

Synthesis and Biological Evaluation of some (Z)-N-benzylidene-1H-indazol-3-amine Derivatives as Antimycobacterial Agents

Mazen ALMEHMADI¹, Mamdouh ALLAHYANI¹, Ayman AL-HAZMI¹ & Mohammad ASIF²

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

² Department of Pharmaceutical Chemistry, Era College of Pharmacy, Era University, Lucknow, Uttar Pradesh, India.

SUMMARY. To develop the new (Z)-N-Arylidene-1H-indazol-3-amine derivatives (**3a-e**) were synthesized by microwave technique and evaluated as antimycobacterial agents. These synthesized compounds **3a-e** were synthesized from the reaction of 1H-indazol-3-amine (**1**) and appropriate aromatic aldehyde (**2a-e**) by Schiff reaction method and characterization by IR, ¹H-NMR, mass spectroscopy, and elemental analysis data. The *in vitro* antimycobacterial activity of the produced compounds (**3a-e**) was evaluated using the microplate alamar blue dye test (MABA). A biological examination of the generated compounds (**3a-3e**) indicates that they efficiently inhibit *M. tuberculosis*. Compounds **3d** & **3e** exhibited the highest effect when the *in vitro* antitubercular activity was evaluated against *M. tuberculosis* H37Rv, with a MIC of 6.25 µg/mL. This value was comparable to streptomycin (MIC value 6.25 µg/mL) and less than the positive control pyrazinamide (MIC value 3.12 µg/mL). The remaining other compounds had a lower MIC value range of 12.5-25 µg/mL.

RESUMEN. Para desarrollar los nuevos derivados de (Z)-N-arilideno-1H-indazol-3-amina (**3a-e**) se sintetizaron mediante técnica de microondas y se evaluaron como agentes antimicobacterianos. Los compuestos **3a-e** se sintetizaron a partir de la reacción de 1H-indazol-3-amina (**1**) y el aldehído aromático apropiado (**2a-e**) mediante el método de reacción de Schiff y caracterización por IR, ¹H-NMR, espectroscopía de masas y análisis elemental. datos. La actividad antimicobacteriana *in vitro* de los compuestos producidos (**3a-e**) se evaluó utilizando la prueba del tinte azul alamar en microplaca (MABA). Un examen biológico de los compuestos generados (**3a-3e**) indica que inhiben eficazmente *M. tuberculosis*. Los compuestos (**3d** y **3e**) exhibieron el mayor efecto cuando se evaluó la actividad antituberculosa *in vitro* contra *M. tuberculosis* H37Rv, con una CMI de 6,25 µg/ml. Este valor fue comparable al de la estreptomycin (valor CIM de 6,25 µg/ml) y menor que el de la pirazinamida de control positivo (valor CIM de 3,12 µg/ml). Los otros compuestos restantes tenían un rango de valores de CIM más bajo, de 12,5 a 25 µg/ml.

KEYWORDS: heterocyclic, 1H-Indazole, *Mycobacterium tuberculosis*, synthesis compounds.

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