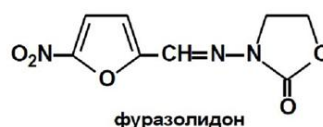
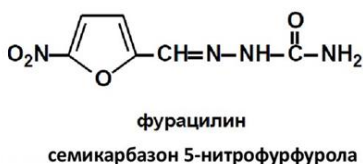
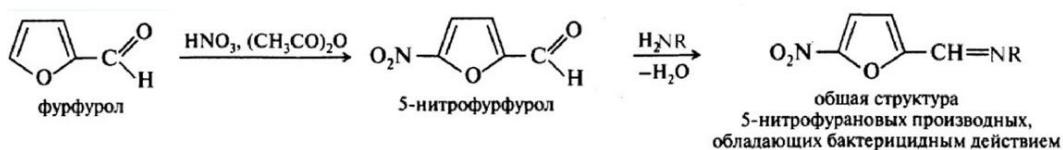


1. БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ВЕЩЕСТВА — ПРОИЗВОДНЫЕ ПЯТИЧЛЕННЫХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ С ОДНИМ ГЕТЕРОАТОМОМ

1.1. Производные фурана

Группа соединений нитрофуранового ряда, первым представителем которых является фурацилин, эффективна в отношении грамположительных, грамотрицательных бактерий (стрептококков, стафилококков, шигелл, сальмонелл и др.), а также лептоспир, трихомонад, кокцидий, лямблий и других микроорганизмов включая штаммы, устойчивые к антибиотикам и сульфаниламидам. В небольших концентрациях такие лекарственные средства проявляют бактериостатическую активность, а при высоких концентрациях — бактерицидную. Бактериостатический эффект возникает за счет образования производными нитрофуранов комплексов с нуклеиновыми кислотами, вследствие чего нарушается ДНК возбудителя и угнетается синтез мембранных и энергетических белков бактерий. Бактерицидный эффект реализуется за счет того, что после восстановления нитрогруппы происходит связывание протонов от клеточных структур возбудителя, угнетаются ферменты цепи дыхания, ингибируется цикл Кребса, и возбудитель гибнет вследствие разрушения микробной клетки.

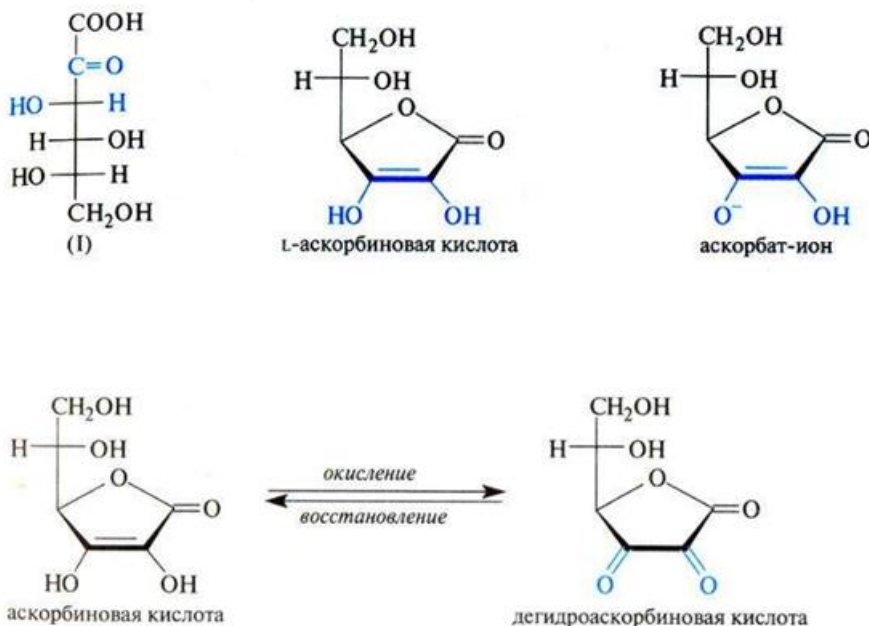


Фурацилин (Нитрофурал) применяют наружно в растворах и мазях как антисептик для обработки ран, кожи, слизистых оболочек, промывания серозных и суставных полостей. Также он способствует заживлению ран и не вызывает раздражения тканей.

Фуразолидон применяют при кишечных инфекциях, заболеваниях мочеполовой системы, а также при массивных поражениях кожи для профилактики осложнений.

Фурадонин (Нитрофурантоин) — (E) -1-[(5-нитро-2-фуранил)метил]амино-2,4-имидазолидиндион — Фурадонин успешно применяется при инфекциях мочевыводящих путей.

Аскорбиновая кислота (витамин С) — γ -лактон 2,3-дегидро-*L*-гулоновой кислоты — необходима для нормального функционирования соединительной и костной ткани. Является антиоксидантом, участвует в гидроксировании пролина и лизина (при образовании коллагена), выполняет функции кофермента в составе фермента тиоглюкозидазы. При участии витамина С происходит транспорт железа и его включение в состав ферритина тканей.

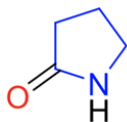


В промышленности аскорбиновую кислоту получают из *D*-глюкозы.

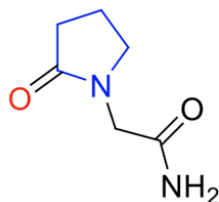
1.2. Производные пиррола

Пирацетам (Ноотропил, Миокалм, Динаген) — 2-оксо-1-пирролидинил-ацетамид, или амид (2-оксопирролидин-1-ил)уксусной кислоты, — ноотропное

биологически активное вещество, используемое для улучшения обменных процессов в коре головного мозга.



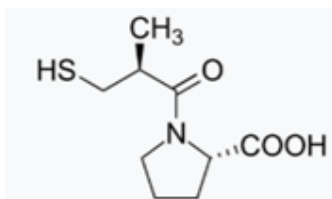
2-пирролидон



пирацетам II

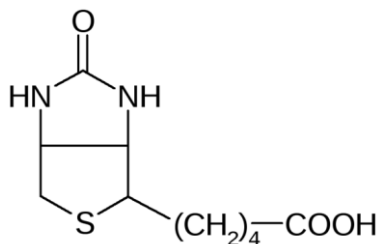
Применяется пирацетам в неврологической, психиатрической и наркологической практике. В результате действия этого биологически активного вещества повышается концентрация АТФ в мозговой ткани, усиливается биосинтез рибонуклеиновой кислоты и фосфолипидов, стимулируются гликолитические процессы. Может использоваться для улучшения памяти и замедления старения мозга.

Каптоприл (Капотен) — 1-[(2S)-3-меркапто-2-метилпропионил]-L-пролин — это современное гипотензивное биологически активное вещество, очень эффективное при гипертонии, сердечной недостаточности, инфаркте миокарда. Механизм действия каптоприла заключается в ингибировании ангиотензин-превращающего фермента.



1.3. Производные тиофена

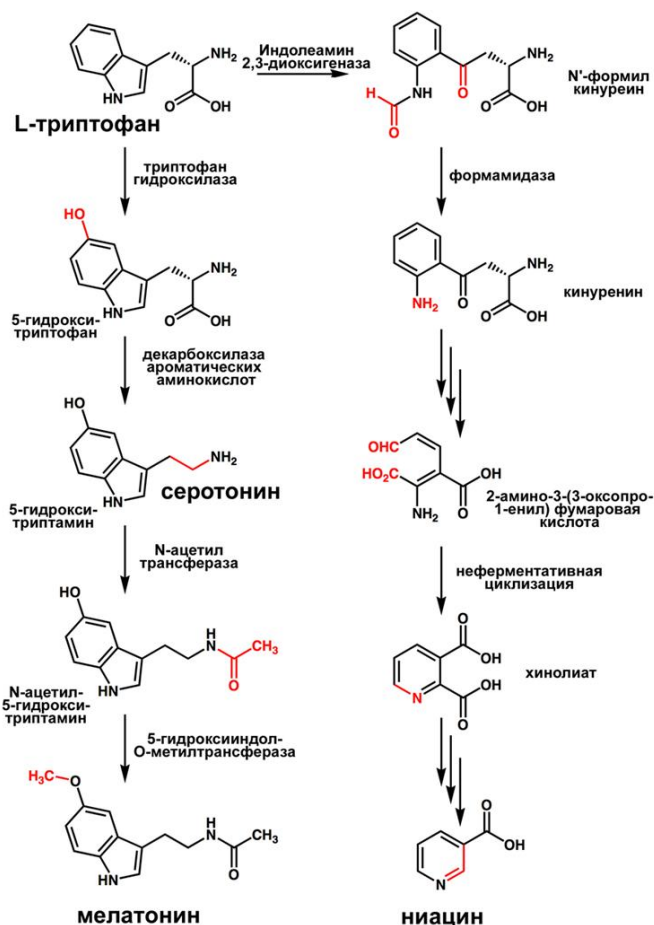
Молекула **биотина** (витамина Н) состоит из тетрагидроимидазольного и тиофанового колец, причем в тиофановом фрагменте один из атомов водорода замещен на остаток валериановой кислоты. Биотин является кофактором в метаболизме жирных кислот, лейцина и в процессе глюконеогенеза.



1.4. Производные индола

Триптофан — β -индолиламинопропионовая кислота — входит в число 20 важнейших природных аминокислот, из которых преимущественно состоят белки всех живых организмов. При этом она является для человека незаменимой, т. е. потребность в триптофане удовлетворяется лишь поступлением в организм этой аминокислоты извне. Данная аминокислота — компонент пищевых белков, которые содержатся в мясе, овсе, бананах, сушеных финиках, арахисе, кунжуте, кедровых орехах, соевых бобах, молоке, йогурте, твороге, рыбе, курице, индейке. В природе оптически чистый триптофан синтезируют микроорганизмы, растения и грибы.

Серотонин — 5-гидрокситриптамин — один из основных нейромедиаторов, часто его называют «гормоном хорошего настроения» и «гормоном счастья». В организме серотонин образуется из триптофана путем его последовательного 5-гидроксилирования ферментом 5-триптофангидроксилазой, а затем декарбоксилирования получившегося 5-гидрокситриптофана ферментом триптофандекарбоксилазой.



Мелатонин — N-[2-(5-метокси-1H-индол-3-ил)этил]этанами́д — основной гормон эпифиза, регулятор суточных ритмов. В организме мелатонин образуется из серотонина. Под воздействием фермента N-ацетилтрансферазы серотонин превращается в N-ацетил-5-гидрокситриптамин, затем реализуется стадия O-метилирования.

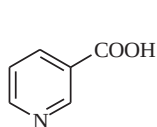
Таблетки мелатонина применяют для облегчения засыпания и для корректировки «внутренних часов» при длительных путешествиях.

2. БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ВЕЩЕСТВА — ПРОИЗВОДНЫЕ ШЕСТИЧЛЕННЫХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ

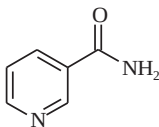
2.1. Производные пиридина

2.1.1. Производные никотиновой кислоты

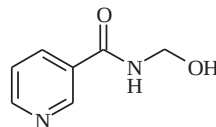
Никотиновая кислота и никотинамид содержатся в печени, почках, мышцах животных, в молоке, рыбе, дрожжах, овощах, фруктах, гречневой крупе и т. д. Это биологически активное вещество обладает противопеллагрическими свойствами, улучшает углеводный обмен, оказывает сосудорасширяющее действие.



НИКОТИНОВАА КИСЛОТА



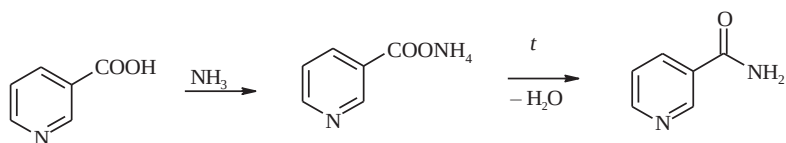
НИКОТИНАМИД



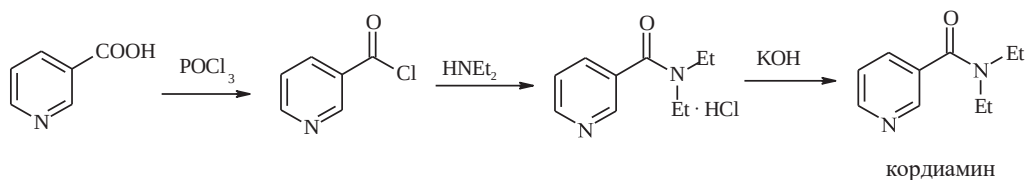
НИКОДИН

Никотинамид — амид никотиновой кислоты — истинный витамин РР (антипеллагрический витамин), распространенный в растительном и животном мире в виде нуклеотидов. Входит в состав важнейшего кофермента оксидоредуктаз НАД (никотинамидаденин-динуклеотид).

Экономичный способ синтеза никотинамида основан на пропускании газообразного аммиака через смесь никотиновой кислоты и водного раствора аммиака при температуре 180–185 °С.

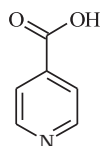


Кордиамин (диэтиламид никотиновой кислоты, никетамид) — стимулятор нервной системы, возбуждатель дыхательных и сосудодвигательных центров головного мозга. Получают это соединение посредством взаимодействия хлорангидрида никотиновой кислоты с диэтиламиноом.

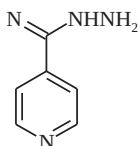


2.1.2. Производные изоникотиновой кислоты

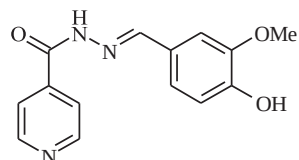
Изоникотиновая кислота — промежуточный продукт в синтезе ряда противотуберкулезных биологически активных веществ группы гидразида изоникотиновой кислоты (таких, как изониазид, фтивазид, метазид).



ИЗОНИКОТИНОВАЯ КИСЛОТА

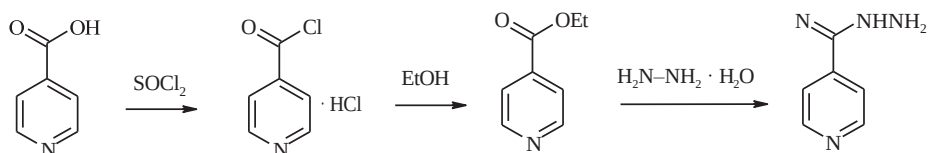


ИЗОНИАЗИД

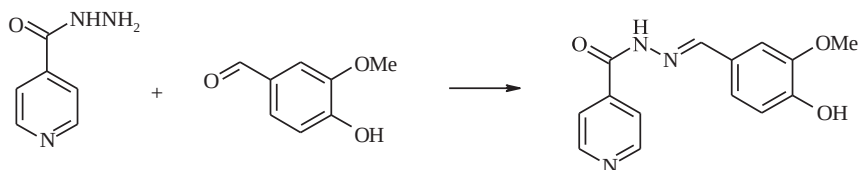


ФТИВАЗИД

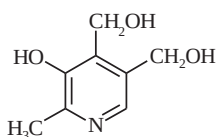
Изониазид получают действием гидразингидрата на этиловый эфир изоникотиновой кислоты:



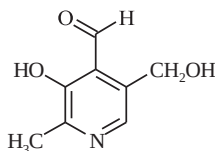
Для получения **фтивазида** проводят взаимодействие изониазид с 3-метокси-4-гидроксibenзальдегидом (ванилином):



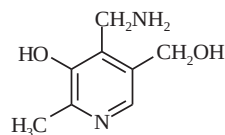
Пиридоксин (витамин В₆) — 4,5-дигидроксиметил-2-метилпиридин-3-ол — был открыт П. Дьерди в 1934 г., а через 4 года выделен в кристаллическом состоянии. Различают три индивидуальных биологически активных вещества, обладающих свойствами витамина В₆: пиридоксамин, пиридоксин и пиридоксаль. Все три формы витамина В₆ легко превращаются друг в друга, однако наибольшую биологическую активность имеет фосфорилированная форма пиридоксала.



пиридоксин



пиридоксаль



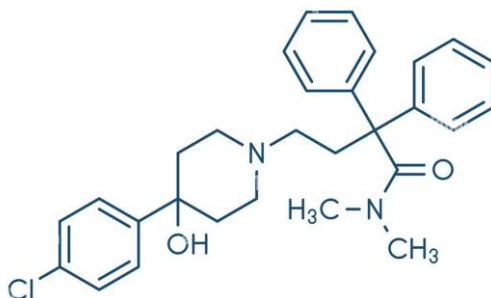
пиридоксамин

Основная функция витамина В₆ состоит в том, что он в составе различных ферментов принимает участие в метаболизме аминокислот. Его активная форма — фосфопиридоксаль — входит в состав аминотрансфераз, катализирующих перенос аминогрупп ряда аминокислот.

Признаком авитаминоза В₆ являются кожные заболевания (эритемы, отеки), нарушения центральной нервной системы и кроветворения. Дефицит витамина В₆ у человека проявляется более отчетливо в младенческом возрасте и сопровождается конвульсиями и эпилептическими припадками. Синтезируется

витамин В₆ растительными и микробными клетками. Наибольшее количество его — в печени, яйцах, дрожжах, моркови. Большое количество анальгетиков относится к производным пиперидина.

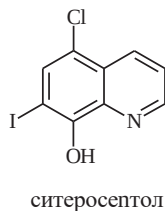
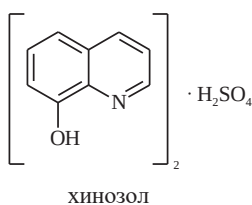
Лоперамид (Имодиум) — 1-(4-хлорфенил)-4-гидрокси-N,N-диметил- α,α -дифенил-1-пиперидинбутирамид — был разработан в компании Janssen Pharmaceutica в 1969 г., он применяется для лечения диареи, вызванной гастроэнтеритом и воспалительными заболеваниями кишечника.



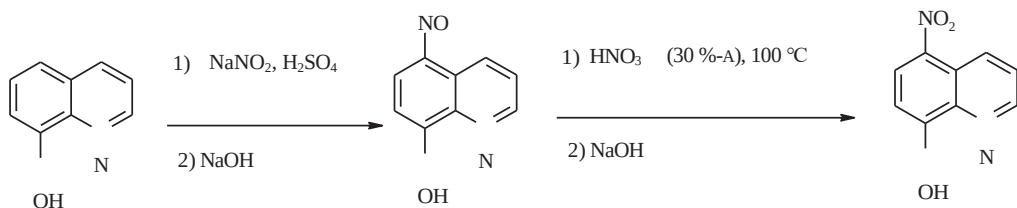
2.1.3. Производные 8-оксихинолина

Применяют эти биологически активные вещества при кишечных инфекционных заболеваниях (дизентерия, сальмонеллез, пищевые токсикоинфекции, кишечные инфекции, вызванные стафилококком, протеем и другими энтеро- бактериями, а также дисбактериоз).

Нитроксолин селективно ингибирует синтез бактериальной ДНК и оказывает действие на грамположительные микроорганизмы. Активен также в отношении *Mycobacterium tuberculosis*, *Trichomonas vaginalis* и некоторых видов грибов *Candida*.



В синтезе нитроксолина используют последовательность реакций нитро- зирование — окисление, в качестве окислителя применяют азотную кислоту:

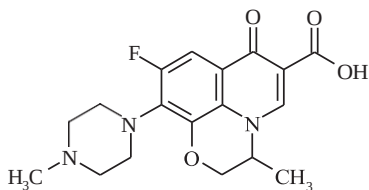


2.1.4. Производные фторхинолового ряда

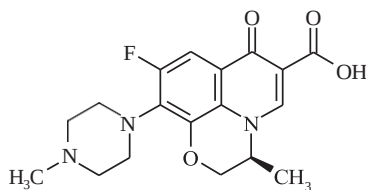
В последние три десятилетия антибактериальные биологически активные вещества фторхинолонового ряда прочно вошли в медицинскую практику.

Первым представителем данных соединений была *оксолиновая кислота*, обладающая широким спектром действия, в особенности против грамотрицательных бактерий.

Офлоксацин (Таривид) — влияет преимущественно на грамотрицательные бактерии. Эффективен в отношении микроорганизмов, устойчивых к большинству антибиотиков и к сульфаниламидам. Применяют офлоксацин при инфекциях дыхательных путей, уха, горла, носа, кожи, мягких тканей, остеомиелите, инфекционных заболеваниях органов брюшной полости, почек, мочевыводящих путей, простатите, инфекционных гинекологических заболеваниях, гонорее. Имеются данные об активности офлоксацина в отношении микобактерий туберкулеза и целесообразности его применения в комплексной терапии больных туберкулезом. Важно отметить, что офлоксацин представляет собой смесь двух энантиомеров. Активность **левофлоксацина** (*S*-(-)-офлоксацина) в 2 раза выше активности рацемата и в 128 раз выше активности *R*-изомера.



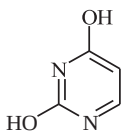
офлоксацин



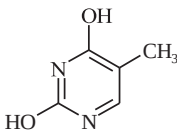
левофлоксацин

2.1.5. Производные пиридина

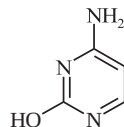
Урацил входит в состав РНК, тимин — в состав ДНК, цитозин — в состав и ДНК, и РНК:



урацил



тимин



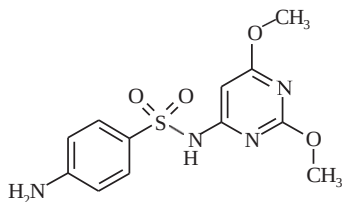
цитозин

Пиримидиновые основания способны к различным типам таутомерных превращений: лактам-лактимному для оксипроизводных и амин-иминному для аминопроизводных. На примере урацила таутомерные превращения можно представить в приведенном далее виде.



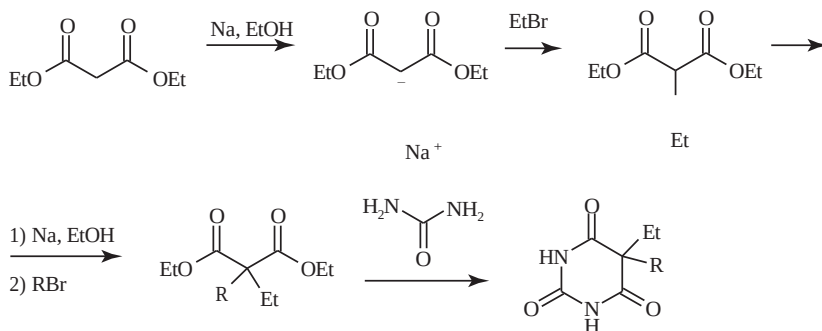
Благодаря таутомерным превращениям пиримидиновые основания вступают во взаимодействие с пентозой по первому атому азота.

Фрагменты пиримидина входят в состав ряда важных сульфаниламидных препаратов, в частности сульфадиметоксина:



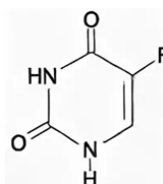
сульфадиметоксин

Барбитураты — группа биологически активных веществ, производных барбитуровой кислоты, оказывающих угнетающее влияние на центральную нервную систему. Применяются барбитураты в качестве снотворных и успокаивающих средств. Ниже приведена схема синтеза двух барбитуратов на основе малонowego эфира и мочевины.

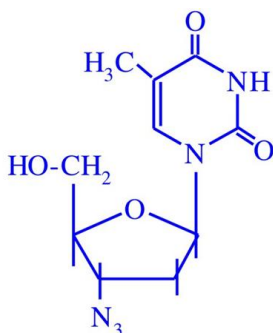


$\text{R}=\text{C}_2\text{H}_5$ (барбитал), C_6H_5 (фенобарбитал)

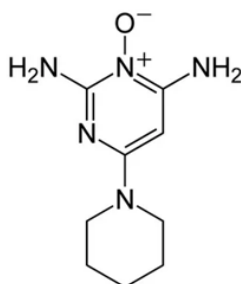
Фторурацил — противоопухолевое биологически активное вещество, ингибирующее тимидилат-синтазу.



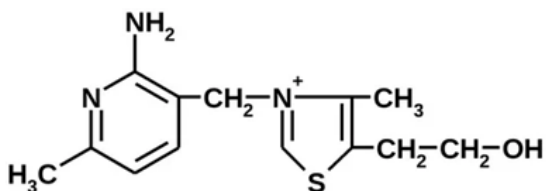
Азидотимидин — противовирусное биологически активное вещество, применяемое в составе комбинированной антиретровирусной терапии, активное в отношении ВИЧ.



Миноксидил — 6-(1-пиперидинил)-2,4-пиримидиндиамин-3-оксид — сосудорасширяющее антигипертензивное биологически активное вещество. При местном применении миноксидил также замедляет или останавливает потерю волос и стимулирует рост новых волос.



Витамин В₁ (тиамин) содержит в своей структуре пиримидиновый фрагмент.

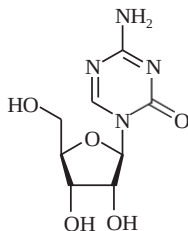


Дефицит витамина В₁ приводит к блокированию реакций декарбоксилирования и к накоплению избыточных количеств пировиноградной кислоты, что может спровоцировать нейротоксикоз. При недостатке тиамина возникает болезнь бери-бери (разновидность полинейропатии). К счастью, сегодня это заболевание встречается редко, оно возникает у людей, питающихся преимущественно белым рисом, лишенным оболочки.

2.2. Производные триазина

В некоторых синтетических лекарственных средствах присутствуют фрагменты 1,3,5-триазина либо 1,2,4-триазина.

3-Азацитидин (Вайдаза) — рибофуранозид 4-амино-1,3,5-триазин-2-она — проявляет противоопухолевую и противолейкемическую активность.



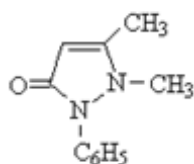
5-азацитидин

Противоопухолевые эффекты данного биологически активного вещества связаны с двойным механизмом действия — он встраивается не только в молекулу ДНК, вызывая ее гипометилирование, но и в молекулу РНК. Гипометилирование приводит к экспрессии генов-онкосупрессоров и к восстановлению дифференцировки клеток. Понижая количество РНК в клетках, азацитидин способствует цитостатическому эффекту вне зависимости от клеточной фазы.

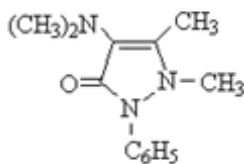
3. БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ВЕЩЕСТВА — ПРОИЗВОДНЫЕ АЗОЛОВ

3.1. Производные пиразола

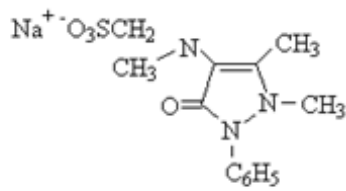
Метамизол натрия (Анальгин) — натриевая соль [(2,3-дигидро-1,5-диметил-3-оксо-2-фенил-1Н-пиразол-4-ил)метиламино]метансульфоновой кислоты — обезболивающее, противовоспалительное, жаропонижающее биологически активное вещество. Синтезирован в 1920 г. в ходе исследований по созданию легко растворимой формы амидопирин.



Антипирин

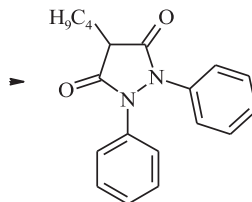


Амидопирин



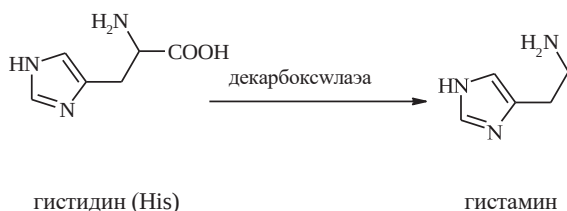
Анальгин

Бутадион — 1,2-дифенил-4-*n*-бутил-3,5-пиразолидиндион — является ингибитором биосинтеза простагландинов, превосходя в этом отношении ацетилсалициловую кислоту. Применяют при ревматизме, ревматоидных полиартритах, инфекционных неспецифических полиартритах, болезни Бехтерева, подагре. Синтез бутадиона проводят конденсацией гидразобензола с бутилмалоновым эфиром.

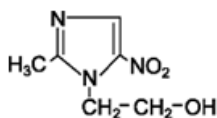


3.2. Производные имидазола

Гистидин — *L*-2-амино-3-(1H-имидазол-4-ил)пропановая кислота — незаменимая аминокислота; гистидина гидрохлорид используют для лечения больных гепатитами, язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки. Имеются также данные о благоприятном влиянии этой аминокислоты на липопротеиновый обмен при атеросклерозе. При декарбоксилировании гистидина в организме образуется гистамин — биогенный амин, ответственный за аллергические реакции.

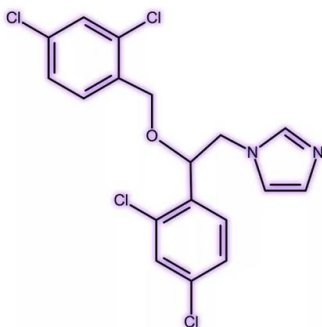


Метронидазол — 2-(2-метил-5-нитро-1H-имидазол-1-ил)этанол — противопротозойное и противомикробное биологически активное вещество. Препарат Метронидазол входит в перечень жизненно необходимых и важнейших лекарственных препаратов.



3.3. Соединения с противогрибковой активностью

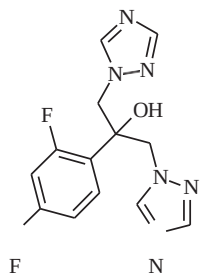
Миконазол — (RS)-1-{2-(2,4-дихлорфенил)-2-[(2,4-дихлорфенил)метокси]-этил}-1H-имидазол — биологически активное вещество для местного лечения при большинстве грибковых заболеваний.



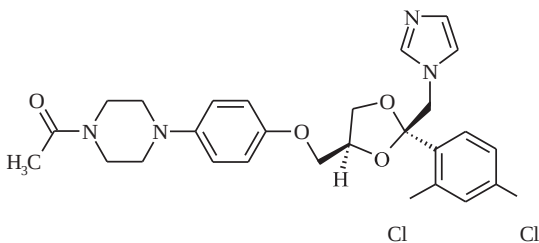
Флуконазол (Дифлюкан) — 2-(2,4-дифторфенил)-1,3-бис(1H-1,2,4-триазол-1-ил)-2-пропанол — является лечебным и профилактическим биологи-

чески активным веществом, применяемым при кандидозе и некоторых других микозах.

Кетоконазол эффективен при приеме внутрь, оказывает влияние как на поверхностные, так и на системные микозы. Действие кетоконазола связано с нарушением биосинтеза эргостерина, триглицеридов и фосфолипидов, необходимых для образования клеточной мембраны грибов.



флуконазол

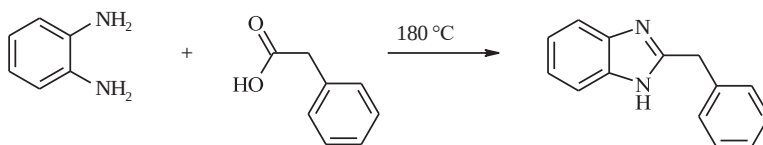


кетоконазол

4. БИЦИКЛИЧЕСКИЕ ГЕТЕРОЦИКЛЫ С ДВУМЯ И БОЛЕЕ ГЕТЕРОАТОМАМИ

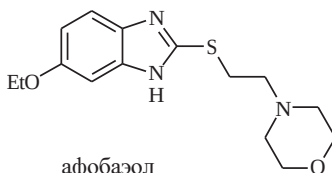
4.1. Производные бензимидазола

Гипотензивное биологически активное вещество **дибазол** — 2-(фенилметил)-1H-бензимидазол — относится к классу бензазолов. Получают дибазол путем циклоконденсации *o*-фенилендиамина и фенилуксусной кислоты.



дибазол

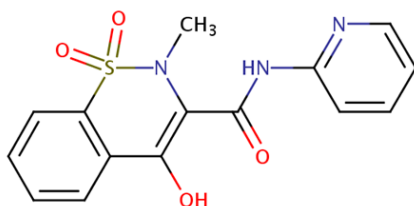
Афобазол — 5-этоксi-2-[2-(морфолино)этилтио]бензимидазола дигидрохлорид — был разработан в НИИ фармакологии РАМН в качестве анксиолитика, он эффективен при генерализованном тревожном расстройстве, но не относится к биологически активным веществам первого выбора при обычных тревожных расстройствах.



афобазол

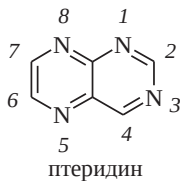
4.2. Производные бензотиазина, фенотиазина, бензотиадиазина, бензотриазина

Пироксикам — нестероидное противовоспалительное биологически активное вещество, неселективно ингибирующее фермент циклооксигеназу. Хорошо зарекомендовал себя в лечении больных с ревматоидным артритом, остеоартритом и другими заболеваниями опорно-двигательной системы, также используется при дисменорее и для купирования послеоперационных болей. Длительный период полувыведения пироксикама позволяет применять его один раз в день.



4.3. Производные птеридина

Птеридин — бициклический гетероцикл, состоящий из пиримидинового и пиазинового гетероциклических колец:

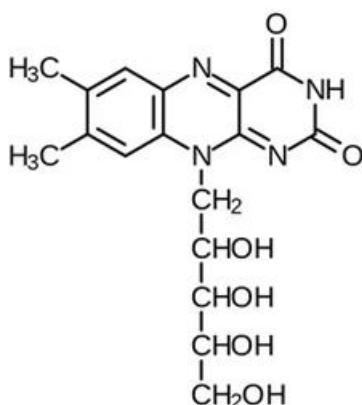


Фолиевая кислота (витамин В_с или В₉) необходима для роста и развития кровеносной и иммунной систем. Состоит фолиевая кислота из трех фрагментов: птерина, *p*-аминобензойной кислоты и глутаминовой кислоты.



Основная биохимическая функция витамина В_с в составе кофермента тетрагидрофолиевой кислоты связана с переносом одноуглеродных фрагментов (формил-, оксиметил-, метенил-, метилен-, метил-, формимино-) различных метаболитов.

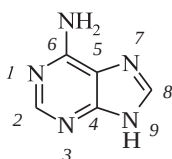
Рибофлавин (витамин В₂) состоит из изоаллоксазина и спирта рибитола. Молекула изоаллоксазина представляет собой три ароматических кольца — бензольное, пиримидиновое и пиразиновое, причем в пиримидиновом кольце содержатся два гидроксильных заместителя.



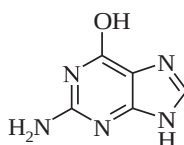
Витамин В₂ образует в организме коферменты около 30 ферментов, осуществляющих перенос водорода на различные субстраты. Часто рибофлавин называют самым значимым веществом для красоты — от его содержания в организме зависит качество эпидермиса. Этот витамин участвует в процессах кроветворения и формирования иммунных антител, поддерживает репродуктивную систему человека, нормализует деятельность щитовидной железы и регулирует рост организма в детский и подростковый периоды.

4.4. Производные пуринов

Среди пуриновых оснований в ДНК и РНК преимущественно встречаются аденин и гуанин.



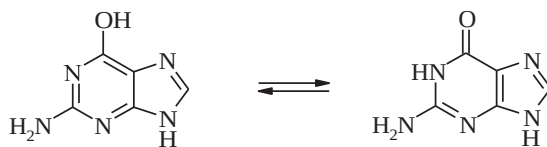
аденин (6-аминопурин)



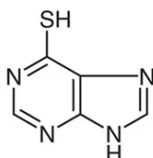
ГУАНИН

В нуклеиновых кислотах пуриновые и пиримидиновые основания главным образом находятся в лактамной и аминной формах, что обеспечивает

правильность спаривания нуклеотидов в ходе матричных синтезов нуклеиновых кислот.



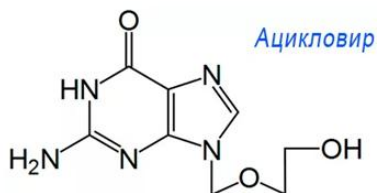
6-Меркаптопурин — цитостатическое биологически активное вещество из группы антиметаболитов. Применяют при следующих заболеваниях: миелолейкоз, хорионэпителиома матки, ретикулезы, острый лимфобластный лейкоз и хронический гранулоцитарный лейкоз.



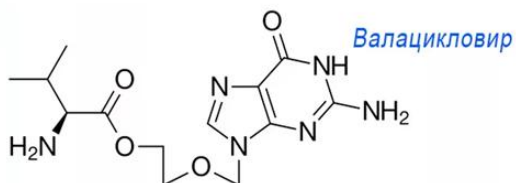
Ацикловир — важное противовирусное биологически активное вещество, открытое в 1970-х гг.; представляет собой классический терминатор цепи, удовлетворяющий следующим требованиям:

- 1) содержит фрагмент гуанина, что позволяет образовать комплементарную пару с цитозиновым остатком темплатной цепи;
- 2) хотя сам ацикловир не содержит трифосфатной группы, она добавляется к молекуле в инфицированной вирусом клетке;
- 3) пентозный остаток не завершен — отсутствует гидроксильная группа в положении 3', которая имеется в нормальном дезоксигуанозине, следовательно, цепь ДНК не может достраиваться дальше.

Особенно эффективен ацикловир в отношении вирусов простого герпеса, опоясывающего герпеса (лишай) и ветряной оспы. Это соединение является аналогом пуринового нуклеозида дезоксигуанозина, нормального компонента ДНК.



Ацикловир

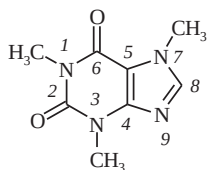


Валацикловир

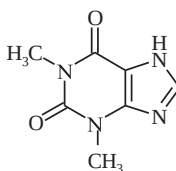
Ганцикловир — аналог ацикловира, имеющий дополнительную гидроксиметильную группу, **валганцикловир** — пролекарство этого соединения. Ганцикловир активен в отношении цитомегаловируса, вируса *Herpes simplex* типов 1 и 2, вируса Эпштейна — Барра, вируса *Varicella zoster* и

вируса гепатита В. Под влиянием кодируемой вирусом тимидиновой киназы ганцикловир быстро фосфорилируется в форму монофосфата, а затем под действием клеточных киназ последовательно превращается в дифосфат и трифосфат. Действуя как субстрат и встраиваясь в ДНК, ганцикловира трифосфат конкурентно ингибирует ДНК-полимеразу, что приводит к подавлению синтеза ДНК

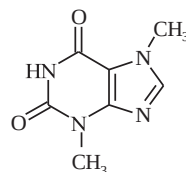
Пуриновые алкалоиды представляют собой N-метилированные ксантины. Кофеин является 1,3,7-триметилксантином, теобромин — 3,7-диметилксантином, теofilлин — 1,3-диметилксантином.



кофеин



теofilлин

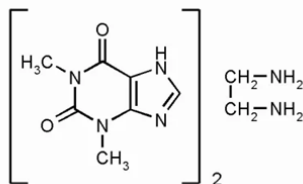


теобромин

Кофеин — психоактивное стимулирующее биологически активное вещество с горьким вкусом, содержащееся в кофе, чае, какао, коле. Влияя на центральную нервную систему (головной и спинной мозг), кофеин усиливает дыхание, повышает частоту и силу сердечных сокращений, ускоряет обмен веществ и тем самым создает ощущение бодрости, снимает усталость и сонливость. Также кофеин оказывает мочегонное действие и стимулирует сужение кровеносных сосудов, что определяет его способность облегчать головную боль, вызванную их расширением (этим обусловлено присутствие данного вещества в комбинированном препарате от головной боли Цитрамон). Кроме того, кофеин повышает мышечный тонус и улучшает координацию движений.

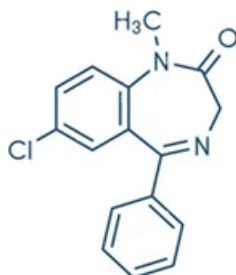
Теofilлин содержится в чае, **теобромин** — в чае и какао. Их действие аналогично действию кофеина, но мочегонный эффект более сильный и продолжительный. Применяют теofilлин и теобромин как сердечно-сосудистые средства.

На использовании кислотных свойств пуриновых алкалоидов основано получение водорастворимых препаратов. Примером такого препарата может служить **эуфиллин** — соль теofilлина с этилендиамином.



4.5. Производные бензодиазепинов

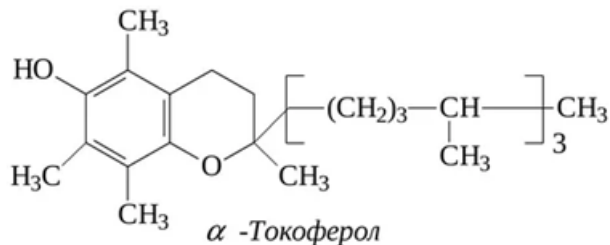
Диазепам – 7-хлор-1,3-дигидро-1-метил-5-фенил-2Н-1,4-бензодиазепин-2-он – оказывает седативный, снотворный, противотревожный, противосудорожный, миорелаксирующий (расслабляющий) и амнестический эффекты. Усиливает действие снотворных, наркотических, нейролептических, анальгетических препаратов, алкоголя. Прием диазепама в течение длительного времени может привести к зависимости от препарата.



5. ПРОИЗВОДНЫЕ ШЕСТИЧЛЕННЫХ КИСЛОРОДСОДЕРЖАЩИХ ГЕТЕРОЦИКЛОВ

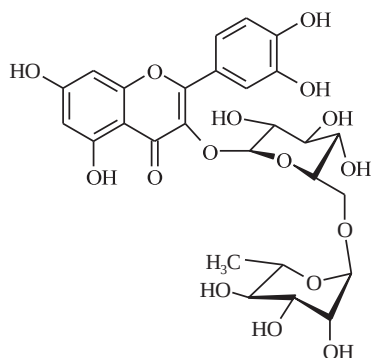
В 1922 г. Г. Эванс и А. Бишо открыли жирорастворимый витамин, названный ими **токоферолом** (дословно — способствующий родам). Позднее он стал известен как витамин Е. Имеются три группы токоферолов — производных хромана, различающихся по степени метилирования хроманового ядра и биологической активности: α -токоферол, или 5,7,8-триметилтокол; β -токоферол, или 5,8-диметилтокол; и γ -токоферол, или 5-монометилтокол. Наибольшей биологической активностью обладает α -токоферол, активность β -токоферола почти вдвое меньше.

Механизм действия витамина Е в первую очередь связан с антиоксидантными свойствами. Предотвращая процесс пероксидного окисления липидов, этот витамин поддерживает целостность биологических мембран, структурным компонентом которых он является, реагируя с пероксидными радикалами липидов, при этом токоферолы, окисляясь до токоферилхинона, обрывают цепи окисления.



Дефицит витамина Е приводит к нарушениям эмбриогенеза и репродуктивных органов, является причиной дегенерации спинного мозга и легочной дистрофии. Токоферолы в большом количестве содержатся в растительных и животных маслах, пшенице, моркови, яйцах и молоке.

Витамин Р представляет собой группу биофлавоноидов, нормализующих проницаемость сосудов, т. е. обладающих сходным с витамином С биологическим действием. Один из этих биофлавоноидов был впервые выделен А. Сент-Дьерди в 1936 г. из кожуры лимона и получил название **рутин**. Другие биофлавоноиды (геспердин, кумарины, антоцианы), как и рутин, являются производными флавона.



рутин

Подобно аскорбиновой кислоте биофлавоноиды участвуют в регуляции синтеза коллагена. Они ингибируют фермент гиалуронидазу, что приводит к стабилизации межклеточной соединительной ткани и стенок сосудов. Дефицит витамина Р вызывает в организме такие нарушения, как ломкость сосудов, мелкие внутрикожные кровоизлияния, кровоточивость десен. Гиповитаминоз сопровождается мышечными болями, общей слабостью и быстрой утомляемостью.

Биофлавоноиды содержатся только в растительных клетках (продукты с высоким содержанием рутина — шиповник, апельсины, лимоны, виноград, клюква, морковь, петрушка).