

Synthesis and Antibacterial Evaluation of Some Novel 1-(5-(Pyridin-4-yl)-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-3-chloro-4-aryl-azetidin-2-one Derivatives

Ahad Amer ALSAIARI ¹, Mazen Mohammed ALMEHMADI ¹ & Mohammad ASIF ^{2,3} *

¹ Department of Clinical Laboratory Sciences, College of Applied Medical Sciences,
Taif University, P.O. Box 11099, Taif 21944, Saudi Arabia

² Glocal School of Pharmacy, Glocal University, Mirzapur Pole,
Saharanpur, Uttar Pradesh, India

³ School of Pharmacy, Glocal University, India, Mirzapur pole Saharanpur,
Uttar Pradesh - 247121 - India

SUMMARY. A novel synthesis of 1-(5-(pyridin-4-yl)-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-3-chloro-4-aryl-azetidin-2-one derivatives (**3a-f**) was done and their antimicrobial activity evaluated. These title compounds were synthesized in three steps. The first step involves the cyclization reaction of isonicotinic acid with thiosemicarbazide to form 2-amino-5-(pyridin-4-yl)-1,3,4-thiadiazole (**1**), in the second step compounds **1** react with appropriate aromatic aldehydes to form N-arylidene-2-amine-5-(pyridin-4-yl)-1,3,4-thiadiazole or Schiff's bases (**2a-f**), in step third compound Schiff's bases **2a-f** react with chloroacetyl chloride to form the final compounds (**3a-f**). By using spectra data analysis to describe the structures of synthesized compounds, they were all assessed for their efficacy as antimicrobial agents against some pathogenic bacterial and fungal strains. All of the title compounds exhibited moderate to good antibacterial activity, according to the findings.

RESUMEN. Se realizó una nueva síntesis de derivados de 1-(5-(piridin-4-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il)-3-cloro-4-aril-azetidina-2-ona (**3a-f**) y se evaluó su actividad antimicrobiana. Estos compuestos del título se sintetizaron en tres pasos. El primer paso implica la reacción de ciclación del ácido isonicotínico con tiosemicarbácida para formar 2-amino-5-(piridin-4-il)-1,3,4-tiadiazol (**1**), en el segundo paso los compuestos **1** reaccionan con los aldehídos aromáticos apropiados para formar N-arilideno-2-amina-5-(piridin-4-il)-1,3,4-tiadiazol o bases de Schiff (**2a-f**), en el tercer paso, las bases de Schiff **2a-f** reaccionan con cloruro de cloroacetilo para formar los compuestos finales (**3a-f**). Mediante el análisis de datos de espectros para describir las estructuras de los compuestos sintetizados, se evaluó la eficacia de todos ellos como agentes antimicrobianos frente a algunas cepas de bacterias y hongos patógenos. Todos los compuestos del título exhibieron una actividad antibacteriana de moderada a buena, según los hallazgos.

KEY WORDS: antibacterial, antifungal agents, azetidinone, pyridine, thiadiazoles.

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: aasif321@gmail.com