

Катализатор для безопасной фармацевтики | Un catalyseur pour une pharmacologie plus sûre

Author: Лейла Бабаева, [Genève - Женева](#), 01.02.2012.



Женевский профессор Петер Кундиг сделал блестящее открытие в области органической химии (unige.ch)

Группа исследователей Отделения органической химии Женевского университета открыла новый катализатор, который сможет найти свое применение в фармацевтике.

|

Un groupe de chercheurs du Département de chimie organique de l'Université de Genève a découvert un nouveau catalyseur qui représente un intérêt considérable pour l'industrie pharmaceutique.

Un catalyseur pour une pharmacologie plus sûre

Речь идет о новом катализаторе, позволяющем проводить реакции между энантиоморфными кристаллами. Особенность этих специфических органических веществ в том, что они по своему строению хиральны, не имеют симметрии относительно правой и левой стороны. Например, если отражение объекта в идеальном плоском зеркале отличается от самого объекта, то объекту присуща хиральность. В живой природе такое явление можно наблюдать, например, на панцире некоторых видов улиток.

Ввиду того, что почти все биомолекулы ассиметричны, хиральность имеет решающее значение при синтезе сложных соединений, обладающих фармакологическими свойствами. Неизвестные ранее науке свойства энантиоморфных кристаллов приводили иногда к трагическим последствиям. Например, препарат [талидомид](#) широко применялся для устранения неприятных симптомов, связанных с беременностью, таких, как бессонница, беспокойство, утренняя тошнота. Однако в период с 1956 по 1962 годы в ряде стран мира родилось, по разным подсчётам, от 8000 до 12 000 детей с врождёнными уродствами, обусловленными тем, что матери принимали препараты талидомида во время беременности. Препарат был снят с производства. Этамбутол, который успешно применяется до сих пор для лечения туберкулеза, имеет также побочный эффект из-за входящих в его состав энантиоморфных кристаллов: он может привести к слепоте. Новый катализатор, обнаруженный женеvскими специалистами, откроет новые перспективы для безопасной фармацевтики.

Органическая химия – наука увлекательная. Ее кузницу можно схематически представить как механическую мастерскую, где на основе соединений углерода специалисты изучают структуру, свойства, методы их синтеза с элементами-органогенами: водородом, кислородом, азотом и пр. Искусство химика состоит в том, чтобы разработать принципы присоединения молекул друг к другу в нужном месте и с минимальным количеством ошибок. В области органической химии изобретение каждого нового метода молекулярного синтеза встречают на ура, ведь теоретически количество возможных соединений молекул бесконечно, как песок морской и звезды небесные...

Такое открытие и совершили исследователи Отделения органической химии Женевского университета под руководством профессора Петера Кундига: Дмитрий Катаев, Масафуми Наканиши и Селин Беснар. В статье, опубликованной в журнале *Angewandte Chemie*, они наглядно продемонстрировали, каким образом внутри молекулы, которую легко синтезировать в промышленных условиях, можно разрушить связь между атомом углерода (C) и атомом водорода (H) для создания новой связи между двумя атомами углерода. В результате, ученым удалось создать новую молекулу более сложного состава: соединенный индолин.

Поскольку индолин присутствует во многих биологически активных веществах, он представляет большой интерес для фармацевтики. Особенность нового вида индолина в том, что он существует в двух практически одинаковых формах. Они на первый взгляд похожи друг на друга, но несопоставимы, как левая и правая рука. А это значит, обладают хиральными свойствами. Запускать хиральные препараты в фармацевтическое производство небезопасно. Однако Петер Кундинг и его исследовательская группа смогли добиться синтеза одной из форм соединенного

индолина, избегая попадания нежелательных «асимметричных» молекул. «Хиральность, а именно свойство асимметрии - очень важный параметр органических веществ, - пояснил профессор Кундиг. – Точно так же, как мы не можем одеть на левую руку перчатку правой руки, так и «левая» молекула не подходит для резервуара, предназначенного для «правых» молекул. Биологические структуры, из которых мы все состоим, по преимуществу хиральны, так же как и большинство молекул, присутствующих во многих медицинских препаратах. Результат применения таких медикаментов: в зависимости от употребляемого энантиомера, можно добиться кардинально противоположного терапевтического эффекта».

С изобретением нового катализатора профессора Кундига такая опасность должна, по всей видимости, отойти в прошлое. Благодаря присутствию в новом соединении минимального количества палладия обеспечивается высокая селективность процесса. Теперь она составляет 33 к 1, то есть в процессе реакции вырабатывается 1 бракованный энантиоморфный кристалл на 33 качественных. Это блестящий результат и настоящий фурор, по мнению Петера Кундига. И все же «реакция Кундига», как ее уже можно заранее окрестить, имеет один недостаток, который препятствует ее включению в промышленное производство. Химическая индустрия использует, как правило, катализаторы, способные вызвать аналогичную реакцию от 1000 до 100 000 раз подряд без необходимости их замены. Только таким образом можно получить большие количества активных веществ. А женевский катализатор выдыхается всего лишь после 20 циклов. Блестящую швейцарскую новинку еще предстоит доработать.



Отделение Органической химии Женевского университета, профессор Кундиг – в переднем ряду, четвертый слева (unige.ch)

[Женевский университет](http://unige.ch)
[швейцарская фармацевтика](http://unige.ch)