

СИНТЕЗ 4-АРИЛФЕНИЛГИДРАЗИНИЛИДЕНИЗОКСАЗОЛ-5-ОНОВ С ПРОТИВОМИКРОБНОЙ АКТИВНОСТЬЮ

Леонова В.А.^(1,2), Елькина Н.А.⁽¹⁾, Щегольков Е.В.⁽¹⁾, Бургарт Я.В.⁽¹⁾,
Герасимова Н.А.⁽³⁾, Евстигнеева Н.П.⁽³⁾, Салоутин В.И.⁽¹⁾

⁽¹⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

⁽²⁾ Уральский федеральный университет

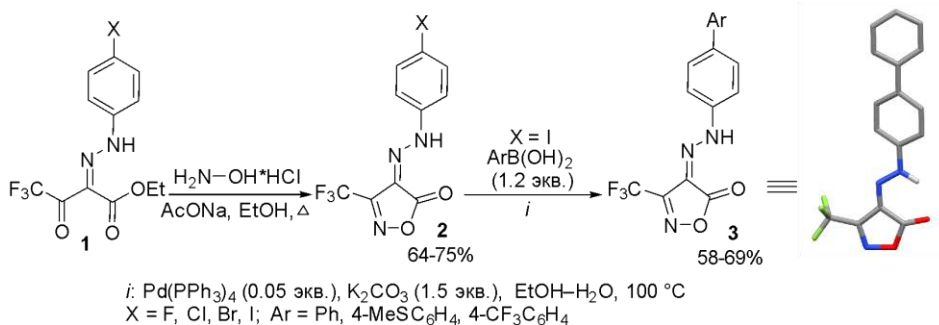
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽³⁾ Уральский НИИ дерматовенерологии и иммунопатологии

620076, Екатеринбург, ул. Щербакова, д. 8

Глобальные проблемы антибиотикорезистентности к возбудителям бактериальных инфекций определяют необходимость поиска новых антимикробных веществ. В докладе обсуждается возможность использования 4-арилгидразинилиденизоксазол-5-онов для создания антибактериальных агентов, поскольку недавно в их ряду нами найдены производные, способные ингибировать рост патогенных бактерий при МИК 0.78 мкг/мл [1].

На данном этапе хемоселективной циклизации 2-арилгидразинилиден-3-трифторметил-3-оксоэфиров **1** с гидроксиламином синтезированы новые галогенсодержащие 4-арилгидразинилиденизоксазол-5-оны **2**. Далее 4-иодфенилгидразинилиденизоксазол-5-оны **3** были введены в реакции кросс-сочетания Сузуки с арилбороновыми кислотами под действием $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ в присутствии K_2CO_3 , в результате чего получены 4-[арилфенилгидразинилиден]изоксазол-5-оны **3**. Биологическое тестирование показало, что синтезированные соединения обладают антимикотической активностью в отношении штаммов *M. canis*, *T. rubrum*, *E. floccosum* с МИК 0.78 мкг/мл. Кроме того, выявлена антибактериальная активность в отношении штамма *N. gonorrhoeae* ATCC 49226/NCTC 12700 с МИК 3.9 мкг/мл и клинического изолята *N. gonorrhoeae* с МИК 3.9–7.8 мкг/мл.



1. Elkina N.A., Shchegolkov E.V., Burgart Y.V., et al. // Journal of Fluorine Chemistry. 2022. Vol. 254. 109935.

Работа выполнена в рамках государственного задания (тема № 124020500023-9).