


'n Deurlopende vloeisintese van die anti-inflammatoriese COX-II-stremmer Celecoxib

**Authors:**

Chantal Scholtz¹
Darren L. Riley¹ 

Affiliations:

¹Department of Chemistry,
University of Pretoria,
South Africa

Corresponding author:

Chantal Scholtz,
Chantal.scholtz@up.ac.za

How to cite this article:

Scholtz, C. & Riley, D.L., 2017,
'n Deurlopende vloeisintese
van die anti-inflammatoriese
COX-II-stremmer Celecoxib',
*Suid-Afrikaanse Tydskrif vir
Natuurwetenskap en
Tegnologie* 36(1), a1465.
[https://doi.org/10.4102/
satnt.v36i1.1465](https://doi.org/10.4102/satnt.v36i1.1465)

Copyright:

© 2017. The Authors.
Licensee: AOSIS. This work
is licensed under the
Creative Commons
Attribution License.

A continuous flow synthesis of the anti-inflammatory COX-II inhibitor Celecoxib. Flow chemistry is a novel technology which can be used for the economical manufacturing of fine chemicals and active pharmaceutical ingredients (APIs) in an environment where economies of scale are not realised. Presented are our efforts to develop a rapid high-yielding flow synthesis of Celecoxib, an anti-inflammatory COX-II inhibitor.

Vloeïchemie is moderne tegnologie wat gebruik kan word vir die ekonomiese vervaardiging van fyn chemikalieë, veral vir aktiewe farmaseutiese middels in 'n omgewing waar die ekonomie van skaal gewoonlik nie gerealiseer word nie. Vloeïchemie word gedefinieer as die gebruik van deurlopende prop-vloei-reaktors in plaas van konvensionele reaktors (Ley & Baxendale 2002a; Baxendale & Ley 2007) vir die sintese van chemiese tussenprodukte en aktiewe farmaseutiese middels.

Vloeïchemie maak gebruik van geïmmobiliseerde reagentse, opruimers en vang-en-vrystel-tegnieke om van die probleme, wat tradisioneel geassosieer word met konvensionele lotsintese, soos bewerking, suiwering en optimisering, te oorkom. Tradisionele glasware word vervang deur patrone en kolomme wat voor gebruik met verskeie soliededraer-reagentse gepak kan word, of deur reaksiemikroskopiese en -kronkels wat die beheerbare meng van reagentse saam met uitstekende beheer van reaksietemperatuur toelaat (Baxendale et al 2006; Ley & Baxendale 2002b).

Van die voordele van vloeïchemie, in vergelyking met lotreaksies, lei tot hoër spesifisiteit, hoër opbrengs, hoër deurset teen laer reaktorvolumes, laer produksiekoste, verbeterde meng- en skaalvergroting, sowel as beter gebruik van oplosmiddels en chemikalieë, om 'n paar te noem. Vloeïchemie word wel benadeel deur duur toerusting en is slegs bruikbaar as die vorming van presipitate vermy kan word. (Ley & Baxendale 2002a; Baxendale & Ley 2007).

Ons ondersoek die gebruik van hierdie tegnologie vir die produksie van verskeie fluoorbevattende, aktiewe farmaseutiese middels met die doel om te bewys dat vloeïchemie meer toepaslik as tradisionele lotsintese is. Ons pogings tot 'n vinnige, hoë opbrengssintese van Celecoxib, 'n anti-inflammatoriese COX-II-stremmer, sowel as die vordering met die sintese van ander fluoorbevattende, aktiewe farmaseutiese middels en tussenprodukte, word aangebied.

Die vloeïroete wat ontwerp is, lewer 'n hoë opbrengs Celecoxib, met verminderde reaksietye, en die proses word as geheel in groen oplosmiddels gedoen. Toekomstige doelwitte behels die ontwikkeling van 'n vloeïproses waardeur ariëhidrasiene as ariëfluoriede verkry kan word.

Literatuurverwysings

- Baxendale, I.R., Deeley, J., Griffiths-Jones, C.M., Ley, S.V., Saaby, S. & Tranmer, G.K., 2006, 'A flow process for the multi-step synthesis of the alkaloid natural product oxomaritidine: A new paradigm for molecular assembly', *Chemical Communications* 24, 2566–2568. <https://doi.org/10.1039/b600382f>; PMID:16779479
- Baxendale I.R. & Ley S.V., 2007, 'Solid supported reagents in multi-step flow synthesis', in P. Seeberger & T. Blume (eds.) *New avenues to efficient chemical synthesis, Ernst Schering Foundation Symposium Proceedings* 3/2006, 151–185, Springer, Berlin/Heidelberg. https://doi.org/10.1007/2789_2007_033
- Ley, S.V. & Baxendale, I.R., 2002a, 'New tools and concepts for modern organic synthesis', *Nature Reviews Drug Discovery* 1(8), 573–586. <https://doi.org/10.1038/nrd871>; PMID:12402498
- Ley, S.V. & Baxendale, I.R., 2002b, 'Organic synthesis in a changing world', *The Chemical Record* 2(6), 377–388. <https://doi.org/10.1002/ctr.10033>; PMID:12469349

Read online:

Scan this QR
code with your
smart phone or
mobile device
to read online.

Note: A selection of conference proceedings: Student Symposium in Science, 27–28 October 2016, North-West University, South Africa. Organising committee: Mr Rudi Pretorius (Department of Geography, University of South Africa); Dr Hertzog Bisset (South African Nuclear Energy Corporation [NECSA]); Dr Andrew Swarts (School of Physical and Chemical Sciences, North-West University).