**Функционализация вторичных аминов как способ модификации пиллар[5]арена фармакофорными фрагментами**

***Пергат А. В., Александрова Ю. И., Шурпик Д.Н.,* *Зеленихин П.В., Стойков И. И.***

*Студент, 4 курс бакалавриата*

*Казанский (Приволжский) федеральный университет,*

*химический институт им. А.М. Бутлерова, Казань, Россия*

*E-mail:* [*pergatarina@yandex.ru*](mailto:pergatarina@yandex.ru)

Растущее число инфекций, вызываемых золотистым стафилококком *S. aureus* и кишечной палочкой *E. Coli* с множественной лекарственной устойчивостью, показали, что на сегодняшний день важной задачей является выявление и разработка альтернативного способа введения антибактериальных средств, механизм устойчивости бактерий к которым отличается от механизма устойчивости к традиционным формам введения антибиотиков.

Пилларарены – новый тип макроциклов, открытый в 2008 году Т. Огоши и др., с повторяющимся гидрохиноновыми звеньями, соединенными метиленовыми мостиками в *пара*-положениях. Они привлекли внимание благодаря их применению в качестве основных строительных блоков при изготовлении многофункциональных и биоактивных материалов.

Для подбора оптимальных условий и влияния заместителей в платформе пиллар[5]арена на антибактериальные свойства мы предварительно получили производные следующих гетероциклов: морфолина, пиперидина, пирролидина. Далее эти прекурсоры были введены в реакцию с декабромэтоксипиллар[5]ареном с получением целевых макроциклов с хорошими выходами. Дополнительно были получены новые водорастворимые деказамещенные производные пиллар[5]арена, содержащие аммониевые, алкильные, ацильные, арильные и стрептоцидные фрагменты. Для этого в пиллар[5]арен был введен тиахолиновый фрагмент.

Структура всех полученных макроциклов была подтверждена современными физическими и физико-химическими методами исследования: ЯМР 1H, 13C, ИК спектроскопией, MALDI и ESI масс-спектрометрией и тонкослойной хроматографией. Способность к самосборке и агрегации установлена методом ДРС.

После синтеза и определения структурных характеристик катионных производных пиллар[5]арена была систематически исследована их антибактериальная активность по отношению к ряду биопленок патогенных микроорганизмов при помощи колориметрического MIC-теста. Было показано, что синтезированный макроцикл, содержащий стрептоцидный фрагмент, обладает высокой активностью в ингибировании грамположительных и грамотрицательных бактерий, при этом не проявляя генотоксичности в тесте Эймса. Это катионное производное пиллар[5]арена может быть использовано в качестве кандидата для борьбы с лекарственно-устойчивыми бактериальными инфекциями.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта РНФ №22-73-10166.