

Дослідження протимікробної активності похідних 5-метил-6-(3-арил-1,2,4-оксадіазол-5-іл)тієно[2,3-*d*]піримідин-2,4(1*H*,3*H*)-діонів методом серійних розведень

Власов С. В.<sup>1</sup>, Осолодченко Т. П.<sup>2</sup>, Власов В. С.<sup>3</sup>, Коваленко С. М.<sup>4</sup>

<sup>1</sup>Національний фармацевтичний університет, кафедра органічної хімії

(м. Харків, Україна)

sergiy.vlasov@gmail.com

<sup>2</sup>ДУ «ІМІ ім. І.І. Мечникова НАМН», лабораторія біохімії і біотехнології

(м. Харків, Україна)

<sup>3</sup>Національний фармацевтичний університет, кафедра фармакоінформатики

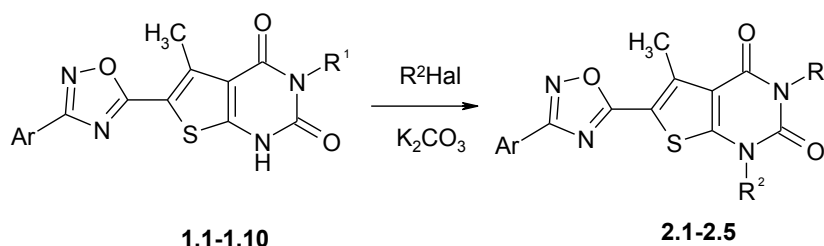
(м. Харків, Україна)

<sup>4</sup>Харківський національний університет імені В.Н. Каразіна, кафедра органічної хімії

(м. Харків, Україна)

Для синтезованих раніше в рамках експериментальних робіт Національного фармацевтичного університету похідних **1** та **2** нами було проведено попередній скринінг протимікробної активності методом дифузії в агар «колодязів». Сполуки, які містять у положенні 3 тієно[2,3-*d*]піримідинової системи фенільний радикал, а саме **1.1**, **2.1** та **2.3** виявили значну активність по відношенню до *Staphylococcus aureus* та *Bacillus subtilis* [1].

Схема



Для окремих із сполук **1** та **2** в ході попередніх досліджень встановлений потенціал протимікробної активності, і тому заплановані та проведені їх подальші дослідження методом серійних розведень. Нами було визначено мінімальні бактеріостатичні концентрації (МБ<sub>СТК</sub>), та мінімальні бактерицидні концентрації (МБ<sub>ЦК</sub>) та одержано наступні дані: **1.1** (Ar = R<sup>1</sup> = Ph) *S. aureus* ATCC 25923 МБ<sub>СТК</sub> = 250 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *E. coli* ATCC 25922 МБ<sub>СТК</sub> = 250 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *P. aeruginosa* ATCC 27853 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *P. vulgaris* ATCC 4636 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *B. subtilis* ATCC 6633 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 125 мкг/мл; *C. albicans* ATCC 653/885 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; **2.1** (Ar = R<sup>1</sup> = Ph; R<sup>2</sup> = Bn) *S. aureus* ATCC 25923 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *E. coli* ATCC 25922 МБ<sub>СТК</sub> = 250 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *P. aeruginosa* ATCC 27853 МБ<sub>СТК</sub> = 1000 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 1000 мкг/мл; *P. vulgaris* ATCC 4636 МБ<sub>СТК</sub> = 1000 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 1000 мкг/мл; *B. subtilis* ATCC 6633 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *C. albicans* ATCC 653/885 МБ<sub>СТК</sub> = 1000 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 1000 мкг/мл; **2.3** (Ar = R<sup>1</sup> = Ph; R<sup>2</sup> = *n*-FBn) *S. aureus* ATCC 25923 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *E. coli* ATCC 25922 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *P. aeruginosa* ATCC 27853 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *P. vulgaris* ATCC 4636 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл; *B. subtilis* ATCC 6633 МБ<sub>СТК</sub> = 125 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 250 мкг/мл; *C. albicans* ATCC 653/885 МБ<sub>СТК</sub> = 500 мкг/мл, МБ<sub>ЦК</sub> = 500 мкг/мл.

#### Література

1. С. В. Власов, С. М. Коваленко, А. І. Федосов, В. П. Черних // Журнал органічної та фармацевтичної хімії. – 2011. – Т. 9, №3(35). – С. 51-55.