

Степин С.Г.¹, Ржеусский С.Э.¹, Слабин В.К.², Милевская К.В.¹

**Синтез и исследование антимикробной активности гидрохлорида
1-диэтиламино-3-фенилпропина-2**

¹УО «Витебский государственный ордена Дружбы народов медицинский университет», Витебск, Республика Беларусь

²Университет Орегона, Юджин, США

Ацетиленовые соединения проявляют более выраженную физиологическую активность, меньшую токсичность и легче усваиваются организмом, чем их олефиновые или насыщенные аналоги. Производные

диацетилена и природные полиины обладают высокой антимикробной, фунгицидной и инсектицидной активностью и являются перспективными противоопухолевыми средствами. Среди синтетических производных диацетилена отмечена также противовирусная, антиаритмическая, спазмолитическая, холинолитическая, гипотензивная, сосудорасширяющая и другие виды активности [1]. Ацетиленовые амины проявляют высокую бактерицидную активность [2,3], в некоторых случаях, превосходящую по активности тетрациклин и ампилокс [3].

Цель настоящей работы заключается в синтезе и исследовании бактерицидной и антимикотической активности потенциального лекарственного средства - гидрохлорида 1-диэтиламино-3-фенилпропина-2.

Материалы и методы исследования. ИК-спектры записывали на ИК-Фурье спектрометре фирмы Thermo Scientific Nicolet iS 10 в таблетках калия бромида 1-Диэтиламино-3-фенилпропин-2 синтезирован взаимодействием фенилацетилена с изобутилдиэтиламинометиловым эфиром в присутствии каталитических количеств хлорида меди (I). Гидрохлорид 1-диэтиламино-1-фенилпропина-2 получен пропусканием хлористого водорода в эфирный раствор амина.

Испытания антимикробной активности проводили методом двукратных последовательных разведений, с последующим высеванием на агар.

Результаты и обсуждение. Известны методики синтеза ацетиленовых аминов при помощи реакции Манниха и взаимодействием концевых ацетиленов с *гем*-диаминами [4]. Изобутилдиэтиламинометиловый эфир и другие аминокетали легко синтезируются взаимодействием изобутилового спирта, параформа и вторичных аминов без использования в качестве катализаторов солей самария, которые необходимы в методике [4]. Синтезированное вещество представляет собой белые кристаллы легко растворимые в воде. Т. пл. 134-135°C.

Установлено, что исследуемое вещество в диапазоне концентраций 0,125-0,063% останавливает рост грамотрицательных микроорганизмов *P. Aeruginosa*, *K. Pneumoniae*, *Echerichia coli*. Минимальной бактерицидной активностью по отношению к исследуемым микроорганизмам обладает раствор вещества с концентрацией 0,250%.

Определено, что гидрохлорид 1-диэтиламино-3-фенилпропина-2 обладает противогрибковой активностью. В концентрации 0,125% его раствор обладает как фунгиостатической, так и фунгицидной активностью.

Показано, что в исследуемых концентрациях гидрохлорид ацетиленового амина не обладает антимикробной активностью против грамположительных микроорганизмов.

Заключение. Синтезировано потенциальное лекарственное средство - гидрохлорид 1-диэтиламино-3-фенилпропина-2. Установлена бактерицидная активность в отношении грамотрицательных бактерий и противогрибковая активность.

Литература

1. Шостаковский, М.Ф. Химия диацетилена/ М.Ф. Шостаковский, А.В. Богданова. – М., «Наука», 1971. – 524 с.
2. Синтез, строение и биологические свойства 1-(2-этоксиэтил)-4-(3-феноксипропан-2-ил)-4-[(2-метилпиридил-5-этил)пиперидина]/ К. Канитар [и др.]// Химический журнал Казахстана. – 2013. – № 3. – С. 25-32.
3. Sheat, M.A. Synthesis and Study of Acetylenic Amines Derivatives Containing Sulfonamido, β -Naphthoxy and Hippurate Groups/ M.A. Sheat, Z.F. Saeed // National Journal of Chemistry. – 2006. – V - 21. – P. 53-62.
4. Синтез пропаргиламинов аминометилированием ацетиленов гем-диаминами/ М.Г. Шайбакова [и др.]// ЖОрХ. – 2010. – Т.46. - № 1. – С. 25-32.