

**ABSTRACT** V této rigorózní práci byly řešeny tři problémy. a) Syntéza a antimykobakteriální aktivity nových halogenovaných salicylanilidů substituovaných v poloze 4' rozvětveným alkylem. b) Syntéza a antimykobakteriální aktivita nových halogenovaných 3-(4-alkylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4-(3H)-dionů. c) Vliv záměny oxo skupiny za thioxo skupinu v předchozí skupině látek.

a) Bylo syntetizováno 8 halogenovaných derivátů 4'-alkylsalicylanilidů s rozvětveným alkylovým řetězcem. Tyto látky byly hodnoceny *in vitro* na antimykobakteriální aktivitu vůči *Mycobacterium tuberculosis*, *Mycobacterium kansasii* a *Mycobacterium avium*.

b) Dále bylo syntetizováno 7 nových halogenovaných derivátů benzoxazindionů s rozvětveným řetězcem reakcí salicylanilidu s metylchlorformiátem. Antimykobakteriální aktivita syntetizovaných látek byla hodnocena vůči třem rozdílným kmenům mykobakterií. Nejúčinnější látkou této série byl 7-chlor-3-(4-*sek*-butylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4-(3H)-dion.

c) Dále byly syntetizovány látky 7-chlor-3-(4-isopropylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on, 6-brom-3-(4-isopropylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on, 6-brom-3-(4-*sek*-butylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on, 6-chlor-3-(4-*sek*-butylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on, 7-chlor-3-(4-isopropylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4(3H)-dithion, 6-brom-3-(4-*sek*-butylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4(3H)-dithion, 6-brom-3-(4-isopropylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4(3H)-dithion, 6-chlor-3-(4-*sek*-butylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4(3H)-dithion. Tyto látky byly hodnoceny *in vitro* na antimykobakteriální aktivitu proti *M. tuberculosis*, *M. kansasii* (dvěma kmenům) a *M. avium*. 6-Brom-3-(4-isopropylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on a 6-brom-3-(4-*sek*-butylfenyl)-4-thioxo-2H-1,3-benzoxazin-2(3H)-on vykazovaly největší aktivitu proti *M. tuberculosis* ze všech studovaných skupin. Jako srovnávací látka byl zvolen INH. Náhrada oxo skupiny za thioxo skupinu v pozici 4 u 3-(4-alkylfenyl)-1,3-benzoxazin-2,4(3H)-dionů vedlo ke zvýšení antimykobakteriální aktivity proti *M. tuberculosis*.