



# WayScience

International Scientific and  
Practical Internet Conference

**«Development of Education, Science and Business:  
Results 2021»**

# WayScience

Міжнародна науково-практична  
інтернет-конференція

**«Розвиток освіти, науки та бізнесу:  
результати 2021»**

Editorial board of International Electronic Scientific and Practical Journal «WayScience»  
(ISSN 2664-4819 (Online))

The editorial board of the Journal is not responsible for the content of the abstracts and may not share the author's opinion.

**Розвиток освіти, науки та бізнесу: результати 2021: тези доп. міжнародної науково-практичної інтернет-конференції, 6-7 грудня 2021 р. – Дніпро, Україна, 2021. – 168 с.**

**(Development of Education, Science and Business: Results 2021: abstracts of the International Scientific and Practical Internet Conference, December 6-7, 2021. – Dnipro, Ukraine, 2021. – 168 p.)**

International Scientific and Practical Internet Conference "Development of Education, Science and Business: Results 2021" devoted to the main research of this year.

Topics cover all sections of the International Electronic Scientific and Practical Journal "WayScience", namely:

- public administration;
- philosophical sciences;
- economic sciences;
- historical sciences;
- legal sciences;
- agricultural sciences;
- geographic sciences;
- pedagogical sciences;
- psychological sciences;
- sociological sciences;
- political sciences;
- philological sciences;
- technical sciences;
- medical sciences;
- chemical sciences;
- biological sciences;
- physical and mathematical sciences;
- other professional sciences.

**Dnipro, Ukraine – 2021**

## ПЕРСПЕКТИВНІ АСПЕКТИ ПОШУКУ НОВИХ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ МОЛЕКУЛ СЕРЕД ТІОФЕН-3-ІЛВМІСНИХ 1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОЛІВ

**Бігдан О.А.**

к. фарм. н.

доцент кафедри клінічної фармації, фармакотерапії,  
фармакогнозії та фармацевтичної хімії

**Хільковець А.В.**

очний аспірант кафедри природничих дисциплін для іноземних студентів та  
токсикологічної хімії  
nastia010792@ukr.net

Запорізький державний медичний університет, Україна

**Вступ.** 1,2,4-Триазол та його похідні є одними з найбільш активних у біологічному аспекті класів сполук, володіючи широким спектром фармакологічної дії. Гетероциклічна система 1,2,4-триазолу окремо та у поєднанні з іншими гетероциклами надає дослідникам багато можливостей щодо виявлення клінічно значущих сполук з широким спектром біологічних властивостей. Деякі з сучасних препаратів, такі як рибавірін (протівірусний засіб), ризатриптан (антимігричний засіб), алпразолам (анксіолітичний засіб), флуконазол та ітраконазол (протигрибкові агенти) є найкращими прикладами того, як похідні 1,2,4-триазолу можуть бути активними фармацевтичними інгредієнтами (АФІ) ліків.

Навін Б. Патель та інші [1, с. 4293-4299] синтезували серію 3-(3-піридил)-5-(4-метилфеніл)-4-(N-заміщених-1,3-бензотіазол-2-аміно)-4Н-1,2,4-триазолів, які володіють протимікробними властивостями та виявились активними протитуберкульозними агентами. Колективом турецьких науковців [2, с. 381-392] синтезовано ряд нових 5-[(4-амінофенокси)-метил] -4-алкіл(арил)-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-триазол-3-тіонів, серед яких виявлено сполуки з протівірусною дією. Крім того, деякі з них виявились активними щодо культури клітин HEL та E6SM, а також типовими протитуберкульозними речовинами. Іншим колективом [3, с. 532] синтезувано нові 1,4-дизаміщені-1,2,4-триазоло [4,3-а]-хіназолін-5(4Н)-они та проведено скринінгові випробування їх щодо ВІЛ. Shingare та інші [4, с. 187] синтезували певні 1,4-бензотіазинілтіосемикарбазиди, 1,2,4-триазоли, оксадіазоли і тіадіазоли та виявили серед них протитуберкульозну активність. С. Д. Джоші та інші [5, с. 1989-1996] отримали ряд похідних 5-заміщених-4-аміно-1,2,4-триазолін-3-тіонів – перспективних антибактеріальних агентів.

Цікаві з наукової точки зору результати біологічних випробувань фуранвмісних 1,2,4-триазолів наведено в роботі вітчизняних науковців [6, с. 361]. Іншим колективом авторів досліджено фізико-хімічні властивості амінопохідних 1,2,4-триазолів та їх відновлених систем [7, с. 464-474], а введення до структури заміщених 1,2,4-триазолів галогенвмісних фрагментів створює сприятливі умови для синтезу перспективних молекул [8, с. 22-29]. Оригінальний та нескладний метод синтезу нових 5-(фуран-2-іл)-4-алкіл-, арил-, аміно-1,2,4-триазол-3-тіонів пропонують науковці Запорізького державного медичного університету [9, с. 83-87], доводячи, що бромфуран-1,2,4-триазоли володіють більш вираженою протимікробною активністю [10, с. 50-58]. Біциклічні похідні 1,2,4-триазолу, аналізуючи інформацію, можуть виявитись привабливими та перспективними для створення «бібліотек» нових протимікробних агентів [11, с. 463-470]. Таким чином, аналізуючи наукові досягнення досить широкого кола науковців, ми вважали за доцільне акцентувати увагу на пошуку нових біологічно активних структур серед похідних 1,2,4-триазолу за рахунок додаткового введення типового фармакофору тіофену.

**Метою** роботи було отримання ряду нових 5-(тіофен-3-ілметил)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-триазол-3-тіолів, вивчення їх фізико-хімічних властивостей. В якості напівпродуктів для синтезу нових

5-(тіофен-3-ілметил)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-триазол-3-тіолів було використано відповідні N-R<sub>1</sub>-2-(2-(тіофен-3-іл)ацетил)гідразинокарботіоаміди. Закриття циклу проходить у лужному середовищі, виділення відповідних тіолів проводили додаванням оцтової кислоти. Подальші перетворення було проведено додаванням еквівалентних кількостей хлоретанолу в лужному середовищі метанолу до відповідних тіолів. В кожному випадку суміші кип'ять протягом 3 годин, фільтрують, розчинник випаровують. З високими виходами отримано ряд нових сполук. Наступним етапом роботи було дослідити взаємодію відповідних 5-(тіофен-3-ілметил)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-триазол-3-тіолів з 2-бром-1-арилетанолами: 2-бром-1-(2-бромфеніл)етаноном, 2-бром-1-(3-фторфеніл)етаноном та 2-бром-1-(4-фторфеніл)етаноном. Будова синтезованих сполук у всіх випадках підтверджена сучасними фізико-хімічними методами аналізу, а їх індивідуальність – хроматографічно.

**Висновки.** Вперше синтезовано ряд нових похідних 5-(тіофен-3-ілметил)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-триазол-3-тіолу, в деяких випадках досліджено подальші перетворення сполук. Будова отриманих речовин підтверджена сучасними фізико-хімічними методами аналізу. Ретельно вивчені та інтерпретовані <sup>1</sup>H ЯМР- спектр синтезованих сполук.

### Список літератури:

1. Patel N.B., Khan I.H., Rajani S.D. Pharmacological evaluation and characterizations of newly synthesized 1,2,4-triazoles. *European Journal of Medicinal Chemistry*. 2010. V. 45. P. 4293-4299.
2. Kucukguzel I., Tatar E., Kucukguzel S.G., Rollas S., Clercq E.D. Synthesis of some novel thiourea derivatives obtained from 5-[(4-aminophenoxy)methyl]-4-alkyl/aryl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thiones and evaluation as antiviral/anti-HIV and antituberculosis agents. *European Journal of Medicinal Chemistry*. 2008. V. 43. P. 381-392.
3. Alagarsamy V., Giridhar R., Yadav M.R., Revathi R., Ruckmani K., Clercq E.D. AntiHIV, antibacterial and antifungal activities of some novel 1,4-disubstituted-1,2,4-triazolo[4,3-a]quinazolin-5(4h)-ones. *Ind. J. Pharm. Sci.* 2006. V. 68 (4). P. 532.
4. Shingare M.S., Chaudari B.R., Shinde D.B. Synthesis of 1,4-benzothiazinyl thiosemicarbazides, triazoles, oxadiazoles, and thiadiazoles. *Indian J Heterocyclic Chem.* 1995. V. 4. P. 187.
5. Joshi S.D., Vagdevi H.M., Vaidya V .P., Gadaginamath G.S. Synthesis of new 4-pyrrol-1-yl benzoic acid hydrazide analogs and some derived oxadiazole, triazole and pyrrole ring systems: A novel class of potential antibacterial and antitubercular agents. *European Journal of Medicinal Chemistry*. 2008. V. 43. P. 1989-1996.
6. Parchenko V.V. Synthesis, physico-chemical and biological properties of the 1,2,4-triazole-3-thione 5-furilderivatives: Dis ... Dr. of Pharm. Sciences. *Zaporizhya*. 2014. P. 361.
7. Bihdan O., Parchenko V., Zazharskyi V., Fotina T., Davydenko P. Studying of physico-chemical properties of 5-(2-,3-fluorophenyl)-4-((aryl-, geteryl) yliden) amino-1,2,4-triazole-3-thiols and any of their retrievalproducts. *Res. J. Pharm. Biol. Chem. Sci.* 2019. V. 10(1). P. 464-474.
8. O. A. Bihdan, V. V. Parchenko, R. O. Shcherbyna, A. A Safonov (2018). 1,2,4-Triazole Derivatives with Halogen Substituted Fragments, Their Synthesis, Modification and Biological Properties. *Research journal of pharmaceutical biological and chemical sciences*, 1 (1): P. 22-29.
9. Parchenko V. V., Erohin V. V., Panasenko O. I., Knysh E. G. Synthesis, transformation, physical and chemical properties of 4-alkyl-, aryl- and 4-aminoderivatives of 1,2,4-triazole-3-thiol with fragments of furan remains. *Zaporozh. med. Zhurnal*. 2010. 12 (4). P. 83–87.
10. Zazharskyi, V., Parchenko, M., Parchenko, V., та ін. Physicochemical properties of new S-derivatives of 5-(5-bromofuran-2-yl)-4-methyl-1,2,4-triazol-3-thiols. *Voprosy Khimii i Khimicheskoi Tekhnologii*. 2020. V. 6, No. 6. P. 50–58.
11. Bihdan O. A., Parchenko V. V. Some aspects of synthesis 3-(2-florphenyl)-6-R<sub>1</sub>-[1,2,4]triazol[3,4-b][1,3,4]thiadiazole and 3-(2-, 3-ftorphenyl)-6-R<sub>2</sub>-7H[1,2,4]triazolo[1,3,4]tiadiazines. *Research Journal of Pharmaceutical, Biological and Chemical Sciences*. 2018. № 9(3). P. 463—470.