

Invenția se referă la compușii organici din șirul terpenic, în particular la homodrimanii ce posedă activitate antimicotică.

Din această serie de preparate cel mai apropiat analog al compusului revendicat după proprietățile biologice este clotrimazolul [1]. Însă acest preparat are un șir de dezavantaje, ce constau în:

- eficiența redusă a preparatului;
- reacțiile alergice și iritație în locul aplicării;
- tulburări gastrointestinale, urinare;
- în sistarea tratamentului de lungă durată pot apărea exacerbări ale leziunilor.

Din aceste considerente, cu scopul de a proteja sănătatea populației, este necesar de a continua cercetările științifice în domeniul elaborării remediilor antifungice originale din materie primă locală cu activitate mai înaltă și toxicitate mai joasă, și totodată mai ieftine decât preparatele importate, adică accesibile pentru populație, ce constituie o problemă de importanță primordială pentru Republica Moldova. De o importanță separată este și faptul că materia primă de bază este locală, renovabilă și ușor accesibilă (deșeurile din industria uleiurilor eterice).

Problema pe care o rezolvă invenția este lărgirea gamei de compuși cu activitate antimicotică înaltă.

Esența invenției constă în aceea că 12-hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanul poate fi utilizat în tratamentul afecțiunilor micotice.

Avantajul invenției în raport cu preparatele cunoscute:

1. Eficiența mai înaltă a preparatului în raport cu cele existente;
2. Accesibilitatea produsului.

Procedeele de obținere a 12-hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanului este descris în brevetul de invenție MD 2639 G2 2004.12.31, iar proprietățile antimicotice ale produsului anterior nu au fost descrise.

Experiența a fost efectuată în paralel utilizând diferiți solvenți:

I experiment - dimetilformamidă (DMFA);

II experiment- alcool etilic.

În calitate de culturi de referință în experimentul in vitro au fost folosite tulpinile microbiene: Candida albicans, Aspergillus niger, Aspergillus fumigatus, Penicilium. În cazul Candida albicans au fost utilizate diferite tulpini:

I experiment - Candida albicans-1 (tulpina de la bolnav);

II experiment - Candida albicans-2 și 3 (tulpini de colecție).

În I experiment activitatea preparatului a fost comparată cu cea a nistatinei, în experiment II cu a clotrimazolului.

Exemplu de realizare a invenției. Activitatea fungicidă a 12-hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanului a fost cercetată prin utilizarea metodei de diluție în serie în mediu nutritiv lichid (Sabouraud, PH=7). 12-hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanului a fost dizolvat în alcool etilic. Inoculatele au fost pregătite din culturi de șapte zile de fungi Candida albicans, Aspergillus niger, Aspergillus fumigatus, Penicilium. După amestecarea inoculatele cu diluțiile 12-hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanului eprubetele erau expuse în termostat la t=28°C pentru 11 zile, zilnic însemnând creșterea fungilor.

Activitatea fungicidă a fost determinată după lipsa creșterii fungilor la o însămânțare repetată a fungilor pe geloza Sabouraud cu incubare timp de 11 zile la 28°C.

Reieșind din rezultatele obținute putem conchide că preparatul manifestă activitate antimicotică pronunțată față de tulpinile Candida albicans:

a) I experiment - concentrația minimală de inhibiție (CMI) și concentrația minimală fungicidă (CMF) constituie 15,62 mcg/ml, ce depășește activitate antifungicidă a nistatinei de 5,1 ori (concentrația minimală de inhibiție și concentrația minimală fungicidă a nistatinei față de Candida albicans constituie 80 mcg/ml).

Tabela 1

Tulpinile microbiene	12-Hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanul (conform [2])		Nistatină	
	CMI (mcg/ml)	CMF (mcg/ml)	CMI (mcg/ml)	CMF (mcg/ml)
Candida albicans – 1	15,62	15,62	80	80
Aspergillus niger	250	250		
Aspergillus fumigatu	250	250		
Penicilium	125	125		

b) II experiment - concentrația minimală de inhibiție (CMI) și concentrația minimală fungicidă (CMF) constituie 2,5 mcg/ml, ce depășește activitate antifungicidă a clotrimazolului de 2 ori (concentrația minimală de inhibiție și concentrația minimală fungicidă a clotrimazolului față de Candida albicans constituie 5 mcg/ml).

Tabela 2

Tulpinile microbiene	12-Hidroperoxi-8 α , 12-epoxi-11-bishomodrimanul (conform [2])		clotrimazolul	
	CMI (mcg/ml)	CMF (mcg/ml)	CMI (mcg/ml)	CMF (mcg/ml)
Candida albicans – 2	2,5	2,5	5	5
Candida albicans – 3	2,5	2,5	5	5

Proprietățile depistate prezintă interes din punct de vedere a lărgirii și/sau completării arsenalului de preparate antimicotice cu spectru larg de acțiune.

Preparatul obținut posedă proprietăți antimicotice pronunțate, este relativ ieftin, deoarece se obține ușor din materie primă locală accesibilă și poate fi utilizat pe larg în farmaceutică.