البحث السابع (بحث رقم 7 في قائمة الأبحاثمحل تقييم اللجنة الموقرة)

Title	Approaches towards the synthesis of a novelclass of 2-amino-5-arylazonicotinate, pyridazinoneand pyrido[2,3-*d*]pyrimidine derivatives as potentantimicrobial agents
Authors	**Hamada Mohamed Ibrahim,** Haider Behbehani, M. H. Elnagdi
Journal Information	*Chemistry Central Journal*, **7**, 123 (**2013)**
ISSN	1752-153X
Impact factor	**2.55**(2015)

الملخصالعربي

الهدف من هذا البحث هو تخليق مركبات جديدة من الاريل ازو نيكوتينات, بيريديذين و بيردو[٣,٢-*b*]بيريميدين والتي لهاقيمةللانسانكعوامل علاجيةلعلاجالأمراضالمعدية، وخصوصا كمضادات للبكتيريا ومضادات للفطريات. فى هذا البحث تم تحديد طريقة عامة لتحضير الاريل ازو نيكوتينات والبيريديذين. فى السابق عند اجراء التفاعل بين ٣-اوكسو-٢-اريل هيدرازنوبروبانال معبعض المركبات المحتوية على مجموعة الميثيلين النشطة مثل الايثيل سيانواسيتات والمالونونتريللم يتم تحديد العوامل التى تؤثر على الناتج النهائى سواء كان الناتجالاريل ازو نيكوتينات اوالبيريديذين. ففى هذا البحث وجد ان

1- الناتج يكون الاريلازونيكوتينات فقط عندما تكون وحدة الاريل فى مجموعة الهيدرازون محتوية على مستبدل ساحب للالكترونات مثل Cl, Br, NO_2 .
2- الناتج يكونالبيريديذين فقطعندما تكون وحدة الاريل فى مجموعة الهيدرازون فينيل او فينيل محتوية على مستبدل معطى للالكترونات.

ولتحضير مركباتالبيردو[٣,٢-*b*]بيريميدين تم تكثيف مركباتالاريلازونيكوتينات٨ المحضرة سابقا معثنائي ميثيل أسيتال ثنائي ميثيل الفورماميد لتكوين الاميدين والذى بدورة تم حلقنتة ليعطى المركب المطلوب بيردوبيريميدين. وتم اجراءايضا تفاعل بين مركبات الازونيكوتينات مع انهيدريد حمض الخليك والثيو يوريا.تم إثبات التراكيب الكيميائية لهذه المركبات عن طريق طيف الكتلة وأشعه الرنين المغناطيسي وكذلكباستخدام تقنية الاشعة السينية للبلورة الواحدة وذلك لدراسة الأنتقائية التوجيهية و تحديد التراكيب البنائية للعديدمنالمركبات المخلقة بصورة دقيقة.وفى النهاية تمت دراسة النشاط البيولوجى (بعضأنواعالبكترياوالفطريات) للمركباتالتيتمتحضيرها وجرى تقييم أنشطة هذة المواد الجديدة وثبت أن مجموعة من هذة المركبات اظهرت نشاط واعد وخاصة ضد البكتيريا سالبة الجرام، البكتيريا إيجابية الغرام والخميرة.

Abstract:

The reaction of 3-oxo-2-arylhydrazonopropanals **2** with ethyl cyanoacetate and with malononitrile**3a,b** has led to formation of 2-amino-5-arylazo-6-aryl substituted nicotinates **8a-k** as sole isolable products when the aryl group in the arylazo moiety is substituted with electron withdrawing group like Cl, Br, NO_2, while pyridazinones**10** were formed from the same reaction when the arylazo moiety is phenyl or phenyl substituted with electron donating group. The 2-aminoazonicotinates **8** were condensed with DMF-DMA to afford the amidines**13a,b**which then they cyclized to afford the targeted pyrido[2,3-*d*]pyrimidine derivatives **15a,b** respectively. The structures of all new substances prepared in this investigation were determined by using X-ray crystallographic analysis and spectroscopic methods. Most of the synthesized compounds in this investigation were tested and evaluated as antimicrobial agents and the biological activity screening tests showed that many of the obtained compounds exhibit high antimicrobial activity comparable to ampicillin which is used as reference compounds.

رئيس قسم الكيمياء　　قائم بعمل عميد الكلية

أ.د. خالد حسين حسن زغلول