



BIURO WSPÓŁPRACY
Z GOSPODARKĄ

33.

POCHODNE KWASU
PIRAZYNOKARBOKSYLOWEGO,
SPOSÓB OTRZYMYWANIA
ORAZ ZASTOSOWANIE

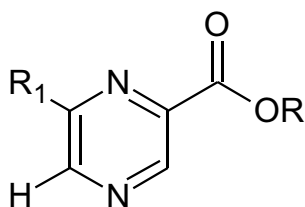
Pochodne kwasu pirazynokarboksylowego, sposób ich otrzymywania oraz zastosowanie

STAN OBECNY

Dążenie do zapewnienia odpowiedniej sterylności pomieszczeń i przedmiotów w dobie rozwoju nowoczesnego stylu życia oraz nieumiejętne stosowanie antybiotyków i pojawianie się szczepów bakterii i grzybów opornych na większość znanych leków, wymuszają wprowadzanie do użytku nowych substancji o działaniu przeciwmikrobiologicznym, szczególnie o szerokim spektrum działania przeciw drobnoustrojom. Przykładem jest tu kwas pirazynokarboksylowy (POA) i jego pochodne. Związki te są wykorzystywane do produkcji farmaceutyków np. preparatów przeciwgruźliczych. Mechanizm działania kwasu i jego pochodnych opiera się głównie na obniżaniu pH cytoplazmy, zaburzaniu działania przenośników elektronów i funkcji błon biologicznych komórek drobnoustrojów. Pozwala to, na zastosowanie tych związków jako substancji farmakologicznie czynnych, pierwotnie występujących w postaci proleku. Samo wytworzenie proleku posiadającego odpowiednie parametry farmakokinetyczne stwarza jednak problemy natury technicznej. W przypadku zastosowań farmaceutycznych, synteza taka powinna być uproszczona oraz powinna umożliwiać uzyskanie wysokich wydajności i czystości otrzymywanego związku.

NOWE PODEJŚCIE

Istotą rozwiązania jest sposób wydajnego otrzymywania nowych pochodnych kwasu pirazynokarboksylowego i ich zastosowanie jako związków **przeciwgrzybiczych i przeciwbakteryjnych**. Wzór ogólny nowych pochodnych POA przedstawia poniższy rysunek:



gdzie: R oznacza grupę alkilową, prostą lub rozgałęzioną, zawierającą od dwóch do ośmiu atomów węgla, natomiast R₁ oznacza 2-hydroksybenzyl lub

grupę 3-metylofenyloaminową.

Sposób otrzymywania pochodnych kwasu pirazynokarboksylowego opisanych wzorem polega na ogrzewaniu zakwaszonej mieszaniny kwasu pirazynokarboksylowego oraz alkoholu

ZALETY ROZWIĄZANIA

- Rozszerzenie wachlarza dostępnych substancji przeciwgrzybiczych i przeciwbakteryjnych.
- Szerokie spektrum działania nowych pochodnych POA.
- Prosty i wydajny z technologicznego punktu widzenia sposób otrzymywania pochodnych POA.

alifatycznego zawierającego od dwóch do ośmiu atomów węgla, w dowolnym stosunku, w polu mikrofalowym, w temperaturze od 80° do 180°C, przez określony czas i przy utrzymaniu odpowiedniego ciśnienia. Taka metoda syntezy zapewnia wysoką wydajność w krótkim czasie oraz umożliwia prostą izolację gotowych produktów z mieszaniny poreakcyjnej. Do nowych pochodnych kwasu otrzymanych tym sposobem należą estry kwasu 6-[(3-metylofenylo)-amino]-pirazyno-2 karboksylowego: **n-heksylowy, etylowy, butylowy, i-butyloowy oraz i-pentylowy**.

Działanie przeciwdrobnoustrojowe związków obejmuje gatunki grzybów z rodzaju *Candida m.in. C. albicans, C. tropicalis, C. krusei, C. glabrata* oraz pleśnie jak *Aspergillus fumigatus, Trichosporon asahii, Absidia corymbifera, Trichophyton mentagrophytes*, a także bakterie *Staphylococcus (gronkowiec złocisty i gronkowiec skórny), Enterococcus, Escherichia coli, Klebsiella pneumoniae (pałeczka zapalenia płuc), Pseudomonas aeruginosa (pałeczka ropy błękitnej)*.

OBSZARY ZASTOSOWANIA

- Medycyna/farmakologia – jako środki/leki przeciwgrzybicze i przeciwbakteryjne np. do odkażania ran.
- Przemysł – jako środki dezynfekujące, substancje wykorzystywane do produkcji preparatów czyszczących.

TWÓRCY

Robert Musioł, Martin Dolezal, Wioleta Cieślak

OCHRONA PATENTOWA

Prezentowane rozwiązanie zostało zgłoszone jako wynalazek w Urzędzie Patentowym RP w dniu 08.07.2011 pod nr P.395585. Aktualnie wynalazek jest chroniony patentem o nr 217165.

DANE KONTAKTOWE

Biurowo Współpracy z Gospodarką
tel. + 48 32 359 22 71, +48 32 359 20 81
e-mail: transfer@us.edu.pl
www.transfer.us.edu.pl