

## 5-(2-AMINOFENIL)-1,3,4-OXSADIAZOL-2-TIOLNING YANGI S-ALKIL HOSILALARI SINTEZI, TUZILISHI VA ANTIMIKROB FAOLLIGI

Jololiddinov Fazliddin Yo'ldoshali O'g'li

Qo'qon universiteti Andijon filiali,

Biologik kimyo va farmatseftika kafedrası o'qtuvchisi

jololiddinofazliddin162@gmail.com

+998971569200

Kamoldinov Salohiddin Sharobiddin o'g'li

Qo'qon Universiteti Andijon filiali

Tibbiyot fakulteti Davolash ishi yo'nalishi 2-bosqich talabasi

kamoldinovsalohiddin006@gmail.com

<https://doi.org/10.5281/zenodo.20507576>

Hozirgi kunda yuqumli kasalliklarni davolashda patogen mikroorganizmlarning ko'p sonli antibiotiklarga rezistentligi (chidamliligi) global sog'liqni saqlash tizimining eng jiddiy muammolaridan biridir [1]. Shu sababli, medicinal kimyoda yangi kimyoviy skafoldlar asosida samarali antimikrob va antifungal agentlarni ishlab chiqish o'ta dolzarb hisoblanadi [2]. Benzimidazol va tiadiazol yadrolari bilan bir qatorda, tarkibida kislorod va azot saqlovchi 1,3,4-oksadiazol halqasi o'zining past toksikligi hamda biologik nishonlar bilan vodorod bog'lari hosil qila olish qobiliyati tufayli yuqori farmakoforlik potensialiga ega [3]. Xususan, oksadiazol halqasining 2-holatidagi ekzotsiklik tiol (-SH) guruhining selektiv S-alkillanishi molekulaning lipofilik xossasini oshiradi, bu esa uning hujayra membranalaridan oson o'tib, faollikning kuchayishiga olib keladi [4, 5].

Tadqiqot maqsadi. Antranil kislotasi hosilasi asosida olingan 5-(2-aminofenil)-1,3,4-oksadiazol-2-tiol boshlang'ich moddasining reaktiv tiol guruhi bo'yicha yangi S-alkil hosilalarini sintez qilish, ularning tuzilishini FT-IR va UB-Vis spektral usullarda isbotlash hamda antimikrob faollik qonuniyatlarini (SAR) o'rganish.

Ekspirimental qism. Maqsadli sintez molekuladagi amin (-NH<sub>2</sub>) guruhiga zarar yetkazmagan holda, faqat tiol (-SH) guruhining regioselektiv S-alkillanishini ta'minlash maqsadida DMF erituvchisi muhitida va kaliy karbonat (K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>) ishtirokida olib borildi. Alkillovchi reagentlar sifatida metil yodid, etil bromid, propil bromid va benzil xloriddan foydalanildi. Reaksiya aralashmasi 4.5-5 soat davomida 60-70 C haroratda doimiy aralashtirildi. Hosil bo'lgan birikmalarning individual tozaligi va tuzilishi FT-IR (KBr tabletkalarida) hamda UB-Vis (etanol eritmasida) spektroskopiyasi yordamida tasdiqlandi. Antimikrob faollik *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli* va *Candida albicans* test-shtammlariga qarshi standart disk-diffuziya (100 µg/ml) va mikrosuyultirish (MKB/MIC, µg/mL) usullarida baholandi.

Natijalar va muhokama. Maqsadli S-alkiloksadiazol hosilalari yuqori unumdorlik (68-84%) bilan barqaror kristall moddalar holida olindi. FT-IR spektrlarining tahlili shuni ko'rsatdiki, boshlang'ich moddaga xos bo'lgan ekzotsiklik tiol guruhining 2570 cm<sup>-1</sup> sohadagi kuchsiz yutilish chizig'i butkul yo'qolib, 742-758cm<sup>-1</sup> sohada yangi C-S bog'iga xos intensiv yutilish signallari paydo bo'lgan. Shuningdek, fenil halqasidagi amin guruhiga xos valent tebranishlar 3300-3420 cm<sup>-1</sup> o'zgarishsiz qolishi reaksiyaning faqat oltingugurt atomida ketganini tasdiqlaydi. UB spektrlarida oksadiazol va aminofenil xromoforlarining qo'shilishi hisobiga π-π\* elektron o'tishlar (260-265 nm) hamda S-substituent zanjiri uzunligi va tabiati (alifatik -aromatik) ortishi bilan aniq batoxrom siljishlar (gipsofaollik effekti) qayd etildi.

Mikrobiologik skrining natijalari sintez qilingan barcha moddalarning test-shtamlarga qarshi sezilarli faolligini ko'rsatdi. Struktura va faollik o'rtasidagi bog'liqlik (SAR) tahliliga ko'ra, lipofilik darajasi eng yuqori bo'lgan 2-benziltio-5-(2-aminofenil)-1,3,4-oksadiazol hosilasi barcha mikroorganizmlarga nisbatan eng yuqori natijani berdi (inhibitsiya zonasi 17–19 mm). Ushbu birikmaning *C. albicans* zamburug'iga qarshi bostiruvchi minimal konsentratsiyasi (15.62  $\mu$ g/m) standart flukonazol preparati ko'rsatkichiga to'liq tenglashdi, bu esa benzil radikalining ferment-nishonlar bilan qo'shimcha gidrofob o'zaro ta'sirlashishi bilan izohlanadi.

**Xulosa.** 5-(2-Aminofenil)-1,3,4-oksadiazol-2-tiolning to'rtta yangi S-alkil hosilalari muvaffaqiyatli sintez qilindi va ularning fizik-kimyoviy parametrlari tizimli tavsiflandi. Oksadiazol karkasiga aminofenil va lipofil S-substituentlarning birgalikda kiritilishi antimikrob va antifungal samaradorlikni keskin oshirishi aniqlandi. Olingan ma'lumotlar kelajakda ushbu geterotsiklik tizim asosida maqsadli ravishda yangi polifunksional dori vositalarini loyihalashda muhim ilmiy poydevor bo'lib xizmat qiladi.

### Adabiyotlar, References, Литературы:

1. World Health Organization. Global antimicrobial resistance and use surveillance system (GLASS) report 2023. *WHO Guidelines*, Geneva, 2023.
2. Kumar, S., & Sharma, P. Benzimidazole and oxadiazole derivatives: A review on synthesis and biological applications. *European Journal of Medicinal Chemistry*, 144, 112–132, 2018.
3. Yadav, P., & Ganguly, S. Synthesis, characterization, and biological activity of 1,3,4-oxadiazole derivatives: A review. *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 52(3), 645–660, 2015.
4. Rasulev, B., Nazarov, A., & Akbarov, A. Lipophilicity and antimicrobial activity of heterocyclic sulfur compounds. *Chemistry of Heterocyclic Compounds*, 51(7), 832–839, 2015.
5. Ali, I., Khan, F. G., & Siddiqui, N. Biological activities of substituted oxadiazoles: A review. *Bioorganic Chemistry*, 101, 103950, 2020.
6. Khabibullaev, S., Yuldashev, N., & Mamazulunov, N. (2023). Metabolic changes in the body as the result of long-term use of artificial sweetener-sodium cyclamate. *Science and innovation*, 2(D10), 64-70..
7. Қодиров, Р. Ш., Мамазулунов, Н. Х., Ботиров, Э. Х., & Юсупов, М. М. (2020). Флавоноиды *russowia sogdiana* (BGE). *fedsch. Экономика и социум*, (12-1), 628-631.
8. Мамазулунов, Н. (2021). Послеоперационные острые эрозии и язвы и их клиничко-биохимический прогноз. *Экономика и социум*, (3-2 (82)), 116-119.
9. Nurmuhammad, M. (2025). Buyraklarda urat toshlari hosil bo'lishi va davolash yo'llari. *Ta'lim innovatsiyasi va integratsiyasi*, 59(3), 90-94.
10. Mamazulunov, N. (2021). Inorganic phosphate and principles of fluorescence. *Экономика и социум*, (3-1 (82)), 167-169.
11. Мамазулунов, Н. Х., Ботиров, Э. Х., & Юсупов, М. М. (2020). Флавоноиды *russowia sogdiana* (BGE). *fedsch. Экономика и социум*, (12 (79)), 628-631.
12. Vokiyev, M., & Mamazulunov, N. (2020). Some biological active products of metallocenes. *Экономика и социум*, (12 (79)), 67-70.
13. Икрамова, М. М., Таджибоев, К. Т., & Мамазулунов, Н. Х. (2013). Определение активности аминотрансфераза в перфузате печени при экспериментальном токсическом гепатите. *science and world*, 42.
14. Юлдашев, Н., Мамазулунов, Н., & Хабибуллаев, С. Научное обозрение. *Биологические науки. Научное обозрение*, (2), 51-57.

15. Mamazulunov, N. Maqola NamDU Ilmiy Axborotnoma 2024 10 son.