

Баньковская Е.В.

СУЛЬФАНАМИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ КАК АНТИМЕТАБОЛИТЫ ПАРА-АМИНОБЕНЗОЙНОЙ КИСЛОТЫ

Научный руководитель: канд. мед. наук, доц. Ринейская О.Н

Кафедра биоорганической химии

Белорусский государственный медицинский университет г. Минск

Сульфаниламидные препараты – это группа химически синтезированных веществ, которые используются для лечения инфекционных заболеваний. Их открытие связывают с текстильной промышленностью в процессе поиска хороших красителей для тканей. Фамилия, с которой связано открытие – Гельмо – это химик родом из Франции, который синтезировал п-аминобензол-сульфамид, который так же носит название белый стрептоцид. Но никто не мог предположить, что это вещество будет применяться в области медицины.

В 1932 году немецкий концерн «И.Г. Фарбениндустри» получили прontosил, который носит название красный стрептоцид. А через два года, венгерский ученый Г. Домагк, изучил и сделал вывод о лечебных свойствах, проводя эксперимент на мышах.

Сходство сульфаниламидных препаратов с парааминобензойной кислотой (ПАБК), которая играет важную роль в жизнедеятельности микроорганизмов, обуславливает бактериостатическое действие. ПАБК необходима для биосинтеза фолиевой кислоты в бактериальных организмах, для которых сульфаниламид токсичен. Поэтому между этими веществами существует конкуренция за ингибирование ферментативной формы дигидрофолатсинтазы, и они вызывают блокаду синтеза дигидрофолиевой кислоты (DHFA), которая необходима для синтеза нуклеиновых кислот. Когда процесс биосинтеза коферментных форм фолиевой кислоты блокируется в бактериальных организмах, возникает ингибирование их роста и размножения. Многие бактерии обладают устойчивостью к данной группе препаратов. Клиническая устойчивость грамотрицательных кишечных бактерий передается плазмидами и определяется генами, кодирующими альтернативные варианты лекарственной устойчивости ферментов DHPS. Тем не менее, сульфаниламиды по-прежнему широко используются, особенно при инфекциях мочевыводящих путей в сочетании с триметопримом, а также для лечения или профилактики паразитарных и малярийных инфекций, обычно в сочетании с триметопримом или пириметамином.

Сульфаниламиды являются важным классом антибиотических препаратов с широким спектром активности, которые очень эффективны против грамположительных и некоторых грамотрицательных бактерий. Повышенная антибактериальная активность препаратов наблюдается при замене электроноакцепторных групп такими, как нитрогруппа. Химически сульфаниламидные препараты являются амфотерными. По своей химической структуре сульфаниламиды являются производными амида сульфаниловой кислоты, имея в составе ароматическое ядро, первичную ароматическую аминогруппу и сульфаниламидную группу. Физиологическое действие веществ связано с наличием сульфанилового радикала.

Сульфаниламидные препараты имеют недостаток: плохо растворяется в воде, однако проблема решаема: введение в молекулу готового кислотного остатка или увеличением полярности N-H связи амидной группы.

Несмотря на недостатки, сульфаниламидные препараты являются широко используемыми синтетическими противомикробными препаратами.