

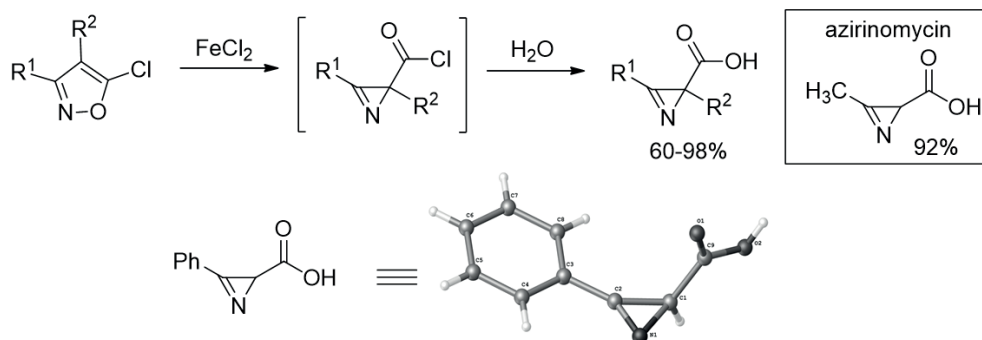
СИНТЕЗ И АНТИБАКТЕРИАЛЬНАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ 2H-АЗИРИН-2-КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Ростовский Н.В., Сахаров П.А., Новиков М.С., Хлебников А.Ф.

Санкт-Петербургский государственный университет, Институт химии,
198504, Санкт-Петербург, Петергоф, Университетский пр. 26,
e-mail: n.rostovskiy@spbu.ru

Поиск новых органических соединений с антибактериальными свойствами является актуальной задачей химии и фармацевтики. Перспективным классом таких соединений являются 2H-азирин-2-карбоновые кислоты. Известны и исследованы лишь два представителя 2H-азирин-2-карбоновых кислот (азириномицин¹ и мотуалева кислота F²), выделенные из природных объектов. Оба вещества продемонстрировали широкий спектр биологической активности, в том числе антибактериальную активность в отношении золотистого стафилококка и метициллин-резистентного золотистого стафилококка.^{1,2}

В работе разработан надёжный и эффективный синтетический метод получения азирин-2-карбоновых кислот из 5-хлоризоксазолов, включающий катализируемую хлоридом железа(II) изомеризацию 5-хлоризоксазола в азирин-2-карбонилхлорид и его гидролиз. Осуществлён синтез широкого набора 2H-азирин-2-карбоновых кислот и получены первичные данные по их антибактериальной активности. Строение одной из полученных кислот подтверждено методом РСА.



Литература

1. Stapley, E. O.; Hendlin, D.; Jackson, M.; Miller, A. K.; Hernandez, S.; Mata, J. M. J. *Antibiot.* 1971, 24, 42; Miller, T. W.; Tristram, E. W.; Wolf, F. J. J. *Antibiot.* 1971, 24, 48.
2. Keffer, J. L.; Plaza, A.; Bewley, C. A. *Org. Lett.* 2009, 11, 1087.

Исследование проведено при поддержке Совета по науке при Президенте РФ (МК-2698.2019.3) и РФФИ (18-33-00699) и с использованием оборудования ресурсных центров СПбГУ «Магнитно-резонансные методы исследования», «Рентгенодифракционные методы исследования», «Методы анализа состава вещества» и «Образовательный центр по направлению химия».