

СИНТЕЗ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНОГО ВЕЩЕСТВА С ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫМ СВОЙСТВОМ

М.Н. Кузнецов, А.Т. Шелудякова

Научный руководитель – начальник центра коллективного пользования
«Физико-химические методы анализа ТПУ» А.А.Иванов

Исследовательская школа химических и биомедицинских технологий
634034, Россия, г. Томск, пр-кт. Ленина, д. 43-А, misha264629@gmail.com

Результаты исследований, проведенные ВОЗ, показывают, что в России на 100000 человек приходится 1000 с заболеваниями мочевыводящих путей [1]. При лечении подобных заболеваний используют противовоспалительные препараты, как один из компонентов комплексной терапии, состоящей из мочегонных, антимикробных и, собственно, противовоспалительных препаратов. Последние в основном относятся к нестероидным противовоспалительным препаратам, одним из основных является – диклофенак натрия. Однако несмотря на распространенность, он имеет существенный недостаток, выражающийся в образовании дефектов слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта, или же провоцирующее рецидивы уже имеющейся язвенной болезни. В качестве альтернативы противовоспалительным веществам используются растительные комплексные препараты, которые не приводят к образованию язв. Применение этой группы сопровождается следующими недостатками: низкой комплаентностью пациентов, сложностью дозирования, загрязнением препарата пестицидами, инсектицидами и другими химическими веществами.

Целью данной работы является синтез соединения, которое обладало бы противовоспалительной активностью, не имело бы серьезных побочных эффектов и недостатков в применении.

В процессе работы был синтезирован метиловый эфир 4-(α - β -D-глюкопиранозилокси)бензойной кислоты, обладающий противовоспалительной активностью благодаря наличию в его химической структуре фрагмента 4-гидроксибензойной кислоты.

Для синтеза была использована следующая методика [4]: в первую очередь была проведена реакция типичного гликозилирования: к смеси пента-О-ацетил- β -D-глюкопиранозы и метиловый эфир пара-гидроксибензойной кислоты в атмосфере аргона добавили триэтиламин в трихлорметане, а затем эфират трехфтористого бора в метиленхлориде.

После перемешивания к реакционной смеси добавляли насыщенный водный гидрокарбонат натрия, а уже после реакцию смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой оставили на 24 часа для сушки. В итоге получили смесь фенилгликозидного продукта и метилового эфира пара-гидроксибензойной кислоты, который впоследствии были разделены с помощью растворения в этаноле и последующими кристаллизацией и фильтрацией. Конечный продукт дезацетилировали, получив целевой.

Таким образом, на выходе получили противовоспалительный препарат – метиловый эфир 4-(α - β -D-глюкопиранозилокси)бензойной кислоты, который в отличие от аналогов (например, диклофенака натрия и аспирина) не обладает существенными побочными эффектами.

Список литературы

1. *Заболеваемость населения России в 2011 году. Статистические материалы*, Г.А. Александрова (ред.), Москва (2012).
2. N. Galvan et al., *Mutat. Res.*, 649(1–2), 54–61 (2008).
3. M. Li, S.M. Shandilya. Et al., *ACS Chem. Biol.*, 7(3), 506–517 (2012).
4. Yeon Soo Lee , Eun Suk Rho , Yong Ki Min , Bum Tae Kim & Ki Ho Kim // *Journal of Carbohydrate Chemistry* (2001) 503–506 *Practical β -stereoselective O-glycosylation of phenols with penta-oacetyl- β -D-glucopyranose*, *Journal of Carbohydrate Chemistry*.