

ФТОРОВМІСНІ АНАЛОГИ АНЕСТЕЗИНА

ФТОРСОДЕРЖАЩИЕ АНАЛОГИ АНЕСТЕЗИНА

FLUORINE CONTAINING ANALOGS OF ANESTHESINE

Науковий керівник: старший викладач кафедри органічних і фармацевтичних технологій Гайдаржи І.І., Гайдаржи І.И., Gaidarzhy Ivan

Виконав – Орлик В.В., Орлик В.В., Orlyk Vadym

Анотація: Синтезовано аналоги анестезину, які містять групу - OC_2F_5 , шляхом трифторацетилювання естерів *para*-оксибензойної кислоти і подальшого фторування естерів *para*-трифторацетоксибензойної кислоти. Дослідження одержаних сполук проводилося на білих беспородних мишах в капсаїциновому тесті, який показав, що найбільшу активність має етиловий естер *para*-пентафторетоксибензойної кислоти.

Ключові слова: місцевий анестетик, *para*-пентафторетоксибензойна кислота, фтор, анестезин.

Аннотация: Синтезированы аналоги анестезина, содержащие группу - OC_2F_5 , путем трифторацетилирования эфиров *para*-оксибензойной кислоты и дальнейшего фторирования эфиров *para*-трифторацетоксибензойной кислоты. Исследование полученных соединений проводилось на белых беспородных мышах в капсаициновом тесте, который показал, что наибольшей активностью обладает этиловый эфир *para*-пентафторэтоксibenзойной кислоты.

Ключевые слова: местный анестетик, *para*-пентафторэтоксibenзойная кислота, фтор, анестезин.

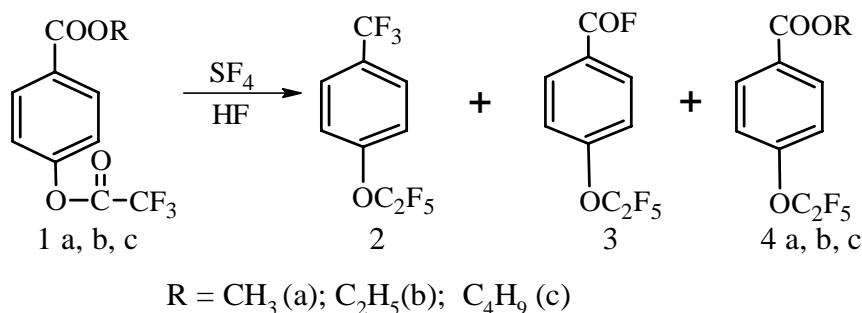
Abstract: The anesthesine analogues containing the - OC_2F_5 group, synthesized by trifluoroacetylation of *p*-alkoxybenzoates and subsequent fluoridation of the *para*-

Тези доповідей 54-ої конференції молодих дослідників ОНПУ-магістрантів "Сучасні інформаційні технології та телекомунікаційні мережі" //Одеса: ОНПУ, 2019, вип. 54

trifluoroacethoxybenzoic acids esters, were synthesized. The study of the compounds obtained was carried out on white non-breeding mice in the capsaicin test, which showed that the most active is the ethyl ester of *para*-pentafluoroethoxybenzoic acid.

Key words: local anesthetic, *para*-pentafluoroethoxybenzoic acid, fluorine, anestezin.

В роботі [1] було показано, що при фторуванні метилових естерів *para*-трифторацетоксибензойних кислот чотирифтористою сіркою в присутності фтористого водню при кімнатній температурі протягом 94 годин утворюється суміш *para*-пентафторетоксибензотрифториду (2), фторангідриду (3) і метилового естеру *para*-пентафторетоксибензойної кислоти (4). В таких умовах виходи метилового естеру *para*-пентафторетоксибензойної кислоти (4) недостатні (не більше 50%), крім того в продуктах реакції в значній кількості міститься бензотрифторид (2).



Заміна алкільного залишку в естерній групі не чинить суттєвого впливу на продукти фторування естерів *n*-пентафторетоксибензойної кислоти. Значно більший вплив мають температура та тривалість реакції, а також наявність перемішування.

Обробка продуктів фторування естерів *para*-трифторацетоксибензойної кислоти розчином гідрокарбонату натрію та подальша їх перегонка дозволяє отримати метиловий, етиловий і бутиловий естери *para*-пентафторетоксибензойної кислоти, ці сполуки є фторвмісними аналогами анестезину. Найбільш виражені анестезуючі властивості має етиловий естер *para*-пентафторетоксибензойної кислоти.

Список літератури:

1. *Гайдаржи І.І., Мотняк Л.А., Кушніченко Б.В.* Синтез пентафторетоксибензойних кислот // Вісник ОНУ. Хімія. – 2019. – Т. 24, № 1 (69), С. 53-60.
2. R. Hiltmann, F. Mietzsch, and W. Wirth, U. S. Patent 2,291,077 (1960).
3. J. W. Wilson, C. L. Zirkle, E. L. Anderson, J. J. Stehle, and G. E. Ulllyott, J. Org. Chem., 16, 792 (1951).
4. J. W. Wilson and E. L. Anderson, J. Org. Chem., 16, 800 (1951).
5. R. H. DeWolfe, J. Org. Chem., 27, 490 (1962).

Секція хімії

Підсекція органічних і фармацевтичних технологій

Орлик В.В.+38 050 510 67 52

Гайдаржи І.І. +38 096 836 35 31 14.05.2019