جامعة الموصل
كلية التربية للعلوم الصرفة

تحضير وتشخيص مركبات حلقية غير متجانسة عن طريق تفاعل الغلق الحلقي للايمينات وتقييم فعاليتها البايولوجية

احمد مهدي صالح

رسالة ماجستير

الكيمياء

بإشراف

الاستاذ المساعد

الدكتور مهند يقضان صالح

١٤٤٣ هـ

٢٠٢٢ م

المستخلص

تم في هذا البحث تحضير وتشخيص عدد من المركبات الحلقية غير المتجانسة ، ابتداءا" بالحلقة الرباعية كمشتقات (3-كلورو-4-أريل الازيتيدين-2-اون) وخماسية الحلقة مثل معوض (3,2 ثنائي اريل الثايازولدين-4-اون) ومشتقات (5,1-ثنائي أريل التترازول) ، إضافة الى مشتقات الحلقة السباعية الاوكسازبين-4،7-ثنائي اون باستخدام قواعد شيف والهيدرازونات كمركبات وسطية للتفاعلات والمسارات التالية تلخص العمل:-

المسار الأول: تضمن تحضير عدد من مركبات قواعد شيف (A_{1-6}) عن طريق تفاعل مشتقات البنزالديهايد اوالكيتون الاروماتية مع الامينات المناسبة ومن ثم حولقة هذه المركبات بواسطة الفا - كلورو خلات الكلوريد لتكوين مشتقات الحلقة الرباعية الازتيدين-2-أون (A_{7-12}) ، كما تم في هذا المسار تحضير مشتقات الحلقة الخماسية (3,2 ثنائي اريل الثايازولدين-4-اون)- اون (A_{13-18}) من مفاعلة قواعد شيف مع حامض الثايوكلايكولك ، كذلك حولقة مركبات قواعد شيف بواسطة ازيد الصوديوم لتحضير مشتقات (5,1-ثنائي أريل التترازول) (A_{19-22}) ، حضرت الحلقة السباعية الاوكسازبين - 7,4-ثنائي اون (A_{25-36})من مفاعلة قواعد شيف مع انهيدريد الماليك وانهيدريد الفثاليك.

المسار الثاني: تضمن هذا المسار تحضير عدد من الهيدرازونات (A_{45-49}) وذلك من مفاعلة مشتقات البنزالديهيد مع هيدرازيد حامض الديكانويك (A_{44}) ثم مفاعلتها مع كواشف حولقة مختلفة ، حيث تم مفاعلتها مع الفا - كلورو خلات الكلوريد لتحضير مشتقات (3-كلورو-4-أريل الازيتيدين-2-اون) (A_{50-54}) ومن مفاعلتها مع حامض كلايكوليك لتخليق مشتقات (3,2 ثنائي اريل الثايازولدين-4-اون) (A_{55-59})، ومن خلال مفاعلة الهيدرازونات مع ازيد الصوديوم نحصل على مشتقات التترازول (A_{60-64})، وحضرت مشتقات الاوكسازبين-4،7-ثنائي ون (A_{65-74}) من مفاعلة الهيدرازونات (A_{44}) مع انهيدريد الماليك مره وانهيدريد الفثاليك مرة أخرى.

المسار الثالث: في هذا المسار تم تحضير مشتق البايرازول–3–اون (A_{75}) من مفاعلة هيدرازيد حامض الديكانويك (A_{44}) مع اسيتو خلات الاثيل وثم تفاعل مشتق البايرزول–3–اون مع مشتقات البنزالديهايد للحصول على مربكات الجالكون.(A_{76-80})

المسار الرابع: حضر في هذا المسار مشتق 2،1 – بس (4 – ميثوكسي بنزيليدين) هيدرازين (A_{81}) من مفاعلة مولات مضاعفة من 4–ميثوكسي بنزالديهيد مع الهيدرازين المائي ، بعد ذلك تم مفاعلته مع مركبات قواعد شيف (A_{1-6}) .

تم تشخيص المركبات المحضرة باستخدام الطرق الطيفية المتاحة (FTIR, ^{1}H-NMR) وقد دلت النتائج المستحصلة على صحة التراكيب المسندة لهذه المركبات.

وأخيرا تم تقييم الفعالية البايولوجية للمركبات المحضرة ضد نوعين من البكتريا الموجبة *Staphylococcus aureus* والسالبة *Eschershia Coli* لصبغة كرام في مختبرات الطب البيطري لجامعة الموصل وعند مقارنة نتائج التقييم مع مركبات دوائية قياسية تبين ان لبعض المركبات المحضرة فعالية دوائية .

Abstract

In this research, the synthesis and identification of a number of heterocyclic compounds, starting with the four membered ring as derivatives of azitidine-2-on and five- membered ring such as the thiazolidine-4-one and tetrazole derivatives, in addition to the derivatives of the oxazepin-4,7- dione using Schiff base and hydrazones compounds as intermediates .

The first path: included the preparation of a number of Schiff base compounds (A_{1-6}) by reacting aromatic benzaldehyde or ketone derivatives with amines and then cyclizing these compounds by α-chloroacetyl chloride to form derivatives of the tetracyclic azetidine-2-one (A_{7-12}), as In this pathway, the derivatives of the thiazolidine-4-one (five membered ring) (A_{13-18}) were prepared from the reaction of Schiff's bases with thioglycolic acid, as well as the cyclization of Schiff's bases compounds by sodium azide to prepare tetrazol derivatives (A_{19-22}), creating the seven membered-ring oxazepine, 4- dione (A_{25-36}) from the reactance of Schiff bases with maleic anhydride and phthalic anhydride respectively.

The second path: This path included the preparation of a number of hydrazones (A_{45-49}) from the reaction of substituted benzaldehyde with decanoic acid hydrazide (A_{44}) through their reactance with different cyclic reagents, where they were reacted with α-chloroacetyl chloride to prepare substituted azitidine-2- one (A_{50-54}) and its reaction with glycolic acid to synthesize the derivatives of thiazolidine-4-(A_{55-59}), and through the reaction of hydrazones with sodium azide, we get derivatives for trazole (A_{60-64}), and the derivatives of oxazepine-4,7-dione were created. (A_{65-74}) from reacting the hydrazones (A_{44}) with maleic anhydride afforded and phthalic anhydride again.

The third path: In this path, the pyrazole-3-on derivative (A_{75}) was prepared from the reaction of decanoic acid hydrazide (A_{44}) with ethyl acetoacetate, and then the pyrazole-3-on derivative was reacted with benzaldehyde derivatives to obtain chalcon (A_{76-80}).

The fourth pathway: In this pathway, a derivative 1,2-bis(4-methoxybenzylidene)hydrazine (A_{81}) was prepared from the reaction of tow equivalent moles of 4-methoxybenzaldehyde with aqueous hydrazine, after

which it was reacted with Schiff bases compounds (A_{1-6}) to form of 1,2,4-triazine derivatives with via Diels-Alder like reaction (A_{82-86}).

The identity of the prepared compounds was determined using physical constants and spectroscopic methods (infrared and nuclear magnetic resonance spectroscopy) and the biological activity was evaluated in veterinary laboratories using two types of gram-positive and gram-negative bacteria.

University of Mosul
College of Education
For Pure Science

Synthesis and characterization heterocyclic compounds via cycloaddition reaction of imines and evaluation of their biological activity

Ahmed Mahdi Salih

M. Sc. Thesis

Chemistry

Supervised By
Assist. Prof.
Dr. Mohanad Yaqdhan Salih

2022 A.D. 1443 A.H.