Герасимюк І.Г., Чорна М.А., Ротар Д.В.

# ПЕРСПЕКТИВИ СИНТЕЗУ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ ПРОТИБАКТЕРІАЛЬНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ СПОЛУК КЛАСУ 4-ПІРАЗОЛВМІСНИХ 1,4-ДИГІДРОПІРИДИН-3,5-ДИКАРБОКСИЛАТІВ

Буковинський державний медичний університет, Чернівці, Україна
Кафедра мікробіології та вірусології
*(науковий керівник - к.мед.н. Ротар Д.В.)*

Актуальність роботи. Антибіотикорезистентність основних збудників інфекційних захворювань, без перебільшення, є однією з найбільших проблем сучасної медицини. Виходів із ситуації, що склалася у зв'язку зі зростаючою стійкістю збудників інфекційних захворювань до антимікробних засобів, на даний момент є лише два: інтенсифікувати розробку і впровадження нових антимікробних препаратів або знаходити методи контролю розповсюдження резистентності мікроорганізмів до препаратів, що вже існують і використовуються.

Мета дослідження. Виявлення протибактеріальної активності у нових 4 - [(3-етоксикарбоніл) - 4 - піразоліл] - 1,4 - дигідро - 3,5 - піридиндикарбоксилатів.

Матеріали та методи. Скринінг біологічних (протибактеріальних) властивостей 6 нових сполук класу 4 - піразолвмісних 1,4 - дигідропіридин - 3,5 - дикарбоксилатів, синтезованих на кафедрі фармацевтичної та медичної хімії Буковинського державного медичного університету, провели in vitro за допомогою класичного мікрометоду двократних серійних розведень з використанням одноразових полістиролових планшет та мікротитраторів Такачі. Для встановлення протибактеріальної активності використано 5 клінічних штамів бактерій S. aureus, E. coli, Ps. aeruginosa, P. vulgaris, Kl. pneumoniae.

Результати дослідження. Аналіз мікробіологічного дослідження синтезованих сполук, показав наявність у кожної з них широкого спектру антибактеріальної активності. При цьому більш висока чутливість до інгібуючої дії досліджуваних препаратів характерна для грамнегативних бактерій, особливо найчутливішим виявився клінічний штам Ps. aeruginosa, для 2а - МБсК - 62.5 мкг/мл, МБцК - 125 мкг/мл. У решти речовин МБсК та МБцК тест-культур клінічних штамів варіювали у межах від 125 мкг/мл до 500 мкг/мл. Варто відзначити, що нові сполуки проявили кращі результати щодо P. vulgaris та Kl. pneumonia, де відмічено співпадання у МБсК та МБцК у встановлених концентраціях.

Висновки. Встановлено перспективність у синтезі та нових сполук 4 - [(3-етоксикарбоніл) - 4 - піразоліл] - 1,4 - дигідро - 3,5 - піридиндикарбоксилатів, так як у представників даного класу виявлені протибактеріальні властивості.

Герасимюк І.Г., Патрабой В.В., Ротар Д.В.

# ПОШУК ПРОТИГРИБКОВИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ У 4-[(3-ЕТОКСИКАРБОНІЛ)-4-ПІРАЗОЛІЛ]-1,4-ДИГІДРО-3,5-ПІРИДИНДИКАРБОКСИЛАТІВ

Буковинський державний медичний університет, Чернівці, Україна
Кафедра мікробіології та вірусології
*(науковий керівник - к.мед.н. Ротар Д.В.)*

Актуальність роботи. Сьогодні людство переживає епідемію опортуністичних інфекцій, серед яких мікозам належить одне з провідних місць. Найстійкішими видами вважають C. albicans, C. glabrata і C. crusei, а також C. lipolytica, C. norvegensis. Одним з головних напрямків в лікуванні хворого кандидозом є вплив на етіологічний фактор. Препарат призначається при визначені чутливості до нього грибкової інфекції, як в монокультурі, так і в асоціації з іншими мікроорганізмами. В ситуації відсутності можливостей проведення мікробіологічних досліджень, препаратом вибору може слугувати системний антибіотик з широким спектром дії. Основна проблема при лікуванні низки форм кандидозів полягає в тому, що частина видів Candida відзначається стійкістю до системних протигрибкових препаратів.

Мета дослідження. Виявлення антифунгальної активності у нових 4 - [(3-етоксикарбоніл) - 4 - піразоліл] - 1,4 - дигідро - 3,5 - піридиндикарбоксилатів.

Матеріали та методи. Виявлення протигрибкових властивостей 6 досліджуваних сполук, синтезованих на кафедрі фармацевтичної та медичної хімії Буковинського державного медичного університету, провели in vitro за допомогою класичного мікрометоду двократних серійних розведень з використанням одноразових полістиролових планшет та мікротитраторів Такачі на 3 штамах дріжджеподібного гриба роду Candida (1-референтний штам C. albicans ATCC 885-653 та 2 клінічних штами цього ж виду.

Результати дослідження. Скринінг протигрибкових властивостей класу 4 - [(3-етоксикарбоніл) - 4 - піразоліл] - 1,4 - дигідро - 3,5 - піридиндикарбоксилатів показав наявність їх у сполук 2а-3в (МФсК, МФцК – 125 мкг/мл), решта сполук проявляли протигрибкову активність від 250 мкг/мл і вище відносно C. albicans ATCC 885-653. Клінічний штам C. albicans I виявився чутливим до сполук 2а, 2в, 3а (МФсК, МФцК – 62,5мкг/мл). Другий клінічний тест-штам дріжджеподібного гриба виявився більш резистентним, МФсК та МФцК коливались від 125 мкг/мл до >500 мкг/мл.

Висновки. Виявлення протифунгальної активності у нових 4 - [(3-етоксикарбоніл) - 4 - піразоліл] - 1,4 - дигідро - 3,5-піридиндикарбоксилатів визначає їх, як перспективні речовини для створення нових препаратів для боротьби із резистентними штамами C. albicans.