ИЗУЧЕНИЕ АНТИМИКРОБНОЙ АКТИВНОСТИ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ХИНАЗОЛИН-4(3Н)-ОНА В ОТНОШЕНИИ ГРАМОТРИЦАТЕЛЬНЫХ И ГРАМПОЛОЖИТЕЛЬНЫХ ПАТОГЕННЫХ МИКРООРГАНИЗМОВ

**А.А. Старикова¹, Н.М. Габитова^{1,3}, Д.В. Мережкина², А.А. Озеров²,
М.А. Смотров¹, И.Н. Тюренков²**

¹ФГБОУ ВО «Астраханский государственный медицинский университет» Министерства здравоохранения Российской Федерации
414000, Россия, г. Астрахань, ул. Бакинская, 121.

²ФГБОУ ВО «Волгоградский государственный медицинский университет»
Министерства здравоохранения Российской Федерации
400131, Россия, г. Волгоград, Павших Борцов пл., 1.

³Федеральное государственное бюджетное учреждение «Научно-исследовательский институт по изучению лепры» Министерства здравоохранения Российской Федерации
414057, Россия, г. Астрахань, проезд Николая Островского, 3.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-109

E-mail: alhimik.83@mail.ru

Проблема поиска веществ, проявляющих противомикробную активность и не вызывающих резистентность у патогена, является актуальной и требует незамедлительного решения. Производные хиназолин-4(3Н)-она, как соединения с уникальным химическим строением, проявляющие широкий спектр фармакологической активности, могут быть рекомендованы в качестве противомикробных агентов, оказывающих действие как в отношении грамположительных, так и грамотрицательных бактерий.

Рис. 1. Общая формула производных хиназолин-4(3Н)-она

В результате первичного микробиологического скрининга установлено, что вещество, содержащее амидную группу, связанную с ядром хиназолинона и бензойным кольцом, проявляет выраженную бактериостатическую активность в отношении *S. aureus*, *E. coli* и *K. Pneumoniae*, и способно оказывать бактерицидное действие на *P. mirabilis*. Демонстрируется чувствительность *S. pneumoniae*, *E. coli* и *K. Pneumoniae* к производному хиназолин-4(3Н)-она, содержащему нафтильный радикал. Учитывая способность хиназолиноновых соединений ингибировать синтез ДНК за счет расщепления бактериальной ДНК-гиразы и топоизомеразы, можно предполагать, что азотсодержащий электронодонорный заместитель участвует в образовании водородной связи с активным сайтом фермента. Присутствие нафтильного радикала в молекуле способствует увеличению степени липофильности вещества, вследствие чего повышается адсорбция соединения клеткой за счет возникновения прочных гидрофобных взаимодействий.