

Chemiku... *cura te ipsum*

Rozważania egzystencjalne

Trzeba się pogodzić z faktem, że na razie nauka nie jest w stanie zapewnić ludziom nieśmiertelności. Dodatkowo w naszym krótkim żywocie jesteśmy narażeni na nieprzyjemne epizody zwane chorobami. Nękały one ludzkość od zarania dziejów. Od samego początku starano się też z nimi walczyć. Korzystano nie tylko z modlitw czy zaklęć, lecz także z tego, co oferowała natura, a więc z ziół, preparatów zwierzęcych i mineralnych. Szamani, czarownice, babki, zielarze, guślarze, znachorzy etc. nie prowadzili zakrojonych na szeroką skalę badań toksykologicznych preparatów, które polecali do stosowania. Jeśli chory przeżył, to dobrze, a jeśli nie przeżył, to trudno. Metoda prób i błędów zebrała wiele ofiar, ale po tysiącach lat dała współczesnej medycynie całkiem skuteczne środki lecznicze na wiele dolegliwości. Obecnie rolę poszukiwaczy nowych leków przejęli biolodzy, botanicy, etnobotanicy i chemicy. Z jakim skutkiem?

Leki z bożej apteki...

Do bardziej znanych roślin, które zasłużyły się w medycynie i nadal są stosowane do wyrobu leków (i nie tylko) należą m.in. mak lekarski, naparstnica purpurowa, krasnodrzew pospolity (koka), drzewo chinowe czy barwinek różowy (Fot.1 i 2). Z wymienionych roślin uzyskuje się na skalę przemysłową odpowiednio **morfinę** (analgetyk), **digitoksynę** (lek nasercowy), **kokainę** (stosowaną w laryngologii i okulistyce), **chininę** (lek antymalaryczny – obecnie powoli wycofywany) oraz **winkrystynę** (lek antynowotworowy). Mimo że wszystkie wspomniane związki zostały zsyntetyzowane w laboratorium, ich przemysłowa synteza jest ekonomicznie nieopłacalna.



Fot.1. Mak lekarski



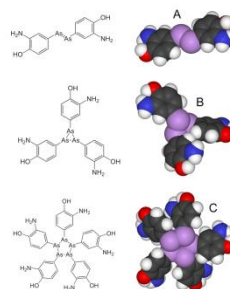
Fot.2. Barwinek różowy

Tuning natury...

Kora wierzby białej *Salix alba* od czasów starożytnych była stosowana do przygotowywania preparatów przeciwbólowych i obniżających gorączkę. W 1828 roku wyodrębniono z niej glikozyd **salicynę**, z którego później uzyskano **kwas salicylowy** o działaniu podobnym do kory wierzby. Efektem ubocznym jego stosowania było podrażnienie ścian żołądka. Te niedogodności zostały usunięte, gdy zaczęto stosować pochodną tego kwasu, a mianowicie **kwas acetylosalicylowy**. Uczynił to m.in. niemiecki chemik **Felix Hoffmann** (1868–1946), który podał ten preparat swojemu ojcu cierpiącemu na zapalenie stawów. Ojciec uczonego przeżył, bóle ustąpiły, a firma Friedrich Bayer & Co, gdzie pracował Hoffmann, pod koniec XIX wieku wprowadziła ten preparat na rynek pod nazwą **aspiryny** (Fot.3). Kwas salicylowy potrzebny do produkcji aspiryny otrzymywano z fenolu będącego m.in. produktem ubocznym suchej destylacji węgla kamiennego, z którego otrzymuje się koks. Tym sposobem aspiryna stała się lekiem otrzymywanym całkowicie w drodze syntezy chemicznej. Otworzyła się nowa era w chemii leków.



Fot.3. Aspiryna firmy Bayer



Fot.4. Struktury chemiczne (B i C) salwarsanu

Nowe pociski...

Wkrótce po aspirynie pojawiły się nowe preparaty niemające swoich odpowiedników w naturze. Jednym z większych utrapień, które dręczyły Europejczyków od końca XV wieku, był syfilis. Nie znano skutecznego środka zaradczego na to dokuczliwe schorzenie, a kuracja polegająca na wcieraniu toksycznej dla organizmu rtęci czy też wdychaniu jej par często kończyła się tragicznie dla pacjenta. Przełom nastąpił w 1909 roku, kiedy to niemiecki chemik **Paul Ehrlich** (1854–1915) po licznych próbach znalazł wreszcie skuteczne remedium na syfilis. Okazał się nim **salwarsan (Fot.4)** zawierający arsen. Uwieńczone sukcesem badania nad tym związkiem dodały impetu innym poszukiwaniom. Wkrótce zostały wynalezione nowe bardzo skuteczne preparaty bakteriobójcze. Niemiecki chemik **Gerhard Domagk** (1895–1964) podczas badania właściwości barwników zauważył, że jeden z nich, **prontosil**, zwalcza paciorkowce. Wkrótce nadarzyła się okazja do przetestowania preparatu, ponieważ córka badacza nabawiła się zakażenia bakteryjnego. Domagk zaordynował jej preparat doustnie i dziewczynka błyskawicznie wróciła do zdrowia. Sam barwnik nie jest lekiem, tylko związek chemiczny powstający na skutek jego rozpadu w ludzkim organizmie. Był to **sulfanilamid**, który dał początek erze **sulfonamidów**. Ponieważ jednak wywoływały one niekorzystne skutki uboczne, zostały jakiś czas potem zastąpione przez równie skuteczne antybiotyki, którymi były **penicyliny**. Odkrycie to ludzkość zawdzięcza szkockiemu lekarzowi **Aleksandrowi Flemingowi** (1881–1955). Pierwsze penicyliny izolowano z pleśni, a obecnie otrzymuje się je metodami biosyntetycznymi. Zarówno sulfonamidy jak i penicyliny przyczyniły się do uratowania milionów ludzi.

Na raka gazy bojowe...

W nocy z 12 na 13 lipca 1917 roku wojska niemieckie wystrzeliły w stronę aliantów 50 tysięcy pocisków artyleryjskich wypełnionych **iperytem siarkowym** – gazem bojowym o właściwościach parzących, skutkiem czego ok. 15 tysięcy żołnierzy brytyjskich zostało wyeliminowanych z działań wojennych (Fot.5). Lekarze, którzy udzielali im pierwszej pomocy zauważyli znaczne obniżenie poziomu leukocytów u porażonych żołnierzy. Stąd też powstał pomysł wykorzystania iperytu do leczenia niektórych nowotworów. Z powodu bardzo dużej toksyczności tej substancji zsyntetyzowano analogi zawierające azot zamiast siarki i wykorzystano w leczeniu ziarnicy złośliwej i niektórych rodzajów białaczek. W 1946 roku jeden z **iperytów azotowych** pod nazwą **chlormetyna** został wprowadzony do leczenia. Był to pierwszy syntetyczny lek stosowany w chemioterapii nowotworów. W 1990 roku pojawił się na rynku, **Taxol**, bardzo skuteczny lek przeciwnowotworowy uzyskany z cisa pacyficznego, *Taxus brevifolia*. Lek ten odkryto w latach 60. ubiegłego wieku. Jest stosowany w kuracji raka jądra, jajnika, sutka czy płuc. Ustalono, że należy poświęcić jedno stuletnie drzewo, aby uzyskać 300 mg taksolu – jest to jednorazowa dawka leku dla chorego na raka pacjenta... A po jednej dawce nie wraca się oczywiście do zdrowia. Stąd istniało zagrożenie że populacja cisa

pacyficznego może być zagrożona... Na szczęście opracowano metody syntetyczne pozwalające na otrzymywanie tego leku bez konieczności wycinania tych bardzo wolno rosnących drzew.



Fot.5. John Singer Sargent, *Zagazowani*, obraz z 1918 r.

A może nad morze...

Omawiane do tej pory preparaty lecznicze pochodziły z lasów, łąk, plantacji... Czy morza i oceany pokrywające 70,8% ziemskiego globu mają coś do zaoferowania? Na razie biologicznie aktywne substancje pochodzące z głębin nie stanowią poważnej konkurencji dla substancji wcześniej wymienionych, m.in. z powodu trudności w pozyskiwaniu materiału do badań. W latach 50. ubiegłego stulecia wyizolowano z gąbek, żyjących w pobliżu Karaibów, dwa nukleozydy o właściwościach antywirusowych – **spongotymidynę i spongourydynę**. Ich chemiczna modyfikacja wzmocniła te właściwości, co zaowocowało wprowadzeniem na rynek farmaceutyczny dwóch nowych leków.

W leczeniu jest używany również **Prialt**, analgetyk prawie 1000 razy silniejszy od morfiny, otrzymany z morskiego ślimaka *Conus magus*. Stosuje się go w przypadkach przewlekłego bólu (np. w terminalnych stanach nowotworowych), kiedy zawodzą inne substancje przeciwbólowe, np. morfina.

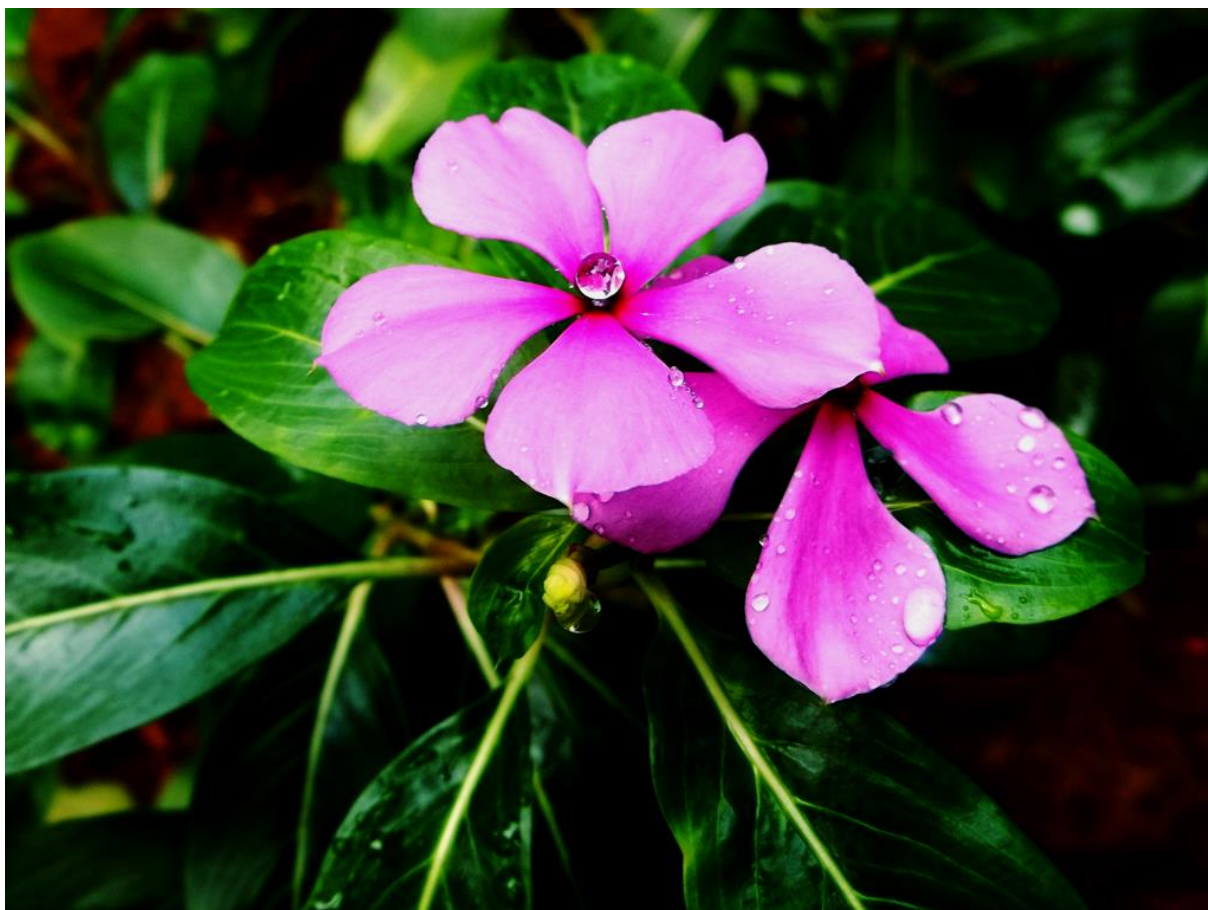
Co dalej...?

Chemicy nie ustają w poszukiwaniach nowych biologicznie aktywnych związków w naturze, a następnie przeprowadzają syntezę ich analogów. Otrzymują też coraz to nowe preparaty niemające swoich naturalnych odpowiedników. Czy wygramy wyścig z chorobami lub odpornymi na znane nam antybiotyki superbakterie... przyszłość pokaże. Z powodu degradacji środowiska naturalnego i zanikania wielu gatunków roślin i zwierząt możemy się też spóźnić z jakimś ratującym życie odkryciem. Pamiętajmy jednak, że *contra vim mortis non est medicamen in hortis*... maksyma ta dotyczy również leków całkowicie syntetycznych. Bogini Atropos czeka na każdego z nas ze swoimi nożycami i żaden chemik nic na to nie poradzi.

Fotografie:



<https://commons.wikimedia.org/wiki/File:Papaversomniferum.jpg> domena publiczna



<https://commons.wikimedia.org/wiki/File:Nithyaklalyani.jpg> domena publiczna



One Real Aspirin

Counterfeits and substitutes may be ineffective, and even harmful. Refuse them. Protect yourself by demanding

Bayer-Tablets of Aspirin

Every tablet and every package of genuine Aspirin bears

*“The Bayer
Cross*



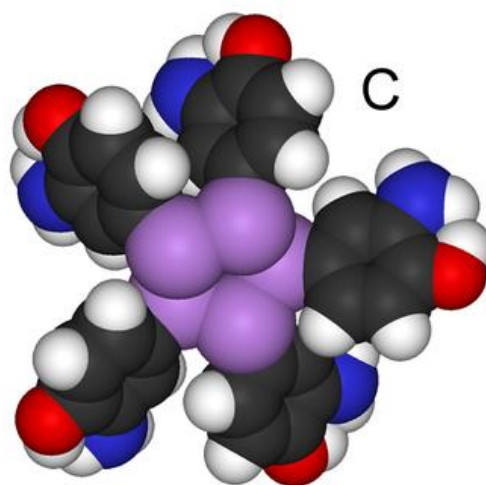
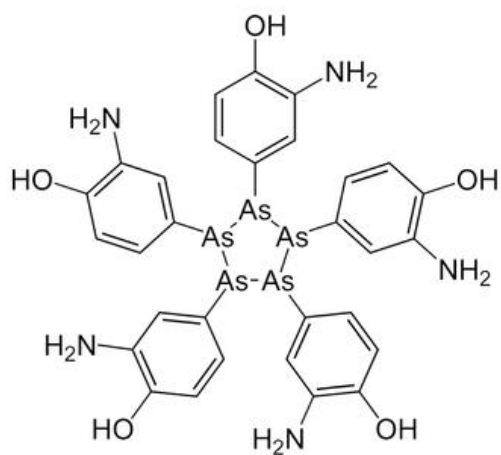
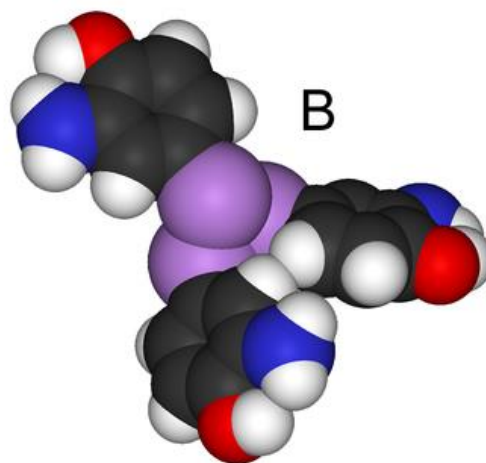
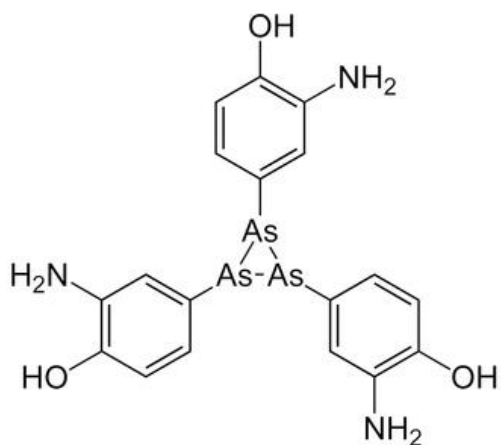
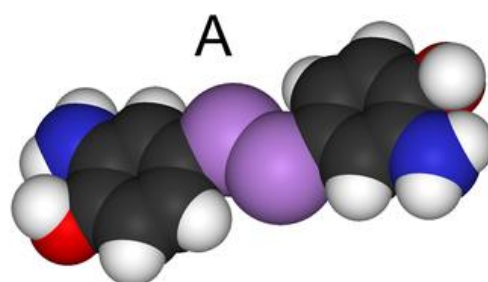
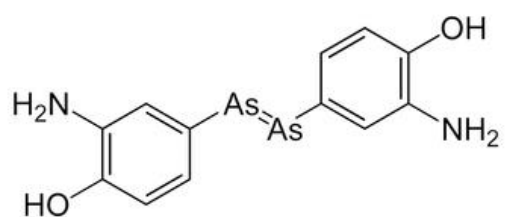
*Your Guarantee
of Purity”*

Pocket Boxes of 12, Bottles of 24 and Bottles of 100

The trade-mark "Aspirin" (Reg. U. S. Pat. Office) is a guarantee that the monoacetic acid of salicylic acid in these tablets is of the reliable Bayer manufacture.



<https://commons.wikimedia.org/wiki/File:Gassed.jpg> domena publiczna



<https://commons.wikimedia.org/wiki/File:Salvarsan-montage.png> domena publiczna