

Синтез и противомикробная активность α -бензилиденгидразидов p -фууроил-5-йодантраниловой кислоты

Газизова Асия Фаниловна, Курбатов Евгений Раисович

Пермская государственная фармацевтическая академия, Пермь

Научный(-е) руководитель(-и) – доктор фармацевтических наук, профессор

Коркодинова Любовь Михайловна, Пермская государственная фармацевтическая академия, Пермь

Введение

Антраниловая кислота и ее производные обладают широким спектром фармакологического действия (противовоспалительное, анальгетическое, противомикробное и т.д.) и являются основой для синтеза высокоэффективных и малотоксичных соединений. Таким образом, поиск новых соединений с различными видами активности среди замещенных гидразидов N -ацил-5-йодантраниловой кислоты является актуальным.

Цель исследования

Синтез новых биологически активных соединений в ряду R -бензилиденгидразидов N -фууроил-5-йодантраниловой кислоты.

Материалы и методы

Внутримолекулярной циклизацией N -фууроил-5-йодантраниловой кислоты в пропионовом ангидриде получен 2-фууроил-6-йод-3,1-бензоксазин-4-он. Перемешиванием его в среде этанола с гидразингидратом в течение 1 ч при 18-20 °С синтезирован гидразид N -фууроил-5-йодантраниловой кислоты, конденсацией которого с бензальдегидом, 4-диметиламинобензальдегидом, 2,4-диметоксибензальдегидом, 2-гидрокси-4-нитробензальдегидом, 2-гидроксиафтбензальдегидом, 4-диэтиламинобензальдегидом получены R -бензилиденгидразиды.

Результаты

Синтезированные соединения являются кристаллическими или аморфными веществами белого или белого с желтоватым, зеленоватым или розоватым оттенком цвета, нерастворимыми в воде, этаноле, растворимыми в органических растворителях (ДМСО, ДМФА). Строение подтверждено данными ЯМР 1H - и ИК- спектроскопии. Изучена противомикробная активность соединений методом серийных разведений в жидкой среде по отношению к эталонным штаммам золотистого стафилококка (*St. aureus*) и кишечной палочки (*E. coli*).

Выводы

Установлено, что вещества оказывают противомикробное действие в концентрации 1000 мкг/мл.