НОВЫЕ АНТИБАКТЕРИАЛЬНЫЕ КАТИОННЫЕ АМФИФИЛЫ

С.М. Филатова, В.О. Овсянников, У.А. Буданова, Ю.Л. Себякин

МИРЭА – Российский технологический университет,
119571, Россия, г. Москва, пр.Вернадского, 86.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-508

E-mail: c-221@yandex.ru

Перспективным классом новых антибактериальных агентов являются катионные пептидомиметики, обладающие значительной антимикробной активностью по сравнению с известными антибиотиками [1]. Резистентность бактерий к таким молекулам возникает значительно медленнее, чем к традиционным антибиотикам, так как мишенью их действия является бактериальная мембрана [2]. На основании литературных данных для синтеза были выбраны соединения с величиной гидрофильно-липофильного баланса (ГЛБ) в диапазоне 4–6 [3].

Разработанная схема синтеза позволяет получать соединения с заданным набором свойств благодаря тонкой настройке структуры пептидомиметиков на основе диэтаноламина в гидрофобном блоке и остатков L-лизина, L-орнитина, глицина, L-аланина, L-фенилаланина в полярном блоке. Сложноэфирные связи в гидрофобной области и спейсерная амидная связь должны увеличивать биодоступность и снижать цитотоксичность молекулы по отношению к клеткам млекопитающих.

Конечные соединения получены в количествах, достаточных для проведения микробиологических исследований. По результатам предварительных тестов амфилилы проявляют активность против *S. subtilis* и *E. coli* в диапазоне МИК 1–100 мкг/мл.

Работа поддержана Российским Фондом Фундаментальных исследований, грант РФФИ № 20-04-00672

Литература

1. Zhang, E., Bai, P.-Y., Cui, D.-Y., Chu, W.-C., Hua, Y.-G., Liu, Q., and Liu, H.-M., European Journal of Medicinal Chemistry. 2018, 143, 1489–1509.
2. K. Matsuzaki, Biochim. Biophys. Acta. 1999, 1462, 1–10.
3. Filatova, S. M., Denieva, Z. G., Budanova, U. A. and Sebyakin, Y. L., Moscow University Chemistry Bulletin. 2020, 75(6), 320–327.