

Експериментально встановлено, що реакція Сейфєрта-Гільберта успішно масштабується та має широкий спектр застосування, роблячи її ключовим методом синтезу аліфатичних алкінів, як у лабораторних, так і у промислових масштабах. Однак синтез сполук з невеликими R-групами може бути складнішим через їх низьку температуру кипіння.

У подальшому планується розширити дослідження та підтвердити універсальність даного методу для більш складних субстратів, включаючи ті, що містять не лише гетероатоми, але й гетероцикли. Крім того, планується проведення досліджень потенційної біологічної активності синтезованих сполук, для визначення їх можливого використання як біологічно активних речовин, зокрема, як потенційних фармацевтичних засобів.

#### Список використаних джерел

1. Talele, T. T. Acetylene Group, Friend or Foe in Medicinal Chemistry. *J. Med. Chem.* 2020. Vol. 63(11). 5625–5663. doi:10.1021/acs.jmedchem.9b01617

УДК 547.787.1

Кудрик В.Ю., Макей О.П., Янченко В.О.

Національний університет «Чернігівський колегіум» імені Т. Г. Шевченка

#### СИНТЕЗ НОВИХ 2-[5-(2-ТІЄНІЛ)-1,3,4-ОКСАДІАЗОЛ-2-ІЛ] КАРБОНОВИХ КИСЛОТ

Виконано дослідження синтезу 2-[5-(2-тієніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл]карбонових кислот шляхом модифікації 5-(2-тієніл)тетразолу.

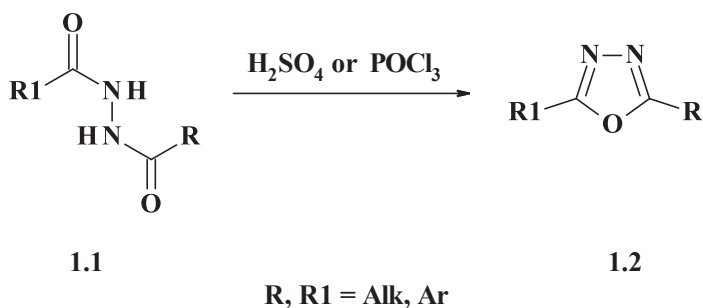
The synthesis of 2-[5-(2-thienyl)-1,3,4-oxadiazol-2-yl]carboxylic acids by modification of 5-(2-thienyl)tetrazole was studied.

**Ключові слова:** карбонові кислоти, похідні 1,3,4-оксадіазолу, 2-[5-(2-тієніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл]карбонові кислоти.

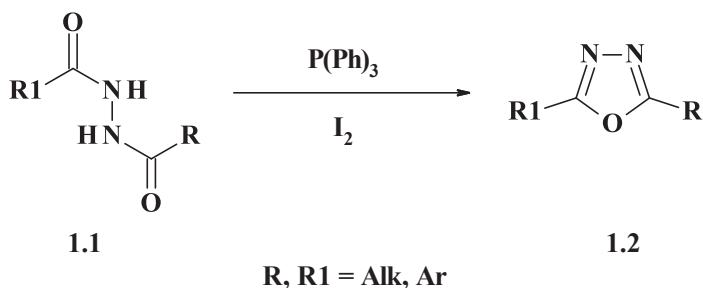
У літературних джерелах достатньо уваги приділяється методам синтезу оксигеновмісних кислот, а саме: похідним оксазолу, оксадіазолу [1,2]. Насамперед це пов'язано з широким спектром різних видів біологічної

активності. Крім того, деякі сполуки на даному етапі вже використовуються у якості діючих фармацевтичних препаратів проти збудників різних захворювань та полегшення проявів хвороб. У той же час гетероциклічні сполуки з тіофеновим фрагментом можуть проявляти різноманітні види біологічної активності, та входять до складу речовин, які застосовуються в сучасному світі [3, 4].

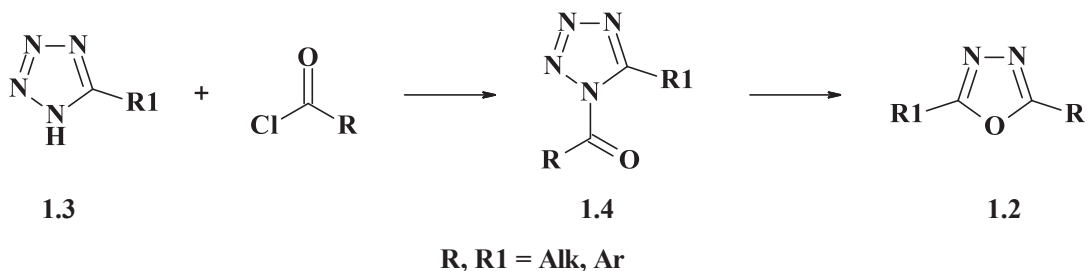
Нами було поставлено завдання здійснити синтез карбонових кислот, які містять ядро 1,3,4-оксадіазолу. Аналізуючи методи отримання сполук ряду оксадіазолу є очевидним те, що найчастіше застосовують 2 варіанти. Один з них передбачає циклізацію дизамішених гідразидів **1.1** з використанням низки дегідратуючих реагентів ( $H_2SO_4$ ,  $POCl_3$ ) [1,2].



Також альтернативний варіант передбачає застосування сумішей трифенілфосфіну та йоду [5].

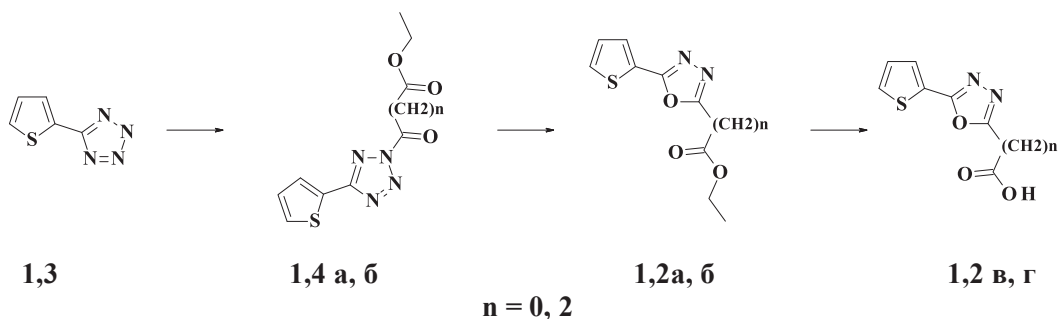


Ще один спосіб синтезу оксадіазолів **1.2** [6] передбачає використання у якості вихідних сполук тетразолів **1.3** з наступною взаємодією з ацилюючими агентами (найчастіше хлороангідридів або ангідридів карбонових кислот).



Виходячи з двох стратегій нами було вибрано другий варіант синтезу заміщених 1,3,4-оксадіазолів, оскільки на нашу думку у даному випадку не виникає необхідність використання значних кількостей водовіднімаючих засобів. Проблема полягає у тому, що на стадії виділення доведеться проводити нейтралізацію кислотних неорганічних компонентів або ж відганяти надлишок хлороокису фосфору. Це пов'язано з тим, що 1,3,4-оксадіазольне ядро є досить чутливе до дії сильних кислот у водному середовищі, і як наслідок, цикл зазнає руйнування у результаті кислотного гідролізу, що підвищує ризики виділення вихідних діацилгідразинів **1.1**.

Зваживши зазначені недоліки, було прийняте рішення здійснювати синтез похідних 1,3,4-оксадіазолу **1.2а-г** на основі 5-тіофензаміщеного тетразолу **1.3** згідно наступної схеми, яка складається з трьох стадій.



У результаті експерименту було отримано як проміжні сполуки **1.2а,б**, так оксадіазоли **1.2в,г**. Слід відмітити, що речовину **1.2в** вдалося виділити у формі калієвої солі, оскільки кислотна форма зазнає декарбоксілювання.

Дослідження були виконані з використанням потужностей ТОВ НВК «Укроргсинтез».

### Список використаних джерел

1. Yanting D., Zilu W., Lianqing C. One pot solvent-free solid state synthesis, photophysical properties and crystal structure of substituted azole derivatives. *Journal of Molecular Structure*. 2019. Vol. 1193. P. 315–325.
2. Blackhall A., Brydon D., Saga A. Substitution reactions of phenylated aza-heterocycles. Part 1. Nitration of 2,5-diphenyl-1,3,4-oxadiazole: a product study

- using high performance liquid chromatography. *Journal of the Chemical Society. Perkin transactions II*. 1980. P. 773–777.
- Oertel R, Rahn R, Kirch W. Clinical pharmacokinetics of articaine. *Clinical Pharmacokinetics*. 1997. Vol. 33. № 6. P. 417–425.
  - Ganten D, Mulrow P. Pharmacology of Antihypertensive Therapeutics. [S.l.]: Springer-Verlag Berlin Heidelberg; 2013. 880 p.
  - Li F., Ma C., Degrado W. Discovery of Highly Potent Inhibitors Targeting the Predominant Drug-Resistant S31N Mutant of the Influenza A Virus M2 Proton Channel. *Journal of Medicinal Chemistry*. 2016. Vol. 59, № 3. P. 1207–1216.
  - Reichart B., Kappe O. High-temperature continuous flow synthesis of 1,3,4-oxadiazoles via N-acylation of 5-substituted tetrazoles. *Tetrahedron Letters*, 2012. Vol. 53, № 8. P. 952–955.

УДК 541.49:577.15/17:547.732:632.954

**Рассевич Я.І., Гнатюк О.В., Лявинець О.С.**

*Чернівецький національний університет імені Юрія Федьковича*

## **ІНГІБІТОРНІ ВЛАСТИВОСТІ ДЕЯКИХ ЗАМІЩЕНИХ ПОХІДНИХ 5-БЕНЗИЛІДЕНБАРБІТУРОВОЇ КИСЛОТИ**

Волюмометричним методом досліджені інгібіторні властивості похідних 5-бензиліденбарбітурової кислоти. Розраховано основні кінетичні параметри процесу. Встановлено, що фрагмент піримідин-2,4,6-тріону майже не виявляє антиоксидантних властивостей. Електронодонорні замісники в бензиліденовому фрагменті посилюють антиоксидантні властивості фенольного гідроксилу.

**Ключові слова:** 5-бензиліденбарбітурова кислота, швидкість поглинання кисню, швидкість окиснення, антиоксидантні властивості, вільні радикали.

The inhibitory properties of 5-benzylidenebarbituric acid derivatives were investigated using the volumetric method. The main kinetic parameters of the process were calculated. It was established that the pyrimidine-2,4,6-trione fragment has almost no antioxidant properties. Electron-donating substituents in the benzylidene fragment enhance the antioxidant properties of phenolic hydroxyl.

**Key words:** 5-benzylidenebarbituric acid, oxygen absorption rate, oxidation rate, antioxidant properties, free radicals.

Пошук нових типів антиоксидантів та вивчення механізму їх дії є актуальним та важливим завданням. Це зумовлено їхньою здатністю за низьких концентрацій сповільнювати або усувати небажані процеси вільно-радикального окиснення органічних речовин, утворення та перетворення пероксидних сполук. Завдяки