

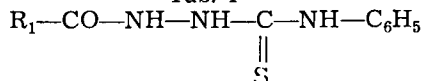
$R_1 = \alpha$ -pirydyli). Związek A-IV jest dostępny również w reakcji tionu 3, 4-dwufenylotiazolonu-2 z hydrazidem kwasu pikolinowego (patrz cz. I, III $R = R_2 = C_6H_5$). A-IV podobnie jak jego analog izonikotynoilowy i nikotynoilowy jest trwały w środowisku zasadowym (10% wodny roztwór NaOH), a ogrzewany z 15% wodnym roztworem HCl daje z dobrą wydajnością 2-fenylotiamino-3-amino-4-fenylotiazolinę.

B-II jest natomiast trwały nie tylko w środowisku zasadowym, ale również w kwaśnym i mimo długotrwałego ogrzewania nie ulega zmianie. Różni się on tym od pozostałych połączeń pyrydoilowych zawierających układ 2-fenylotiamino-3-amino-4-fenylotiazoliny, które w 15% wodnym roztworze HCl ulegają hydrolizie do wspomnianej tiazoliny. Obydwa związki są również trwałe w metanolemym roztworze gazowego chlorowodoru. Roztwór metanolemowy w obecności bezwodnego CH_3COONa — reakcja ta przebiega w sposób zdecydowanie odmienny od analogu izo- i nikotynoilowego. Przy ogrzewaniu do 2 godz. powstaje mieszanina trzech związków: A-IV, B-II i 5- α -pirydylo/-2-fenylotiamino-1, 3, 4-oksadiazolu (II) ($R_1 = \alpha$ -pirydyli). Dłuższe ogrzewanie — do 20 godz., daje już tylko oksadiazol i niewielką ilość B-II.

Budowę omawianego oksadiazolu potwierdza charakterystyczne widmo w nadfiolecie (ryc. 7). W widmie w podczerwieni brak jest również pasma grupy karbonylowej. Wreszcie związek ten, podobnie jak jego analogi γ - i β -pirydylowe, ogrzewany z 15% wodnym roztworem HCl daje 5- α -pirydylo/-1, 3, 4-oksadiazol-2 identyczny z połączeniem otrzymanym wg Yoshida (1) na drodze utlenienia tionu 5- α -pirydylo/-1, 3, 4-oksadiazolonu-2 z wodą utlenioną.

W piśmiennictwie brak jest w ogóle danych dotyczących syntezy i właściwości 5- α -pirydylo/-2-fenylotiamino-1, 3, 4-oksadiazolu. Nie dały również rezultatu próby otrzymania tego związku przy pomocy ogólnych metod syntezy 5- R_1 -2-fenylotiamino-1, 3, 4-oksadiazolu (2, 3). 20-godzinne ogrzewanie 4-fenylotiosemikarbazydu kwasu pikolinowego z ω -chloroacetofenonem w obecności bezwodnego CH_3COONa oraz hydrolizę alkaliczną (10% wodny roztwór NaOH) związku B-I można więc traktować jako jedyne reakcje syntezy 5- α -pirydylo/-2-fenylotiamino-1, 3, 4-oksadiazolu. Porównanie rezultatów cyklizacji 4-fenylotiosemikarbazydów kwasów pyrydynowych z ω -chloroacetofenonem (tab. 1) wskazuje na zdecydowanie odmienny charakter tych reakcji tylko w

Tab. 1

Reakcja z ω -chloroacetofenonem

	R_1	A	B	Oksadiazol
Metanol	γ -pirydyli	39,4%	9,2%	—
	β -pirydyli	50,0%	13,0%	—
	α -pirydyli	27,0%	32,6%	—
CH_3COONa	γ -pirydyli	—	—	80,0%
	β -pirydyli	—	—	76,0%
	α -pirydyli	8,8%	18,6%	6,4%*
		—	3,2%	40,5%**

* Ogrzewanie 2 godz.

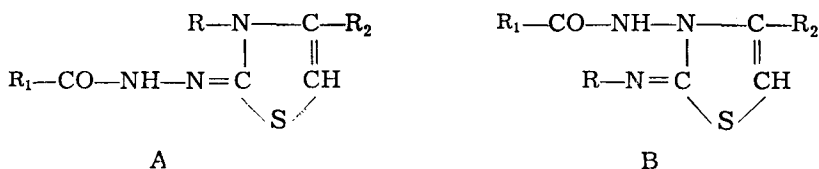
** Ogrzewanie 20 godz.

obecności bezw. CH_3COONa . Reakcja w roztworze metanolowym przebiega we wszystkich przypadkach jednakowo.

Spektroskopia w nadfiolecie

Pomiary przeprowadzono przy pomocy spektrofotometru VSU2-P firmy Carl Zeiss (Jena), stosując etanolowe roztwory badanych związków. Wyniki przedstawiono w tab. 2 i 3. Związki A-I i A-III (ryc. 1 i 2) dają widmo zawie-

Tab. 2



Związek	R ₁	R	R ₂	Pasmo max w nm	ε	
A-I	α-pirydył	CH ₃	CH ₃	259	11 340	
	β-pirydył (4)	CH ₃	CH ₃	260	11 200	
	γ-pirydył (5)	CH ₃	CH ₃	262	11 600	
A-II	α-pirydył	C ₆ H ₅	CH ₃	266	11 350	
	β-pirydył (4)	C ₆ H ₅	CH ₃	254	12 000	
	γ-pirydył (5)	C ₆ H ₅	CH ₃	254	12 100	
A-III	α-pirydył	CH ₃	C ₆ H ₅	260	14 650	
	β-pirydył (4)	CH ₃	C ₆ H ₅	261	14 600	
	γ-pirydył (5)	CH ₃	C ₆ H ₅	260	15 400	
A-IV	α-pirydył	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	258	13 600	
	β-pirydył (4)	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	266	13 000	
	γ-pirydył (5)	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	265	13 300	
B-I	α-pirydył	C ₆ H ₅	CH ₃	261	10 800	9 050
	β-pirydył (4)	C ₆ H ₅	CH ₃	264 287	10 000	
	γ-pirydył (5)	C ₆ H ₅	CH ₃	281	10 400	
B-II	α-pirydył	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	266	15 300	13 250
	β-pirydył (4)	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	264 286	13 400	
	γ-pirydył (5)	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	281	14 400	

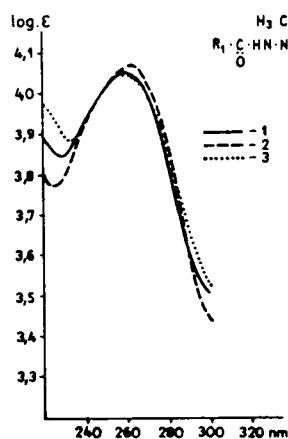
rające jedno pasmo absorpcji o praktycznie jednakowych wartościach λ max (259, 261 nm). Widma związków A-II i A-IV (ryc. 3 i 4) zawierających rodnik fenyłowy przy atomie N³ — pierścienia tiazolu są częściowo różne. Dotyczy to zwłaszcza pochodnych α-pirydyłowych, przy których obserwuje się wyraźne przesunięcie pasma, przy A-II od 259 do 256 nm, przy A-IV od 265 do 256 nm. Jeszcze większe różnice występują przy pochodnych typu B (ryc. 5 i 6). Odpowiednie pary połączeń B-I i B-II dają widma, w których nie można wyróżnić pasm charakterystycznych dla tej grupy związków. Bardzo zbliżone są widma analogów pirydyłowych oksadiazolu (II) (ryc. 7). Wartość λ max

Tab. 3

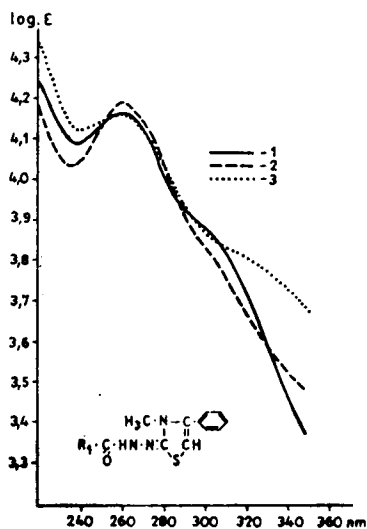


Związek	R ₁	Pasmo			
		λ max w nm		ε	
II	α-pirydył	246	313	19 270	20 020
	β-pirydył (4)	248	308	19 300	18 450
	γ-pirydył (5, 6)	247	319	20 500	17 700
IV	α-pirydył	256	282	9 500	12 250
	β-pirydył (4)	230	292	5 000	10 500
	γ-pirydył (5, 6)	234	318	5 300	15 200

pierwszego pasma jest dla wszystkich porównywanych połączeń jednakowa (246—248 nm). W przypadku pasma II w długofalowej części widma obserwuje się kolejne batochromowe przesunięcia w szeregu β-, α- i γ-pirydył (308—313—319 nm). Różne są natomiast widma połączeń IV (ryc. 8). Widoczny jest tutaj duży wpływ kolejnych rodników pirydylowych na silnie sprzężony układ 5-R₁-1, 3, 4-oksadiazolonu-2.

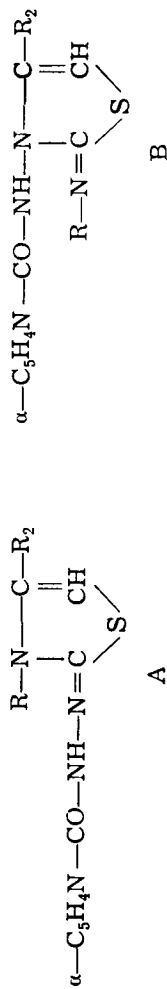


Ryc. 1. Widmo w nadfiolecie związku A-I; 1 — R₁=α-pirydył, 2 — R₁=β-pirydył, 3 — R₁=γ-pirydył
 Ultraviolet spectra of compounds A-I; 1 — R₁=α-Pyridyl, 2 — R₁=β-Pyridyl, 3 — R₁=γ-Pyridyl

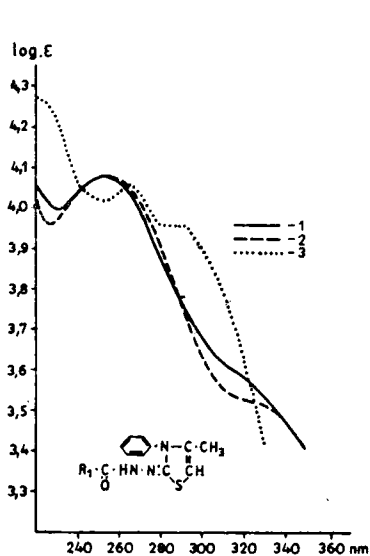


Ryc. 2. Widmo w nadfiolecie związku A-III; objaśnienia jak w ryc. 1
 Ultraviolet spectra of compounds A-III; explanations as in fig. 1

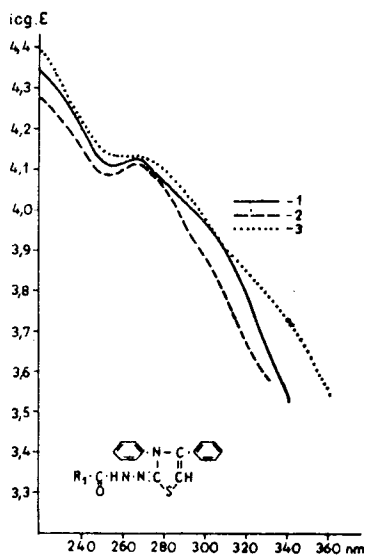
Tab. 4



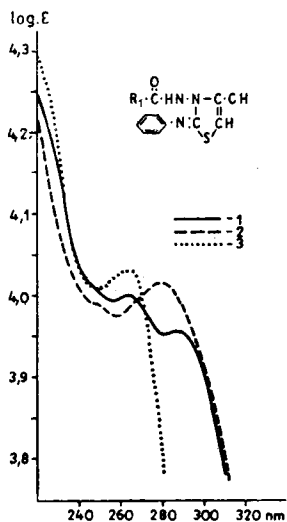
Związek	R		Pasma absorpcji w cm ⁻¹									
	R	R ₂	1362	1435	1520	1570	1618	1689	3062	3140	3290	3360
A-I	CH ₃	CH ₃										
A-II	C ₆ H ₅	CH ₃	1300	1431		1589	1625	1700	3062	3120	3162	
A-III	CH ₃	C ₆ H ₅	1302	1335	1430	1565	1590	1618	1690	3085	3270	3332
A-IV	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	1305	1322	1435	1551	1579	1605	1688	1700	3062	3129
B-I	C ₆ H ₅	CH ₃	1310	1430	1522	1595	1632	1679	3076	3280	3365	
B-II	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	1352	1429	1590	1622	1696	3070	3130	3230		



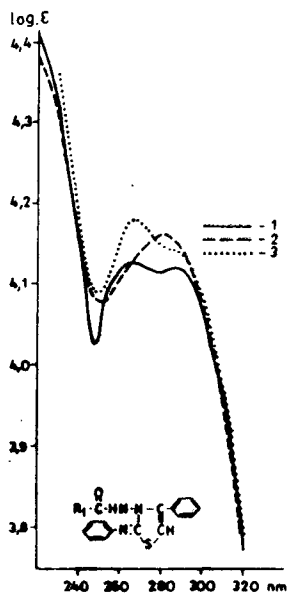
Ryc. 3. Widmo w nadfiolecie związku A-II;
objaśnienia jak w ryc. 1
Ultraviolet spectra of compounds A-II;
explanations as in fig. 1



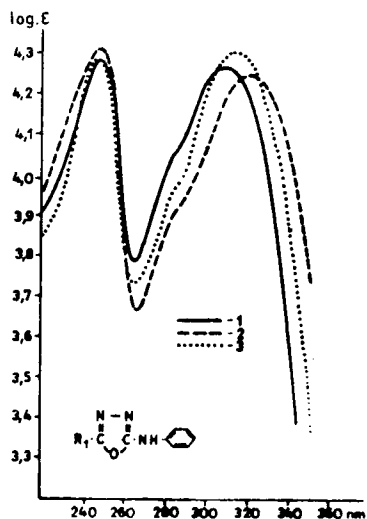
Ryc. 4. Widmo w nadfiolecie związku A-IV;
objaśnienia jak w ryc. 1
Ultraviolet spectra of compounds A-IV;
explanations as in fig. 1



Ryc. 5. Widmo w nadfiolecie związku B-I;
objaśnienia jak w ryc. 1
Ultraviolet spectra of compounds B-I;
explanations as in fig. 1

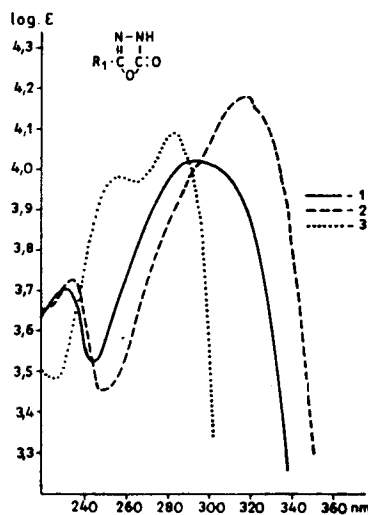


Ryc. 6. Widmo w nadfiolecie związku B-II;
objaśnienia jak w ryc. 1
Ultraviolet spectra of compounds B-II;
explanations as in fig. 1



Ryc. 7. Widmo w nadfiolecie oksadiazolu II; objaśnienia jak w ryc. 1

Ultraviolet spectra of 2-R₁-5-phenylamino-1,3,4-oxadiazole II; explanations as in fig. 1



Ryc. 8. Widmo w nadfiolecie oksadiazolonu IV; objaśnienia jak w ryc. 1

Ultraviolet spectra of 2-R₁-1,3,4-oxadiazolone IV; explanations as in fig. 1

Spektroskopia w podczerwieni

Pomiary przeprowadzono przy pomocy spektrofotometru UR-10 firmy Carl Zeiss (Jena), stosując zawiesiny w nujolu. Uzyskane wyniki przedstawione są w tab. 4. W porównaniu z połączeniami γ - i β -pirydylowymi nie obserwuje się zróżnicowania pasma grupy karbonylowej (pasma amidowe I) w zależności od struktury A lub B. Wszystkie badane związki wykazują absorpcję w stosunkowo wąskim zakresie 1679—1700 cm^{-1} .

Badania *in vitro**)

związków A-I do A-IV oraz B-I i B-II. W badaniach wirusostatycznych (wirus grypy A, A₂ i B) aktywność wykazał jedynie związek A-I przy stężeniu 500 mcg/ml. Badania bakteriostatyczne objęły 183 szczepy wrażliwe, średnio wrażliwe i odporne na działanie podstawowych antybiotyków i sulfonamidów następujących gatunków bakterii: *Staphylococcus aureus* i *albus*, *Escherichia coli*, *Streptococcus alfa* i *beta*, *Klebsiella rhinoscleromatis* i *ozenae*, *Proteus vulgaris*, *Pseudomonas aeruginosa*, prątki saprofityczne i patogenne H₃₇Rv. Odpowiednie działania wykazały związki A-I i A-IV w odniesieniu do 11% badanych gatunków. Badania przeciwgrzybicze przeprowadzono na 42 szczepach *Candida albicans*. Związki A-I i A-II wykazały aktywność w stosunku do wszystkich badanych drożdżaków.

*) Badania wykonane zostały w Katedrze Mikrobiologii Lekarskiej Akademii Medycznej w Lublinie.

CZĘŚĆ DOŚWIADCZALNA

1. /4-fenylo-3-metylo-2, 3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydrazyd kwasu pikolinowego (A-III).

a) Mieszaninę 2,2 g 4-metylo-tiosemikarbazydu kwasu pikolinowego oraz 1,65 g ω -chloroacetofenonu w 15 ml metanolu ogrzewano do wrzenia w ciągu 4 godz. Otrzymany roztwór oziębiono, rozcieńczono wodą i zobojętniono amoniakiem. Wydzielony osad odsączono, przemyto metanolem. Po krystalizacji z benzenu bezbarwne słupki o t.t. 154—156°C. Wydajność 2,7 g (90%).

Analiza:

Dla wzoru $C_{16}H_{14}N_4OS$.

Obliczono: 61,91% C, 4,54% H, 18,05% N

Otrzymano: 61,71% C, 4,58% H, 18,24% N.

Pikrynian

Do roztworu 1,2 zasady A-III w 10 ml ciepłego metanolu dodano 0,98 g kwasu pikrynowego i ogrzewano do wrzenia w ciągu 0,5 godz., następnie oziębiono. Wytrącony osad odsączono, przekrystalizowano z metanolu. Wydajność 1,6 g (76%) Żółte słupki o t.t. 198—200°C.

Analiza

Dla wzoru $C_{22}H_{17}N_7O_4S$.

Obliczono: 48,97% C, 3,12% H

Otrzymano: 48,69% C, 3,29% H.

b) Stop otrzymany przez ogrzanie 1,85 g 3-metylo-4-fenylo-tiazolotionu-2 (7) i 1,15 g siarczanu dwumetylowego rozpuszczono w 10 ml etanolu, dodano 2,42 hydrazynu kwasu pikolinowego i ogrzewano do wrzenia 1 godz. Otrzymany roztwór oziębiono, dodano równą objętość wody i zobojętniono rozcieńczonym amoniakiem. Wydzielony produkt zawieszono w 20 ml wody, ogrzano do wrzenia. Pozostałość odsączono i przekrystalizowano z benzenu. Wydajność 2,05 g (74%). Bezbarwne słupki o t.t. 154—156°C.

Analiza:

Dla wzoru $C_{16}H_{14}N_4OS$.

Obliczono: 18,05% N; Otrzymano: 18,28% N.

Mieszanina ze związkiem otrzymanym w pkt 1a topi się bez depresji.

2. /3,4-dwufenylo-2,3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydrazyd kwasu pikolinowego (A-IV) i 2-fenyloimino-3-pikolinoiloamino-4-fenylo-4-tiazolina (B-II).

Mieszaninę 10 g 4-fenylo-tiosemikarbazydu kwasu pikolinowego i 5,7 g ω -chloroacetofenonu w 30 ml metanolu ogrzewano do wrzenia w ciągu 5 godz. Otrzymany roztwór oziębiono, rozcieńczono 200 ml wody i zobojętniono nasyconym roztworem octanu sodu. Wydzielony osad odsączono, wysuszono (13,65 g), a następnie wyekstrahowano 270 ml wrzącego metanolu. Nierozpuszczoną część przekrystalizowano 2-metoksy-etanolu otrzymując 4 g (29%) 2-fenyloimino-3-pikolinoiloamino-4-fenylo-4-tiazolinę (B-II). Bezbarwne słupki o t.t. 218—220°C.

Analiza:

Dla wzoru $C_{21}H_{16}N_4OS$.

Obliczono: 67,71% C, 4,33% H, 15,04% N

Otrzymano: 67,82% C, 4,41% H, 14,85% N

Ekstrakt metanolowy odparowano pod zmniejszonym ciśnieniem do sucha.

Pozostałość zawieszono w 20 ml zimnego chloroformu, pozostawiono na 0,5 godz., następnie przesączono. Osad przekrystalizowano z 2-metoksy etanolu, otrzymując dodatkowo 0,5 g związku B-II (łącznie wydajność 4,5 g 32,6%).

Pikrynian

0,8 g zasady B-II rozpuszczono na gorąco w 50 ml mieszaniny metanol: 2-metoksy-etanol (1:1) i ogrzewano do wrzenia w ciągu 0,5 godz. Roztwór oziębiono, wydzielony osad odsączono, przekrystalizowano z metanolu. Żółte słupki o t.t. 229—230°C. Wydajność 0,85 g (66%).

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{27}H_{19}N_7O_8S$.

Obliczono: 53,91% C, 3,18% H,

Otrzymano: 53,68% C, 3,22% H.

Przesącz chloroformowy odparowano. Suchą pozostałość przekrystalizowano z mieszaniny 2-metoksy-etanol (2 : 3) otrzymując 3,4-dwufenylo-2, 3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydrazyd kwasu pikolinowego (A-IV). Bezbarwne słupki o t.t. 198—200°C. Wydajność 3,8 g (27%).

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{21}H_{16}N_4OS$.

Obliczono: 67,71% C, 4,33% H, 15,04% N

Otrzymano: 67,52% C, 4,28% H, 15,04% N.

Dwupikrynian

0,5 g związku A-IV i 0,67 g kwasu pikrynowego w 25 ml metanolu ogrzewano do wrzenia w ciągu 0,5 godz. Roztwór oziębiono, wydzielony osad odsączono i przekrystalizowano z etanolu. Żółte płytki o t.t. 161—163°C. Wydajność 1g (91%).

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{33}H_{22}N_{10}O_{15}S$.

Obliczono: 47,71% C, 2,66% H

Otrzymano: 47,52% C, 2,38% H

3. 3, 4-dwufenylo-2, 3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydrazyd kwasu pikolinowego (A-IV).

2,45 g 3, 4-dwufenylo-tiazolionu-2 (7) ogrzewano z 1,26 g siarczanu dwumetylowego do całkowitego rozpuszczenia osadu. Klarowny stop rozpuszczono w 6 ml etanolu, dodano 1,23 g trójetyloaminy oraz 2,5 g hydrazynu kwasu pikolinowego. Całość ogrzewano do wrzenia w ciągu 0,5 godz., oziębiono, wydzielony osad odsączono, zagotowano z 25 ml wody, przesączono na gorąco. Po krystalizacji z 20% metanolu bezbarwne słupki o t.t. 198—200°C. Wydajność 1,9 g (57,6%).

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{21}H_{16}N_4OS$.

Obliczono: 15,04% N; Otrzymano: 15,14% N.

Mieszanina ze związkiem otrzymanym w pkt 2 topi się bez depresji.

4. 3,4-dwufenylo-2,3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydrazyd kwasu pikolinowego (A-IV), 2-fenyloimino-3-pikolinoilamino-4-fenylo-4-tiazolina (B-II) i 5- α -pirydylo/-2-fenyloamino-1,3,4-oksadiazol (II).

Mieszaninę 4 g 4-fenylo-tiosemikarbazydu kwasu pikolinowego, 6 g bez-

wodnego octanu sodu, 2,3 g ω-chloroacetofenonu w 40 ml metanolu ogrzewano do wrzenia w ciągu 2 godz., następnie roztwór z osadem oziębiono i przesączono. Wydajność 4,65 g — frakcja a. Przesącz metanolowy zateżono pod zmniejszonym ciśnieniem do małej objętości. Wydzielony osad odsączono, przemyto wodą, przekrystalizowano z etanolu otrzymując bezbarwne igły 5-*a*-pirydylo/-2-fenyloamino-1,3,4-oksadiazolu (II) o t.t. 238—240°C. Wydajność 0,2 g (6,4%).

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{13}H_{10}N_4O$.

Obliczono: 23,51% N; Otrzymano: 23,59% N.

Mieszanina ze związkami otrzymanym przez hydrolizę alkaliczną zasady B-I (cz. I pkt 7c) topi się bez depresji.

Frakcja a — 4,65 g rozpuszczono na zimno w 70 ml metanolu nasyconego gazowym HCl, zadano nadmiarem eteru. Wydzielony chlorowodorek odsączono, rozpuszczono w 20 ml wody, zobojętniono roztworem octanu sodowego — 1,4 g produktu (frakcja b). Przesącz eterowy odparowano, pozostałość zawieszono w wodzie, zadano octanem sodu. Otrzymany osad — 1,99 g (frakcja c) wyekstrahowano 50 ml gorącego metanolu. Nierozpuszczoną część przekrystalizowano z octanu etylu, otrzymując 0,85 g (18,6%) 2-fenyloimino-3-pikolinoiloamino-4-fenylo-4-tiazoliny (B-II). Bezbarwne słupki o t.t. 218—220°C.

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{21}H_{16}N_4OS$.

Obliczono: 15,04% N; Otrzymano: 15,08% N.

Mieszanina ze związkami otrzymanym w pkt. 2 topi się bez depresji.

Frakcja b — 1,4 g wyekstrahowano 50 ml gorącego metanolu. Ekstrakty metanolowe z frakcji b i c połączono, zateżono do małej objętości. Wydzielony osad odsączono, zawieszono w 10 ml chloroformu. Po 0,5 godz. przesączono. Przesącz chloroformowy odparowano. Suchą pozostałość przekrystalizowano z metanolu otrzymując 0,48 g (8,8%) /3,4-dwufenylo-2,3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydryazydu kwasu pikolinowego (A-IV). Bezbarwne słupki o t.t. 198—200°C.

A n a l i z a:

Dla wzoru $C_{21}H_{16}N_4OS$.

Obliczono: 15,04% N; Otrzymano: 15,24% N.

Mieszanina ze związkami otrzymanymi w pkt. 2 i 3 topi się bez depresji

Reakcje /3,4-dwufenylo-2,3-dwuhydro-tiazolideno-(2)/-hydryazydu kwasu pikolinowego (A-IV).

15% wodny roztwór HCl: 2-fenyloimino-3-amino-4-fenylo-4-tiazolina. 1 g związku A-IV w 20 ml 15% HCl ogrzewano do wrzenia w ciągu 1,5 godz. Roztwór oziębiono, wydzielony produkt rozpuszczono w 50% metanolu i zobojętniono amoniakiem. Po krystalizacji z metanolu bezbarwne kryształy o t.t. 196—198°C. Wydajność 0,6 g (84%).

A n a l i z a:

Dla wzoru: $C_{15}H_{13}N_3S$.

Obliczono: 15,71% N; Otrzymano: 15,97% N.

Mieszanina z 2-fenyloimino-3-amino-4-fenylo-4-tiazoliną otrzymaną wg H ü n i g a (8) topi się bez depresji.

Pochodna p-nitro-benzylidenowa

Mieszaninę 0,2 g tiazoliny i 0,12 g aldehydu p-nitro-benzoesowego w 10 ml metanolu ogrzewano do wrzenia w ciągu 6 godz., następnie oziębiono, osad odsączono, przemyto metanolem. Po krystalizacji z mieszaniny 2-metoksy-etanol:metanol (3:1) czerwone igły o t.t. 163—164°C. Wydajność 0,15 g (50%). Mieszanina z pochodną p-nitro-benzylidenową otrzymaną wg H ü n i g a (8) topi się bez depresji.

PIŚMIENNICTWO

1. Shigeru Yoshida, Motosugu Asai: Patent japoński 10230, 30, 11, 1956.
2. Gehlen H., Möckel K.: Liebigs Ann. Chem. 660, 144—147, 1962.
3. Masaki Ohta, Hiromoto Ueda.: Nippon Kagaku Zasshi. 82, 1530—1533, 1961.
4. Biliński S., Bielak L.: Ann. Univ. Mariae Curie-Skłodowska, Lublin, sectio D, 28, 171—187, 1973.
5. Biliński S.: Ann. Univ. Mariae Curie-Skłodowska, Lublin, sectio AA, 13, 183—202, 1968.
6. Biliński S.: Ann. Univ. Mariae Curie-Skłodowska, Lublin, sectio AA, 13, 203—222, 1968.
7. Kendall J. D., Suggate H. G.: J. Chem. Soc. 1503—1509, 1949.
8. H ü n i g S., Lampe W.: J. Prakt. Chem. 8, 264—278, 1959.

Otrzymano 7 V 1974.

Р Е З Ю М Е

Исследована реакция конденсации 4-R-тиосемикарбазида пиколиновой кислоты ($R = \text{CH}_3, \text{C}_6\text{H}_5$) с ω -хлорацетофеноном. Установлен ход реакции в разных направлениях. Если $R = \text{CH}_3$, то образуется производное гидразона А (А-III). Если $R = \text{C}_6\text{H}_5$, то в среде метанола получается смесь соединений А-IV и В-II; в присутствии безводного CH_3COONa получают совместно соединения А-IV, В-II и производное оксадиазола II. Изучены превращения соединений А-IV и В-II в условиях кислотного и щелочного гидролиза. Представлены результаты спектрофотометрического анализа (УФ, ИК) и антибактериального действия синтезированных соединений.

S U M M A R Y

The reaction of the condensation of picoline acid 4-R-thiosemicarbazide ($R = \text{CH}_3, \text{C}_6\text{H}_5$) with ω -chloroacetophenone was examined. The reaction may run in various directions. When $R = \text{CH}_3$ hydrazone A derivative (A-III) is obtained. When $R = \text{C}_6\text{H}_5$ in the methanol medium a mixture of the compounds AIV and B-II is obtained; in the presence of anhydrous sodium acetate, A-IV, B-II and oxadiazole derivative II are simultaneously obtained. The regroupment of compounds A-IV and B-II in acid and alkaline conditions was examined. The results of the spectrophotometrical analysis (UV, IR) and in vitro examinations of the obtained compounds are presented.

