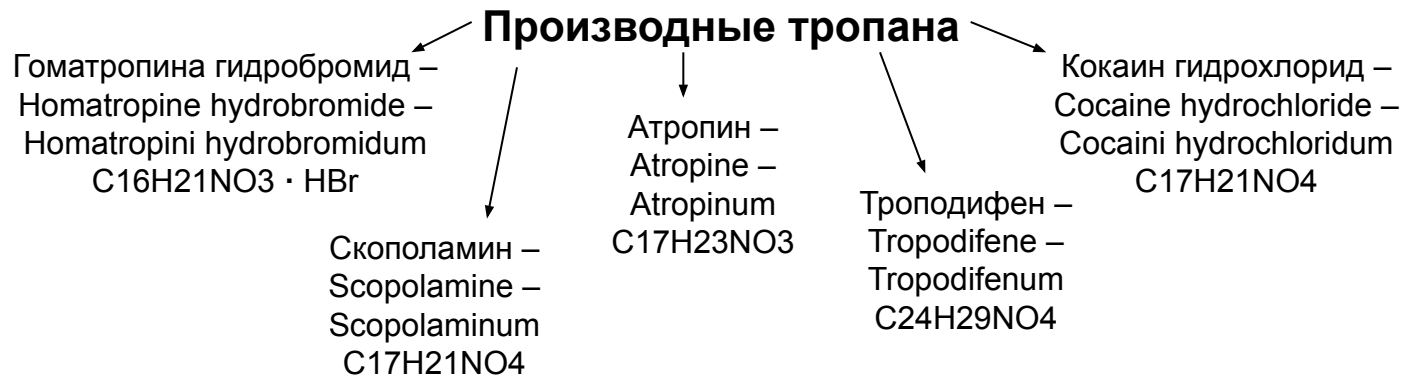


Цитозин (4-амино-2-гидроксипиридин)

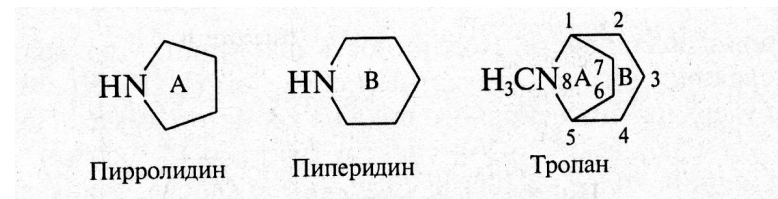
Для соединений и ЛВ этой группы характерна лактим – лактамная таутомерия:

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

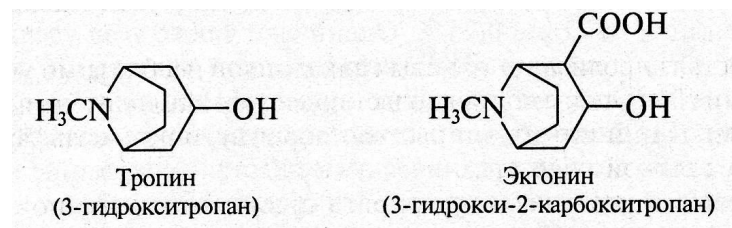




Тропан – бициклическое основание, содержащее два конденсированных цикла : пятичленный пирролидин и шестичленный пиперидин.



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



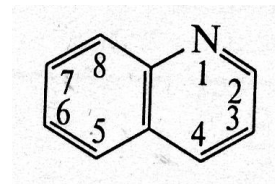
Производные хинолина

Хинина гидрохлорид –
Quinine hydrochloride –
Chinini hydrochloridum
[C₂₀H₂₄N₂O₂] · HCl ·
2H₂O

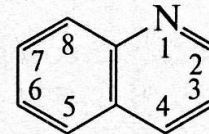
Хинина дигидрохлорид –
Quinine dihydrochloride –
Chinini dihydrochloridum
[C₂₀H₂₄N₂O₂] · 2HCl

Хинина сульфат –
Quinine sulfate –
Chinini sulfas
[C₂₀H₂₄N₂O₂]₂ · H₂SO₄ ·
2H₂O

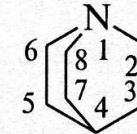
Хинолин (бензопиридин) –
конденсированная система,
образованная ароматическим
бензольным ядром и пиридиновым
циклом:



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

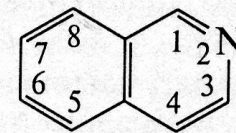
Производные изохинолина

Папаверина гидрохлорид –
Papaverine hydrochloride –
Papaverini hydrochloridum
C₂₀H₂₁NO₄HCl

Дротаверин
(Но-шпа) –
Drotaverine –
Drotaverinum
C₂₄H₃₁NO₄

Изохинолин – изомер хинолина:

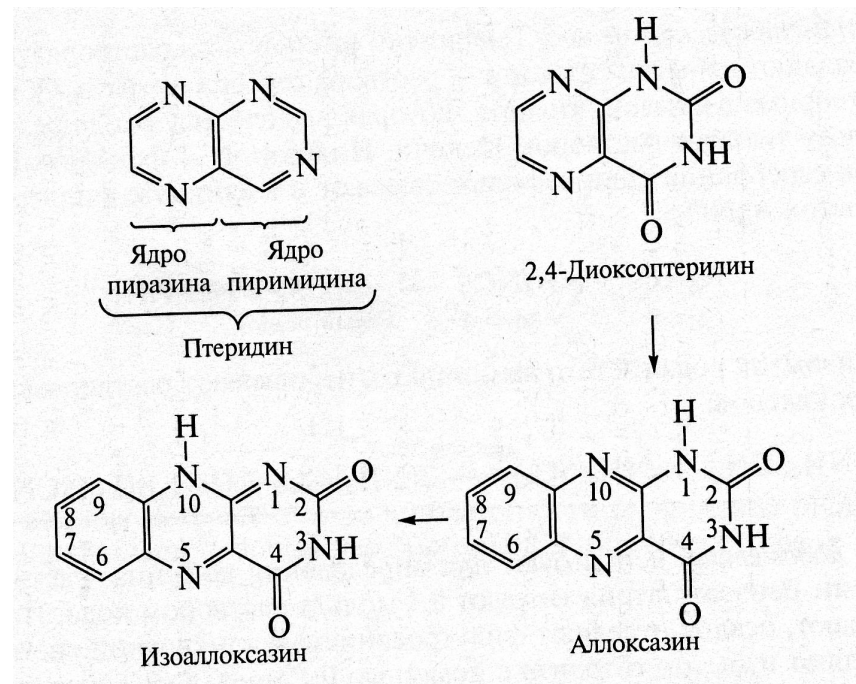
Ядро изохинолина входит в состав
изохинолиновых алкалоидов.

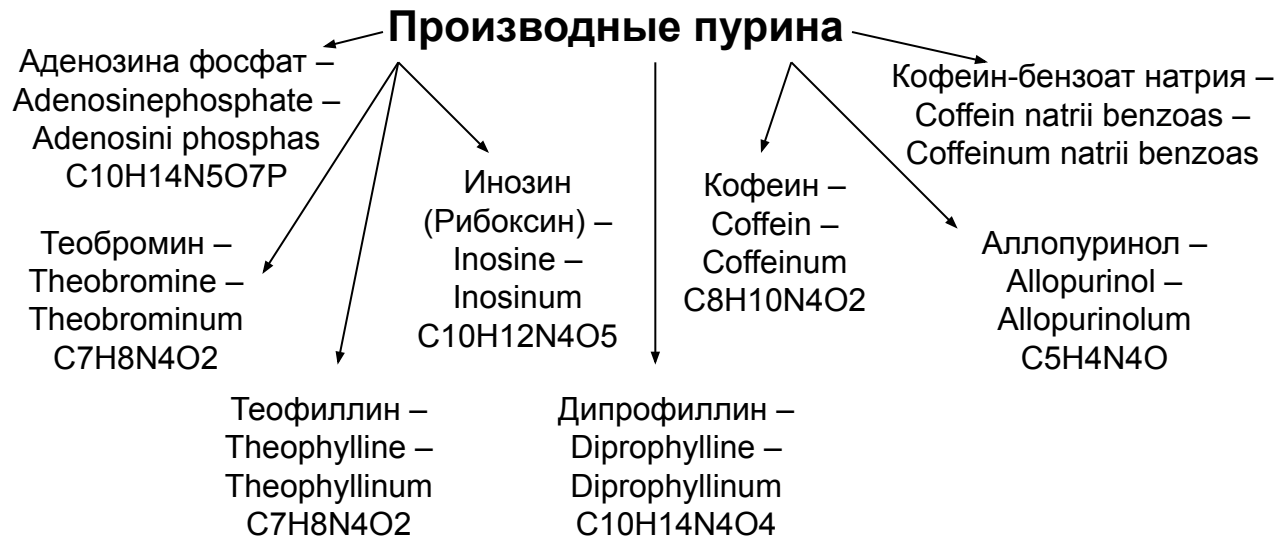


Производные изоаллоксазина

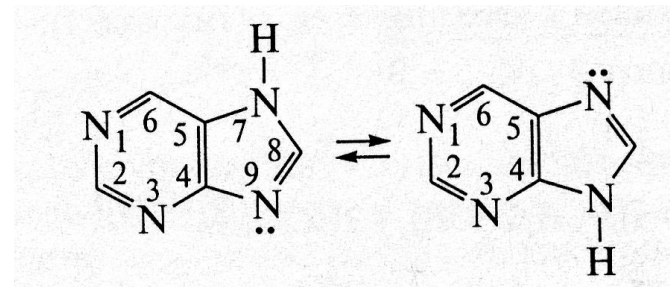
Рибофлавин
(витамин B₂) –
Riboflavine –
Riboflavinum
C₁₇H₂₀N₄O₆

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:





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



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

