

Тези доповідей 48-ої наукової конференції молодих дослідників ОНПУ-магістрантів "Сучасні інформаційні технології та телекомунікаційні мережі". // Одеса: ОНПУ, 2013, вип. 48.

УДК 658.5.014.1.001.76

ФЕРМЕНТАТИВНИЙ ГІДРОЛІЗ ПОХІДНИХ 1,4-БЕНЗДІАЗЕПІН-2-ОНУ

Герасимик Г.С.

Науковий керівник – проф. кафедри. «Органічні і фармацевтичні технології»,

док. біол. наук. Романовська І.І.

Відомо, що для проведення досліджень фармакологічних властивостей лікарських препаратів, які є рацематами, необхідна наявність индивідуальних препаратів S- та R-енантіомерів складних ефірів 3-гідрокси-1,4-бенздіазепін-2-ону, потенційних анксиолітичних і снодійних засобів.

Мета даного дослідження – проведення стереоселективного гідролізу рацематів складних ефірів 3-гідрокси-1,4-бенздіазепін-2-ону з отриманням оптично чистих енантіомерів для подальшого дослідження їх фармакологічних властивостей.

Раніше за допомогою виділеної МФ (вихід білка 38,0 мг/г тканини, естеразна активність (по 1-нафтілацетату) - 17,25 мкмоль/мг білка на хв) здійснений стереоселективний гідроліз ряду складних ефірів 3-гідрокси-1,4-бенздіазепін-2-ону з 50 % ступенем трансформації. В результаті були отримані S-енантіомери субстратів, встановлені їх молекулярні та кристалічні структури, кути обертання (е.и. > 97 %).

З мозку свині методом низькошвидкісної седиментації в присутності іонів Ca^{2+} виділена мікросомальна фракція, з виходом білка 36,9 мг / г тканини, естеразною активністю - 65,9 нмоль / мг білка на хв. За допомогою виділеної мікросомальної фракції мозку свині здійснений стереоселективний гідроліз. Виділений нетрансформований субстрат є сумішшю енантіomerів, збагаченої R-формою. Низька енантіомерна чистота може бути обумовлена умовами проведення процесу. Надалі планується оптимізація умов ферментативного гідролізу для отримання оптично чистого R-енантіомеру.