

ABSTRAKT

Syntéza hydroxyderivátů 3-fenyl-2*H*-1,3-benzoxazin-2,4(3*H*)-dionu

Jitka Musilová

Tato diplomová práce se zabývá přípravou 16 cyklických analogů hydroxysalicylanilidů, t.j. 3-fenyl-2*H*-1,3-benzoxazin-2,4(3*H*)-dionů monosubstituovaných na heterocyklickém jádře hydroxylovou skupinou.

Čtyři série výchozích hydroxysalicylanilidů byly syntetizovány reakcí odpovídajících hydroxysalicylových kyselin s anilinem (nesubstituovaným nebo substituovaným v poloze 4 chlorem, methylovou nebo methoxylovou skupinou) za přítomnosti chloridu fosforitého v mikrovlnném reaktoru. Žádané 1,3-benzoxazinové deriváty z nich byly připraveny působením ethyl-chlorformiátu ve výtěžku 77 - 94 %. Všechny připravené látky byly charakterizovány infračervenými a NMR spektry a elementární analýzou.

Při hodnocení antifungální aktivity *in vitro* vůči *Candida albicans*, *C. tropicalis*, *C. krusei*, *C. glabrata*, *Trichosporon asahii*, *Trichophyton mentagrophytes*, *Aspergillus fumigates* a *Absidia corymbifera* nebyla žádná z látek účinnější než ketokonazol. Výchozí hydroxysalicylanilidy byly vesměs aktivnější než jejich cyklické analogy.

