

УДК 547.782

АНТИМИКРОБНАЯ АКТИВНОСТЬ 3-м-ХЛОРМЕТИЛФЕНИЛ-1,2-ЭПОКСИПРОПАНА

Э.М.Кулиев, И.А.Гусейнов

Институт полимерных материалов Национальной АН Азербайджана
AZ 5004 Сумгайыт, ул С. Вургуна, 124; e-mail: ipoma@science.az

Синтезирован 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропан взаимодействием хлористого бензила с эпихлоргидрином в гептане в присутствии безводного хлористого алюминия. Установлено, что синтезированное соединение является биологически активным веществом и проявляет более выраженную активность, чем нитрофунгин, хлорамин, фенол, риванол, применяющиеся в практике, и может найти применение в медицине в качестве антимикробного, фунгицидного препарата.

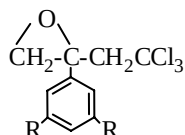
Ключевые слова: антимикробная активность, фунгицид, биологически активное вещество.

Известно, что галоидзамещенные сложные эфиры ароматического ряда формулы



где, R – метил, хлорметил, бутил, обладают гербицидной активностью [1].

Из класса галоидсодержащих ароматических оксиранов известны соединения общей формулы



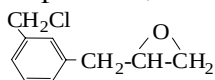
где, R – бром, хлор или C₁-C₃ – алкил, обладающие гербицидными свойствами [2].

В литературе известен также ряд галогенсодержащих соединений, обладающих антимикробной активностью [3-4].

Аналогами по применению являются нитрофунгин и хлорамин, обладающие антимикробной активностью [5].

Целью данной работы является расширение ассортимента средств воздействия на микроорганизмы и грибы.

Поставленная цель достигается свойствами нового соединения 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропана формулы



, обладающего анти-микробной активностью.

3-м-Хлорметилфенил-1,2-эпоксипропан получают известной реакцией алкилирования по Фриделю-Крафтсу [6] и последующим дегидрохлорированием в щелочной среде продукта конденсации.

Структура полученного соединения подтверждена данными ИК-спектроскопии, физико-химическими постоянными и элементным составом.

Пример. Синтез 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропана.

К охлажденной до 0°C смеси, состоящей из 100 мл гептана, 20 г (0.15 моль) хлористого бензила и 6 г безводного хлористого алюминия, в течение 2 ч., добавляют 5 г (0.05 моль) эпихлоргидрина. Содержимое колбы перемешивают при комнатной температуре еще 1-2 ч., затем разлагают подкислением водным раствором HCl. Верхний слой отделяют и сушат Na₂SO₄. После отгонки растворителя продукт подвергают вакуумной разгонке и собирают фракцию (6 г) с т. кип. 139-141°C/5 мм, n_D^{20} 1.5210, d_4^{20} 1.1825, которая соответствует дихлоргидрину 3-м-хлорметилфенил-1-хлорпропан-2-олу с выходом 40% (от теории). Затем дихлоргидрин обрабатывают едким калием в среде сухого серного эфира в течение 3 ч. После соответствующей обработки и разгонки собирают 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропан с т. кип. 93-94°C/1.5 мм,

n_D^{20} 1.4922, d_4^{20} 1.2254; $MR_{\text{Днайд.}}$ 48.53, $MR_{\text{Двыч.}}$ 49.08. Выход 90% от теории.
Найдено, %: С 65.16; Н 6.25; Cl 20.01; $C_{10}H_{11}OCl$.
Вычислено, %: С 65.76; Н 6.00; Cl 19.45.

Чистота по ГЖХ составляет 99.8%. Состав и структура синтезированного соединения определена методом ИК-спектроскопии. Было установлено, что интенсивность полос поглощения 800-850 см^{-1} соответствует валентным колебаниям

связи С-Cl. Кроме того, в спектре присутствует полоса в области 3050 см^{-1} (эпоксидная группа), а также полоса поглощения 2850-3040 см^{-1} соответствующая арильной группе.

Антимикробную активность 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропана изучали дисковым методом и методом серийного разведения в жидкой и твердой питательной среде на спектре из нескольких штаммов микроорганизмов (см. табл. 1, 2).

Табл. 1. Антимикробное действие 1%-ного 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропана в отношении различных микроорганизмов с применением дискового метода

Тест культура									
№	Название препарата	Стафилакокк золотистый 209-р	Кишечная палочка 675	Серрация шт. 2	Мусовас Б-5	Палочка антропоноса 1312	Микроспорон	Кандида албиканс	Аспергиллус нигер
Диаметр зоны задержки роста, мм									
Опыт									
1.	3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропан	24	20	24	18	31	52	62	40
Контроль									
1.	Спирт 96°C	10	12	13	8	7	12	10	7
2.	Нитрофунгин	10	8	10	8	10	18	10	15
3.	Хлорамин	8	9	9	8	7	8	10	8
4.	Формалин	9	10	10	11	7	10	10	7

Результаты исследования показывают, что антимикробное действие нового соединения в 2-6 раза превышает антимикробное действие спирта, хлорамина и формалина и 2-3 раза – нитрофунгина, а

минимальные бактериостатические или микростатические концентрации данного соединения в 2-16 раза меньше, чем нитрофунгина и хлорамина.

Табл. 2. Сравнительная антимикробная активность 3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропана с нитрофунгином и хлорамином

№	Штамм микроорганизмов	Минимальные бактериостатические или микростатические концентрации, в мг/мл		
		опыт		контроль
		3-м-хлорметилфенил-1,2-эпоксипропан	нитрофунгин	хлорамин
1.	Стафилакокк золотистый 209-р	100	200	Более 200
2.	Стрептококк гемолитический 295	100	200	200
3.	Кишечная палочка	25	Более 200	200

4.	Синегнойная палочка	100	Более 200	200
5.	Палочка антракоида 1312	25	200	Более 200
6.	Микробактериум Б-5	100	200	25
7.	Кандида албиканс	6.25	50.0	200
8.	Аспергиллус нигер	12.5	100	200
9.	Эпидермофитон Кауфман-Вольф	12.5	100	200
10.	Трихофитон	6.25	100	200

Следовательно, новое соединение благодаря структурным особенностям по сравнению с широко применяемыми в практике антимикробными препаратами – спиртом, хлорамином, нитрофунгином, формалином и т. д. обладает значительно

более эффективными антимикробными действиями против различных микроорганизмов и грибов при малых бактериостатических и микростатических концентрациях.

ЛИТЕРАТУРА

1. А. с. СССР № 504756, КЛ СО 7 С 69/90. 1974.
2. Патент ФРГ № 2519073, КЛ СО 7 С 33/08. 1977.
3. Гаджилы Р.А., Гахраманов Р.Ф., Караев З.О. и др. Синтез и противомикробная активность 2-алкил-1-[2'-хлор(диэтиламино, морфолино)-метилкарбонил этокси] пирролов // Хим. Фармацевт. журн. 2010. № 8. С. 28-30.
4. Дикусар Е.А., Поткин В.И., Козлов Н.Г. и др. Синтез и изучение фунгицидной активности аминовых солей глицирризиновой кислоты. // Химия растительного сырья. 2011. № 4. С. 53-56.
5. Мельников Н.Н. Химия и технология пестицидов. М.:Химия. 1979. С. 436.
6. Химический энциклопедический словарь. 1983. С. 635.

3-m-XLORMETİLFENİL-1,2-EPOKSİPROPANIN ANTİMİKROB AKTİVLİYİ

E.M.Quliyev, İ.Ə.Hüseynov

Susuz xlorlu alüminiumun iştirakı ilə xlorlu benzilin epixlorhidrinlə heptan həlledicisində qarşılıqlı təsirindən 3-m-xlormetilfenil 1.2-epoksipropan sintez edilmişdir. Müəyyən olunmuşdur ki, sintez olunmuş birləşmə bioloji aktivliyə malikdir və onun aktivliyi nitrofunqin, xloramin, fenol, rivanolla müqayisədə daha yüksəkdir və tibbdə antimikrob, funqisid preparat kimi istifadə oluna bilər.

Açar sözlər: antimikrob aktivlik, funqisid, bioloji aktiv maddə.

ANTIMICROBIAL ACTIVITY OF 3-m-CHLORMETHYLPHENYL-1,2-EPOXYPROPANE

E.M.Kuliyev, I.A.Huseynov

3-m-chlormethylphenyl-1,2-epoxypropane has been synthesized through the interaction of benzyl chloride with epichlorohydrin in heptane in the presence of anhydrous aluminum chloride. It revealed that the synthesized compound is a biologically active substance and shows more expressed activity than nitrofungin, chloramine, phenol and rivanol which are used in practice, and that this compound may be applied in the medicine as antimicrobial, fungicide preparation.

Keywords: antimicrobial activity, fungicide, biologically-active substance.

Поступила в редакцию 26.04.2013.

