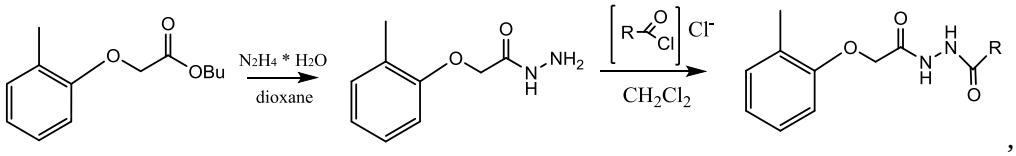
СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ СМЕШАННЫХ ДИАЦИЛГИДРАЗИНОВ 2-(О-ТОЛИЛОКСИ)УКСУСНОЙ КИСЛОТЫ С НИКОТИНОВОЙ И ИЗОНИКОТИНОВОЙ КИСЛОТАМИ

Харламов В.А.[(1)], *Кудрявцева Т.Н.*[(1)], *Климова Л.Г.*[(2)]
[(1)] Курский государственный университет
305000, г. Курск, ул. Радищева, д. 33
[(2)] Курский государственный медицинский университет
305041, г. Курск, ул. К. Маркса, д. 3

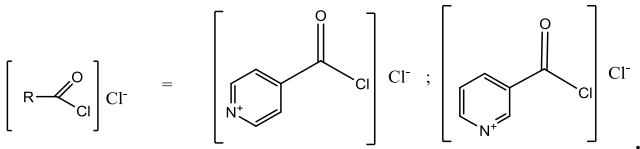
Производные 2-(о-толилокси)уксусной (о-крезоксиуксусной) кислоты хорошо зарекомендовали себя как в качестве биологически активных соединений, поэтому синтез новых соединений данного ряда представляет практический интерес.

Нами были получены диацилгидразиды, содержащие структурные фрагменты о-крезоксиуксусной кислоты и никотиновой (изоникотиновой) кислоты взаимодействием гидразида о-крезоксиуксусной кислоты с хлорангидридом никотиновой (изоникотиновой) кислоты.

Гидразид о-крезоксиуксусной кислоты получали кипячением ее бутилового эфира с трёхкратным избытком гидразина гидрата в среде диоксана. Хлорангидриды никотиновой и изоникотиновой кислот получали в виде гидрохлоридов кипячением указанных кислот в пятикратном избытке тионилхлорида.



,

где 

.

К раствору гидразида о-толиоксиуксусной кислоты в метиленхлориде небольшими порциями прибавляли гидрохлорид хлорангидрида никотиновой или изоникотиновой кислоты. Растворитель отгоняли и к остатку прибавляли раствор карбоната натрия. Полученный осадок фильтровали и сушили. Получили выход целевого продукта 70% от теоретического.

Для полученных соединений был осуществлён прогноз биологической активности с помощью программного ресурса PASS Online. Установлено что синтезированные смешанные диацилгидразины с высокой вероятностью могут обладать антимикобактериальной и противотуберкулёзной активностью.

Исследование антибактериальной активности полученных соединений in vitro показало наличие незначительной антибактериальной активности по отношению к исследованным штаммам.