

ПОШУК СПОЛУК З ПРОТИМІКРОБНОЮ ДІЄЮ СЕРЕД 8-ТІОЗАМІЩЕНИХ 7-(2-ГІДРОКСИ-3-М-ЕТИЛФЕНОКСИПРОПІЛ-1)ТЕОФІЛІНУ

Іванченко Д.Г., Романенко М.І., Сінченко Д.М., Шепель К.С., Макоїд О.Б.
Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя, Україна

За останнє десятиліття проблема глобальної резистентності до протимікробних препаратів виходить на передній план. Швидкість еволюції бактерій, в ході якої формується антибіотикорезистентність, перевищила швидкість відкриття нових ліків. Це поглиблює проблему резистентності і наголошує на необхідності збереження ефективності існуючих антибіотиків. 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 із вищенаведеного, можна зробити висновок, що проблема розробки оригінальних вітчизняних препаратів протимікробної дії є перспективною та актуальною.

Метою даної роботи є розробка простих лабораторних методів синтезу неописаних в літературі 8-тіозаміщених 7-(2-гідрокси-3-м-етилфеноксипропіл-1-)теофіліну та вивчення їх фізико-хімічних і біологічних властивостей.

Реакція 8-бромо-7-(2-гідрокси-3-м-етилфеноксипропіл-1-)теофіліну з сульфідом натрію в середовищі ДМФА реалізується утворенням 8-тіопохідного, взаємодія якого з галогеналканами у водно-спиртовому середовищі веде до утворення відповідних 8-тіозаміщених. В ПМР-спектрах отриманих сполук форма, розташування та інтенсивність сигналів протонів залишків у положеннях 1, 3, 7, 8 повністю відповідає їх будові.

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.