

Síntesis y Actividad Antimicrobiana de Diacilhidrazinas y Análogos

RUBEN H. EDROSA y SUSANA M. SICARDI

Cátedra de Farmacoquímica, IQUIMEFA, Facultad de Farmacia y Bioquímica, Universidad de Buenos Aires, Junín 956, (1113) Buenos Aires, Argentina

RESUMEN: Fueron sintetizadas y evaluadas *in vitro*, 11 diacilhidrazinas de ácidos grasos. Algunas de ellas fueron derivatizadas por oxidación a diacildiazenos o ciclizadas utilizando acetato de mercurio como único reactivo. Mientras que las diacilhidrazinas resultaron activas frente a microorganismos Gram-negativos, los diacildiazenos y la diimida mercúrica cíclica de la sym-hexanoilhidrazina amplían el espectro hacia Gram-positivos y hongos. Es de destacar la actividad de la sym-decanoilhidrazina frente a *Pseudomonas aeruginosa*.

SUMMARY: A series of fatty acid diacylhydrazines (I) and analogs have been prepared and tested *in vitro* in a search for more effective germicides. Derivatization of (I) with $\text{CO}_3 \text{Ag}_2$ - Celite afforded the corresponding diacyldiazenes. It was found that the reaction of (I) with mercuric acetate afforded directly mercuric cyclic diimides. While diacylhydrazines showed activity against Gram-negative microorganisms, diacyldiazenes and mercuric cyclic diimide extended the antibacterial spectrum to Gram-positive and fungi. Sym-decanoylhydrazide showed the highest activity against *Pseudomonas aeruginosa*.

INTRODUCCION

Son pocas las hidrazidas, aril o heteroíl sustituidas que han sido reconocidas por su actividad antimicrobiana ^{1,2}, destacándose entre ellas la Isonicotinhidrazida por su potencia y selectividad frente al *Mycobacterium tuberculosis* ³. El estudio reciente de hidrazidas N'-piridonioacetilsustituidas conteniendo al subgrupo amidocarbamoílo (-CO-NH-NH-CO-) ha despertado considerable interés acerca de su actividad antimicro-

biana, selectividad y baja toxicidad ⁴⁻⁷.

En esta publicación se describe el estudio de compuestos simples conteniendo la función amidocarbamoílo como son las diacilhidrazinas de ácidos grasos (I-XI), conocidas por su participación como intermediarios en la formación de heterociclos⁸⁻¹⁰ más que por sus posibles acciones biológicas. Como apertura a la síntesis de nuevas estructuras derivadas de la anterior, se oxidó la función amidocarbamoílo transformando diacilhidrazi-

PALABRAS CLAVE: Antibacterianos, diacilhidrazinas, diacildiazenos, diimidas mercúricas cíclicas, síntesis directa de diimidas mercúricas cíclicas con acetato de mercurio.

KEY WORDS: Antibacterials diacylhydrazines, diacyldiazenes and mercuric cyclic diimides mercuric acetate reactive for mercuric cyclic diimides synthesis.