9.2. ČESKÝ ABSTRAKT

V rigorózní práci byl popsán vliv záměny oxo skupiny za thioxoskupinu v řadě halogenovaných 3-(4-ethylfenyl)benzoxazin-2,4(3*H*)-dionů a 6-chlor-3-(4-butyfenyl)benzoxazin-2,4(3*H*)-dionů Výchozí ethyl (nebo butyl) salicylanilidy byly syntetizovány z ethyl (nebo butyl) anilinu a substituované salicylové kyseliny v toluenu za přítomnosti chloridu fosforitého. (Skupina halogenovaných salicylových kyselin: 4-chlor-, 5-chlor-, 5-brom- and 3,5-dibrom salicylová kyselina.) Halogenované 4´-ethylsalicylanilidy reagovaly v suchém pyridinu s methyl-chloroformiatem za vzniku 3-(4-ethylfenyl)benzoxazin-2,4(3*H*)-dionů. Podobně byly připraveny 6-chlor-3-(4-butylfenyl)benzoxazin-2,3,(4-*H*)-diony. Směs 3-(4-ethyfenyl)-4-thioxo-2*H*-1,3-benzoxazin-2(3*H*)-onu a 3-(4-ethylfenyl)-2*H*-1,3-benzoxazin-2,4(3*H*)-dithionu byla připravena reakcí halogenovaných 3-(4-ethylfenyl)- 2*H*-1,3-benzoxazin-2,4(3*H*)-dionů se sulfidem fosforečným. Látky byly odděleny chromatograficky. Podobně byl získán 6-chlor-3-(4-butylfenyl)-thioxo-2*H*-1,3-benzoxazin-2(3*H*)-on a 6-chlor-3-(4-butylfenyl)-2*H*-1,3-benzoxazin-2,4(3*H*)-dithion. Látky byly hodnoceny *in vitro* na antimykobakteriální aktivitu vůči *Mycobacterium tuberculosis, M. kansasii* (dva kmeny) a *M. avium.* Thioxo (nebo dithioxo) deriváty jsou vysoce aktivními antimykobakteriálními látkami, aktivními vůči INH-rezistentním kmenům *M. kansasii* a *M. avium.* Nejaktivnější deriváty byly proti *M. tuberculosis* více aktivní než isonikotin hydrazid (INH). Studie je zajímavá svým zaměřením na látky o novém mechanismu aktivity. Tím přináší i biochemicky zajímavou problematiku.