

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 кожній з них широкого спектру антимікробної 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. pneumoniae*, 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 визначенні чутливості до нього грибової 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 штахтах 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 – 62,5 мкг/мл). Другий клінічний тест-штам дріжджеподібного гриба виявився більш резистентним, МФсК та МФцК коївались 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 штамми *C. albicans*.