ПОИСК ПРОТИВОГРИБКОВОЙ АКТИВНОСТИ В РЯДУ 1-ЗАМЕЩЁННЫХ 4,4,4-ТРИГАЛОГЕНБУТАН-1,3-ДИОНОВ

Н.Ю. Лисовенко, Е.П. Козлова, С.Ю. Баландина

Кафедра фармакологии и фармации химического факультета
Пермского государственного национального исследовательского университета,
614990, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-495

E-mail: lisovn@mail.ru

Человечество постоянно сталкивается с новыми инфекционными заболеваниями. Поэтому поиск и разработка высокоэффективных противомикробных лекарственных препаратов является одной из современных задач, стоящих перед учёными. Недавно нами было показано, что 1-замещённые 4,4,4-трихлорбутан-1,3-дионы, обладают высокой противогрибковой активностью [1-3]. В продолжение работы в поисках эффективных противомикробных агентов мы расширили ряд исследуемых соединений, данные по противогрибковой активности которых представлены в таблице 1.

1a-h

Табл. 1

Результаты исследований противогрибковой активности соединений 1a-h

№	R	Hal	<i>Aspergillus</i> , МФК	<i>Penicillium</i>	<i>Trichoderma</i>
			Минимальная фунгистатическая концентрация		
1a	C ₆ H ₅	Cl	31,2	7,8	31,2
1b	4-MeOC ₆ H ₄	Cl	31,2	31,2	125,0
1c	4-NO ₂ C ₆ H ₄	Cl	62,5	62,5	62,5
1d	2-thienyl	Cl	15,6	15,6	62,5
1e	C ₆ H ₅	F	250,0	250,0	250,0
1f	4-MeOC ₆ H ₄	F	62,5	62,5	62,5
1g	4-NO ₂ C ₆ H ₄	F	125,0	250,0	125,0
1h	2-thienyl	F	125,0	62,5	125,0

Примечание: конечная концентрация клеток микромицетов в опыте составила $2,5 \times 10^4$ клеток/мл.

Из полученных результатов следует, что соединения **1a-d**, содержащие CCl₃-группу, обладают более выраженной фунгистатической активностью, ингибируют рост микромицетов в диапазоне концентраций 7,8 – 125,0 мкг/мл, тогда как соединения **1e-h**, содержащие CF₃-группу, подавляют рост клеток в концентрации 62,5 - 250,0 мкг/мл.

Относительная простота получения 1-замещённых-4,4,4-тригалогенбутан-1,3-дионов, их выраженная противогрибковая активность позволяет предположить, что соединения этого класса являются перспективными для дальнейшего углубленного изучения с целью создания новых противомикробных препаратов.

Литература

- [1] Лисовенко Н.Ю., Чемадунов Д.Г., Баландина С.Ю., Махмудов Р.Р. Хим.-фарм. журнал. 2017. 51(3). 29-30.
- [2] Баландина С.Ю., Максимов А.Ю., Лисовенко Н.Ю., Шилова А.В. Биофарм. журнал. 2019. 11(6). 62-66.
- [3] Патент RU 2 690 009 C1.