

Sintesis dan uji aktivitas biologi senyawa analog antibiotika UK-3 (2-Hidroksinikotinil-Heksil-Serin-Ester dan turunannya)

Sherley, author

Deskripsi Lengkap: <https://lib.ui.ac.id/detail?id=77658&lokasi=lokal>

Abstrak

Senyawa antibiotika memegang peranan penting di dalam pengobatan berbagai macam penyakit infeksi baik yang disebabkan oleh mikroba maupun yang disebabkan oleh virus. Senyawa - antibiotika UK-3 telah diisolasi dari miselium *Streptomyces*-sp. 517-02 -dan diketahui mempunyai aktivitas dalam menghambat pertumbuhan bakteri dan sel kanker. Total sintesis senyawa UK-3 dan analognya juga telah dilakukan. Penelitian ini bertujuan untuk mensintesis senyawa Analog UK-3 (SH-1, SH-3) yang diharapkan mempunyai aktivitas yang lebih besar dari senyawa aslinya.

Metode sintesis yang digunakan adalah melalui tiga tahap reaksi. Tahap pertama adalah reaksi esterifikasi L-serin dan heksanol dengan katalis asam p-TsOH dalam benzen. Selanjutnya pada tahap kedua adalah pembentukan 2-hidroksinikotinil-heksil-serin-ester antara asam 2-hidroksinikotinat dan heksilserin-ester-p-TsOH dengan katalis/aktivator DMAP/DCC dalam piridin. Reaksi terakhir adalah esterifikasi senyawa 2-hidroksinikotinil-serin-heksil-ester dengan anhidrida asetat dalam piridin menghasilkan SH-1, dengan asam fenil propanoat dan oktanoat dengan DMAP/DCC dalam diklorometan masing-masing menghasilkan SH-2 dan SH-3.

Senyawa hasil sintesis diidentifikasi dengan menggunakan spektrofotometer Infra Merah (FT-IR), spektrometer Resonansi Magnetik-Inti (¹H-NMR), spektrofotometer, Ultra Violet dan -spektrometer- Massa (MS). Pengujian aktivitas senyawa analog UK-3 dilakukan dengan uji antimikroba-terhadap beberapa mikroba dan uji toksisitas terhadap Brine Shrimp. Senyawa SH-3 aktif menghambat pertumbuhan terhadap bakteri *Escherichia coli* dan *Candida albicans* sampai konsentrasi 75 ppm, sedang SH-2 menunjukkan aktivitas paling tinggi terhadap uji Brine Shrimp dengan nilai LC50 pada konsentrasi 700,22 ppm.

<hr>

The Synthesis And Biological Activity Test Of Antibiotic UK-3 Analogues (2-idroxy nicotinyl-Hexyl-Serine-Ester-And Its Derivatives)

Antibiotic compounds play important role in medical treatment of various infection diseases either caused by microbes or viruses. The Antibiotic UK-3 has been isolated from mycelium *Streptomyces* sp. 517-02 and found that its activity inhibits the growth of bacteria and cancer cells. Total synthesis of UK-3 and its analogues have been conducted as well. The goal of this research is to synthesize various analogues of UK-3 (SH-1, SH-2, SH-3) which is hoped to have higher activities than that of the original compound.

The synthesis method consist of three reaction steps. The first step is esterification reaction of -L-serine and hexanol with catalyst p-TsOH in -benzene. The -second -step is the formation of -2-hydroxynicotinyl-hexyl-serine-ester between 2-hydroxynicotinyl acid and hexyl-serine-ester with catalyst/aktivator DMAP/DCC in

pyridine. The last reaction is esterification of 2-hydroxynicotinyl-serine-ester-compound and acetic-anhydride in pyridine - which form SH-1. If phenyl propionic acid or octanoic acid was used in the presence of DCCIDMAP in dichloromethane, the product formed was SH-2 and SH-3. The product of each step was identified and characterized by means of Infrared spectrophotometer (FTIR), ¹H-NMR spectrometer, UV spectrophotometer and Mass spectrometer. The activity of SH-1, SH-2 and SH-3 as antimicrobes tested against several microorganisms and their toxicity was tested against Brine Shrimp. SH-3 was found active against *E. coli* and *C. albicans* up to the concentrations of 75 ppm, while SH-2 indicated the highest activity on Brine Shrimp test with the value of LC₅₀ in the concentrations of 700,22 ppm.