

## **БАКТЕРИОЛОГИЯ**

### ПОИСК НОВЫХ ТУБЕРКУЛОСТАТИКОВ В РЯДУ ПОЛИФТОРСОДЕРЖАЩИХ СОЕДИНЕНИЙ

Бургарт Я.В.<sup>1</sup>, Худина О.Г.<sup>1</sup>, Щегольков Е.В.<sup>1</sup>, Кудрякова Ю.С.<sup>1</sup>, Щербаков К.В.<sup>1</sup>,  
Кравченко М.А.<sup>2</sup>, Салоутин В.И.<sup>1</sup>, Чупахин О.Н.<sup>1</sup>

<sup>1</sup>ФГБУН «Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского Уральского  
отделения Российской академии наук», Екатеринбург, Россия

<sup>2</sup>ФГБУ «Уральский научно-исследовательский институт  
фтизиопульмонологии»МЗ РФ, Екатеринбург, Россия

**Актуальность.** Туберкулез продолжает оставаться одной из наиболее распространенных и опасных инфекций в мире. Одним из приоритетных направлений борьбы с туберкулезом является расширение программ химиотерапии, включающих разработку новых эффективных и безопасных противотуберкулезных препаратов.

**Цель:** поиск новых туберкулостатиков в ряду полифторсодержащих соединений. Фармацевтическая перспективность препаратов, содержащих атом фтора, обусловлена их отличительным поведением в биохимических процессах.

**Материалы.** Исследованию противотуберкулезной активности была подвержена значительная выборка фторсодержащих соединений различных классов. Скрининг был проведен в ряду полифторалкилзамещенных открыто-цепных производных 1,3-дикарбонильных соединений и их гетероциклических производных (пиразолов, бензодиазепинов, азолоазинов), а также салициловых кислот, хромонов и кумаринов, содержащих атомы фтора в ароматическом ядре.

**Результаты.** Противотуберкулезное действие изучено в опытах *in vitro* в отношении лабораторного штамма микобактерий туберкулеза H<sub>37</sub>Rv. Для наиболее активных соединений дополнительно изучена активность по отношению к штаммам *M. avium*, *M. terrae* и МЛУ. В качестве препарата сравнения использован изониазид. В результате скрининга выявлены группы наиболее активных соединений. В докладе обсуждаются методы синтеза исследуемых соединений и зависимость «структура – свойство». Поиск туберкулостатиков в ряду 2-гидроксиимино-содержащих гетероциклов был наиболее успешным, поскольку найдены бензодиазепиноны с туберкулостатической активностью на уровне изониазида и с меньшей токсичностью.

**Заключение.** Результаты исследования свидетельствуют о перспективности поиска новых высокоэффективных туберкулостатиков в ряду фторзамещенных соединений. Работа выполнена при поддержке РНФ (грант №16-13-10255)

Ответственный за переписку: Бургарт Янина Валерьевна, burgart@ios.uran.ru