**GLIKOKONIUGATY KWASÓW CHINOLINOWYCH,**

**SPOSÓB ICH OTRZYMYWANIA ORAZ ZASTOSOWANIE**

**STAN OBECNY**

Nieustającego poszukiwania nowych leków przeciwnowotworowych nie trzeba uzasadniać, szczególnie w kontekście pojawiania się niebezpiecznych odmian lekoopornych. Dotychczas stosowane chemioterapeutyki są sukcesywnie wypierane przez leki nowych generacji o niższej toksyczności i mniej uciążliwych ubocznych skutkach kuracji. Szczególnie ważna stała się ich biodostępność, która jest istotna w przypadku bardzo aktywnych związków, jakimi są leki przeciwnowotworowe. Chcąc zwiększyć potencjał terapeutyczny wprowadzono koncepcję „proleku” będącego czynnikiem poprawiającym profil farmakokinetyczny substancji oraz ich biodostępność. W związku z tym coraz powszechniejsze staje się stosowanie pochodnych chinolinowych lub glikokoniugatów. Wybór sposobu ich zastosowania zależy przede wszystkim od struktury farmaceutyku (np. nie wszystkie leki posiadają łatwo jonizowalne grupy funkcyjne, czasem są to związki obojętne) oraz sposobu podawania i mechanizmu, według którego lek jest metabolizowany.

**NOWE PODEJŚCIE DO ZASTOSOWANIA GLIKOKONIUGATÓW KWASÓW CHINOLINOWYCH**

Pochodne chinoliny są związkami często badanymi pod kątem ich potencjalnej aktywności biologicznej. Proponowane nowe pochodne chinoliny mają postać glikokoniugatów kwasów chinolinowych. Uzyskano je dzięki syntezie pochodnych chinolinowych z fragmentem tiocukrowym, połączonych poprzez łącznik aromatyczny. Takie związki mają bardzo korzystne parametry farmakokinetyczne, pozwalające na ułatwione przenikanie do wnętrza komórki. Biozgodność takich połączeń jest wysoka i zapewnia nie tylko transport międzybłonowy, ale i stosunkową łatwość w katalizowanej enzymami hydrolizie proleku do aktywnej formy.

**ZALETY ROZWIĄZANIA**

* Możliwość zastosowania w leczeniu chorób nowotworowych;
* Niewielka toksyczność;
* Możliwość zastosowania jako środka antybakteryjnego;
* Duża aktywność związku na poziomie łatwo osiągalnym w tkankach;
* Lepsze parametry fizykochemiczne związków (m.in. rozpuszczalność);
* Otrzymywanie w wyniku prostych metod syntezy.

**OBSZARY ZASTOSOWANIA**

* Przemysł farmaceutyczny,
* Medycyna.

**WSPÓŁTWÓRCY ROZWIĄZANIA**

Gabriela Pastuch-Gawełek, Maciej Serda, Robert Musioł, Anna Mrozek-Wilczkiewicz, Wioleta Kowalczyk, Alicja Ratuszna, Jarosław Polański.

**OCHRONA PATENTOWA**

Prezentowane rozwiązanie zostało zgłoszone w Urzędzie Patentowym RP w dniu 19.03.2012 r. pod nr P.398517 z wnioskiem o udzielenie patentu.