Биологически активные вещества (БАВ) ЛРС: классификация, растворимость, значение в медицине.

Лектор:

PhD, ассоц. профессор

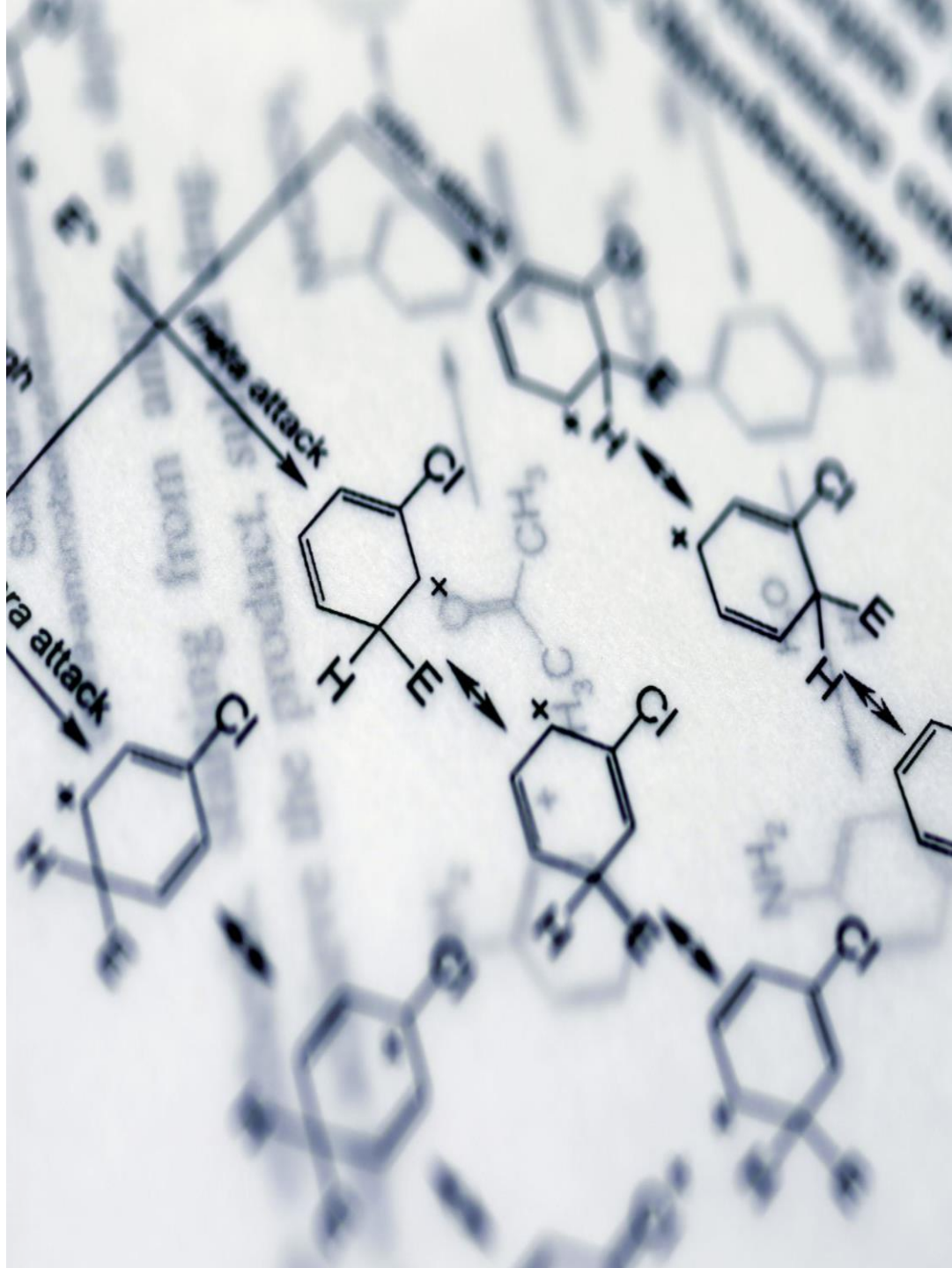
Оңалбек Дамира Дүйсембекқызы

ВВЕДЕНИЕ

- По данным ВОЗ, около **80% населения мира** используют лекарственные растения в медицине.
- Более **40% фармацевтических препаратов** содержат БАВ растительного происхождения.

БАВ важны для:

- терапии хронических заболеваний,
- профилактики,
- создания новых синтетических и комбинированных препаратов.



Что такое БАВ?

Биологически активные вещества (БАВ) — это природные соединения, входящие в состав лекарственного растительного сырья, оказывающие физиологическое действие на организм.

БАВ определяют **фармакологическую активность ЛРС**.

БАВ – химические соединения, синтезируемые растениями в процессе обмена веществ.

Они обеспечивают **фармакологическую активность ЛРС**.

Являются основой для производства фитопрепаратов, БАДов и синтетических лекарств.

БАВ – это вещества, обладающие способностью **влиять на физиологические функции организма** даже в малых дозах.

Отличие от питательных веществ: они не служат источником энергии, но оказывают специфическое воздействие.

Основные задачи изучения БАВ

- **Классификация** – выявить, к какой группе относится вещество.
- **Выявление растворимости** – важно для выбора растворителей при экстракции.
- **Фармакологическая активность** – установление действия на организм.
- **Методы анализа** – качественные и количественные.
- **Стандартизация ЛРС** – включение в фармакопею.

Химический состав лекарственного растительного сырья

В растительном сырье присутствуют:

- **Биологически активные вещества**
- **Сопутствующие вещества**
- **Балластные вещества**
- **Минеральные компоненты**

При экстракции важно извлечь максимально возможное количество необходимых БАВ и одновременно ограничить переход нежелательных компонентов.

Именно поэтому большое значение имеет **селективность экстракции**.

Химическая классификация БАВ (I уровень)

Алкалоиды (азотсодержащие основания).

Гликозиды (сахаристые соединения)

Флавоноиды (полифенолы)

Таннины (дубильные вещества)

Сапонины

Органические кислоты

Витамины

Эфирные масла

Слизи и камеди

Горечи

Полисахариды

Растворимость БАВ

Группа БАВ	Растворимость в воде	Растворимость в спирте	Растворимость в жирах
Алкалоиды (осн.)	Плохо	Хорошо	Плохо
Алкалоиды (соли)	Хорошо	Хорошо	Плохо
Гликозиды	Хорошо	Хорошо	Плохо
Флавоноиды	Плохо	Хорошо	Иногда
Таннины	Хорошо	Частично	Плохо
Эфирные масла	Нерастворимы	Хорошо	Хорошо
Сапонины	Хорошо	Умеренно	Плохо
Полисахариды	Хорошо (коллоидно)	Плохо	Плохо
Витамины (A, D, E)	Плохо	Плохо	Хорошо
Витамины (C, B)	Хорошо	Хорошо	Плохо

Растворимость БАВ



В воде: гликозиды, полисахариды, витамины, алкалоиды в виде солей.



В спиртах: алкалоиды, гликозиды, флавоноиды, сапонины, дубильные вещества.



В жирах и эфирных маслах: липофильные витамины (A, D, E, K), эфирные масла, жирные кислоты.



Растворимость зависит от **полярности** молекулы и наличия функциональных групп.

БАВ и их растворимости



Алкалоиды: морфин, атропин (растворимы в спирте, плохо в воде).



Флавоноиды: рутин, кверцетин (растворимы в спирте, плохо в воде).



Таннины: хорошо растворимы в воде.



Эфирные масла: нерастворимы в воде, растворимы в жирах.



Сапонины: растворимы в воде, дают мыльную пену.

Алкалоиды

Более **12 000 соединений** известно в природе.

Основные свойства: горький вкус, щёлочные свойства, физиологическая активность.

Примеры:

- Морфин (обезболивающее).
- Кофеин (психостимулятор).
- **Атропин (спазмолитик).**

Растворимость: основания – в спирте, соли – в воде.

Растворимость алкалоидов

Растворимость алкалоидов существенно зависит от химической формы.

- **Свободные основания**

Многие свободные основания алкалоидов хуже растворяются в воде и лучше — в некоторых органических растворителях.

- **Соли алкалоидов**

Многие соли значительно лучше растворяются в воде. Поэтому изменение **pH** используется для управления растворимостью и селективностью при выделении алкалоидов.

- Упрощенно:
- **Алкалоид-основание + кислота → соль алкалоида**

Изменение кислотности среды может переводить алкалоид из одной формы в другую.

Гликозиды

Состоят из **углеводной части (гликон)** и **неуглеводной части (агликон)**.

Классы: сердечные, антрахиноновые, синильные и др.

Примеры:

- Дигоксин – усиливает сокращения миокарда.
- Салицин – прототип аспирина.
- Алоин – слабительное.

Растворимость: хорошо в воде и спирте.

Классификация гликозидов

В зависимости от природы агликона выделяют, например:

- сердечные гликозиды;
- флавоноидные гликозиды;
- антраценгликозиды;
- фенольные гликозиды;
- некоторые сапониновые гликозиды.

Поэтому термин «гликозиды» обозначает структурный принцип, а не одно фармакологическое действие.

Растворимость гликозидов

Наличие сахарного компонента часто повышает полярность молекулы.

Многие гликозиды растворимы в:

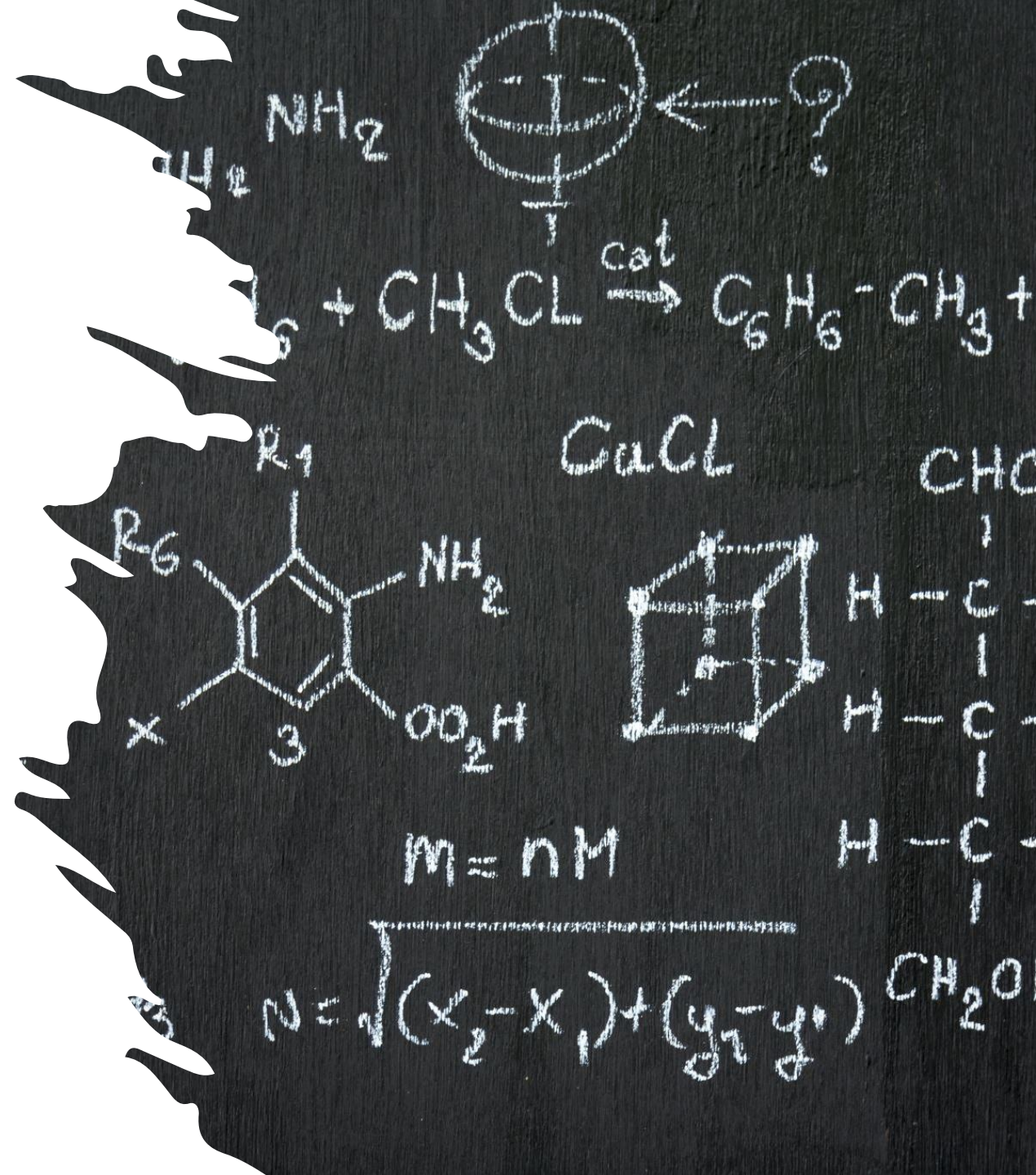
- воде;
- водно-спиртовых смесях;
- полярных органических растворителях.

После гидролиза образующийся агликон может иметь значительно меньшую растворимость в воде.

Это важно при разработке технологии экстракции.

Флавоноиды

- Более **4000 соединений**.
- Функции: антиоксидантное, капилляроукрепляющее, противовоспалительное.
- Примеры:
  - Рутин – укрепляет сосуды.
  - Кверцетин – антиоксидант.
  - Гесперидин – цитрусовые.
- Используются при атеросклерозе, гипертонии.



Растворимость флавоноидов



Растворимость сильно зависит от структуры.

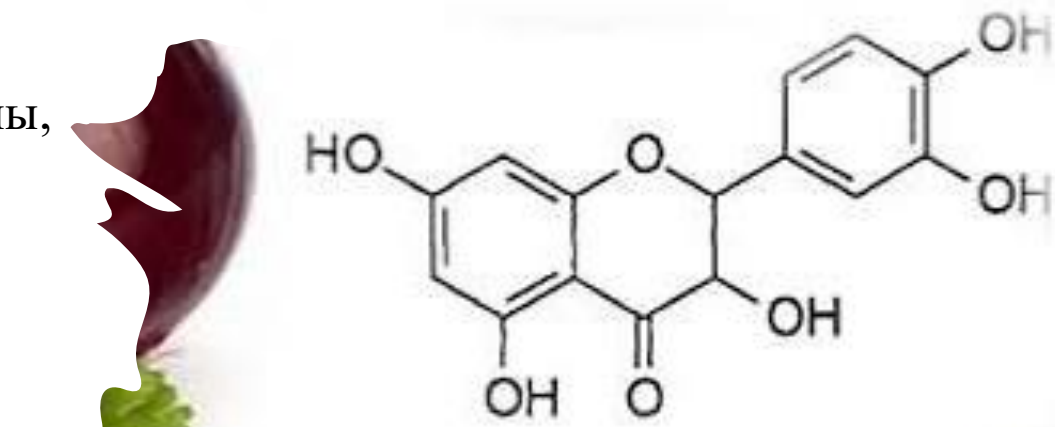
Флавоноидные гликозиды обычно более полярны, чем соответствующие агликоны.

Для извлечения флавоноидов часто применяют:

- воду;
- этанол;
- водно-этанольные смеси.

Соотношение воды и этанола позволяет изменять селективность экстракции.

Поэтому водно-спиртовые смеси широко используются при разработке растительных экстрактов, богатых полифенолами.







Таннины (дубильные вещества)

Полифенольные соединения.

Действие: вяжущее, противомикробное, противовоспалительное.

Примеры:

- Галлотаннины – чай.
- Катехины – зелёный чай, виноград.

Применяются в терапии ЖКТ, стоматологии, дерматологии.

Растворимость дубильных веществ

Многие танины хорошо извлекаются:

- водой;
- водно-спиртовыми смесями.

Из-за большого количества гидроксильных групп они обычно обладают значительной полярностью.

При технологической обработке необходимо учитывать возможность:

- окисления;
- комплексообразования;
- взаимодействия с белками;
- изменения свойств при длительном хранении.

Сапонины



Стероидные и тритерпеновые соединения.



Дают мыльную пену в воде.



Действие: отхаркивающее, адаптогенное, противоопухолевое.



Примеры:

Женьшень – иммуномодулятор.

Солодка – отхаркивающее средство.

Растворимость сапонинов

Сапонины имеют одновременно:

- гидрофильную сахарную часть;
- относительно липофильный агликон.

Поэтому обладают амфифильными свойствами.

Многие сапонины извлекаются:

- водой;
- водно-спиртовыми смесями;
- спиртами.

Их поверхностно-активные свойства могут влиять на технологический процесс и вызывать пенообразование.



Эфирные масла

- Летучие ароматические смеси.
- Действие: антисептическое, противовоспалительное, спазмолитическое.
- Примеры:
  - Ментол – мята.
  - Эвгенол – гвоздика.
  - Лимонен – цитрусовые.
- Используются в фармацевтике, ароматерапии, косметологии.

Растворимость эфирных масел

Эфирные масла:

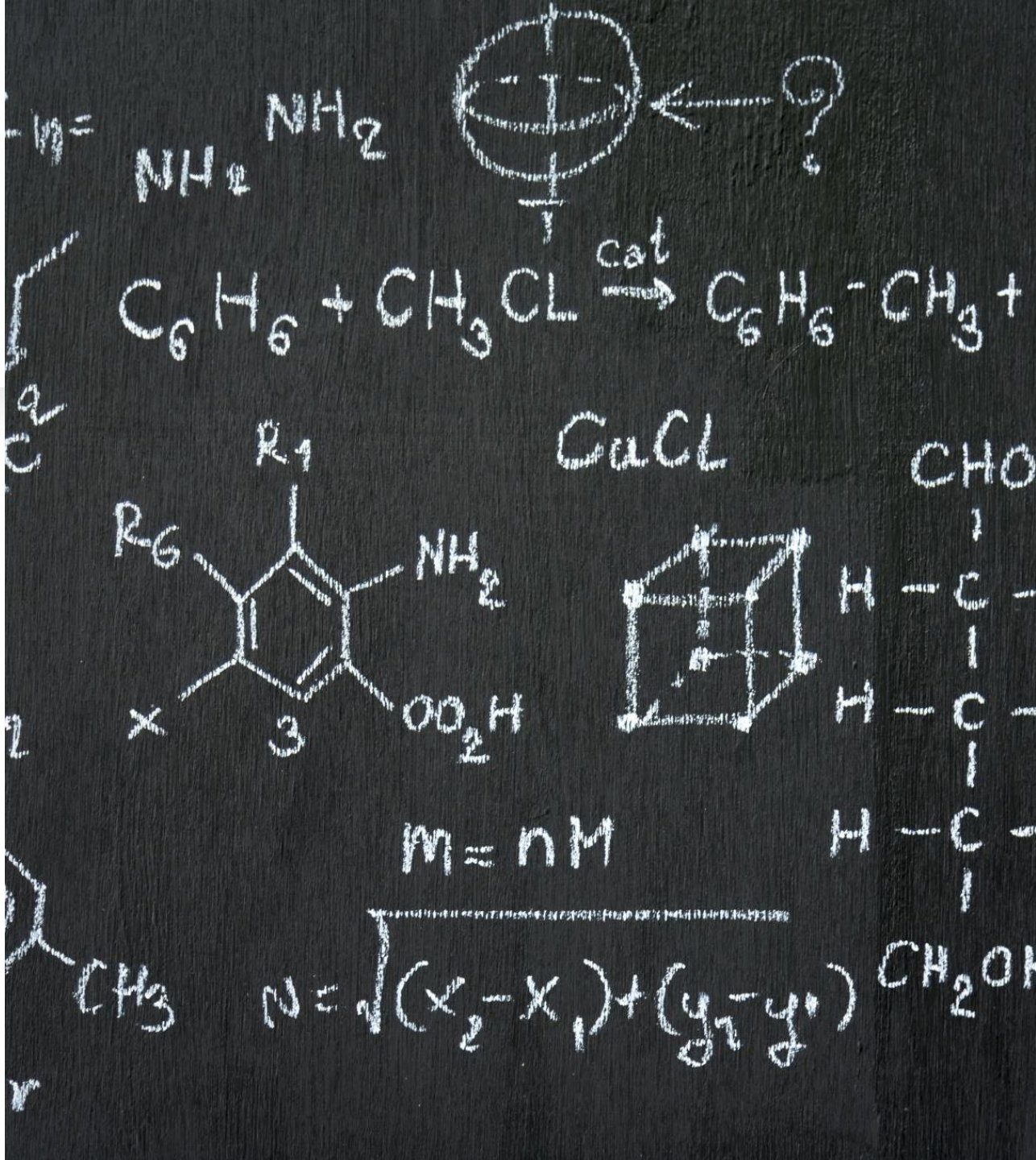
- плохо растворяются в воде;
- лучше растворяются в этаноле определенной концентрации;
- хорошо растворяются во многих органических растворителях;
- хорошо извлекаются сверхкритическим CO_2 многие липофильные компоненты.

Для получения эфирных масел также широко применяют **гидродистилляцию и перегонку с водяным паром**.

Следовательно, для летучих липофильных БАВ обычная водная экстракция часто не является оптимальным методом.

Органические кислоты

- Участвуют в регуляции обмена веществ.
- Примеры:
  - Лимонная кислота (цитрусовые).
  - Яблочная кислота (яблоки).
  - Щавелевая кислота (щавель).
- Применение: нормализация кислотно-щелочного равновесия, стимуляция пищеварения.



Витамины

- Витамины С и группы В – **водорастворимые**.
- Витамины А, D, Е, К – **жирорастворимые**.
- Источники:
  - Шиповник (витамин С).
  - Морковь (β-каротин).
  - Орехи и семена (витамин Е).
- Применение: профилактика авитаминозов, антиоксидантная терапия.

Полисахариды

Биополимеры: крахмал, слизь, пектины, камеди.

Свойства: обволакивающее, ранозаживляющее, иммуномодулирующее.

Примеры:		
Лен аптечный (слизь).	Алтей лекарственный (корень).	Яблоки (пектины).

Растворимость полисахаридов

Многие полисахариды:

- растворяются в воде;
- набухают в воде;
- образуют коллоидные растворы или вязкие дисперсии.

Этанол может снижать растворимость ряда полисахаридов и использоваться для их осаждения из водных растворов.

Условно:

Водный раствор полисахарида

этанол

↓

снижение растворимости

↓

осаждение полисахарида

Горечи

- Низкомолекулярные соединения с горьким вкусом.
- Стимулируют аппетит и секрецию ЖКТ.
- Примеры:
  - Полынь горькая.
  - Цикорий.
  - Горечавка.



Фармакологическая классификация БАВ

Кардиотоники – дигоксин, строфантин.

Анальгетики – морфин, кодеин.

Антибиотики – фитонциды, берберин.

Антиоксиданты – рутин, витамин Е.

Стимуляторы – женьшень, элеутерококк.

Примеры растений и БАВ

- Мак снотворный – морфин (обезболивающее).
- Наперстянка – дигоксин (кардиотоник).
- Кора ивы – салицин (жаропонижающее).
- Женьшень – сапонины (адаптоген).
- Шиповник – витамин С (иммуномодулятор).

Стандартизация БАВ

Для воспроизводимого качества растительного препарата необходимо контролировать содержание химических компонентов.

Стандартизация может проводиться:

По действующему веществу

Если соединение, ответственное за терапевтический эффект, установлено.

По активному маркеру

Если вещество связано с фармакологической активностью, но не является единственным действующим компонентом.

По аналитическому маркеру

Если соединение используется прежде всего для идентификации и контроля постоянства качества.

Современное значение БАВ

Создание новых **фитопрепаратов** и БАДов.

Использование в **фармацевтической химии** для синтеза аналогов.

Перспективные направления:

- противоопухолевые препараты,
- антиоксидантные комплексы,
- адаптогены.

Спасибо за внимание!