

СИНТЕЗ І ВИВЧЕННЯ ПРОТИМІКРОБНОЇ АКТИВНОСТІ 8-ТІОПОХІДНИХ 1-ЗАМІЩЕНИХ 7-АЛКЕНІЛ 3-МЕТИЛКСАНТИНУ

Іванченко Д.Г., Романенко М.І., Поліщук Н.М.,
Біленький С.А., Крісанова Н.В., Шепель К.С.

Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя

Сучасні антибіотики і синтетичні антимікробні препарати займають провідне місце в лікуванні бактеріальних інфекцій. Незважаючи на високу вибірковість дії, антибіотики викликають ряд побічних ефектів: алергічні реакції, суперінфекції (дисбактеріоз, ослаблення імунітету) і токсичні явища (диспепсію, флебіти, порушення функції печінки і нирок та ін.). Слід зазначити, що в останні роки значно зросла частота грибкових захворювань. Це пов'язано з різким збільшенням числа факторів ризику розвитку мікозів (активна антибіотикотерапія, проведення реанімаційних заходів, використання глюкокортикоїдних і імуносупресивних препаратів та ін.).

Виходячи з вищевказаного, розробка сучасних фармакологічних препаратів з різноманітною біологічною дією є актуальним і перспективним напрямком сучасної фармацевтичної науки.

Метою даної роботи є розробка простих лабораторних методів синтезу неописаних в літературі 8-тіопохідних 1-заміщених 7-алкеніл-3-метилксантину та вивчення їх фізико-хімічних і біологічних властивостей.

Взаємодією 1-заміщених 7-алкеніл-8-бромо-3-метилксантину з натрію сульфідом синтезовано відповідні 8-тіоксантини, нагрівання яких з галогеналканами, галогенкетонами, галогенамідами(естерами) веде до утворення відповідних 8-тіопохідних.

В ПМР-спектрах отриманих сполук форма, розташування та інтенсивність сигналів протонів залишків у положеннях 1, 3, 7, 8 повністю відповідає їх будові. Чистота синтезованих речовин контролювалась методом тонкошарової хроматографії.

Для дослідження протимікробної активності новосинтезованих речовин застосовано еталонні тест-культури грампозитивних і грамнегативних бактерій а саме: *Escherichia coli*, *Staphylococcus aureus*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Candida albicans*. Протимікробна та протигрибкова активність оцінювалась за мінімальною інгібуючою концентрацією. В якості еталонів порівняння використовували ампіцилін та ністатин. Серед отриманих сполук за показниками протимікробної активності виявлені сполуки, які не поступаються, а в деяких випадках активніші за еталони порівняння.

Встановлено певні закономірності в ряді «хімічна структура – біологічна дія». Для остаточних висновків необхідно провести додаткові дослідження. Робота в даному напрямку триває.