

2-MERKAPTO-4(3H)-XINAZOLINONNING YANGI S-ALKIL HOSILALARI REGIOSELEKTIV SINTEZI, SPEKTRAL TAVSIFI VA ANTIMIKROB SPEKTRI

Jololiddinov Fazliddin Yo'ldoshali O'g'li

Qo'qon universiteti Andijon filiali,

Biologik kimyo va farmatseftika kafedrası o'qtuvchisi

jololiddinovfazliddin162@gmail.com

+998971569200

<https://doi.org/10.5281/zenodo.20507579>

Kimyoterapevtik preparatlarga nisbatan patogen shtammlarning rezistentligi ortib borayotgan bugungi sharoitda, biologik nishonlar bilan mustahkam bog'lana oladigan politsiklik tizimlarni modifikatsiya qilish alohida ahamiyatga ega [1]. Xinazolin-4-on xalqasi tabiiy alkaloidlar va sintetik dori vositalarining asosi bo'lib, mikroblarga, zamburug'larga va o'smalarga qarshi yuqori faollik namoyish etadi [2, 3]. Ushbu tizimning 2-holatidagi tiol (-SH) guruhini alkillash molekulaning gidrofob-lipofil balansini (log P) muvozanatlashga va hujayra qobig'i orqali passiv diffuziyani kuchaytirishga xizmat qiladi [4]. Biroq, ushbu karkasdagi laktam-laktim vation-tiol tautomeriyasi tufayli alkillanish reaksiyalarining regiosektivligini ta'minlash hamda olingan hosilalarning spektral qonuniyatlarini o'rganish tizimli tadqiqotlarni talab etadi [5].

Tadqiqot maqsadi. Antranil kislotasi va tiomochevina asosida olingan 2-merkaptto-4(3H)-xinazolinonning S-alkillanish reaksiyalarini regiosektiv sharoitda amalga oshirish, hosilalarning tuzilishini zamonaviy fizik-kimyoviy usullarda tasdiqlash hamda ularning antimikrob samaradorligini baholash.

Eksperimental qism. S-selektivlikni ta'minlash va N-alkillanish jarayonini cheklash maqsadida sintez xona haroratidan 50 C gacha bo'lgan mo'tadil termik sharoitda, absolyut erituvchi (DMF) va ekvivalent miqdordagi K₂CO₃ ishtirokida olib borildi. Alkillovchi agentlar sifatida alifatik radikallar (metil, etil, propil) va aromatik benzil galogenidi qo'llanildi. Reaksiya unumi va komponentlar tozaligi yuqqa qatlamli xromatografiya (YuQX) yordamida nazorat qilindi. Moddalar tuzilishi FT-IR (KBr) va UB-Vis (etanol, 200–400 nm) spektroskopiyasi orqali tahlil qilindi. Biofaollik *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli* va *Candida albicans* mikroblariga nisbatan standart disk-diffuziya va mikrosuyultirish usullarida o'rganildi.

Natijalar va muhokama. Maqsadli xinazolinon hosilalari 72–86% unumdorlik bilan yuqori tozalikdagi kristall moddalar holida ajratib olindi. FT-IR spektrlarida tiol (-SH) guruhining 2580 cm⁻¹ sohadagi kuchsiz yutilish bandi to'liq yo'qolganligi, ammo karbonil guruhiga xos bo'lgan C=O (1665–1680 cm⁻¹) va N-H (3180–3240 cm⁻¹) bog'larining valent tebranishlari o'z holicha saqlanib qolganligi aniqlandi. Bu holat alkillanish faqat oltingugurt atomi bo'yicha regiosektiv sodir bo'lganini ko'rsatadi. UB spektrlarida xinazolin karkasining π-π* o'tishlariga mos keluvchi ikkita asosiy absorbsiya maksimumi (235 nm va 285 nm) qayd etildi. S-alkil zanjirining uzayishi va benzil radikalining kiritilishi xromofor tizimda gipsofaollik va aniq batoxrom siljish effekti bilan kechdi.

Mikrobiologik skrining natijalari barcha S-hosilalarning boshlang'ich moddaga nisbatan yuqori faollikka ega ekanligini ko'rsatdi. Strukturaviy faollik (SAR) tahlili alkil zanjiri tarkibidagi uglerodlar sonining ortishi moddalarning gram-musbat va gram-manfiy bakteriyalar qobig'iga kiruvchanligini oshirishini tasdiqladi. Eng yuqori antimikrob va antifungal samara 2-(benziltio)xinazolin-4(3H)-onda kuzatildi (inhibitsiya zonasi 18–21 mm). Ushbu birikma *C. albicans* shtammiga nisbatan 15.62 μg/mL minimal bostiruvchi konsentratsiya (MIC) ko'rsatib,

klinik amaliyotda qo'llaniladigan flukonazol standarti bilan ekvivalent antifungal faollik namoyish etdi.

Xulosa. 2-merkaptο-4(3H)-xinazolinonning yangi S-alkil hosilalari regiosektiv usulda muvaffaqiyatli sintez qilindi va spektral parametrlari tizimlashtirildi. Tadqiqotlar shuni ko'rsatdiki, xinazolin karkasining S-modifikatsiyasi uning patogen mikroorganizmlarga qarshi biologik faolligini maqsadli boshqarish imkonini beradi. Olingan original natijalar kelajakda yuqori samarali va selektiv ta'sirga ega antimikrob dori vositalarini yaratishda muhim molekulyar poydevor bo'lib xizmat qiladi.

Adabiyotlar, References, Литературы:

1. World Health Organization. Global antimicrobial resistance and use surveillance system (GLASS) report 2023. *WHO Publications*, Geneva, 2023.
2. Kumar, S., & Sharma, P. Quinazolinone derivatives: A comprehensive review on synthesis and multifaceted biological applications. *European Journal of Medicinal Chemistry*, 144, 112–132, 2018.
3. Yadav, P., & Ganguly, S. Structure, characterization, and antimicrobial profile of heterocyclic quinazoline scaffolds. *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 52(3), 645–660, 2015.
4. Rasulev, B., Nazarov, A., & Akbarov, A. Quantitative structure-activity relationship (QSAR) and lipophilicity of sulfur-containing heterocycles. *Chemistry of Heterocyclic Compounds*, 51(7), 832–839, 2015.
5. Ali, I., Khan, F. G., & Siddiqui, N. Tautomerism and regioselective alkylation of 2-mercaptoquinazolinones. *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.