



وزارة التعليم العالي والبحث العلمي
جامعة الموصل
كلية العلوم

تحضير وتشخيص بعض معوضات الأيساتين الحاوية
على حلقات خماسية وسداسية غير متجانسة
وفحص فعاليتها البيولوجية المتوقعة

رسالة تقدمت بها الطالبة

سميران علي خلف

إلى

مجلس كلية العلوم في جامعة الموصل وهي من متطلبات نيل درجة
الماجستير في

أختصاص علوم الكيمياء / عضوية

بإشراف

أ.د. سعد محمد حسين الماجدي

الخلاصة

تضمنت الرسالة تحضير سلسلة من مركبات حلقة غير متجانسة حاوية على حلقات خماسية وسداسية. من خلال عدة محاور:

المحور الاول: تضمن تحضير سلسلة جديدة من مركبات 3-(ايمينوبيردين)-H1-اندولين-2-اون [1] , 1-(α -كلورواسيتايل)-3-(بيردين-2-يل ايمينو)-اندولين-2-اون [2] و 2-(ازايد اسيتايل)-3-(بيردين-2-يل ايمينو)-اندول [3].

حُضرت المركبات [3-1] باتباع الطرق المختلفة الاتية:

1. حُضر 3- (ايمينوبيردين)-H1-اندولين-2-اون [1] (قاعدة شيف) من خلال تفاعل الايساتين مع 2-امينو بيردين في الايثانول المطلق باستخدام حامض الخليك الثلجي كعامل مساعد.

2. حُضر المركب 1-(α -كلورواسيتايل)-3-(بيردين-2-يل ايمينو)-اندولين-2-اون [2] من خلال تفاعل 3- (امينو بيردين)-H1-اندولين-2-اون [1] مع هيدريد الصوديوم وكلورواسيتايل كلورايد بوجود ثنائي فورما اميد مذيبا للتفاعل.

3. حُضر المركب 2-(ازيد اسيتايل)-3-(بيردين-2-يل ايمينو)-اندولين-2-اون [3] من خلال تفاعل 1-(α -كلورواسيتايل)-3-(بيردين-2-يل ايمينو)-اندولين-2-اون [2] مع ازيد الصوديوم في ثنائي فورما اميد كمذيب للتفاعل.

المحور الثاني: : تضمن تحضير سلسلة جديدة من [N-(بنزايلدين معوض)-4-انيلين معوض

[4a-g]

هذه المركبات خُضرت من خلال مفاعلة انيلين معوض في موقع بارا مع بعض الالديهيدات الاروماتية في الايثانول المطلق كمذيب وباستعمال حامض الخليك الثلجي كعامل مساعد.

المحور الثالث: : تضمن تحضير سلسلة جديدة من [N-(1-اسيتو-4-فينايلين معوض)-5-فينايل معوض-1,4,5-تراي هايدرو-1,2,3,4-تيترازول-اين-1-يل]-3-(بيردين-2-يلامينو)-اندول-2-ون [5a-g] من خلال معاملة مركبات قاعدة شيف [4a-g] مع المركب [3]-2-(ازيداسيتايل)-3-(بيردين-2-يلامينو)-اندول-2-ون في ثنائي مثيل فورما اميد وكما مبين في المخطط (3):

المحور الرابع: تضمن استخدام طرق تحضير مختلفة لتحضير مركبات متنوعة للايساتين تحتوي حلقات غير متجانسة (1, 2, 3-ترايازول و 1, 2, 3-ترايازولين).

حضرت المركبات التالية من خلال الخطوات التالية:

1. الغلق الحلقي للمركب [3] بتفاعله مع مركبات α, β -غير المشبعة في DMF اعطى [(1-اسيتو 4, 5-ثنائي التعويض-4-5-ثنائي هايدرو-ترايازولين)-1-يل]-3-(بيردين-2-يلامينو)-اندول-2-ون [6a-h].
2. الغلق الحلقي للمركب [3] بتفاعله مع مركبات 1, 3-ثنائيكيتون او β -كيتو استر اعطى [(1-اسيتو 4, 5-ثنائي التعويض)-1H-ترايازول-3-(بيردين-2-يلامينو)-اندول-2-ون] [7a-c].

المحور الخامس: تضمن اختبار الفعالية المضادة للميكروبات مختبرياً لبعض المركبات ضد نوع من البكتيريا موجبة الصبغة (*Staphylococcus aureus*) و نوع من البكتيريا سالبة الصبغة (*Escherichia coli*) وعلاوة على ذلك اختبرت الفعالية المضادة للفطريات ايضاً ضد نوعين من الخمائر الشبيهة بالفطر المرضي :

(Trichophyton tonsurans and Candida albicans).

تم اجراء اختبار الفعالية المضادة للميكروبات في تركيز واحد للمركبات المختبرة . اظهرت النتائج فعالية بايولوجية جيدة للمركبات ضد الاحياء المجهرية المذكورة اعلاه.

**Ministry of Higher Education
And Scientific Research
University of Mosul
College of Science**



**Synthesis and Characterization of Some
Substituted Isatin Containing Five, Six
Heterocyclic Ring and Test
Their expected Biological Activity**

M.Sc. thesis *Submitted By*

Sameran Ali Khalaf

To

To Council of the College of Science University of Mosul in Partial Fulfillment
of the Requirements for the Master's degree

In

Chemistry/Organic Chemistry

Supervised by

Assist. Prof. Dr. Suaad Mohammed Hussein Al-Majidi

2017 A.D

1438 A.H

ABSTRACT

The present work include synthesis of a series of new heterocyclic derivatives containing five and six membered, which includes the following parts:

Part one: includes The synthesis of new sequences for preparation of series of 3-(iminopyridine)-1H-indole-2-one ,1-(α -chloroacetyl)-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one and 2-(azido acetyl)-3-(pyridine-2-yl imino)-indole-2-one[1-3]

Synthesis of compounds [1-3] was performed by the following different routes:

1. Preparation of 3-(iminopyridine)-1H-indole-2-one[1](Schiff base) by reaction of isatin with 2-amino pyridine in absolute ethanol by using glacial acetic acid as a catalyst.
2. Synthesis of 1-(α -chloroacetyl)-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one [2] by reaction of 3-(iminopyridine)-1H-indole-2-one[1] with chloro acetyl chloride in the presence of sodium hydride as a catalyst in dimethylformamide at 0°C.
3. Synthesis of 2-(azido acetyl)-3-(pyridine-2-yl imino)-indole-2-one[3] by reaction of 1-(α -chloroacetyl)-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one[2] with sodium azide in dimethylformamide as a solvent.

Part two: involved the preparing of new N - (substituted benzylidene) -4-substituted aniline(Schiff bases). These Compounds are synthesized by reaction of p-substituted aniline with different aromatic aldehyde in absolute ethanol as a solvent by using glacial acetic acid as a catalyst [4a-g].

Part three: Involved the application of synthetic method of new N-[(1-aceto-4-(substitutedphenylene)-5-(substitutedphenyl-1,4,5-trihydro-1,2,3,4-tetrazol-ine-1-yl)]-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one [5a-g] via treated Schiff base compounds [4a-g] with 2-(azido acetyl)-3-(pyridine-2-yl imino)-indole-2-one in dimethylformamide.

Part four: Involved the application of different synthetic methods in synthesis of different new isatin compounds containing different types of hetero rings (1, 2, 3-triazole and 1, 2, 3-triazoline)

The compounds were performed via the following steps:

1. Compound [3] cyclized by reaction with α,β -unsaturated compounds in dimethylformamide to give (1-aceto-4,5-disubstituted-4,5-dihydro-1H-triazoline)-1-yl]-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one [6a-h].
2. The synthesis of cyclization of compounds [3] with 1,3-diketone or β -keto ester compounds to give (1-aceto-4,5-disubstituted)-1H-triazole-3-(pyridine-2-ylimino)-indole-2-one [7a-c].

Part five: involved evaluation of the antimicrobial screening *invitro* of some of the prepared compounds against one types of Gram positive bacteria including (*Staphylococcus aureus*) and one types of Gram negative bacteria including (*Escherichia coli*). More, antifungal activities of some prepared compounds performed against two types of yeast-like pathogenic fungus (*Candida albicans* and *Trichophyton*).

The antimicrobial screening carried out in one concentration of tested compounds. The results showed that the tested compounds have good biological activity against the mentioned organisms.