

Ржеусский С.Э.¹, Степин С.Г.¹, Дикусар Е.А.², Манькова Ю.С.¹

Синтез и исследование антимикробной и противовирусной активности иодметилата 4-бензоилпиридина

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

²ГНУ «Институт физико-органической химии НАН Беларуси», Минск, Республика Беларусь

Производные пиридина проявляют: противомикробную, антибактериальную, анальгетическую, антипаркинсоническую, противосудорожную, противоопухолевую, цитотоксическую, противомаларийную,

противодиабетическую и другие виды биологической активности. Лекарственные средства, содержащие пиридиновый фрагмент используют для лечения туберкулеза, ишемического инсульта, болезни Альцгеймера, паралича Белла, болезни Хантингтона, мигрени, множественных склерозов и болезни Паркинсона [1]. Доступным исходным для синтеза лекарственных средств является 4-бензоилпиридин, производные которого проявляют противосудорожное и противоэпилептическое действие [2].

Цель настоящей работы заключалась в синтезе и исследовании бактерицидной, противогрибковой и антивирусной активности потенциального лекарственного средства иодметилата 4-бензоилпиридина.

Материалы и методы исследования. ИК-спектры записывали на ИК-Фурье спектрометре фирмы Thermo Scientific Nicolet iS 10 в таблетках калия бромида. Иодметилат 4-бензоилпиридина синтезирован кипячением эквимольных количеств 4-бензоилпиридина с иодметаном в растворе этанола.

Антивирусную активность изучали на монослойных культурах первичных клеток эмбрионов кур и на пассивируемых кожно-мышечных клетках эмбриона человека. Определению количественных характеристик противовирусного эффекта предшествовало нахождение максимально переносимой концентрации (МПК) для тканевых культур.

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

Результаты и обсуждение. Иодметилат 4-бензоилпиридина образуется практически с количественным выходом и представляет собой желтые кристаллы с т. пл. 181-182°C, хорошо растворимые в воде.

Иодметилат 4-бензоидпиридина проявил антивирусную активность против РНК- и ДНК-содержащих вирусов: герпес простой 1 типа (+), Венесуэльский энцефаломиелит лошадей (+), бешенство (++), осповакцина (++), рота (+++), энтеровирус ЕСНО 6 (+++). МПК 200 мкг/мл. Препарат оказался неактивен к вирусам гриппа и парагриппа.

Установлено, что исследуемое вещество обладает антимикробной активностью по отношению к *Staphilococcus aureus* и *Echerichia coli*. Показано, что минимальная подавляющая концентрация для этих микроорганизмов составляет 0,25%. Минимальную бактерицидную концентрацию установить не удалось, поскольку если она есть, то превышает рабочую концентрацию раствора 1%.

Определено, что исследуемое вещество не обладает антимикотической активностью.

Заключение. Взаимодействием 4-бензоилпиридина с иодметаном синтезирован иодметилат 4-бензоилпиридина. Исследована его анти-микробная, противогрибковая и противовирусная активность. Установлено, что иодметилат 4-бензоилпиридина проявляет бактерицидную и противовирусную активность, является потенциальным лекарственным средством и доступным предшественником для синтеза новых потенциальных лекарственных средств.

Литература

1. Лукевич, Э. Производные пиридина в арсенале лекарственных средств (обзор) / Э. Лукевиц // Хим. гетероцикл. соед. – 1995. – № 6. – С. 723–734.
2. Синтез и противосудорожная активность производных оксимов 3- и 4- бензоилпиридинов / Л.А. Жмуренко [и др.] // Хим.-фарм. журн. – 2018. – Т. 52. - № 1. – С. 19 – 28.