Министерство здравоохранения

УО Витебский государственный ордена Дружбы народов медицинский университет

Кафедра ботаники и фармакогнозии с курсом ФПК и ПК

Курсовая работа

на тему: «Алкалоиды и их фармакологическая активность»

Исполнитель: студентка 4 группы 3 курса

фармацевтического факультета

Мойсевич А.А.

Руководитель: Кузмичева Н.А.

Витебск 2010г.

**Содержание**

1. Введение 2
2. Историческая справка 4
3. Номенклатура и классификация 6
4. Распространение алкалоидов в растительном мире 12
5. Факторы, влияющие на накопление алкалоидов в растениях 13
6. Функции алкалоидов 15
7. Биогенез 17
8. Фармакологическая активность и применение 20
9. Важнейшие алкалоиды 22
10. Заключение 28
11. Список литературы 29

**Введение**

C древнейших времен человек использовал алкалоиды как лекарства, яды и колдовские зелья, однако структура многих из этих соединений была определена относительно недавно. Термин «алкалоид» («похожий на щелочь») был предложен в 1819 фармацевтом В.Мейснером. Первое современное определение (1910), данное Э.Винтерштейном и Г.Триром, описывает алкалоид в широком смысле как азотсодержащее вещество основного характера растительного или животного происхождения; при этом истинный алкалоид должен удовлетворять четырем условиям: 1) атом азота должен быть частью гетероциклической системы; 2) соединение должно иметь сложную молекулярную структуру; 3) оно должно проявлять значительную фармакологическую активность и 4) иметь растительное происхождение.

К настоящему времени выделено свыше 10 000 алкалоидов разнообразных структурных типов, что превышает число известных соединений любого другого класса природных веществ. Неудивительно, что классическое определение Винтерштейна – Трира устарело: соединения, рассматриваемые большинством химиков и фармакологов как алкалоиды, не отвечают всем его требованиям. Например, колхицин и пиперин не имеют основного характера, в то же время колхицин и такие фенилэтиламины, как мескалин, не являются гетероциклами.

Сложность структуры – слишком расплывчатое понятие, чтобы входить в определение: то, что сложно для одних химиков, кажется простым для других. Фармакологическая активность – неудачный критерий, поскольку многие вещества проявляют ее, если присутствуют в достаточных дозах. Если включить ее в определение, придется оговорить уровень доз. Многие вещества со структурой классических алкалоидов получены из материалов нерастительного происхождения – тканей животных, грибов (в том числе плесневых), бактерий. Так что новое определение понятия «алкалоид», с одной стороны, должно охватывать возможно большее число соединений, относимых к алкалоидам большинством исследователей, а с другой – исключать такие классы природных азотсодержащих соединений, как алифатические амины, аминокислоты, аминосахара, белки и пептиды, нуклеиновые кислоты, нуклеотиды, птерины, порфирины и витамины. Следующее определение, предложенное У.Пельтье, отвечает этим условиям и поэтому получило широкое признание: алкалоид – это циклическое органическое соединение, содержащее азот в отрицательной степени окисления и имеющее ограниченное распространение среди живых организмов.

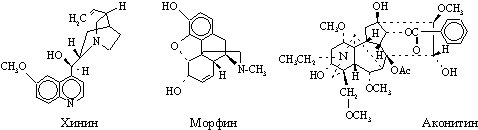
Требование наличия циклического фрагмента в структуре молекулы исключает из списка алкалоидов простые низкомолекулярные производные аммония, а также циклические полиамины, такие, как путресцин H2N(CH2)4NH2, спермидин H2N(CH2)4NH(CH2)3NH2 и спермин H2N(CH2)3NH(CH2)4NH(CH2)3NH2. В то же время требование наличия азота в отрицательной степени окисления (с.о.) обусловливает включение в список алкалоидов аминов (с.о. –3), аминоксидов (–1), амидов (–3) и четвертичных аммониевых солей (–3), но исключает нитро- (+3) и нитрозо- (+1) соединения.

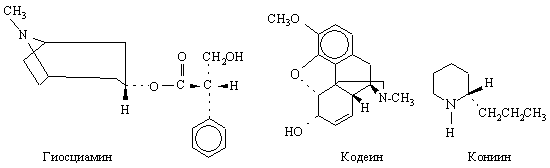
При этом важно, чтобы соблюдалось [условие](javascript://) ограниченной распространенности в живой природе, иначе почти все природные азотистые соединения пришлось бы причислить к алкалоидам.

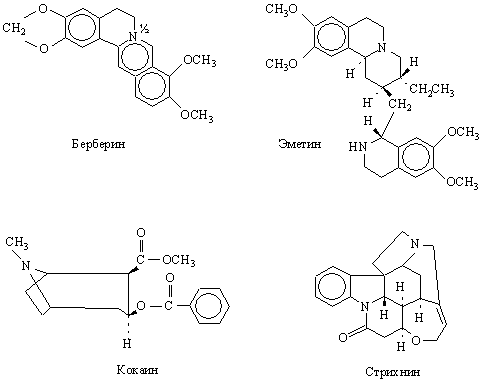
Определение алкалоидов, предложенное Пельтье, [удобно](javascript://) в том отношении, что подтверждает отнесение к алкалоидам большинства тех соединений, которые, хотя традиционно считаются алкалоидами, должны были бы исключаться из их числа согласно классическому определению Винтерштейна – Трира. Это, например, колхицин, пиперин, фенилэтиламины, рицинин, генцианин, буфотоксин. Поскольку структурой соединения определяется его принадлежность к алкалоидам, антибиотики соответствующей структуры (например, циклосерин, глиотоксин, митомицин С, пенициллин, стрептомицин и стрептонигрин) тоже могут быть отнесены к алкалоидам.[1]

**Историческая справка**

Начало химии алкалоидов обычно относят к 1803, когда Л.Ш.Деронь выделил из опиума – высохшего на воздухе млечного сока снотворного (опийного) мака *Papaver somniferum* – смесь алкалоидов, которую он назвал наркотином. Затем в 1805 Ф.Сертюрнер сообщил о выделении морфина из опиума. Он приготовил несколько солей морфина и показал, что именно морфином обусловливается физиологическое действие опиума. Позднее (1810) Б.Гомес обработал спиртовый экстракт коры хинного дерева щелочью и получил кристаллический продукт, который назвал «цинхонино». П.Пельтье и Ж.Кавенту на фармацевтическом факультете Сорбонны (1820) выделили из «цинхонино» два алкалоида, названные хинином и цинхонином. Позднее исследователи получили более двух десятков оснований из экстрактов коры хинного дерева и растений рода ремиджия (*Remijia*) сем. мареновых. Между 1820 и 1850 было выделено и описано большое число алкалоидов новых разнообразных типов. Среди них аконитин из растений рода аконит (*Aconitum*, борец) – одно из наиболее токсичных веществ растительного происхождения; атропин – оптически неактивная форма гиосциамина и мощное мидриатическое средство (даже 4×10–6 *г* вызывают расширение зрачка); колхицин – алкалоид безвременника осеннего, применяемый при лечении подагры; кониин представляет особый исторический интерес, поскольку именно он стал орудием казни Сократа в 399 до н.э., когда великий философ был вынужден выпить чашу с настоем болиголова (*Conium maculatum*); кодеин – близкий к морфину алкалоид, являющийся ценным обезболивающим и противокашлевым средством; пиперин – алкалоид черного перца (*Piper nigrum*); берберин – алкалоид из корней барбариса обыкновенного (*Berberis* *vulgaris*); стрихнин – очень ядовитый алкалоид, содержащийся в семенах чилибухи (*Strychnos nux-vomica*) и используемый при некоторых сердечных болезнях и для истребления грызунов; эметин содержится в корне ипекакуаны (*Cephaelis ipecacuanha*, рвотный корень) – рвотное и противопротозойное средство, применяется для лечения амебной дизентерии; кокаин содержится в листьях тропических растений рода *Erythroxylum*, главным образом в коке (*E. coca*), используется в медицине как местноанестезирующее средство:[2]







**Номенклатура и классификация**

Номенклатура алкалоидов не была систематизирована – как из-за сложности соединений, так и по историческим причинам. Все названия имеют суффикс -ин и произведены разными путями: от родовых названий растений (гидрастин от *Hydrastis canadensis* и атропин от *Atropa belladonna*); от видовых названий растений (кокаин от *Erythroxylon coca*); от названий лекарственного растения, из которого выделен алкалоид (эрготамин от английского ergot – спорынья); от выявленной физиологической активности (морфин от Морфея – древнегреческого бога сна); от личного имени (пельтьерин назван в честь химика Пьера Жозефа Пельтье; по названию этого алкалоида названа группа алкалоидов – группа пельтьерина). Пельтье выделил ряд алкалоидов – эметин (1817), колхицин (1819), стрихнин (1819), бруцин (1820), цинхонин (1820), хинин (1820), кофеин (1820), пиперин (1821), кониин (1826), тебаин (1835) и, между прочим, зеленый пигмент растений хлорофилл, которому он дал название.

Две обычно используемые системы классифицируют алкалоиды по родам растений, в которых они встречаются, или на основании сходства молекулярной структуры. Классы алкалоидов, члены которых объединены по источнику выделения, – это алкалоиды аконита, аспидоспермы, хинного дерева, спорыньи, эфедры, ибоги, ипекакуаны, люпина, опийного мака, раувольфии, крестовника, картофеля, стрихноса (рвотного ореха) и иохимбе.[3]

Модифицированный вариант классификации А.П. Орехова

В основе классификации алкалоидов лежит структура гетероцикла и положение азота в молекуле алкалоида.

Большинство алкалоидов - гетероциклические соединения (с азотом в цикле) - истинные алкалоиды. Небольшое число алкалоидов содержат азот в боковой цепи или являются ациклическими соединениями - протоалкалоиды.

**I. Алкалоиды с азотом в боковой цепи и ациклические алкалоиды - протоалкалоиды**

Протоалкалоиды - низкомолекулярные относительно простые азотсодержащие соединения, имеющие генетическую связь с аминокислотами.

Протоалкалоиды делят на три группы:

1. *Алифатические*. Сферофизин из сферофизы солонцовой:



СФЕРОФИЗИН

2. *Фенилалкиламины,* из которых самая большая группа - *фенилэтиламиновые**протоалкалоиды.* К алкалоидам этой группы относится эфедрин из побегов эфедры хвощевой и капсаицин из плодов перца однолетнего:



ЭФЕДРИН КАПСАИЦИН

3. *Колхициновые алкалоиды* - колхицин и колхамин из клубнелуковиц безвременника великолепного:



КОЛХИЦИН

**II. Алкалоиды с азотом в составе гетероцикла - истинные алкалоиды**

Производные пирролидина



ПИРРОЛИДИН

подразделяются на:

1) *простые производные пирролидина*- гигрин, кускгигрин, которые содержатся в сырье белладонны:



ГИГРИН

2) *производные пирролизидина* - это конденсированная система из двух циклов пирролидина:



ПИРРОЛИЗИДИН

Производными пирролизидина являются платифиллин и саррацин, которые содержатся в траве крестовника плосколистного:



ПЛАТИФИЛЛИН

**III. Пиридиновые и пиперидиновые алкалоиды**



ПИРИДИН ПИПЕРИДИН

Эта группа алкалоидов подразделяется на:

1) *простые производные пиридина и пиперидина*. Представителем этой группы является кониин, который содержится в плодах болиголова пятнистого:



КОНИИН

2) *производные бициклической неконденсированной системы, состоящей из циклов пиридина и пирролидина.* К этой группе относится никотин, который содержится в табаке:



НИКОТИН

3) *производные бициклической неконденсированной системы колец пиридина и пиперидина*. Представителем этой группы является анабазин, который содержится в анабазисе:



АНАБАЗИН

**IV. Тропановые алкалоиды**

Тропановые алкалоиды - производные бициклической конденсированной системы пирролидина и пиперидина:



ТРОПАН



ГИОСЦИАМИН (L), СКОПОЛАМИН

АТРОПИН (рацемат)

Эти алкалоиды содержатся в растениях из семейства Пасленовые: белладонне, белене, дурмане обыкновенном и дурмане индейском.

**V. Хинолизидиновые алкалоиды**

Хинолизидиновые алкалоиды **-** производные бициклической конденсированной системы из двух циклов пиперидина:



ХИНОЛИЗИДИН

Различают 5 групп хинолизидиновых алкалоидов:

1. *Группа лупинина.* Лупинин впервые выделен из люпина. В медицинской практике представители этой группы не применяются.

2. *Группа спартеина.* К ней относятся пахикарпин, термопсин, анагирин, содержащиеся в траве софоры толстоплодной:



ПАХИКАРПИН

3. *Группа цитизина.* Цитизин содержится в семенах термопсиса ланцетовидного и в траве термопсиса очередноцветкового:



ЦИТИЗИН

4. *Группа матрина.* Матрин найден в софоре желтоватой.

5. *Группа нуфаридина.* Алкалоиды этой группы обнаружены в представителях семейства нимфейных и в своем составе содержат серу, например, алкалоид нуфлеин, который содержится в корневищах кубышки желтой.

**VI. Производные хинолина**

Сюда относятся алкалоиды хинного дерева: хинин, хинидин, цинхонин.



ХИНОЛИН ХИНИН

**VII. Изохинолиновые алкалоиды:**



ИЗОХИНОЛИН

В медицинской практике нашли применение представители следующих групп:

1. *Группа фенантренизохинолина* (морфина) - сюда относятся морфин, кодеин - алкалоиды мака снотворного.

2. *Группа бензилизохинолина* - куда входит алкалоид папаверин, также содержащийся в маке снотворном.

3. *Группа бензофенантридина* - сангвинарин и хелеритрин - алкалоиды травы чистотела большого:



САНГВИНАРИН

4. *Группа апоморфина* - алкалоид глауцин, выделенный из травы мачка желтого:



ГЛАУЦИН

5. *Группа протоберберина*- берберин, полученный из барбариса обыкновенного, алкалоид гиндарин - из стефании гладкой:



БЕРБЕРИН

6. *Группа бисбензилизохинолиновых алкалоидов,* куда относятся алкалоиды кураре.

VIII. Алкалоиды - производные индола:



ИНДОЛ

Это очень большая группа алкалоидов, имеющих сложное строение:



ЛИЗЕРГИНОВАЯ КИСЛОТА РЕЗЕРПИН

Алкалоиды этой группы содержатся:

* в склероциях спорыньи - эргометрин, эрготамин, эргокристин - производные лизергиновой кислоты;
* в корнях раувольфии - резерпин;
* в траве барвинка малого - винкамин;
* в листьях катарантуса розового - винбластин, винкристин;
* в семенах чилибухи - стрихнин;
* в траве пассифлоры инкарнатной - гармин, гарман, гармол.

**IХ. Алкалоиды - производные пурина:**



ПУРИН КОФЕИН

Производными пурина являются кофеин, теобромин, теофиллин, они найдены в листьях чая китайского, в бобах шоколадного дерева, в зернах кофе.

**Х. Алкалоиды - производные циклопентанпергидрофенантрена**

Алкалоиды - производные циклопентанпергидрофенантрена (стероидные алкалоиды), относятся к псевдоалкалоидам

Их подразделяют на 2 группы:

1. *Азотсодержащие аналоги сапонинов.* Алкалоиды этой группы образуют нормальные (соласодин) и изоряды соединений (томатидин):



СОЛАСОДИН

2. *Азотсодержащие стероиды*, в которых кольца Е и F сконденсированы. К этой группе относится соланидин:



СОЛАНИДИН

Алкалоиды этой группы обнаружены в траве паслена дольчатого (соласонин, соламаргин - агликон соласодин), в корневищах с корнями чемерицы Лобеля, в картофеле (соланин, чаконин - агликон соланидин).

**XI. Алкалоиды дитерпеновые**

Они обнаружены в различных видах живокости (элатин, кондельфин, метилликаконитин и др.), аконита (аконитин, зонгорин).

Структуры этих алкалоидов очень сложны.[4]

**Распространение алкалоидов в растительном мире**

Распространение алкалоидов среди семейств неравномерно. Наиболее широко распространены среди покрытосеменных. Особенно богаты алкалоидами растения семейств: Пасленовые, Маковые, Лютиковые, Астровые, Кутровые, Бобовые, Рутовые, Лилейные и др.

В водорослях, грибах, мхах, папоротниках и голосеменных они встречаются сравнительно редко.

В растении чаще всего содержится не один, а несколько алкалоидов, например, у мака снотворного установлено 26, а в листьях катарантуса розового – более 70 алкалоидов. Но в растении обычно преобладает один, два или три алкалоида, остальные же содержатся в меньшем количестве.

Алкалоиды могут накапливаться в различных органах и частях растений: листьях ( белена черная, дурман обыкновенный ), травах ( маклея, термопсис ), плодах ( перец однолетний ), семенах ( дурман индейский ), в подземных органах ( стефания гладкая ).

В растениях, как правило, накапливаются алкалоиды близкого строения, например, в листьях, корнях и траве белладонны – алкалоиды тропанового ряда; в спорынье – индольные алкалоиды.

Различные части растения могут накапливать разные алкалоиды, например, в семенах термопсиса ланцетовидного преобладает цитизин, а в траве – термопсин.

Иногда алкалоиды накапливаются в одном органе, а в другом отсутствуют или содержатся в небольшом количестве, например, у чемерицы наибольшее количество алкалоидов накапливается в подземных органах.

В растениях алкалоиды находятся в виде солей и растворены в клеточном соке паренхимных клеток. Чаще встречаются соли органических кислот (щавелевой, яблочной, винной, лимонной и др.); в некоторых растениях алкалоиды связаны со специфическими кислотами, например, хинная кислота характерна для хинного дерева, меконовая – для мака снотворного.

Реже встречаются алкалоиды в виде солей неорганических кислот: серной, фосфорной (мак снотворный).

Содержание алкалоидов в ЛРС колеблется в пределах от десятых (реже сотых) долей процента до 1-3%. Это количество считается значительным, т. к. алкалоиды обладают сильным физиологическим действием.

Только у некоторых растений содержание алкалоидов достигает 10%и более, например, в коре хинного дерева содержание алкалоидов составляет 15-20%, в подземных органах стефании (клубни с корнями) 7,5-9%.[5]

**Факторы, влияющие на содержание алкалоидов в растениях**

*Индивидуальные свойства растений*

В мире растений наблюдается внутривидовая изменчивость, которая может происходить спонтанно, и при этом возникают формы с высоким или низким содержанием алкалоидов – хеморассы. Например, в коре хинного дерева содержание алкалоидов может варьировать от 2,5% до 20% и более.

Различным может быть и качественный состав алкалоидов. Причем оба этих свойства передаются наследству, что дает возможность проведения селекционных работ с целью получения высокоалкалоидных форм растений с определенным качественным составом. Так были получены эргометриновый, эрготоксиновый, эрготаминовый штаммы спорыньи.

*Фаза вегетации*

Алкалоиды как продукты обмена веществ накапливаются в растениях на определенных этапах онтогенеза. Максимальное содержание алкалоидов в надземных частях растений (листья, травы) совпадает с периодом наиболее интенсивного развития растения – в молодых растущих тканях (рост, бутонизация, цветение). После цветения содержание алкалоидов обычно снижается.

В поземных органах, как правило, больше алкалоидов содержится осенью – в период плодоношения и отмирания надземной части растения.

Влияние возраста на содержание алкалоидов в растении хорошо прослеживается на хинном дереве. Наиболее богата алкалоидами кора в возрасте дерева от 6 до 12 лет; в старой коре алкалоидов меньше.

У чайного куста наибольшее количество алкалоидов в самых молодых листьях – 3%, а в самых старых (кожистых) – менее 1%.

*Экологические факторы*

Температура

Теплая погода способствует увеличению содержания алкалоидов в растениях, холодная тормозит этот процесс, а заморозки могут действовать губительно.

Свет (освещенность)

Определенной закономерности нет, но значительно чаще интенсивное освещение способствует увеличению содержания алкалоидов. Например, увеличение освещенности стимулирует накопление алкалоидов у термопсиса, паслена дольчатого, у других подавляет их образование (табак, дурман обыкновенный).

Влажность

Среди алкалоидных растений имеются засухоустойчивые и влаголюбивые, но для большинства растений избыток влаги неблагоприятно влияет на накопление алкалоидов (красавка, хинное дерево, мак снотворный).

Высота над уровнем моря

Для ряда растений увеличение высоты над уровнем моря положительно влияет на содержание алкалоидов, но до определенной высоты. Например, содержание алкалоидов у красавки увеличивается с высотой произрастания, оптимум наблюдается на высоте 1500 м, после чего их содержание уменьшается.

При подъеме в горы некоторые растения теряют свои ядовитые свойства: болиголов пятнистый в горах не содержит конина.

Большое влияние на накопление алкалоидов оказывает географическое положение и климатические условия.

Установлено, что алкалоидсодержащие растения чаще встречаются на юге, в странах с тропическим климатом.

Кроме того, у растений, произрастающих в южных районах, содержание алкалоидов выше.

Состав почв (геохимический фактор)

На содержание алкалоидов у многих растений большое влияние оказывает состав почвы. Например, в листьях дурмана обыкновенного, растущего на щелочных почвах, алкалоидов больше, чем в листьях дурмана, растущего на кислых и нейтральных почвах.

На образование алкалоидов большое влияние оказывают определенные химические элементы: марганец, кобальт способствуют увеличению содержания алкалоидов тропанового ряда, медь необходима для образования аминокислот, являющихся предшественниками алкалоидов в растениях, цинк стимулирует синтез и накопление индольных алкалоидов.[6]

**Функции алкалоидов**

Алкалоиды столь разнообразны по строению, что нет возможности предложить единую гипотезу, а тем более единую теорию их образования в растениях. По этой же причине трудно допустить, что все они, разные по строению, выполняют одну  
общую во всех растениях биологическую роль.

О роли алкалоидов в растениях высказано много предположений.

*Алкалоиды - отбросы жизнедеятельности растений.*

Сторонники этой гипотезы рассматривают алкалоиды как конечные продукты процесса обмена веществ, появляющиеся в результате распада азотистых соединений. Это подтверждается, в частности, увеличением количества алкалоидов, которое наблюдается с возрастом у некоторых растений. Для несогласия с этой гипотезой имеются серьезные основания: во-первых, увеличение содержания алкалоидов с возрастом растения наблюдается только у небольшой части алкалоидоносных растений; во-вторых, если алкалоиды действительно отбросы, то они должны присутствовать абсолютно во всех растениях. Далее, отбросы должны выводиться из организма, однако этого не наблюдается. Более того, алкалоиды-основания в растениях связываются с разными органическими кислотами и в виде солей остаются в растениях.

*Алкалоиды - запасные вещества.*

Динамика изменения количества алкалоидов в разных органах растения на разных этапах его развития привлекается как доказательство возможности использования алкалоидов в качестве запасного азотистого материала. Но это доказательство носит косвенный характер. В то же время имеются факты, когда в семенах бесспорно алкалоидоносного растения среди запасных питательных веществ алкалоидов не имеется, а появляются они значительно позже, когда из семян разовьются растения.

*Алкалоиды - защитные вещества.*

В ряде случаев присутствие алкалоидов предохраняет растение от его поедания животными, однако козы поедают листья табака, кролики - листья красавки, а птицы - ягоды этого растения. Имеются также насекомые-вредители, которые поглощают зеленую массу вместе с алкалоидами без какого-либо вреда для себя.

*Алкалоиды - активные и необходимые вещества в биосинтезе, протекающем в растениях.*

Данное представление о роли алкалоидов считается наиболее достоверным. Имеются многочисленные факты, подтверждающие наличие связи между алкалоидами и биохимическими процессами растений.

Алкалоиды являются сенсибилизаторами, т.е. веществами, усиливающими чувствительность клеток и тканей растений к отдельным лучам спектра. Содействуя поглощению растениями солнечных лучей, они ускоряют протекание фазы образования и развития органов плодоношения. Имеются данные о положительном влиянии некоторых алкалоидов на процессы роста растений.

Известно широкое использование алкалоида колхицина для получения полиплоидных форм растений, в том числе и самих алкалоидных растений. Предполагается, что алкалоиды с пиридиновым и пиперидиновым кольцами служат материалом для синтеза пиридиннуклеидных энзимов.

Алкалоидам отводится роль передатчиков кислорода. Эта передача осуществляется через N-оксидные формы алкалоидов. В крестовнике алкалоиды-основания и их N-оксиды всегда находятся в определенном равновесии, разном в зависимости от фазы вегетации растения.

Советские ученые, изучая азотистый обмен у алкалоидоносных растений, указывают, что алкалоиды, будучи весьма динамичными, играют в растительной клетке роль внутренних буферов при азотистом питании. Так, при длительном голодании растения, вызывающем распад белков, идет накопление алкалоидов, а при недостаточности снабжения клетки азотом при наличии углеводов наблюдаются распад алкалоидов и синтезбелка за счет алкалоидного азота.

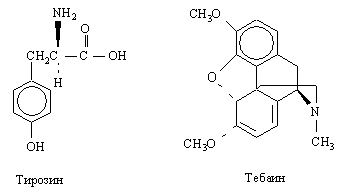
Высказывается мнение, что алкалоиды способствуют выздоровлению растений. Для подтверждения этого приводятся факты концентрации алкалоидов в органах растений, патологическиизмененных в результате механических повреждений (атропина - в опытах с беленой, хинина – в коре хинного дерева при соскабливании коры или частичном ее удалении) или различных заболеваний (никотина в табаке, больном мозаикой).

Таким образом, в вопросе о роли алкалоидов в каждой гипотезе есть известная доля истины, и, если подходить к растению как к целостному организму, алкалоиды могут быть и «излишними**»**, и запасными, и защитными, и активизирующими рост   
и развитие растений и, наконец, веществами другого назначения.[7]

## Биогенез

## Одна из наиболее захватывающих и увлекательных сторон химии алкалоидов – это их синтез в растениях. В течение последних десятилетий химики предложили много биогенетических схем синтеза различных алкалоидов. Большая часть этих схем основана на мысли, что алкалоиды образуются из относительно простых предшественников, например, фенилаланина, тирозина, триптофана, гистидина, ацетатных и терпеновых остатков, метионина и других аминокислот, таких, как антраниловая кислота, лизин и орнитин. Структуры большинства алкалоидов можно вывести теоретически из таких простых предшественников, используя немногие хорошо известные химические реакции. Несколько простых алкалоидов были синтезированы из производных аминокислот в физиологических условиях с применением таких биогенетических концепций. С помощью радиоактивных меток эти теории были подвергнуты экспериментальной проверке.

## Биосинтетические исследования алкалоидов включают введение меченых предшественников в растения с последующим (после надлежащего периода роста) выделением алкалоидов. Полученные алкалоиды подвергают последовательным реакциям расщепления, чтобы определить положение меченых атомов. Этот метод продемонстрировал, что тебаин, кодеин и морфин последовательно образуются в растении из тирозина:

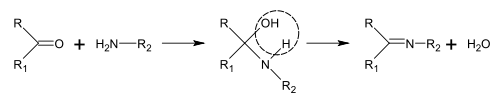


Пути биосинтеза алкалоидов не менее разнообразны, чем их структуры, и их невозможно объединить в общую схему[8]. Тем не менее, существует несколько характерных реакций, участвующих в биосинтезе различных классов алкалоидо:

* образование [оснований Шиффа](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A8%D0%B8%D1%84%D1%84%D0%BE%D0%B2%D0%BE_%D0%BE%D1%81%D0%BD%D0%BE%D0%B2%D0%B0%D0%BD%D0%B8%D0%B5),
* [реакция Манниха](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B0%D0%BA%D1%86%D0%B8%D1%8F_%D0%9C%D0%B0%D0%BD%D0%BD%D0%B8%D1%85%D0%B0).

*Образование оснований Шиффа*

Основания Шиффа могут быть получены в результате реакции [аминов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BC%D0%B8%D0%BD%D1%8B) с [кетонами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B5%D1%82%D0%BE%D0%BD) или [альдегидами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BB%D1%8C%D0%B4%D0%B5%D0%B3%D0%B8%D0%B4). Данная реакция является распространённым способом формирования C=N связи.

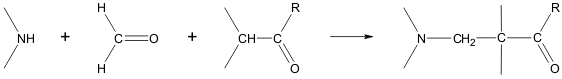
[](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Schiff_base_formation.svg&filetimestamp=20090830181855)

При биосинтезе алкалоидов реакция образования основания может проходить также внутримолекулярно. Примером может являться реакция образования Δ1-пиперидеина, происходящая при синтезе [пиперидинового](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%B8%D0%BF%D0%B5%D1%80%D0%B8%D0%B4%D0%B8%D0%BD) цикла[9]:

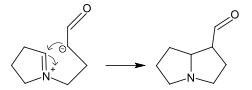
[Schiff base formation intramolecular.svg](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Schiff_base_formation_intramolecular.svg&filetimestamp=20090901221810)

### *Реакция Манниха*

### В реакции Манниха, помимо амина и [карбонильного соединения](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%80%D0%B1%D0%BE%D0%BD%D0%B8%D0%BB%D1%8C%D0%BD%D0%B0%D1%8F_%D0%B3%D1%80%D1%83%D0%BF%D0%BF%D0%B0), участвует также [карбанион](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%80%D0%B1%D0%B0%D0%BD%D0%B8%D0%BE%D0%BD), играющий роль нуклеофила в процессе [присоединения](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B0%D0%BA%D1%86%D0%B8%D0%B8_%D0%BD%D1%83%D0%BA%D0%BB%D0%B5%D0%BE%D1%84%D0%B8%D0%BB%D1%8C%D0%BD%D0%BE%D0%B3%D0%BE_%D0%BF%D1%80%D0%B8%D1%81%D0%BE%D0%B5%D0%B4%D0%B8%D0%BD%D0%B5%D0%BD%D0%B8%D1%8F) к иону, образованному взаимодействием амина и карбонильного соединения.

[](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Mannich.png&filetimestamp=20070124131906)

Реакция Манниха также может осуществляться как межмолекулярно, так и внутримолекулярно. Примером внутримолекулярной реакции Манниха может служить синтез [пирролизидинового](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%9F%D0%B8%D1%80%D1%80%D0%BE%D0%BB%D0%B8%D0%B7%D0%B8%D0%B4%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1) ядра:

[](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Mannich_reaction_intramolecular.svg&filetimestamp=20090830193618)

Разновидностью внутримолекулярной реакции Манниха является [реакция Пикте-Шпенглера](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A0%D0%B5%D0%B0%D0%BA%D1%86%D0%B8%D1%8F_%D0%9F%D0%B8%D0%BA%D1%82%D0%B5_%E2%80%94_%D0%A8%D0%BF%D0%B5%D0%BD%D0%B3%D0%BB%D0%B5%D1%80%D0%B0&action=edit&redlink=1)--циклизация шиффовых оснований, образованных из β-фенилэтиламинов с образованием системы тетрагидроизохинолина. У растений биосинтез алкалоидов происходит всегда под действием ферментов, у животных же известны случаи неферментативного синтеза изохинолиновых алкалоидов, включающий две последовательные стадии: образование основание Шиффа из [катехоламинов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%82%D0%B5%D1%85%D0%BE%D0%BB%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%BD%D1%8B) и альдегида и реакцию Пикте-Шпенглера. Обе эти реакции могут протекать в физиологических условиях и в отсутствии ферментов.

Сходные эксперименты продемонстрировали, что многие другие алкалоиды (никотин, гиосциамин, пеллотин, папаверин, колхицин, грамин) синтезируются из аминокислот.

В настоящее время произошел качественный скачок в исследованиях биогенеза алкалоидов: в растительную систему биосинтеза успешно вводят не только аминокислоты, ацетаты и мевалонолактон, но и в некоторых случаях большие промежуточные соединения[10].

Помимо описанных выше мономерных алкалоидов, существует также некоторое количество димерных (реже — тримерных, значительно реже — тетрамерных) алкалоидов, образующихся в процессе [конденсации](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BD%D0%B4%D0%B5%D0%BD%D1%81%D0%B0%D1%86%D0%B8%D1%8F_(%D1%85%D0%B8%D0%BC%D0%B8%D1%8F)) двух (трёх, четырёх) мономерных алкалоидов. Как правило, димерные алкалоиды являются результатом [конденсации](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BD%D0%B4%D0%B5%D0%BD%D1%81%D0%B0%D1%86%D0%B8%D1%8F_(%D1%85%D0%B8%D0%BC%D0%B8%D1%8F)) двух алкалоидов одинакового типа. Наиболее распространены бисиндольные алкалоиды и димерные [изохинолиновые](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%98%D0%B7%D0%BE%D1%85%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%BB%D0%B8%D0%BD) алкалоиды.

Основные механизмы димеризации алкалоидов:

* [Реакция Манниха](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B0%D0%BA%D1%86%D0%B8%D1%8F_%D0%9C%D0%B0%D0%BD%D0%BD%D0%B8%D1%85%D0%B0). Примером является бисиндольный алкалоид воакамин.
* [Реакция Михаэля](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B0%D0%BA%D1%86%D0%B8%D1%8F_%D0%9C%D0%B8%D1%85%D0%B0%D1%8D%D0%BB%D1%8F) — виллальстонин.
* [Конденсация](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BD%D0%B4%D0%B5%D0%BD%D1%81%D0%B0%D1%86%D0%B8%D1%8F_(%D1%85%D0%B8%D0%BC%D0%B8%D1%8F)) [альдегидов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BB%D1%8C%D0%B4%D0%B5%D0%B3%D0%B8%D0%B4) с [аминами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BC%D0%B8%D0%BD%D1%8B) — токсиферин.
* Окислительное сочетание [фенолов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A4%D0%B5%D0%BD%D0%BE%D0%BB) — даурицин, [тубокурарин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D1%83%D0%B1%D0%BE%D0%BA%D1%83%D1%80%D0%B0%D1%80%D0%B8%D0%BD).
* [Лактонизация](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9B%D0%B0%D0%BA%D1%82%D0%BE%D0%BD) — карпаин[11].

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/c/c8/Voacamine.svg/200px-Voacamine.svg.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Voacamine.svg&filetimestamp=20090922130321)  Воакамин | [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/b/b8/Villalstonine.svg/114px-Villalstonine.svg.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Villalstonine.svg&filetimestamp=20090922131509)  Виллальстонин | [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/0/01/Toxiferine_I.png/132px-Toxiferine_I.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Toxiferine_I.png&filetimestamp=20081003113259)  Токсиферин |
| [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/5/5e/Dauricine.svg/200px-Dauricine.svg.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Dauricine.svg&filetimestamp=20090922131728)  Аурицин | [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/e/ee/Tubocurarine.svg/178px-Tubocurarine.svg.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Tubocurarine.svg&filetimestamp=20070213103238)  [Тубокурарин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D1%83%D0%B1%D0%BE%D0%BA%D1%83%D1%80%D0%B0%D1%80%D0%B8%D0%BD) | [http://upload.wikimedia.org/wikipedia/commons/thumb/3/34/Carpaine.png/168px-Carpaine.png](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A4%D0%B0%D0%B9%D0%BB:Carpaine.png&filetimestamp=20071014234238)  Карпаин |

## Фармакологическая активность и применение

## Фармакологическая активность алкалоидов изменяется в широких пределах в зависимости от структуры. Среди них имеются обезболивающие средства и наркотики (морфин, кодеин); мощные стимуляторы центральной нервной системы (стрихнин, бруцин), мидриатические (т.е. расширяющие зрачок) средства (атропин, гиосциамин) и миотические (т.е. суживающие зрачок) средства (физостигмин, пилокарпин). Некоторые алкалоиды обнаруживают адренергическую активность, возбуждают симпатическую нервную систему, стимулируют сердечную деятельность и повышают кровяное давление (эфедрин, эпинефрин). Другие – снижают кровяное давление (резерпин, протовератрин А). Благодаря своей физиологической активности многие алкалоиды, будучи сильными ядами, находят применение в медицине[12].

## [Медицинское](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D0%B4%D0%B8%D1%86%D0%B8%D0%BD%D0%B0) применение растений-алкалоидоносов имеет давнюю историю. В XIX веке, когда первые алкалоиды были получены в чистом виде, они сразу нашли своё применение в клинической практике в качестве [лекарственного средства](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9B%D0%B5%D0%BA%D0%B0%D1%80%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%B5%D0%BD%D0%BD%D1%8B%D0%B5_%D1%81%D1%80%D0%B5%D0%B4%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%B0). Многие алкалоиды до сих пор применяются в медицине (чаще в виде солей), например:

|  |  |
| --- | --- |
| Алкалоид | Фармакологическое действие |
| [Аймалин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%90%D0%B9%D0%BC%D0%B0%D0%BB%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1) | антиаритмическое |
| [Атропин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D1%82%D1%80%D0%BE%D0%BF%D0%B8%D0%BD), [скополамин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D0%BA%D0%BE%D0%BF%D0%BE%D0%BB%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%BD) | [антихолинергические препараты](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D1%82%D0%B8%D1%85%D0%BE%D0%BB%D0%B8%D0%BD%D0%B5%D1%80%D0%B3%D0%B8%D1%87%D0%B5%D1%81%D0%BA%D0%B8%D0%B5_%D0%B3%D0%B0%D0%BB%D0%BB%D1%8E%D1%86%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%B3%D0%B5%D0%BD%D1%8B) |
| [Винбластин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%92%D0%B8%D0%BD%D0%B1%D0%BB%D0%B0%D1%81%D1%82%D0%B8%D0%BD) | [противоопухолевое](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A6%D0%B8%D1%82%D0%BE%D1%81%D1%82%D0%B0%D1%82%D0%B8%D0%BA%D0%B8) |
| [Винкамин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%92%D0%B8%D0%BD%D0%BA%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1) | сосудорасширяющее, антигипертензивное |
| [Кодеин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D0%B5%D0%B8%D0%BD) | противокашлевое средство |
| [Кокаин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BA%D0%B0%D0%B8%D0%BD) | [анестетик](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B5%D1%81%D1%82%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BA) |
| [Колхицин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BB%D1%85%D0%B8%D1%86%D0%B8%D0%BD) | средство от [подагры](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%BE%D0%B4%D0%B0%D0%B3%D1%80%D0%B0) |
| [Морфин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD) | [наркотический](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B0%D1%80%D0%BA%D0%BE%D1%82%D0%B8%D0%BA) [анальгетик](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B0%D0%BB%D1%8C%D0%B3%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BA) |
| [Резерпин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B7%D0%B5%D1%80%D0%BF%D0%B8%D0%BD) | [антигипертензивное](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%93%D0%B8%D0%BF%D0%BE%D1%82%D0%B5%D0%BD%D0%B7%D0%B8%D0%B2%D0%BD%D1%8B%D0%B5_%D0%BF%D1%80%D0%B5%D0%BF%D0%B0%D1%80%D0%B0%D1%82%D1%8B&action=edit&redlink=1) |
| [Тубокурарин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D1%83%D0%B1%D0%BE%D0%BA%D1%83%D1%80%D0%B0%D1%80%D0%B8%D0%BD) | миорелаксант |
| [Физостигмин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A4%D0%B8%D0%B7%D0%BE%D1%81%D1%82%D0%B8%D0%B3%D0%BC%D0%B8%D0%BD) | [ингибитор ацетилхолинэстеразы](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%98%D0%BD%D0%B3%D0%B8%D0%B1%D0%B8%D1%82%D0%BE%D1%80_%D0%B0%D1%86%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BB%D1%85%D0%BE%D0%BB%D0%B8%D0%BD%D1%8D%D1%81%D1%82%D0%B5%D1%80%D0%B0%D0%B7%D1%8B) |
| [Хинидин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A5%D0%B8%D0%BD%D0%B8%D0%B4%D0%B8%D0%BD) | антиаритмическое |
| [Хинин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A5%D0%B8%D0%BD%D0%B8%D0%BD) | антипиретическое, противомалярийное |
| [Эметин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%AD%D0%BC%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1) | рвотное, антипротозойное |
| [Эргоалкалоиды](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%AD%D1%80%D0%B3%D0%BE%D0%B0%D0%BB%D0%BA%D0%B0%D0%BB%D0%BE%D0%B8%D0%B4%D1%8B&action=edit&redlink=1) | [симпатомиметическое](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A1%D0%B8%D0%BC%D0%BF%D0%B0%D1%82%D0%BE%D0%BC%D0%B8%D0%BC%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BA%D0%B8&action=edit&redlink=1), сосудорасширяющее, антигипертензивное |

Многие синтетические и полусинтетические препараты являются структурными модификациями алкалоидов, разработанными с целью усилить или изменить основное действие препарата и ослабить нежелательные побочные эффекты. Так, например, [налоксон](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B0%D0%BB%D0%BE%D0%BA%D1%81%D0%BE%D0%BD), антагонист [опиоидных рецепторов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9E%D0%BF%D0%B8%D0%BE%D0%B8%D0%B4%D0%BD%D1%8B%D0%B5_%D1%80%D0%B5%D1%86%D0%B5%D0%BF%D1%82%D0%BE%D1%80%D1%8B), является производным содержащегося в [опиуме](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9E%D0%BF%D0%B8%D1%83%D0%BC) алкалоида [тебаина](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D0%B5%D0%B1%D0%B0%D0%B8%D0%BD)[13].

*Применение в сельском хозяйстве*

До разработки широкой гаммы относительно малотоксичных синтетических [пестицидов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%B5%D1%81%D1%82%D0%B8%D1%86%D0%B8%D0%B4) некоторые алкалоиды достаточно широко применялись в качестве [инсектицидов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%98%D0%BD%D1%81%D0%B5%D0%BA%D1%82%D0%B8%D1%86%D0%B8%D0%B4) (соли [никотина](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B8%D0%BA%D0%BE%D1%82%D0%B8%D0%BD) и [анабазина](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B0%D0%B1%D0%B0%D0%B7%D0%B8%D0%BD)). Их применение было ограничено высокой токсичностью для людей[14].

### *Психостимулирующее и наркотическое использование*

### Многие алкалоиды являются [психоактивными веществами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D1%81%D0%B8%D1%85%D0%BE%D0%B0%D0%BA%D1%82%D0%B8%D0%B2%D0%BD%D1%8B%D0%B5_%D0%B2%D0%B5%D1%89%D0%B5%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%B0). Препараты растений, содержащих алкалоиды, их [экстракты](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D0%BA%D1%81%D1%82%D1%80%D0%B0%D0%BA%D1%82), а позже и чистые препараты алкалоидов использовались в качестве стимулирующего и/или [наркотического](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B0%D1%80%D0%BA%D0%BE%D1%82%D0%B8%D0%BA) средства. [Кокаин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BA%D0%B0%D0%B8%D0%BD) и [катинон](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%82%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%BD) являются [стимуляторами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D1%82%D0%B8%D0%BC%D1%83%D0%BB%D1%8F%D1%82%D0%BE%D1%80) [центральной нервной системы](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A6%D0%9D%D0%A1). [Мескалин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D1%81%D0%BA%D0%B0%D0%BB%D0%B8%D0%BD) и многие индольные алкалоиды (такие как [псилоцибин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D1%81%D0%B8%D0%BB%D0%BE%D1%86%D0%B8%D0%B1%D0%B8%D0%BD), [диметилтриптамин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%94%D0%B8%D0%BC%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BB%D1%82%D1%80%D0%B8%D0%BF%D1%82%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%BD), [ибогаин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%98%D0%B1%D0%BE%D0%B3%D0%B0%D0%B8%D0%BD)) обладают [галлюциногенным](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%93%D0%B0%D0%BB%D0%BB%D1%8E%D1%86%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%B3%D0%B5%D0%BD) эффектом. [Морфин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD) и [кодеин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D0%B5%D0%B8%D0%BD) - сильные наркотические обезболивающие.

### Кроме того, существуют алкалоиды, не обладающие сильным психоактивным действием, но являющиеся [прекурсорами](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D1%80%D0%B5%D0%BA%D1%83%D1%80%D1%81%D0%BE%D1%80) для полусинтетических психоактивных веществ. Например, из [эфедрина](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D1%84%D0%B5%D0%B4%D1%80%D0%B8%D0%BD) и [псевдоэфедрина](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D1%81%D0%B5%D0%B2%D0%B4%D0%BE%D1%8D%D1%84%D0%B5%D0%B4%D1%80%D0%B8%D0%BD) синтезируются [меткатинон](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D1%82%D0%BA%D0%B0%D1%82%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%BD) (эфедрон) и [метамфетамин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D1%82%D0%B0%D0%BC%D1%84%D0%B5%D1%82%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%BD)[15].

### Важнейшие алкалоиды

### *Атропин*

### Оптически неактивная форма гиосциамина, широко применяется в медицине как эффективный антидот при отравлениях антихолинэстеразными веществами, такими, как физостигмин и фосфорорганические инсектициды. Он эффективно снимает спазмы бронхов, расширяет зрачок и т.д. Токсические дозы вызывают нарушение зрения, подавление слюноотделения, расширение сосудов, гиперпирексию (повышение температуры), возбуждение и состояние делирия (помрачения сознания).

### Применение

### Применяют атропин при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, пилороспазме, холецистите, желчнокаменной болезни, при спазмах кишечника и мочевых путей, бронхиальной астме, для уменьшения секреции слюнных, желудочных и бронхиальных желез, при брадикардии, развившейся в результате повышения тонуса блуждающего нерва.

### При [болях](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%91%D0%BE%D0%BB%D1%8C), связанных со спазмами гладкой мускулатуры, атропин часто вводят вместе с анальгезирующими средствами ([анальгин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B0%D0%BB%D1%8C%D0%B3%D0%B8%D0%BD), [промедол](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D1%80%D0%BE%D0%BC%D0%B5%D0%B4%D0%BE%D0%BB), [морфин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD) и др.).

### В анестезиологической практике атропин применяют перед [наркозом](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B0%D1%80%D0%BA%D0%BE%D0%B7) и [операцией](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A5%D0%B8%D1%80%D1%83%D1%80%D0%B3%D0%B8%D1%87%D0%B5%D1%81%D0%BA%D0%B0%D1%8F_%D0%BE%D0%BF%D0%B5%D1%80%D0%B0%D1%86%D0%B8%D1%8F) и во время операции для предупреждения бронхиоло- и ларингоспазма, ограничения секреции слюнных и бронхиальных желез и уменьшения других [рефлекторных](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D1%84%D0%BB%D0%B5%D0%BA%D1%81_(%D0%B1%D0%B8%D0%BE%D0%BB%D0%BE%D0%B3%D0%B8%D1%8F)) реакций и побочных явлений, связанных с возбуждением блуждающего нерва.

### Применяют также атропин для рентгенологического исследования желудочнокишечного тракта при необходимости уменьшить тонус и двигательную активность желудка и кишечника.

### В связи со способностью уменьшать секрецию потовых желез атропин употребляют иногда при повышенной потливости.

### Атропин является эффективным [антидотом](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D1%82%D0%B8%D0%B4%D0%BE%D1%82) при отравлениях холиномиметическими и антихолинэстеразными веществами, в том числе ФОС[16].

### *Винбластин и винкристи*

### Барвинок (*Catharanthus roseus*, ранее известный как *Vinca rosea*) содержит множество сложных алкалоидов, среди которых мощные противораковые средства винбластин и винкристин. Поскольку концентрация активных алкалоидов в барвинке ничтожна, для их промышленного получения необходимы огромные количества растительного сырья. Так, для выделения 1 *г* винкристина нужно переработать 500 *кг* корней. Винбластин применяется для лечения различных форм рака и особенно эффективен при болезни Ходжкина (лимфогранулематоз) и хорионкарциноме. Винкристином лечат острую лейкемию, а в комбинации с другими препаратами – лимфогранулематоз[17].

*Кодеин*

Самый распространенный опийный алкалоид. Его можно выделить из опиума (от 0,2 до 0,7%), приготовить метилированием морфина или восстановлением и деметилированием тебаина. Кодеин – наркотический анальгетик и противокашлевое средство. Он менее токсичен и в меньшей степени вызывает привыкание, чем морфин.

В сочетании с ненаркотическими анальгетиками ([анальгин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B0%D0%BB%D1%8C%D0%B3%D0%B8%D0%BD), [амидопирин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BC%D0%B8%D0%B4%D0%BE%D0%BF%D0%B8%D1%80%D0%B8%D0%BD)), [кофеином](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D1%84%D0%B5%D0%B8%D0%BD), [фенобарбиталом](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A4%D0%B5%D0%BD%D0%BE%D0%B1%D0%B0%D1%80%D0%B1%D0%B8%D1%82%D0%B0%D0%BB) применяется при [головных болях](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%93%D0%BE%D0%BB%D0%BE%D0%B2%D0%BD%D0%B0%D1%8F_%D0%B1%D0%BE%D0%BB%D1%8C), [невралгиях](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9D%D0%B5%D0%B2%D1%80%D0%B0%D0%BB%D0%B3%D0%B8%D1%8F) и т. п. Входит в состав [микстуры Бехтерева](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B8%D0%BA%D1%81%D1%82%D1%83%D1%80%D0%B0_%D0%91%D0%B5%D1%85%D1%82%D0%B5%D1%80%D0%B5%D0%B2%D0%B0), применяемой в качестве успокаивающего средства.

Препараты:

* Таблетки «[Коделмикст](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D0%B5%D0%BB%D0%BC%D0%B8%D0%BA%D1%81%D1%82)» , Парацетамол, 500 мг, кодеин 8 мг.
* Таблетки «[Терпинкод](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D0%B5%D1%80%D0%BF%D0%B8%D0%BD%D0%BA%D0%BE%D0%B4)» «[Кодтерпин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D1%82%D0%B5%D1%80%D0%BF%D0%B8%D0%BD)»(Tabulettae «Terpincodum»). Состав: кодеин или кодеина фосфат в пересчете на кодеин 0,008 г, натрия гидрокарбоната и [терпингидрата](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D0%B5%D1%80%D0%BF%D0%B8%D0%BD%D0%B3%D0%B8%D0%B4%D1%80%D0%B0%D1%82) по 0,25 г. Терпинкод и таблетки от кашля назначают в качестве противокашлевых и отхаркивающих средств по 1 таблетке 1 — 3 раза в день.
* Таблетки «[Седал-М](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D0%B5%D0%B4%D0%B0%D0%BB-%D0%9C)» [Парацетамол](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%B0%D1%80%D0%B0%D1%86%D0%B5%D1%82%D0%B0%D0%BC%D0%BE%D0%BB) 300 мг, [метамизол натрия](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D1%82%D0%B0%D0%BC%D0%B8%D0%B7%D0%BE%D0%BB_%D0%BD%D0%B0%D1%82%D1%80%D0%B8%D1%8F) 150 мг, [кофеин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D1%84%D0%B5%D0%B8%D0%BD) 50 мг, [фенобарбитал](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A4%D0%B5%D0%BD%D0%BE%D0%B1%D0%B0%D1%80%D0%B1%D0%B8%D1%82%D0%B0%D0%BB) 15 мг, кодеин 10 мг.
* Таблетки «[Коделак](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D0%B5%D0%BB%D0%B0%D0%BA&action=edit&redlink=1)». Состав: Кодеина фосфата 10 мг (8 мг в пересчёте на кодеин), натрия гидрокарбонат 200 ​мг, корень солодки 200 мг, трава термопсиса ланцетного 20 мг.
* Кодеин является также составной частью таблеток «[Пенталгин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%B5%D0%BD%D1%82%D0%B0%D0%BB%D0%B3%D0%B8%D0%BD)», «[Солпадеин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D0%BE%D0%BB%D0%BF%D0%B0%D0%B4%D0%B5%D0%B8%D0%BD)» (8 мг), «[Седалгин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%A1%D0%B5%D0%B4%D0%B0%D0%BB%D0%B3%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1)», а также сиропа от кашля «[Кофекс](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%9A%D0%BE%D1%84%D0%B5%D0%BA%D1%81&action=edit&redlink=1)».
* В количестве 0,01 г наряду с кофеином входит в таблетки от головной боли «[Каффетин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%84%D1%84%D0%B5%D1%82%D0%B8%D0%BD)»
* Входит в состав таблеток [Нурофен плюс](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%9D%D1%83%D1%80%D0%BE%D1%84%D0%B5%D0%BD_%D0%BF%D0%BB%D1%8E%D1%81&action=edit&redlink=1). 1 таблетка Нурофена плюс содержит: 200 мг [ибупрофена](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%98%D0%B1%D1%83%D0%BF%D1%80%D0%BE%D1%84%D0%B5%D0%BD) и 12,8 мг кодеина фосфата гемигидрата (10 мг в пересчёте на кодеин).[18]

*Колхицин*

Выделен из клубнелуковиц и семян различных видов *Colchicum*, обычно *Colchicum autumnale* (безвременник осенний). Это нейтральный алкалоид, используемый для лечения подагры и для получения клеток растений с удвоенным набором хромосом. Является сильным антимитотиком, связывающимся с белком [тубулином](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A2%D1%83%D0%B1%D1%83%D0%BB%D0%B8%D0%BD), образующим [микротрубочки](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B8%D0%BA%D1%80%D0%BE%D1%82%D1%80%D1%83%D0%B1%D0%BE%D1%87%D0%BA%D0%B8), и, вследствие этого, блокирующим деление клеток на стадии [метафазы](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%B5%D1%82%D0%B0%D1%84%D0%B0%D0%B7%D0%B0). Применяется (наравне с колхамином — деацетилированным производным колхицина) для получения [полиплоидных](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%BE%D0%BB%D0%B8%D0%BF%D0%BB%D0%BE%D0%B8%D0%B4%D0%B8%D1%8F) форм растений и [кариотипирования](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B0%D1%80%D0%B8%D0%BE%D1%82%D0%B8%D0%BF).

C 1970-х годов используется в [селекции фаленопсисов](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D0%B5%D0%BB%D0%B5%D0%BA%D1%86%D0%B8%D1%8F_%D1%84%D0%B0%D0%BB%D0%B5%D0%BD%D0%BE%D0%BF%D1%81%D0%B8%D1%81%D0%BE%D0%B2) и других [орхидных](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9E%D1%80%D1%85%D0%B8%D0%B4%D0%BD%D1%8B%D0%B5).

Колхицин используют для лечения [подагры](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9F%D0%BE%D0%B4%D0%B0%D0%B3%D1%80%D0%B0) (для уменьшения боли) и профилактики амилоидоза при семейной средиземноморской лихорадке (Familial Mediterranean fever (FMF)).

Колхицин способен связываться с тубулином микротрубочек и способствовать их разборке[19].

*Кокаин*

Получают из листьев коки (*Erythroxylum coca*) или синтезируют из экгонина, выделяемого из растительного сырья. Это мощный местный анестетик, он входит в микстуру Бромптона, которая используется для смягчения жестоких болей, сопровождающих последнюю стадию рака. Его стимулирующее действие на ЦНС уменьшает седативный эффект и ослабление дыхания от применения морфина или метадона, используемых в качестве наркотических анальгетиков в составе микстуры Бромптона. Привыкание к кокаину наступает очень быстро. Он включен в список веществ, подлежащих особо тщательному контролю.

Применение

Началом медицинского применения кокаина можно считать [1859 год](http://ru.wikipedia.org/wiki/1859_%D0%B3%D0%BE%D0%B4), когда Нимман впервые выделил кокаин из листьев коки. Новое вещество заинтересовало медицинскую среду того времени.

Первым анестизирующие свойства кокаина обнаружил русский химик, профессор [Петербургского клинического института](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A1%D0%B0%D0%BD%D0%BA%D1%82-%D0%9F%D0%B5%D1%82%D0%B5%D1%80%D0%B1%D1%83%D1%80%D0%B3%D1%81%D0%BA%D0%B0%D1%8F_%D0%BC%D0%B5%D0%B4%D0%B8%D1%86%D0%B8%D0%BD%D1%81%D0%BA%D0%B0%D1%8F_%D0%B0%D0%BA%D0%B0%D0%B4%D0%B5%D0%BC%D0%B8%D1%8F_%D0%BF%D0%BE%D1%81%D0%BB%D0%B5%D0%B4%D0%B8%D0%BF%D0%BB%D0%BE%D0%BC%D0%BD%D0%BE%D0%B3%D0%BE_%D0%BE%D0%B1%D1%80%D0%B0%D0%B7%D0%BE%D0%B2%D0%B0%D0%BD%D0%B8%D1%8F) [В. К. Анреп](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D1%80%D0%B5%D0%BF,_%D0%92%D0%B0%D1%81%D0%B8%D0%BB%D0%B8%D0%B9_%D0%9A%D0%BE%D0%BD%D1%81%D1%82%D0%B0%D0%BD%D1%82%D0%B8%D0%BD%D0%BE%D0%B2%D0%B8%D1%87_%D1%84%D0%BE%D0%BD).

[Карл Коллер](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%9A%D0%BE%D0%BB%D0%BB%D0%B5%D1%80,_%D0%9A%D0%B0%D1%80%D0%BB_(%D0%BE%D1%84%D1%82%D0%B0%D0%BB%D1%8C%D0%BC%D0%BE%D0%BB%D0%BE%D0%B3)&action=edit&redlink=1) впервые использовал 1%-й раствор кокаина в [офтальмологической](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9E%D1%84%D1%82%D0%B0%D0%BB%D1%8C%D0%BC%D0%BE%D0%BB%D0%BE%D0%B3%D0%B8%D1%8F) практике с целью расширения зрачка и местной [анестезии](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BD%D0%B5%D1%81%D1%82%D0%B5%D0%B7%D0%B8%D1%8F).

В 1884 году после доклада Коллера о местно-анестезирующих свойствах кокаина, он стал применяться для местной анестезии в хирургической практике.

Год спустя Вильям Хальстед описал нервноблокирующие свойства алкалоида.

В 1898 году [Генрих Квинке](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%B2%D0%B8%D0%BD%D0%BA%D0%B5,_%D0%93%D0%B5%D0%BD%D1%80%D0%B8%D1%85_%D0%98%D1%80%D0%B5%D0%BD%D0%B5%D1%83%D1%81) применил кокаин как анестетик при лечении позвоночника.

Особую роль в распространении кокаина-анестетика сыграл хирург Карл Людвиг Шлейх, который, после многочисленных опытов на себе, начал применять кокаин в хирургии как местнообезболивающий наркотик.

В настоящее время в медицине кокаин практически не используется, существуют единичные работы, посвящённые его использованию в хирургии глаза и офтальмологии, но описанные в них методики не получили широкого распространения в связи с проблемами приобретения медицинских препаратов кокаина и существованием не менее эффективных препаратов, не вызывающих наркотической зависимости[20].

*Кофеин*

Содержится в кофе, чае, какао, коле и матé (парагвайский чай). В составе многих напитков его потребляют миллионы людей во всем мире. Кофеин обычно извлекают из чая, чайной пыли, чайных отходов или выделяют возгонкой при поджаривании кофе. Его также можно синтезировать из теобромина. Кофеин оказывает возбуждающее действие на центральную нервную и сердечно-сосудистую системы, используется для стимуляции сердечной деятельности, дыхания и как противоядие при отравлении морфином и барбитуратами. Он входит в состав продуктов с торговыми названиями эмпирин, фиоринол, кафергот, виграин.

Из-за возбуждающего свойства кофеина и физического привыкания к нему, многие люди употребляют кофеиносодержащие продукты (напитки) для взбадривания[21].

Применение

В медицине кофеин (и кофеин-бензоат натрия) применяют при инфекционных и других заболеваниях, сопровождающихся угнетением функций ЦНС и сердечно-сосудистой системы, при отравлениях наркотиками и другими ядами, угнетающими ЦНС, при спазмах сосудов головного мозга (при мигрени и др.), для повышения психической и физической работоспособности, для устранения сонливости. Применяют также кофеин при [энурезе](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D0%BD%D1%83%D1%80%D0%B5%D0%B7) у детей.

Кофеин также используется как [мочегонное средство](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%BE%D1%87%D0%B5%D0%B3%D0%BE%D0%BD%D0%BD%D0%BE%D0%B5_%D1%81%D1%80%D0%B5%D0%B4%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%BE).

Кофеин является действующим компонентом большинства [«энергетических напитков»](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D0%BD%D0%B5%D1%80%D0%B3%D0%B5%D1%82%D0%B8%D1%87%D0%B5%D1%81%D0%BA%D0%B8%D0%B9_%D0%BD%D0%B0%D0%BF%D0%B8%D1%82%D0%BE%D0%BA) (там его содержится 250—350 мг/л).

Содержание кофеина в сваренном [кофе](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D1%84%D0%B5) — 380-650 мг/л, в [растворимом кофе](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B0%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%BE%D1%80%D0%B8%D0%BC%D1%8B%D0%B9_%D0%BA%D0%BE%D1%84%D0%B5) 310-480 мг/л, в кофе «[Эспрессо](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D1%81%D0%BF%D1%80%D0%B5%D1%81%D1%81%D0%BE)» — 1700-2250 мг/л. В напитке [«Кола»](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%BB%D0%B0_(%D0%BD%D0%B0%D0%BF%D0%B8%D1%82%D0%BE%D0%BA)) около 100 мг/л кофеина. В [чёрном чае](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A7%D1%91%D1%80%D0%BD%D1%8B%D0%B9_%D1%87%D0%B0%D0%B9) (пакетированном) содержится около 150—400 мг/л кофеина, в [зелёном](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%97%D0%B5%D0%BB%D1%91%D0%BD%D1%8B%D0%B9_%D1%87%D0%B0%D0%B9) — примерно вдвое меньше. По другим данным, в чае содержится от 200 до 425 мг/л кофеина, причем его концентрация в среднем в 1.5 раза больше в зеленом чае, чем в черном. Кофеин в чае действует мягче, но дольше, чем кофеин в кофе.

*Лобелин*

Содержится в лобелии (*Lobelia inflata*) и обладает действием, сходным с действием никотина. По этой причине его вводят в состав таблеток, облегчающих отвыкание от курения. В малых дозах способен возбуждать дыхание, в связи с чем его применяют в случаях удушения, отравления газами, т.е. когда нужно стимулировать дыхание. Большие дозы, наоборот, парализуют дыхание.

*Мескалин*

Содержится в лофофоре Уильямса (*Lophophora williamsii*, мексиканское название – пейот или мескаль) сем. кактусовых и является галлюциногеном. Пейот издавна использовался в обрядах мексиканских и американских индейцев. Поедание пейота вызывает расширение зрачка, сопровождаемое необычным и причудливым восприятием цвета. Мигающие огни и изменчивые образы характеризуют начальную стадию видений. Затем цвета блекнут, человек становится вялым и засыпает. Мескалин проявляет то же действие, что и необработанный растительный материал[22].

*Морфин*

Является важнейшим опийным алкалоидом. Его экстрагируют из высушенного млечного сока, выступающего из надрезов на незрелой головке опийного мака (*Papaver somniferum*). Морфин содержит фенольную и спиртовую гидроксильные группы. Он представляет собой наркотический анальгетик и применяется для обезболивания. Однако длительное его употребление приводит к привыканию и вызывает тошноту, рвоту, запоры.

Применение

Широко применяемые производные морфина:

* [CAS](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%A0%D0%B5%D0%B3%D0%B8%D1%81%D1%82%D1%80%D0%B0%D1%86%D0%B8%D0%BE%D0%BD%D0%BD%D1%8B%D0%B9_%D0%BD%D0%BE%D0%BC%D0%B5%D1%80_CAS) 6009-81-0 — морфина моногидрат (morphine monohydrate)
* CAS 52-26-6 — морфина гидрохлорид (anhydrous morphine HCl), его водные растворы используются под названием «[морфий](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9C%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD_(%D0%BB%D0%B5%D0%BA%D0%B0%D1%80%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%B5%D0%BD%D0%BD%D0%BE%D0%B5_%D1%81%D1%80%D0%B5%D0%B4%D1%81%D1%82%D0%B2%D0%BE))»
* CAS 6055-06-7 — морфина гидрохлорид тригидрат (morphine HCl trihydrate)
* CAS 64-31-3 — морфина сульфат (anhydrous morphine SO4)
* CAS 6211-15-0 — морфина сульфат гидрат (morphine SO4 hydrate)
* CAS 302—31-8 — морфина тартрат (anhydrous morphine tartrate)
* CAS 6032-59-3 — морфина тартрат тригидрат (morphine tartrate trihydrate)
* CAS 41372-20-7 — [апоморфин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BF%D0%BE%D0%BC%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD) (apomorphine)
* CAS 76-58-4 — этилморфин, или [дионин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%AD%D1%82%D0%B8%D0%BB%D0%BC%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD%D0%B0_%D0%B3%D0%B8%D0%B4%D1%80%D0%BE%D1%85%D0%BB%D0%BE%D1%80%D0%B8%D0%B4) (ethylmorphine)
* CAS 76-57-3 — метилморфин, или [кодеин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%9A%D0%BE%D0%B4%D0%B5%D0%B8%D0%BD) (methylmorphine)
* CAS 561-27-3 — диацетилморфин, или [героин](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%93%D0%B5%D1%80%D0%BE%D0%B8%D0%BD) (diacetylmorphine)
* [Дилаудид](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%94%D0%B8%D0%BB%D0%B0%D1%83%D0%B4%D0%B8%D0%B4)
* [Анторфин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%D0%90%D0%BD%D1%82%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1)

Морфин довольно легко окисляется, образуя т. н. [ψ-морфин](http://ru.wikipedia.org/w/index.php?title=%CE%A8-%D0%BC%D0%BE%D1%80%D1%84%D0%B8%D0%BD&action=edit&redlink=1)[23].

*Никотин.*

Этот жидкий алкалоид в чистом виде выделен в 1828 Поссельтом и Рейманом. Его основной источник – табак (*Nicotiana tabacum*), годовое производство листьев которого превышает 5 млн. т. Никотин встречается также в разных видах плауна, хвоще полевом и некоторых других растениях. При курении бóльшая часть никотина разрушается или испаряется.

Никотин – сильный яд. В малых количествах он стимулирует дыхание, но в больших – подавляет передачу импульса в симпатических и парасимпатических нервных узлах. Смерть наступает от прекращения дыхания. Никотин сильно влияет на сердечно-сосудистую систему, вызывая сужение периферических сосудов, тахикардию и подъем систолического и диастолического кровяного давления. Никотин (обычно в виде сульфата) используется как инсектицид в аэрозолях и порошках[24].

*Пилокарпин.*

Этот имидазольный алкалоид получают из листьев различных видов африканского кустарника *Pilocarpus*. Его гидрохлорид и нитрат – холиномиметические (действие аналогично возбуждению холинорецепторов) и миотические (сужающие зрачок с одновременным понижением внутриглазного давления) средства. Главное же использование пилокарпина – для лечения глаукомы. Он применяется также для усиления деятельности потовых и слюнных желез, при водянке на почве нефрита, при некоторых отравлениях (ртутью или свинцом) и др.

*Резерпин.*

Раувольфия – древнее лекарственное растение; сообщения о ее использовании датируются 1000 до н.э. Гипотензивная (снижающая кровяное давление) активность корней *Rauwolfia serpentina*, обнаруженная в 1933, объясняется присутствием алкалоида резерпина. Резерпин проявляет также успокаивающее действие. Поэтому его иногда используют для снижения высокого кровяного давления и повышенной возбудимости при неврозах, истерии и стрессах. Побочные эффекты включают сонливость, брадикардию (уменьшение частоты сердечных сокращений), избыточное слюноотделение, тошноту, понос, усиленное отделение желудочного сока и депрессию.

*Скополамин.*

Является антихолинергическим агентом. Его часто используют для снятия спазмов кишечника при спастическом колите, гастроэнтерите и язве желудка, в качестве успокаивающего при психических возбуждениях.

Благодаря антисекреторному действию скополамина его применяют для снижения мокротоотделения при анестезии (для преднаркоза и при операциях), для подавления секреции желудочного сока при лечении язвы желудка и для уменьшения выделений слизистой оболочки носа при простуде и аллергических заболеваниях.

*Стрихнин.*

Рвотный орех (чилибуха, *Strychnos nux-vomica*) содержит от 1,5 до 5% алкалоидов, главным образом стрихнина или бруцина (диметоксистрихнина). Стрихнин чрезвычайно токсичен, действует главным образом на спинной мозг, приводя к конвульсиям (судорогам), и используется для истребления вредных животных. Он применяется в медицине при параличах, связанных с поражениеми ЦНС, при хронических расстройствах ЖКТ и главным образом как общее тонизирующее при различных состояниях расстроенного питания и слабости, а также для физиологических и нейро-анатомических исследований[25].

*Тубокурарин.*

Кураре, известный яд, которым южноамериканские индейцы начиняют стрелы, является сухим экстрактом из коры и стеблей некоторых видов *Strychnos* (*S. toxifera* и др.). Различают четыре сорта кураре, получивших свое название в зависимости от способа расфасовки: калабаш-кураре («тыквенный», упакованный в небольших высушенных тыквах, т.е. калебассах), пот-кураре («горшочный», т.е. хранящийся в глиняных горшках), «мешочный» (в небольших плетеных мешочках) и тубо-кураре («трубочный», упакованный в бамбуковые трубки 25 см длиной). Поскольку кураре, расфасованный в бамбуковых трубках, обладал самым сильным фармакологическим действием, главный алкалоид был назван тубокурарином. Его гидрохлорид применяется в хирургии для расслабления скелетных мышц. Тубокураринхлорид используют также для лечения столбняка и конвульсий при отравлении стрихнином.

*Хинидин*

Диастереомер хинина – встречается в хинной коре (например, *Cinchona succirubra*) в количествах от 0,25 до 1,25%. Это антиаритмическое сердечное средство, применяемое для предупреждения фибрилляции предсердий (мерцательной аритмии).

*Хинин.*

До Второй мировой войны хинин был единственным антималярийным препаратом. Хинин применяют также для приготовления шипучих тонизирующих напитков. Недавно хинин снова приобрел значение как антималярийный препарат – для лечения устойчивой к хлорохину формы малярии (молниеносной трехдневной малярии)[26].

*Эметин*

Главный алкалоид корня ипекакуаны (*Cephaelis ipecacuanha* или *Cephaelis acuminata*) и был выделен П.Пельтье и Ф.Мажанди в 1817. Его применяют для лечения амебной дизентерии, альвеолярной пиореи и других амебных болезней. Эметин является рвотным и отхаркивающим средством.

*Эргоновин* (*эргометрин, эргобазин).*

Стимулирует мышцы матки. Его применяют для предупреждения и лечения послеродовых воспалений, вызванных атонией матки (т.е. отсутствием физиологического тонуса)[27].

**Заключение**

Среди алкалоидов мы находим и сильнейшие яды (стрихнин, бруцин, никотин), и полезные лекарства (пилокарпин – средство для лечения глаукомы, астропин – средство для расширения зрачка, хинин – препарат для лечения малярии, папаверин – сосудорасширяющее средство, помогающее при гипертонии). К алкалоидам относятся и широко применяемые возбуждающие вещества – кофеин, теобромин, теофиллин.

Интересно, что некоторые алкалоиды являются противоядиями по отношению к своим собратьям. Так, в 1952 г. из одного индийского растения был выделен алкалоид резерпин, который позволяет лечить не только людей отравившихся ЛСД или другими галлюциногенами, но и больных, страдающих шизофренией.

Таким образом, можно заключить, что алкалоиды – весьма обширный класс органических соединений, оказывающих самое различное действие на организм человека. В этом состоит их важная роль, которую играют алкалоиды в химической науке в целом и в повседневной жизни в частности.

**Список литературы:**

1. 1*.Орехов А. П.* Химия алкалоидов. — Изд. 2. — М.: АН СССР, 1955. — с. 6.
2. *Leland J. Cseke et al.* Natural Products from Plants. Second Edition. — CRC, 2006. — p. 30.
3. *Племенков В. В.* Введение в химию природных соединений. — Казань: 2001. — с. 223.
4. *М.М. Коноплева* Фамакогнозия: природные биологически активные вещества: Учеб. пособие. 3-е издание, дополненное / М.М. Коноплева. – Витебск, ВГМУ, 2010. – с. 192-199.
5. *М.М. Коноплева* Фамакогнозия: природные биологически активные вещества: Учеб. пособие. 3-е издание, дополненное / М.М. Коноплева. – Витебск, ВГМУ, 2010. – с. 201-202.
6. *М.М. Коноплева* Фамакогнозия: природные биологически активные вещества: Учеб. пособие. 3-е издание, дополненное / М.М. Коноплева. – Витебск, ВГМУ, 2010. – с. 202-204.
7. *Муравьева Д.А.* Фармакогнозия: Учебник. – 3-е изд., перераб. и доп. – М.: Медицина, 1991. – с.306-308.
8. *Manfred Hesse.* Alkaloids. Nature’s Curse or Blessing. — Wiley-VCH, 2002. — p. 54.
9. *Paul M Dewick.* Medicinal Natural Products. A Biosynthetic Approach. Second Edition. — Wiley, 2002. — p. 305.
10. *Manfred Hesse.* Alkaloids. Nature’s Curse or Blessing. — Wiley-VCH, 2002. — p. 91—105.
11. *Tadeusz Aniszewski.* Alkaloids — secrets of life. — Amsterdam: 2007. — p. 142—143.
12. [Основы ХПС, 2009](http://ru.wikipedia.org/wiki/%D0%90%D0%BB%D0%BA%D0%B0%D0%BB%D0%BE%D0%B8%D0%B4%D1%8B#CITEREF.D0.9E.D1.81.D0.BD.D0.BE.D0.B2.D1.8B_.D0.A5.D0.9F.D0.A12009), с. 80—81
13. *György Matolcsy, Miklós Nádasy, Viktor Andriska.* Pesticide chemistry. — Elsevier, 2002. — p. 21—22.
14. *Geoffrey A. Cordell.* The Alkaloids: Chemistry and Biology. Volume 56. — Elsevier, 2001. — p. 8.
15. *Н. В. Веселовская, А. Е. Коваленко.* Наркотики. — М.: Триада-X, 2000. — с. 51—52.
16. [Химическая энциклопедия: Тропановые алкалоиды](http://www.xumuk.ru/encyklopedia/2/4609.html).
17. *Arnold Brossi.* The Alkaloids: Chemistry and Pharmacology, Volume 23. — Academic Press, 1984. — p. 268.
18. *R. H. F. Manske.* The Alkaloids. Chemistry and Physiology. Volume VIII. — New York: [Academic Press](http://ru.wikipedia.org/wiki/Academic_Press), 1965. — p. 673.
19. [IUPAC. Compendium of Chemical Terminology, 2nd ed. (the «Gold Book»). Compiled by A. D. McNaught and A. Wilkinson. Blackwell Scientific Publications, Oxford (1997). XML on-line corrected version: http://goldbook.iupac.org (2006-) created by M. Nic, J. Jirat, B. Kosata; updates compiled by A. Jenkins. ISBN 0-9678550-9-8. doi:10.1351/goldbook](http://goldbook.iupac.org/A00220.html)
20. [Химическая энциклопедия: Изохинолиновые алкалоиды](http://www.xumuk.ru/encyklopedia/1642.html)
21. *Robert Alan Lewis.* Lewis’ dictionary of toxicology. CRC, 1998. — p. 51.
22. *Орехов А. П.* Химия алкалоидов. — Изд. 2. — М.: АН СССР, 1955. — с. 33.
23. *Manfred Hesse.* Alkaloids. Nature’s Curse or Blessing. — Wiley-VCH, 2002. — p. 338.
24. *Paul M Dewick.* Medicinal Natural Products. A Biosynthetic Approach. Second Edition. — Wiley, 2002. — p. 382.
25. [Химическая энциклопедия: Пирролизидиновые алкалоиды](http://www.xumuk.ru/encyklopedia/2/3370.html).
26. *Tadeusz Aniszewski.* Alkaloids — secrets of life. — Amsterdam: 2007. — p. 108.
27. *Kenneth W. Bentley.* [β-Phenylethylamines and the isoquinoline alkaloids](http://www.rsc.org/publishing/journals/NP/article.asp?doi=NP9971400387) // *Nat. Prod. Rep*. — 1997. — № 14. — С. 387—411.