



Міністерство охорони здоров'я України
Міністерство освіти і науки України
Національний фармацевтичний університет
Кафедра фармацевтичної хімії
Кафедра загальної хімії

Міжнародна internet-конференція

Modern chemistry of medicines

25 вересня 2024 р.
м. Харків, Україна

Посвідчення Державної наукової
установи «Український інститут
науково-технічної експертизи та
інформації» № 263 від 16.04.2024 р.

Міністерство охорони здоров'я України
Міністерство освіти і науки України
Національний фармацевтичний університет
Кафедра фармацевтичної хімії
Кафедра загальної хімії

Ministry of health of Ukraine
Ministry of education and science of Ukraine
National university of pharmacy
Pharmaceutical chemistry department
General chemistry department

MODERN CHEMISTRY OF MEDICINES

Матеріали

**Міжнародної Internet-конференції «Modern chemistry of medicines»,
до 85-річчя з дня народження професора Петра Овксентійовича Безуглого
25 вересня 2024 року**

Materials

**of the International Internet Conference 'Modern chemistry of medicines',
dedicated to the 85th Anniversary of Professor Petro O. Bezuglyi
September 25, 2024**

**ХАРКІВ
KHARKIV
2024**



Синтез та властивості (4-(9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин-6-іл)піперазин-1-іл)(алкіл-, арил-, гетерил)метанонів

Сергій Федотов, Андрій Гоцуля

Запорізький державний медико-фармацевтичний університет м. Запоріжжя, Україна
andrey.goculya@gmail.com

Вступ. Серед значної кількості похідних 1,2,4-триазолу значною перспективою створення біологічно активних субстанцій володіють їх конденсовані похідні. Формуванню конденсованих систем за участю зазначеного гетероциклу активно сприяють як зовнішні та внутрішні нуклеофільні центри в структурі даних сполук. Відповідним хімічним потенціалом наділена значна кількість функціональних груп, серед яких аміно- та меркаптогрупи є найбільш відомими в цій ролі при структурі 1,2,4-триазолу. Тому синтез конденсованих похідних на основі аміно- та меркаптопохідних 1,2,4-триазолу залишається актуальним науковим напрямком сьогодення.

Метою роботи був синтез (4-(9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин-6-іл)піперазин-1-іл)(алкіл-, арил-, гетерил)-метанонів та встановлення їх фізико-хімічних властивостей.

Матеріали та методи. Попередньо було встановлено, що 4-аміно-5-(3-(4-метоксифеніл)піразол-5-іл)-1,2,4-триазол-3-тіол в реакції взаємодії з карбонілдіімідазолом в середовищі 1,4-діоксану з одночасним захистом тіольної групи, перетворюється у 9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин-6-он. На другому етапі одержаний сульфонат був залучений у взаємодію з Вос-піперазином, що дозволило ввести до структури досліджуваної сполуки піперазиновий фрагмент та після деблокування Вос-захисту за допомогою хлоридної кислоти в середовищі 1,4-діоксану одержати 9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)-6-(піперазин-1-іл)-піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин гідрохлорид. Наступний етап функціоналізації передбачав введення карбонільної групи до структури синтезованого 9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)-6-(піперазин-1-іл)-піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин гідрохлориду шляхом взаємодії з хлорангідрідами алкіл-, арил- та гетерилкарбонових кислот. Реакція успішно відбувається в середовищі дихлорометану в присутності триетиламіну. Будова синтезованих речовин доводилась застосуванням елементного аналізу, ^1H та ^{13}C ЯМР-спектроскопії, індивідуальність – хромато-мас-спектрометрією.

Результати та обговорення. Досліджено та успішно реалізовано ряд послідовних процесів структурної функціоналізації 4-аміно-5-(3-(4-метоксифеніл)піразол-5-іл)-1,2,4-триазол-3-тіолу, що дозволило одержати 10 нових сполук, для яких встановлено ряд фізико-хімічних властивостей та констант.

Висновки. Запропоновано методики одержання 4-(9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)-піразоло[1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин-6-іл)піперазин-1-іл)(алкіл-, арил-, гетерил)-метанонів, які є цікавими об'єктами для подальших досліджень фармакологічних властивостей.

Список літератури:

1. Can NÖ, Acar ÇU, Sağlık BN, Levent S, Korkut B, Öz-kay Y, et al. Synthesis, molecular docking studies, and antifungal activity evaluation of new benzimidazole-triazoles as potential lanosterol 14 α -demethylase inhibitors. Journal of Chemistry. 2017. Article ID 9387102. Available from: <https://doi.org/10.1155/2017/9387102>
2. Othman AA, Kihel M, Amara S. 1,3,4-Oxadiazole, 1,3,4-thiadiazole and 1,2,4-triazole derivatives as potential antibacterial agents. Arabian Journal of Chemistry. 2019. 12(7):1660-1675.
3. Zvenihorodska T, Hotsulia A, Kravchenko S, Fedotov S, Kyrychko B. Synthesis and antimicrobial action of 1,2,4-triazole derivatives containing theophylline and 1,3,4-thiadiazole fragments in their structure. African Journal of Biomedical Research. 2021. 24(1):159-163.



Визначення домішок урсодеоксихолевої кислоти у твердих желатинових капсулах	119
Олена Салій, Ганна Тарасенко, Яна Ясько	
Фітофотодерматити, викликані рутою запашною	120
Сергієнко Тетяна, Георгіянц Вікторія, Скибітська Марія, Михайленко Ольга	
Підбір умов для кількісного визначення водорозчинних полісахаридів у лікарській рослинній сировині оману високого кореневищ та коренів	121
Наталія Смілова, Ольга Євтіфєєва, Ольга Головченко, Ольга Рудакова, Вікторія Георгіянц	
Визначення механізму інгібування бутирилхолінестерази дезлоратадином	122
Роман Смішко, Анастасія Бегдай, Ольга Сив'юк, Вадим Лісовий, Галина Кузьміна, Володимир Бессарабов	
Проблеми застосування компонентів рослинного походження при розробці косметичних засобів для вагітних.....	123
Галина Смойловська, Олена Малюгіна, Олена Єренко	
Валідація методики кількісного визначення вмісту води в 1,2,4-трихлорбензолі.....	124
Тетяна Соломінчук, Віталій Рудюк, Вікторія Георгіянц	
Перспективні біополімерні матеріали гемостатичної та кровоспинної дії	125
Ганна Тарасенко, Олена Салій, Віталіна Буцин, Олена Панкратова	
Кінетичне дослідження інгібування рутином окиснення дофаміну	125
Владислав Удовиський, Валентина Древуш, Марія Розумненко, Вікторія Лижнюк, Вадим Лісовий, Галина Кузьміна, Володимир Бессарабов	
Спектрофотометричне визначення концентрацій ароматичних та гетероциклічних амінокислот у подвійних і потрійних розчинах	127
Ірина Фарбун	
Синтез та властивості (4-(9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)піразоло [1,5-<i>d</i>][1,2,4]триазоло[3,4-<i>f</i>][1,2,4]триазин-6-іл)піперазин-1-іл) (алкіл-, арил-, гетерил)метанонів	128
Сергій Федотов, Андрій Гоцуля	
Синтез та властивості продуктів імідування серотоніну та гістаміну 4-заміщеними нафталевими ангідридами.....	129
Надія Федько, Віра Ведута, Катерина Мілінчук, Валерій Ластеженко	
Принципи «зеленої» хімії у виробництві сучасних фітопрепаратів	130
Ольга Хворост, Тетяна Опрошанська, Катерина Скребцова	