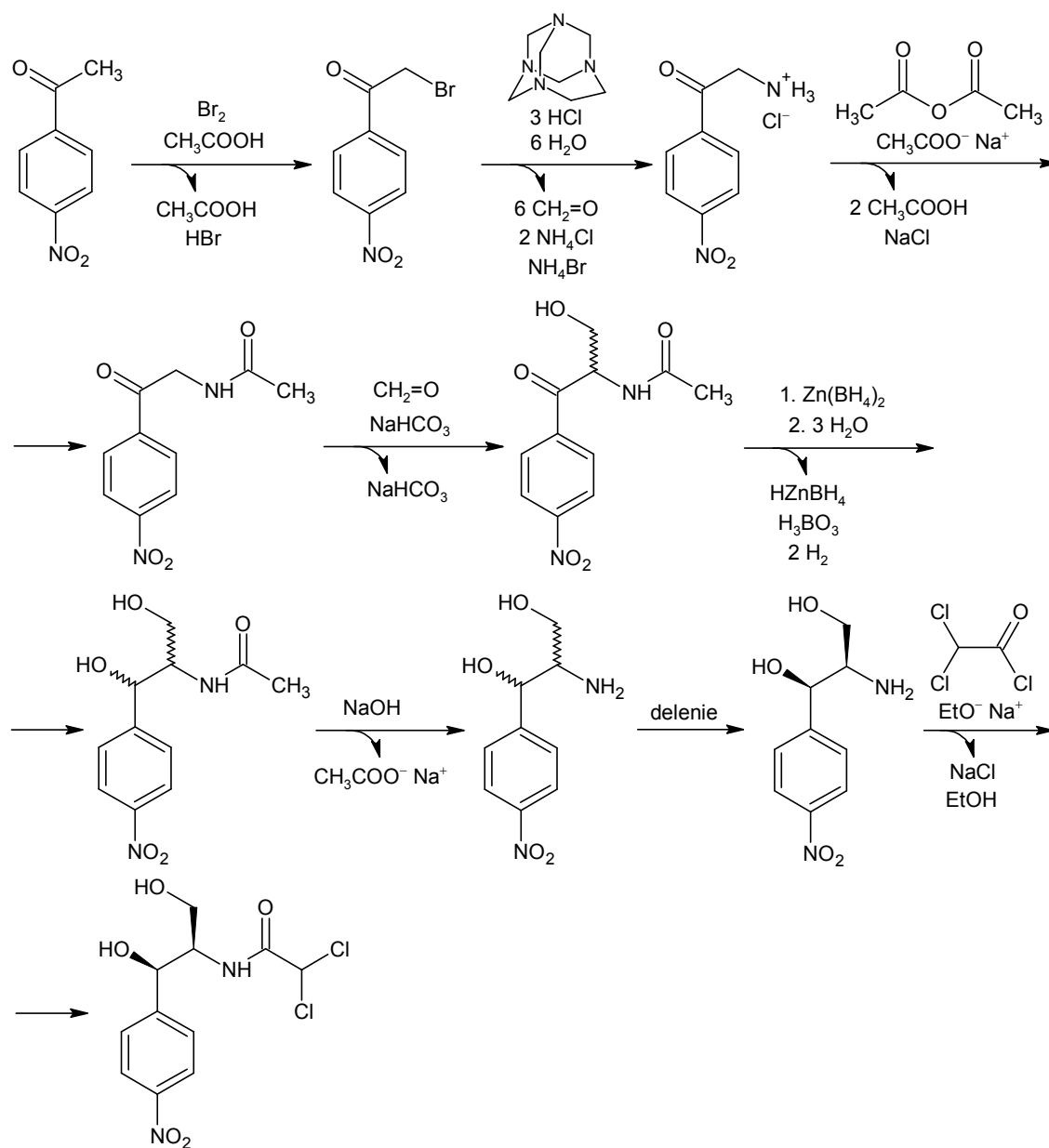


Chloramfenikol (Chloramphenicol)



Infekciu môžeme označiť ako preniknutie choroboplodných mikroorganizmov alebo cudzopasných organizmov do organizmu s ich následným množením vedúcim k vzniku infekčnej choroby. Vzniknuté infekcie však vieme potlačiť rôznymi druhmi látok, medzi ktoré patria aj antibiotiká. Antibiotiká sú definované ako látky produkované mikroorganizmami (alebo ich syntetické analógy), ktoré zasahujú do rastu iných mikroorganizmov. Jedným z najčastejšie využívaných antibiotík je dnes už výhradne synteticky pripravovaný chloramfenikol. Ten bol v minulosti izolovaný zo *Streptomyces venezuelae*. Ide o širokospektrálne antibiotikum pôsobiace proti grampozitívnym aj gramnegatívnym baktériám, ako aj proti spirochétam, rickettsiám a rôznym druhom *Salmonell*.

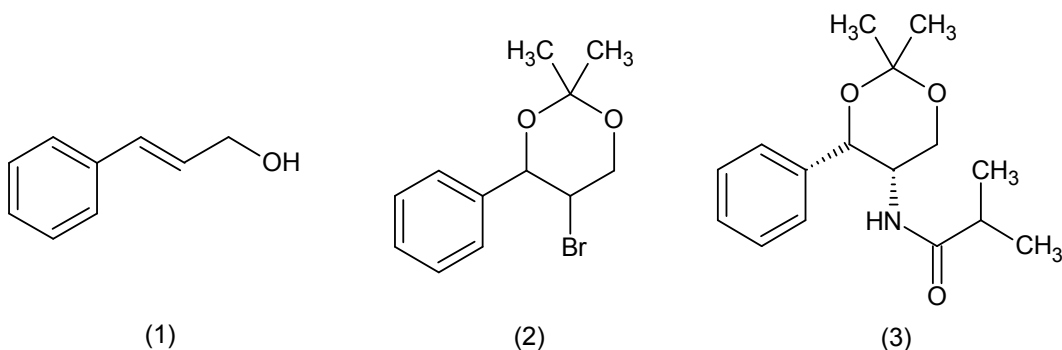
Syntéza začína bromáciou p-nitroacetofenónu a následnou reakciou s urotropínom za vzniku p-nitro- ω -aminoacetofenón hydrochlorid. Ďalším krokom je acetylácia a následná reakcia s formaldehydom za vzniku racemického acetamidohydroxyketónu. Tento sa redukuje pomocou borohydrátu zinočnatého za vzniku acetamidodiolu, ktorý po odhydrolyzovaní chrániacej skupiny prechádza racemickým delením. Výsledkom je (1R,2R)-2-amino-1-(4-nitrofenyl)propán-1,3-diol, ktorý po reakcii s chloridom kyseliny dichlóroctovej v prítomnosti bázy poskytuje chloramfenikol.

Poznámka:

Redukcia príslušného acetamidohydroxyketónu môže byť namiesto borohydrátu zinočnatého uskutočnená aj pomocou aluminium izopropoxidu ($Al(O-i-Pr)_3$).

V poslednom kroku reakcie môže byť namiesto chloridu kyseliny dichlóroctovej použitý aj jej metylester.

Chloramfenikol môže byť pripravený aj zo škoricového alkoholu (1). Ten po bromácii a reakcii s acetónom poskytuje 5-bróm-2,2-dimetyl-4-fenyl-1,3-dioxán (2), ktorý po aminácii, racemickom delení, reakcii s etylesterom kyseliny dichlóroctovej poskytuje N-[(4S,5S)-2,2-dimetyl-4-fenyl-1,3-dioxán-5-yl]-2-metylpropánamid. Konečne sa po nitrácii a po reakcii so síranom železnatým získa chloramfenikol.



Hampl F., Paleček J.: *Farmakochemie*. 1. vyd. VŠCHT, Praha, 2002, s. 186-187.
ISBN 80-7080-495-5.

Narasimhan S., Balakumar R.: *Synthetic Applications of Zinc Borohydride*.
Aldrichim Acta, 31, 1998, s. 19-26.

Kleemann A., Engel J., Kutscher B., Reichert D.: *Pharmaceutical Substances*. 4. vyd.
Thieme Medical Publishers, Stuttgart, 2001, s. 424-426. ISBN 3-13558-404-6.