ДИЗАЙН АНТИБАКТЕРИАЛЬНЫХ И БАКТЕРИЦИДНЫХ СРЕДСТВ НА ОСНОВЕ МАКРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ

О.С. Терентьева, П.Л. Падня, Ю.Г. Штырлин, И.И. Стойков

Казанский (Приволжский) Федеральный Университет, Казань, Россия
420008, Россия, г. Казань, ул. Кремлёвская, 18.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-340

E-mail: olga-potrekeeva@mail.ru

Поиск новых антибактериальных и антисептических препаратов является актуальной задачей в связи с устойчивостью микроорганизмов к существующим лекарствам. Медицинская химия макроциклических соединений в последние годы активно развивается. Уникальные свойства тиакаликсарена (конформационная подвижность и дополнительные координационные центры) позволяют легко получать стереоизомеры с различным расположением функциональных групп в пространстве, что перспективно для создания новых биологически активных соединений.

В рамках этой работы с высокими выходами были синтезированы тетразамещенные четвертичные аммониевые соли на основе *p*-*трет*-бутилтиакаликс[4]арена. Полученные соединения обладают высоким антибактериальным действием в отношении грамположительных (*S. aureus*, *S. epidermidis*, *B. subtilis*) бактерий, сравнимым с известными антисептиками хлоргексидином, мирамистином и бензалкония хлоридом. Установлено, что четвертичные аммониевые производные тиакаликс[4]арена в конформации 1,3-*альтернат* эффективнее подавляют рост исследуемых бактериальных штаммов, чем соединения в конформации *конус*. Исследования цитотоксичности на клетках фибробластов кожи человека (HSF) выявили, что все соединения менее токсичны по сравнению с контрольными препаратами. Полученные результаты открывают возможность создания новых эффективных антибактериальных и антисептических препаратов на основе макроциклических соединений.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда
(No. 19-73-10134).