

تحضير بعض مشتقات 1, 3, 4-اوكساديازول الجديدة من حامض الاندوميثاسين وتقييم فعاليتها الحيوية

نوره عامر حسين، هيفاء يونس حسين، شيما هاشم عبدالرحمن*
قسم الكيمياء، كلية العلوم، جامعة الموصل، العراق



This work is licensed under a [Creative Commons Attribution 4.0 International License](https://creativecommons.org/licenses/by/4.0/)

<https://doi.org/10.54153/sjpas.2024.v6i2/2.670>

الخلاصة:

تضمن البحث تحضير 5-امينو-4,3,1-اوكساديازول-2-يل من خلال مفاعلة حامض الاندوميثاسين مع السيمي كاربازايد هيدروكلورايد وباستعمال أوكسي كلوريد الفوسفور $POCl_3$ كعامل حولقة وبمساعدة هيدروكسيد البوتاسيوم، ومن ثم مفاعلة 5-امينو-4,3,1-اوكساديازول-2-يل مع الالديهيدات للحصول على أنواع جديدة ومختلفة من قواعد شيف. تم دراسة الفعالية الحيوية للمركبات المحضرة ضد بكتريا *E-coli*. ولقد شخصت تراكيب المركبات المحضرة الجديدة باستعمال الطرائق الفيزيائية وقياس اطيف H^1-NMR و IR.

معلومات البحث:

تاريخ الاستلام: 2023/08/13

تاريخ التعديل: 2023/09/30

تاريخ القبول: 2023/10/02

تاريخ النشر: 2024/08/30

الكلمات المفتاحية:

اندوميثاسين، اوكساديازول، الفعالية

الحيوية، IR، NMR

معلومات المؤلف

الايمل:

shaymaa.hashim@uomosul.edu.iq

الموبايل:

المقدمة:

الاندوميثاسين هو أحد مشتقات حامض الخليك والذي ينتمي إلى أدوية مضادات الالتهاب غير الستيرويدية [1]، هذا المركب هو واحد من أكثر مضادات الروماتيزم [2] فائدة ومن الأدوية والعقاقير الأولية الموصى بها لعلاج النقرس [3] وأمراض الكولاجين [4] وهشاشة العظام [5] وآلام الكتف الحادة [6].

الأوكساديازول هو الوحدة النشطة بيولوجيًا في عدد من المركبات، وتمثل مشتقات الأوكساديازول فئة مهمة من المركبات الحلقية غير المتجانسة مع طيف واسع من النشاط الحيوي [7]، مشتقات الأوكساديازول لها أنشطة مضادة للسرطان [8]، ومضادة للجراثيم والالتهابات [9]، ومضادة للسكري [10]، ومسكن للألام [11]. أما تطبيقاتها الصناعية فتتمثل في صناعة الاصباغ [12] والبوليمرات المقاومة للحرارة [13] وصناعة المواد المفلورة (المشعة) [14] والمواد التي تطلق الوميض [15].

قواعد شيف هي من المركبات العضوية الأكثر استخداما، التي سميت على اسم هوغو شيف [16]، تحضر من تفاعل أي أمين أولي مع الألدريد أو الكيتون في ظل ظروف محددة وهي نظير نيتروجين للألدريد أو الكيتون [17] وذلك باستبدال مجموعة الكربونيل (C=O) بمجموعة imine أو azomethine، أستخدمت كأصباغ [18]، وكمحفزات [19]، وكمركبات وسيطة في التخليق العضوي [20]، وكمثبتات بوليمر [21].

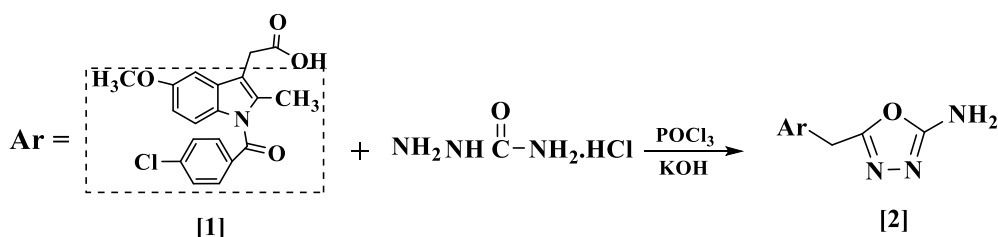
الجزء العملي:

قيست درجات الانصهار باستعمال جهاز apparatus stuart SPM30.Melting point، وأخذت أطياف الرنين النووي المغناطيسي للبروتون $^1\text{H-NMR}$ باستعمال Bruker 400MHz, 100MHz وباستعمال الكلوروفورم المديتر وثنائي ميثيل اوكسيد الكبريت المديتر ($\text{CDCl}_3, \text{DMSO-d}_6$) كمذيبات مع رباعي ميثيل السيليكون كمادة قياسية. أما طيف الأشعة تحت الحمراء فقد تم قياسه باستعمال جهاز BRUKER(4000-400 cm^{-1})، وكما تم استعمال تقنية كروماتوغرافيا الطبقة الرقيقة باستعمال نظام مذيب Ethyl acetate: Petroleum ether (1:2)، (TLC Silica gel 60 F₂₅₄) . وتم استخدام ضوء الأشعة فوق البنفسجية (UV) ومحلول اليود لإظهار مواقع الازاحة للمركبات المحضرة وحساب قيمة معامل الاعاقة (R_f) لها.

جميع المواد الكيميائية المستعملة خلال البحث مجهزة من قبل الشركات (Aldrich)، (BDH)، (Fluka).

تحضير الاوكسادايازول [2] [22]:

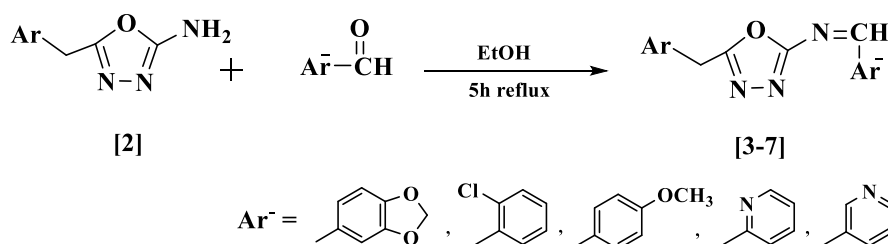
Synthesis of (3-((5-amino-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-1-yl)(4-chlorophenyl)methanone[2]:



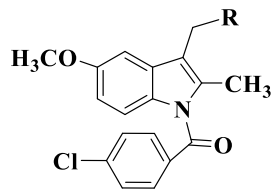
يسخن (0,0001 مول، 0,357 غرام) من حامض الاندوميثاسين و (0,0001 مول، 0,111 غرام) من السيمي كاربازيد $\text{CH}_5\text{N}_3\text{O.HCl}$ في (3 مل) من أوكسي كلوريد الفوسفور POCl_3 في حمام مائي لمدة (45) دقيقة في دورق دائري سعة (25 مل)، يُبرد الخليط الى درجة حرارة المختبر ويُضاف إليه وبصورة تدريجية (3 مل) من الماء، ثم يُصعد الخليط لمدة 4 ساعات، يُرشح المحلول وهو ساخن ويُغسل الراسب بالماء الدافئ، يُعاد الراسب باستعمال محلول هيدروكسيد البوتاسيوم المشبع، ويُترك لمدة (12) ساعة لإكمال عملية الترسيب، بعدها يُرشح الراسب وتُعاد بلورته من الإيثانول للحصول على راسب ذي لون بني، درجة انصهاره ($229-231^\circ\text{C}$)، ($R_f = 0.76$) وبنسبة ناتج (71%).

تحضير قواعد شيف [3-7] [23, 24]:

يُصعد مزيج من الأوكسادايازول المحضر [2] (0,0005 مول، 0,2 غرام) و(0,0005 مول) من أحد الالديهيدات في (10 مل) من الإيثانول المطلق في دورق دائري سعة (25 مل) ولمدة (5) ساعات، بعد انتهاء مدة التصعيد، يُبرد مزيج التفاعل ويُرشح للحصول على راسب، يغسل الراسب بالايتر ثم تُعاد بلورته من الإيثانول، قيم الثوابت الفيزيائية مبينة في الجدول (1).



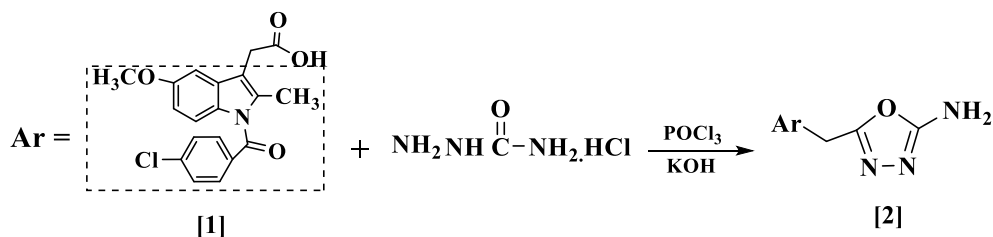
الجدول 1: الخصائص الفيزيائية للمركبات [3-7]



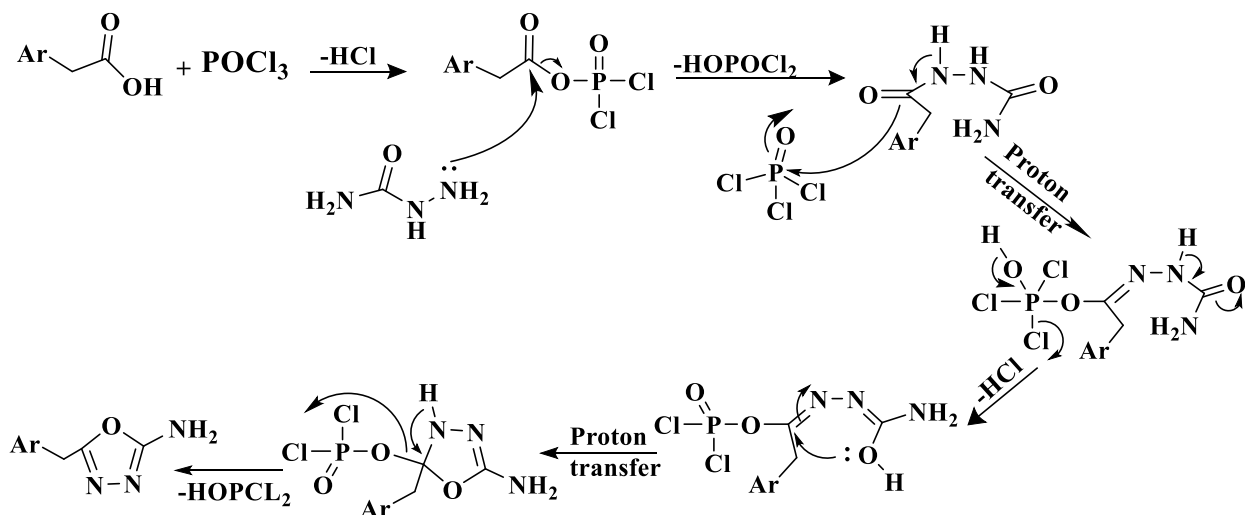
Comp .No.	R	Name of Compound	Molecular Formula	m.p.(°C)	Yield %	R _f	Color
3		(3-((5-((4-((1-oxidaneyl)methoxy)-3-methylbenzylidene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-1-yl)(4-chlorophenyl)methanone	C ₂₉ H ₂₄ ClN ₄ O ₅	193-195	48%	0.79	Black
4		(4-chlorophenyl)(5-methoxy-3-((5-((4-methoxybenzylidene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-2-methyl-1H-indol-1-yl)methanone	C ₂₈ H ₂₃ ClN ₄ O ₄	203-205	72%	0.70	Black
5		(3-((5-((2-chlorobenzylidene) amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-1-yl)(4-chlorophenyl) methanone	C ₂₇ H ₂₀ Cl ₂ N ₄ O ₃	191-194	65%	0.77	Brown
6		(4-chlorophenyl)(5-methoxy-2-methyl-3-((5-((pyridin-2-ylmethylene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-1H-indol-1-yl)methanone	C ₂₆ H ₂₀ ClN ₅ O ₃	123-125	79%	0.70	Brown
7		(4-chlorophenyl)(5-methoxy-2-methyl-3-((5-((pyridin-3-ylmethylene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-1H-indol-1-yl)methanone	C ₂₆ H ₂₀ ClN ₅ O ₃	132-135	91%	0.82	Black

المناقشة:

أستعمل في هذا البحث حامض الاندوميثاسين بوصفه نواة لتحضير مركب الاوكسادايازول (خماسي الحلقة غير المتجانس)، إذ اعتمدت طريقة تحضير الاوكسادايازول على مفاعلة حامض الاندوميثاسين مع ملح السيمي كاربازيد $\text{CH}_5\text{N}_3\text{O} \cdot \text{HCl}$ وبنسب مولية (1:1) واستخدام أوكسي كلوريد الفوسفور POCl_3 كعامل حولقة:



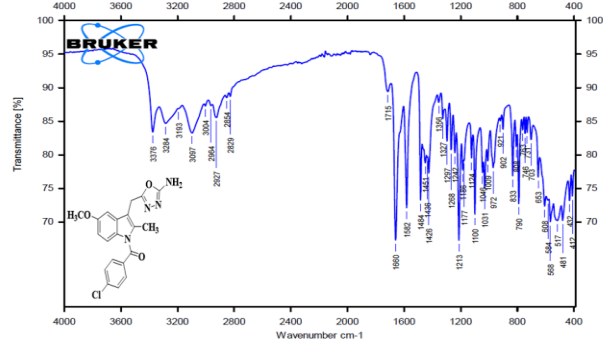
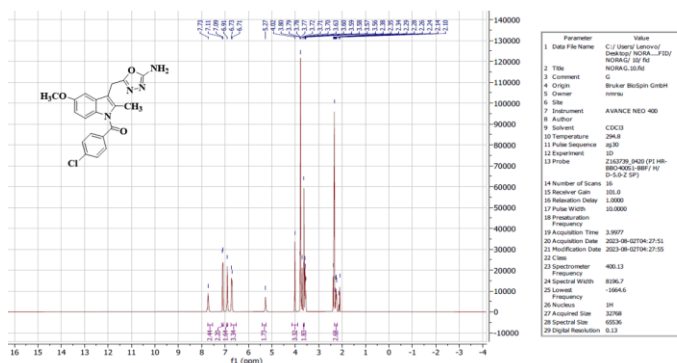
والميكانيكية المقترحة هي [25, 26].



مخطط 1: ميكانيكية تحضير الاوكسادايازول من تفاعل حامض الاندوميثاسين مع السيمي كاربازيد.

شخص المركب [2] طيفيا، إذ تميز طيف الأشعة تحت الحمراء باختفاء حزمة امتصاص المط لمجموعة الكاربونيل (C=O) التي تعود الى الحامض وحزمة امتصاص مجموعة الهيدروكسل (OH) العريضة وظهور حزمة عند (1213, 1242 cm^{-1}) عائدة الى المط المتناظر وغير المتناظر لمجموعة (C-O-C)، وحزمة عند (1582 cm^{-1}) تعود الى مط المجموعة (C=N) لحلقة الاوكسادايازول، كما ظهرت حزمتان عند (3376, 3284 cm^{-1}) تعزى الى مط المجموعة (NH₂) وأظهر طيف الرنين النووي المغناطيسي للبروتون اشارة عند الانحراف الكيميائي (5.27 ppm) تعود الى امتصاص بروتونات المجموعة (NH₂) المعوضة على حلقة الاوكسادايازول، وظهرت بقية الاشارات في الأماكن المتوقعة لها [27]، وكما موضح:

IR ν cm^{-1} : 1660 (C=O str. amide), 1582 (C=N, C=C str. aromatic), 3376, 3379 (NH₂), 2927 (C-H str. aliphatic), 3004 (C-H str. aromatic), 1213-1242 (C-O-C str. sym, asym). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : ppm. 2.35(3H, s, CH₃), 3.77(2H, s, CH₂), 4.02(3H, s, OCH₃), 5.27(2H, s, NH₂), 6.71-7.71 (7H, m, Ar-CH). ¹³C NMR (100 MHz, DMSO-d₆) δ : ppm. 167.99, 165.01, 160.74, 155.64, 137.16, 136.37, 132.43, 131.23, 131.06, 130.79, 129.17, 114.94, 111.90, 108.06, 102.07, 55.72, 24.53, 13.28.



الشكل 2: طيف الرنين النووي المغناطيسي ¹H NMR للمركب [2]

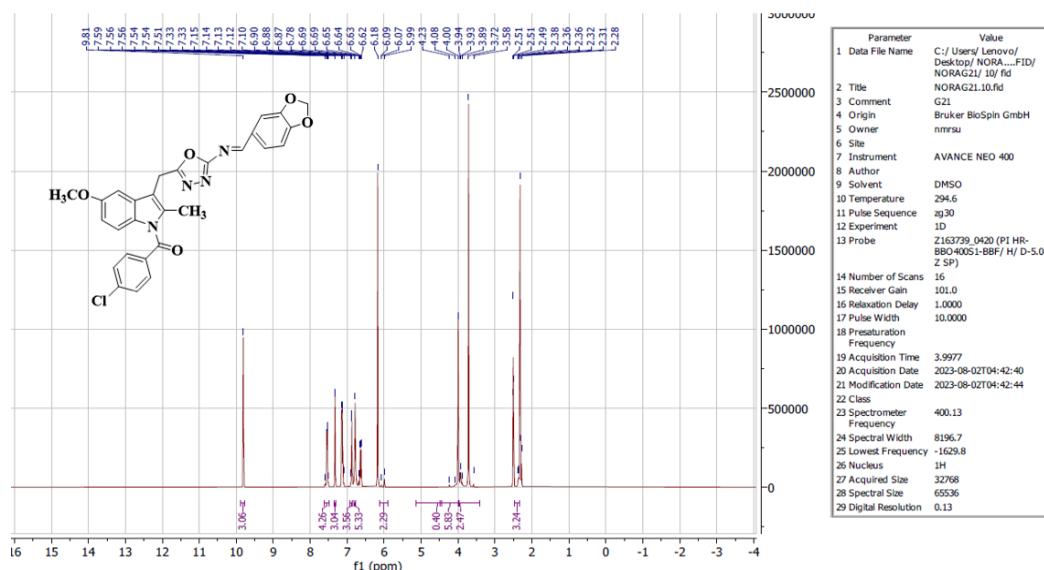
الشكل 1: طيف الأشعة تحت الحمراء لمركب [2]

تشخيص قواعد شيف [3-7]:

(3-((5-((4-((1-oxidaneyl)methoxy)-3-methylbenzylidene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-1-yl)(4-chlorophenyl)methanone [3]:

IR ν cm^{-1} : 1665 (C=O str. amide), 1622 (C=N str. Imine), 1582 (C=N, C=C str. aromatic), 3090 (C-H str. aromatic), 2925 (C-H str. aliphatic), 1260, 1240 (C-O-C asym. sym). ¹H NMR (400

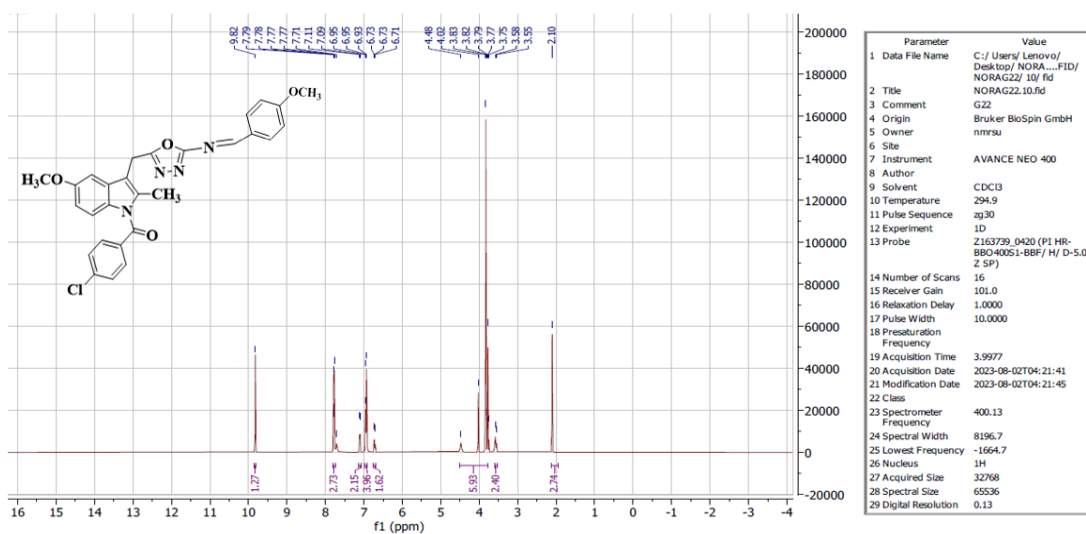
MHz, CDCl₃) δ : ppm. 2.32(3H, s, CH₃), 3.72(2H, s, CH₂), 4.00(3H, s, OCH₃), 5.99(2H, s, CH₂), 6.58-7.59(10H, m, Ar-CH), 9.81(1H, s, =CH), ¹³C NMR (100 MHz, DMSO-d₆) δ : ppm. 191.49, 164.08, 159.14, 153.53, 153.25, 148.83, 134.14, 131.95, 130.56, 129.10, 128.73, 111.55, 110.11, 109.07, 106.72, 103.82, 102.82, 100.29, 55.74, 40.58, 40.37, 40.16, 39.95, 39.92, 39.74, 39.53, 39.32, 20.76, 11.75.



الشكل 3: طيف الرنين النووي المغناطيسي ¹H NMR للمركب [3]

(4-chlorophenyl)(5-methoxy-3-((5-((4-methoxybenzylidene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl) methyl) -2-methyl-1H-indol-1-yl)methanone [4]:

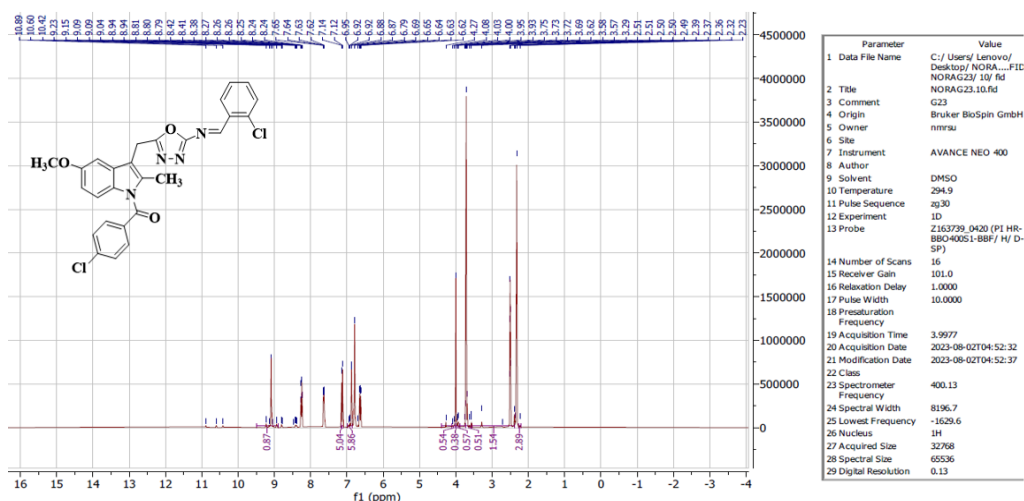
IR ν cm⁻¹: 1661 (C=O str. amide), 1639 (C=N str. imine), 1583 (C=N, C=C str. aromatic), 3102 (C-H str. aromatic), 2938 (C-H str. aliphatic), 1298, 1243 (C-O-C asym. sym). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : ppm. 2.10(3H, s, CH₃), 3.83(2H, s, CH₂), 4.02(3H, s, OCH₃), 4.02(3H, s, OCH₃), 6.71-7.79 (11H, m, Ar-CH), 9.82(1H, s, =CH) ¹³C NMR (100 MHz, DMSO-d₆) δ : ppm. 169.47, 167.99, 165.52, 161.49, 160.30, 155.64, 137.16, 136.37, 132.43, 131.88, 131.23, 131.06, 130.79, 129.17, 128.51, 114.72, 114.34, 111.90, 108.06, 102.07, 55.72, 55.35, 24.45, 13.28, 11.23.



الشكل 4: طيف الرنين النووي المغناطيسي ¹H NMR للمركب [4]

(3-((5-((2-chlorobenzylidene) amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-1-yl)(4-chlorophenyl)methanone [5]:

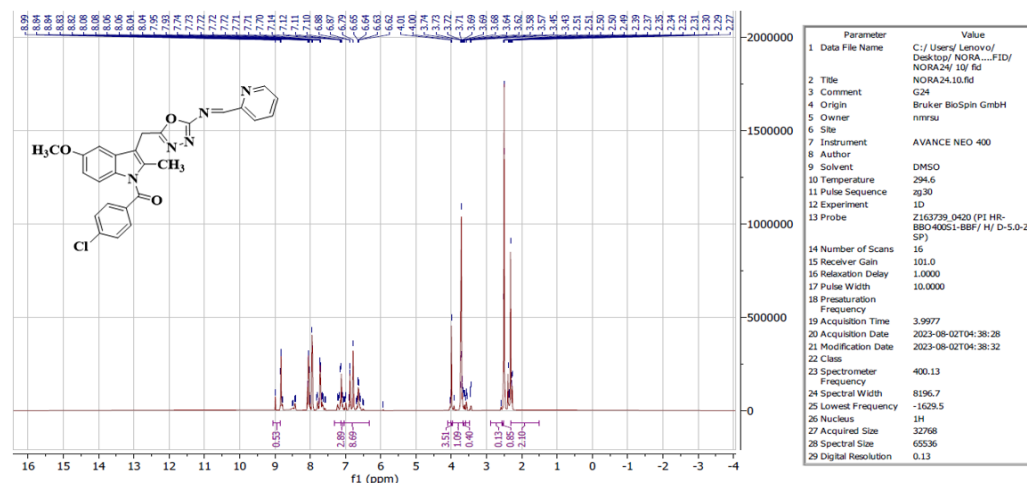
IR ν cm^{-1} : 1660(C=O str. amide), 1631(C=N str. imine), 1582(C=N, C=C str. aromatic), 3102 (C-H str. aromatic), 2942 (C-H str. aliphatic), 1267,1213 (C-O-C asym. sym), 752(C-Cl). 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ : ppm. 2.32(3H, s, CH_3), 3.72(2H, s, CH_2), 4.00(3H, s, OCH_3), 6.64-8.25 (11H, m, Ar-CH), 9.15 (1H, s, =CH). ^{13}C NMR (100 MHz, $DMSO-d_6$) δ : ppm 192.57, 163.61, 158.68, 154.60, 153.10, 151.45, 136.06, 133.69, 131.28, 130.13, 128.29, 124.39, 111.08, 109.65, 103.36, 99.88, 55.31, 40.15, 39.94, , 39.69, 39.52, 39.31, 39.27, 39.10, 38.90, 20.31, 11.28.



الشكل 5: طيف الرنين النووي المغناطيسي 1H NMR للمركب [5]

(4-chlorophenyl) (5-methoxy-2-methyl-3-((5-((pyridin-2-ylmethylene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-1H-indol-1-yl)methanone[6]:

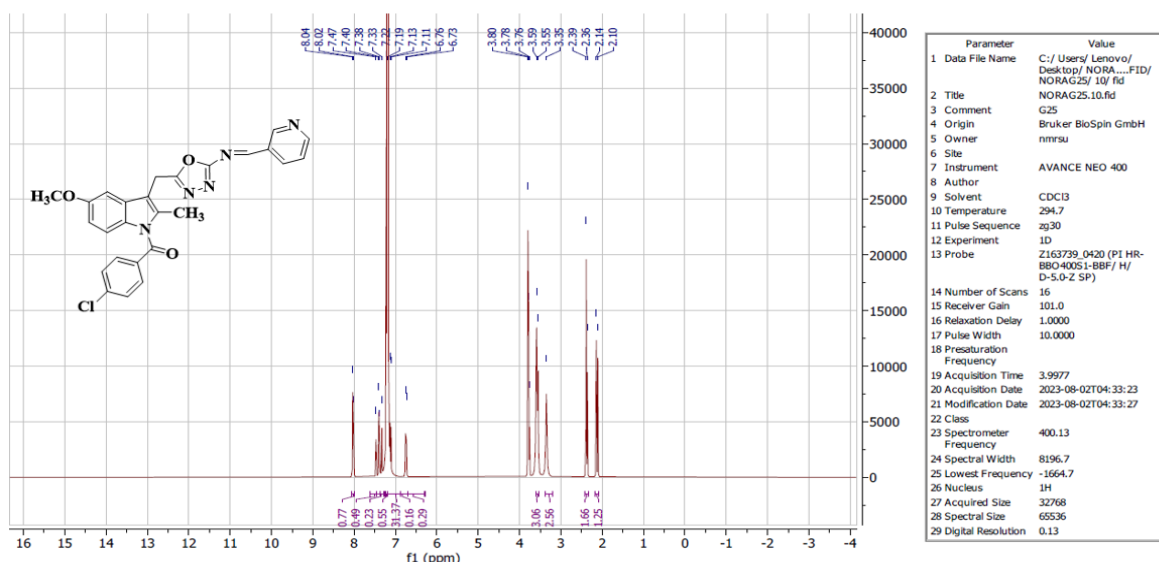
IR ν cm^{-1} :1632(C=O str. amide), 1620(C=N str.imine),1582 (C=N,C=C str. aromatic), 3185(C-H str. aromatic), 2831(C-H str. aliphatic), 1299,1213(C-O-C asym. Sym). 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ : ppm. 2.32(3H, s, CH_3), 3.72(2H, s, CH_2), 4.00(3H, s, OCH_3), 6.62-8.06 (11H, m, Ar-CH), 9.09(1H, s, =CH). ^{13}C NMR (100 MHz, $DMSO-d_6$) δ : ppm. 191.74, 178.01, 167.21, 164.68, 163.57, 162.98, 161.72, 160.17, 148.03, 146.06, 137.38, 135.95, 132.27, 131.13, 130.38, 124.86,121.88, 115.22, 112.53, 98.38, 62.58, 57.45, 56.14, 55.91, 40.59, 39.96.



الشكل 6: طيف الرنين النووي المغناطيسي 1H NMR للمركب [6]

(4-chlorophenyl)(5-methoxy-2-methyl-3-((5-((pyridin-3-ylmethylene)amino)-1,3,4-oxadiazol-2-yl)methyl)-1H-indol-1-yl)methanone [7]:

IR ν cm^{-1} : 1658(C=O str. amide), 1622(C=N str. imine), 1582 (C=N, C=C str. aromatic), 3183 (C-H str. aromatic), 3096(C-H str. aliphatic), 1239, 1215 (C-O-C asym. Sym). 1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ : ppm. 2.14(3H, s, CH_3), 3.59(2H, s, CH_2), 3.80(3H, s, OCH_3), 6.76-7.47(11H, m, Ar-CH), 8.03(1H, s, =CH). ^{13}C NMR (100 MHz, $DMSO-d_6$) δ : ppm. 169.82, 167.99, 162.97, 160.30, 155.64, 151.97, 149.32, 137.16, 136.37, 135.94, 132.43, 131.52, 131.23, 131.06, 130.79, 129.17, 124.47, 114.72, 111.90, 108.06, 102.07, 55.72, 24.45, 24.03, 13.28, 11.20.



الشكل 7: طيف الرنين النووي المغناطيسي 1H NMR للمركب [7]

الدراسة الحيوية Biological study:

في هذا البحث أُجريت الدراسة الحيوية للمركبات المحضرة بأستثناء المركب رقم 1، على نوع واحد من بكتريا القولون *E-coli Escherichia coli* الموجبة لصبغة كرام. أُستخدمت طريقة تقدير الحد الأدنى للتثبيط في مختبرات كلية التربية للعلوم الصرفة/ جامعة الموصل، وحسب الطريقة المعتمدة في الادبيات العلمية [28]. ويوضح الجدول رقم 2 قيم اقل تركيز للتثبيط (MIC) (Minimum Inhibitory Concentration)، ونلاحظ انها جميعا ذات نشاط حيوي متقارب ضمن مدى (129.77-125.63 ملغم/مل). وكانت اعلى قيمة للمركبين رقم 6، 7.

الجدول (2): الفعالية الحيوية للمركبات المحضرة

No.com.	MIC (ملغم/مل) E-coli
1	-
2	128.66
3	125.63
4	126.19
5	126.94
6	129.77
7	129.91

References

1. Buer, J.K., Origins and impact of the term 'NSAID'. *Inflammopharmacology*, 2014. 22: p. 263-267.
2. Kumar, M., Clinical evaluation of patients suffering from rheumatoid arthritis with respect to iron deficiency. *Int J Med Biomed Stud*, 2019. 3(7): p. 178-2.
3. Northbrook, J. and K. Conklin, Is what you put in what you get out? Textbook-derived lexical bundle processing in beginner English learners. *Applied Linguistics*, 2019. 40(5): p. 816-833.
4. Thabet, M., et al., Histological and Immunohistochemical study of Collagen in Patients with Primary Direct Inguinal Hernia and the efficiency of Preperitoneal mesh placement in Its Management.
5. Lucas, S., The pharmacology of indomethacin. *Headache: The Journal of Head and Face Pain*, 2016. 56(2): p. 436-446.
6. Clot-Bey, A.B., *Al-‘Iğāla aṭ-ṭibbīya fimā lā budda minhu li-ḥukamā"l-ğihādya*. 1832.
7. Ahmed, Mohammed Hassan, and Khalid, Fadual Dawod, Synthesis, Characterization of some new 2,5-disubstituted-1,3,4-Oxadiazole Derived from Diclofenac acid and Evaluation of its Antibacterial Efficacy, *Samarra J. Pure Appl. Sci.*, 2020; 2(3): 31-48.
8. Wang, J.-J., et al., Research progress on the synthesis and pharmacology of 1, 3, 4-oxadiazole and 1, 2, 4-oxadiazole derivatives: a mini review. *Journal of Enzyme Inhibition and Medicinal Chemistry*, 2022. 37(1): p. 2304-2319.
9. Scholz, M., et al., Synthesis and evaluation of carbaborane derivatives of indomethacin as cyclooxygenase inhibitors. *Bioorganic & medicinal chemistry*, 2011. 19(10): p. 3242-3248.
10. Mohammad, B.D., et al., Heterocyclic Compounds as Dipeptidyl Peptidase-IV Inhibitors with Special Emphasis on Oxadiazoles as Potent Anti-Diabetic Agents. *Molecules*, 2022. 27(18): p. 6001.
11. Gao, Q., et al., Direct annulation of hydrazides to 1, 3, 4-oxadiazoles via oxidative C (CO)-C (methyl) bond cleavage of methyl ketones. *Organic letters*, 2015. 17(12): p. 2960-2963.
12. Hamada, Y., et al., Blue-light-emitting organic electroluminescent devices with oxadiazole dimer dyes as an emitter. *Japanese journal of applied physics*, 1992. 31(6R): p. 1812.
13. Liu, P., et al., Structure and properties of halogen-free flame retardant and phosphorus-containing aromatic poly (1, 3, 4-oxadiazole) s fiber. *RSC advances*, 2019. 9(13): p. 7147-7155.
14. Ding, J. and M. Day, Novel highly fluorinated poly (arylene ether-1, 3, 4-oxadiazole) s, their preparation, and sensory properties to fluoride anion. *Macromolecules*, 2006. 39(18): p. 6054-6062.

15. Daoud, K.M. and K.H. Al-Nuaimi, Preparation and study of the inhibitory activity against bacteria of some substitutes--methyl nicotina mido] 1-3-4-oxada-pazole-2-new thiol. Iraqi National Journal of Chemistry, 2006. 6(24): p. 518-533.
16. Schiff, H., ZeiteAbteilung.“(A New Series of Organic Diamines. Second Part.). Ann. Chem. Pharm, 1866. 140: p. 92-137.
17. Hladová, M., et al., Review of spectrophotometric methods for determination of formaldehyde. Vedecké Práce Materiálovotechnologickej Fakulty Slovenskej Technickej Univerzity v Bratislave so Sídrom v Trnave, 2019. 27(44): p. 105-120.
18. Selvi, G., et al., The preparation of new palladium (II) complexes with Schiff base type ligands and its impregnated Al₂O₃ materials: As the catalysts for degradation/reduction of organic dyes. Applied Organometallic Chemistry, 2020. 34(12): p. e6009.
19. Rao, R., et al., Recent advances of metal-organic framework-based and derivative materials in the heterogeneous catalytic removal of volatile organic compounds. Journal of Colloid and Interface Science, 2023.
20. Yadav, G. and J.V. Mani, Green synthesis of Schiff bases by using natural acid catalysts. International Journal of Science and Research, 2015. 4(2): p. 121-127.
21. Boulechfar, C., et al., Schiff bases and their metal complexes: a review on the history, synthesis, and applications. Inorganic Chemistry Communications, 2023: p. 110451.
22. Salama, E.E., Synthesis of new 2-amino-1, 3, 4-oxadiazole derivatives with anti-salmonella typhi activity evaluation. BMC chemistry, 2020. 14(1): p. 1-8.
23. Hanna, J.S. and K.M. Alawad, In Silico Molecular Docking & ADME Studies Approach for Designing of New Schiff Base Derivatives of Indomethacin as Both Anti-Inflammatory and Anticancer Agents. NeuroQuantology, 2022. 20(7): p. 1093-1103.
24. Abdulghani, Saba S., and Rasheed, Malath Khalaf, Aminothiazole, Schiff base: synthesis, characterization and evaluation of their antimicrobial and antioxidant activity. Samarra J. Pure Appl. Sci., 2023; 5(2):1-14.
25. Bentiss, F. and M. Lagrenée, A new synthesis of symmetrical 2, 5-disubstituted 1, 3, 4-oxadiazoles. Journal of heterocyclic chemistry, 1999. 36(4): p. 1029-1032.
26. محمود, et al., المركبات خماسية وسداسية الحلقة غير المتجانسة المشتقة من 2-امينو بنزو ثيازول تحضير عدد من. Journal of Education & Science, 2020. 29(4).
27. Al-Ajely, M.S. and A.H. Ali, Synthesis of some thiazole and phthalazine compounds from Schiff bases. Acta Scientific Medical Sciences, 2019. 3(8): p. 82-89.
28. Kowalska-Krochmal B, Dudek-Wicher R., The Minimum Inhibitory Concentration of Antibiotics: Methods, Interpretation, Clinical Relevance. Pathogens. 2021; 10(2):165. <https://doi.org/10.3390/pathogens10020165>.

Synthesis of new 1,3,4-oxadiazole derivatives from indomethacin acid and evaluation of their biological activity

Nora Amer Hussein, Hayfaa Younis Hussien, and Shaymaa Hashim Abdulrahman*

Department of Chemistry, College of Science, University of Mosul, Iraq.

Article Information

Received: 13/08/2023

Revised: 30/09/2023

Accepted: 02/10/2023

Published: 30/08/2024

Keywords:

Indomethacin, Oxadizole,
Biologic Activity, NMR, IR.

Corresponding Author

E-mail:

shaymaa.hashim@uomosul.edu.iq

Mobile:

Abstract

The research included the synthesis of 5-amino-1,3,4-oxadiazole-2-yl by reacting indomethacin acid with semicarbazide hydrochloride, using phosphorus oxychloride (POCl_3) as a cyclizing agent, with the help of potassium hydroxide, and then reacting 5-amino-1,3,4-Oxadiazole-2-yl with aldehydes to obtain new and different types of Schiff bases. The biological activity of the prepared compounds against *E-coli* bacteria was studied. The structures of the newly prepared compounds were characterized using physical methods and measuring H1-NMR and IR spectra.