

# ПОИСК ПЕРСПЕКТИВНЫХ АНТИБАКТЕРИАЛЬНЫХ АГЕНТОВ В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ 2-(1*H*-ИНДОЛ-3-ИЛ)ХИНАЗОЛИН-4(3*H*)-ОНОВ

Е.В. Градова, Л.Ю. Нестерова, А.Г. Ткаченко, М.Г. Учускин, Е.Ю. Мендограло  
Пермский государственный национальный исследовательский университет,  
614068, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15.  
E-mail: ElizavetaGradova@psu.ru

Одна из значимых проблем медицины – устойчивость бактерий к антибиотикам. Формирование бактериальных биопленок оказывает существенное влияние на чувствительность возбудителей некоторых инфекций к антибиотикам<sup>1</sup>. Бактерии в составе биопленки в сотни раз более устойчивы к антибиотикам, что может приводить к рецидиву заболевания. Одним из привлекательных подходов к борьбе с инфекционными заболеваниями является ингибирование образования биопленок.

В докладе обсуждены аспекты синтеза производных 2-(1*H*-индол-3-ил)хиназолин-4(3*H*)-онов **1**. Проведена оценка антибактериальной активности синтезированных соединений в отношении *Staphylococcus aureus* ATCC 25923, в том числе изучена способность наиболее активного синтезированного соединения 2-(5-йод-1*H*-индол-3-ил)хиназолин-4(3*H*)-она (**1a**) предотвращать образование биопленок. Соединение **1a** в сублетальных концентрациях способно предотвращать появление биопленок стафилококков, не влияя на количество клеток в культуре (рис. 1б). Напротив, контрольный антибиотик амикацин уменьшает образование микробной биопленки за счет летального действия на планктонные клетки (рис. 1а).

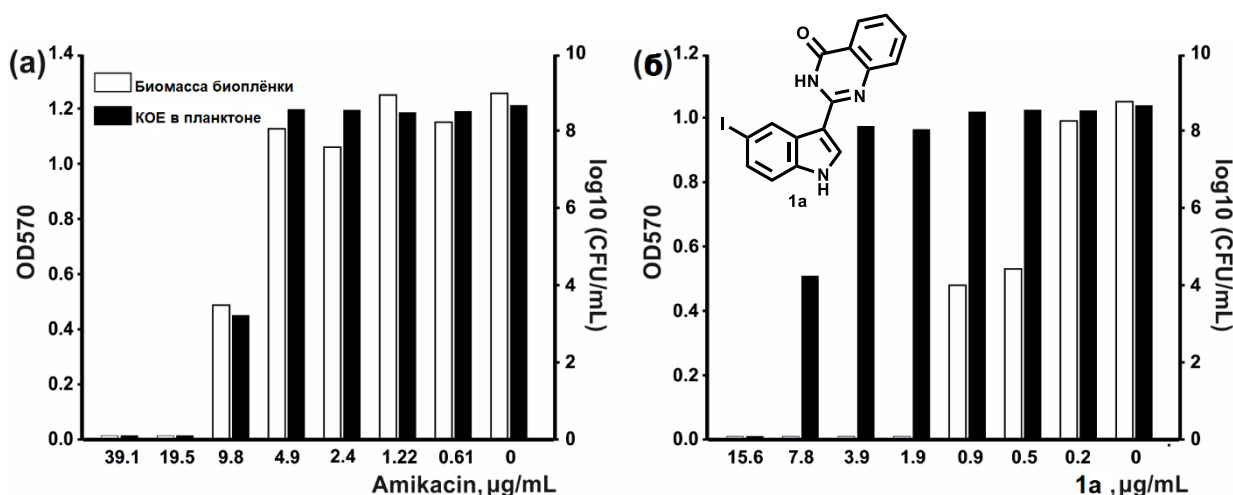


Рис. 1. Влияние сублетальных концентраций амикацина (**а**) и 2-(5-йод-1*H*-индол-3-ил)хиназолин-4(3*H*)-она (**1a**) (**б**) на биомассу биопленки *S. aureus* ATCC 25923 (OD570) и количество колониеобразующих единиц (КОЕ) в планктоне. На диаграммах показаны средние значения трех (**а**) и четырех (**б**) экспериментов.

## Библиографический список

1. Zeiler M.J. Second-Generation Meridianin Analogues Inhibit the Formation of *Mycobacterium smegmatis* Biofilms and Sensitize Polymyxin-Resistant Gram-Negative Bacteria to Colistin / Zeiler M.J., R.J. Melander, C. Melander // ChemMedChem. – 2020. – Vol. 15, Iss. 17. – P. 1672-1679.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (проект № 22-23-00503, <https://rscf.ru/project/22-23-00503/>).