



Національна академія наук України

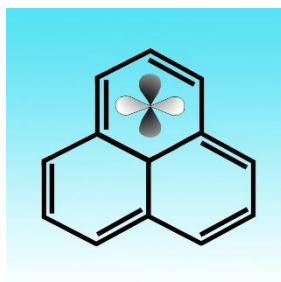


Міністерство освіти та науки України

Державна наукова установа
«Науково-технологічний
комплекс «Інститут
монокристалів»

Харківський національний
університет
імені В.Н. Каразіна

За підтримки Enamine Ltd



**ХІІІ ВСЕУКРАЇНСЬКА КОНФЕРЕНЦІЯ
МОЛОДИХ ВЧЕНИХ ТА СТУДЕНТІВ
З АКТУАЛЬНИХ ПИТАНЬ ХІМІЇ**

Збірка праць

Харків
2-4 травня 2018 року

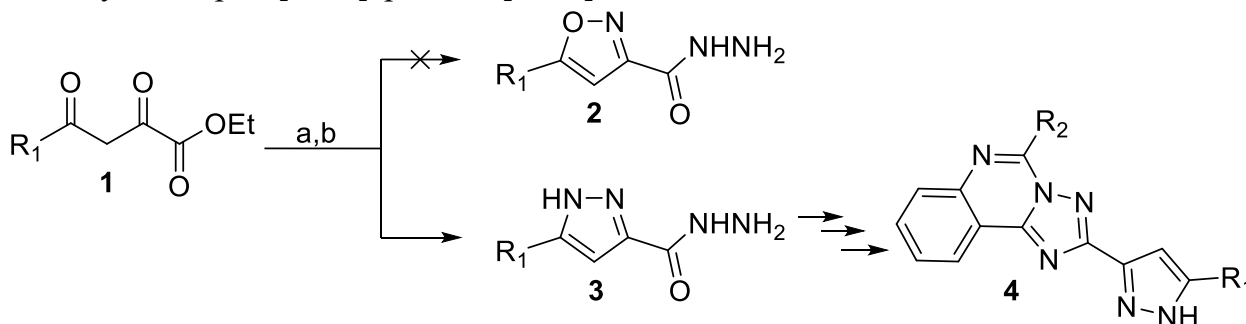
ОСОБЛИВОСТІ СИНТЕЗУ ГЕТЕРИЛ КАРБГІДРАЗИДІВ ЯК ВИХІДНИХ РЕЧОВИН ДЛЯ СИНТЕЗУ 2-ГЕТЕРИЛ [1,2,4]ТРИАЗОЛО[1,5- C]ХІНАЗОЛІНІВ

ЗАЙКА Є., ВОСКОВОЙНИК О.Ю

Запорізький державний медичний університет

Гідрази́ди гетери́л карбо́нових кислот являють собою зручні сполуки для синтезу різноманітних гетероциклів, в тому числі біологічно активних. Так наприклад зазначені гідрази́ди можуть бути використані для синтезу 1,2,4-тріазолів, 1,2,4-тіадіазолів, 1,2,4-оксадіазолів а також конденсованих гетероциклічних систем. Серед інших вкрай перспективними є гідрази́ди гетери́л карбо́нових кислот, що містять ізоксазольний фрагмент. Зазначені сполуки можуть бути використані для синтезу [1,2,4]тріазоло[1,5-с]хіназолінів з ізооксазольним фрагментом, які є перспективними біологічно активними сполуками.

Згідно літературних даних цільові 5-заміщені ізооксазол-3-карбгідрази́ди **2** отримуються нагріванням гідроксиламіну гідрохлориду та етил-4-R-2,4-диоксобутаноату **1** в метанолі чи етанолі протягом 5-7 годин, з наступним гідрази́нолізом продуктів, що утворилися. Однак, за даними комплексу фізико хімічних методів досліджень (¹H ЯМР-спектроскопія та хромато-мас-спектрометрія) реалізація зазначеного синтетичного протоколу привела до формування не ізооксазольних, а піразольних похідних **3**, які також можуть бути використані для синтезу 2-гетерил [1,2,4]тріазоло[1,5-с]хіназолінів **4**.



a, b: $\text{NH}_2\text{OH}\cdot\text{HCl}$, етил-4-R-2,4-диоксобутаноат, метанол (a) чи етанол (b)^{1,2}
кип'ятіння 6 годин, далі гідразин гідрат 2 екв., метанол кип'ятіння 5 год.

В подальшому нами планується оптимізація методів синтезу 5-заміщених ізооксазол-3-карбгідрази́дів, їх структурна модифікація та дослідження біологічної активності синтезованих сполук.

Література

1. *European Journal of Medicinal Chemistry* 51 (2012) 42-51
2. *J. Heterocyclic Chem.*, 19, 557 (1982)