

الملخص العربي

تتناول الرسالة الحالية تحضير مشتقات جديدة من مركبات البنزوثيازول ذات الفاعلية البيولوجية المتوقعة كمضادات للسرطان ومدى ارتباط تلك الفاعلية بالرسو الجزئي.

تتضمن الرسالة اربعة اجزاء:

- **الجزء الاول:** المقدمة وتحتوى على عرض مختصر لمختلف الطرق المؤدية لتشييد ٢- مشتقات البنزوثيازول بالإضافة الى استخداماتها كمضادات للأورام السرطانية.
- **الجزء الثانى:** يتناول الهدف من البحث وعرض المخططات التى توضح الطرق العملية للوصول الى تحضير المركبات الاولية والمركبات الجديدة من البنزوثيازول المحتوية على الثيازولدينون، يوريا، ثيوبوريا، الامين، حلقتين بنزوثيازول والمركبات المحتوية على الفينول.
- **الجزء الثالث:** يوضح المناقشة النظرية للجزء العملى فى تحضير المركبات الأولية **Ia-b** و **VI**.

فعند تفاعل المركبات **Ia-b** مع كلورواسيتيل كلوريد أعطى المركبات الوسيطة **IIa-b** والتي كونت حلقة الثيازولدينون **IIIa-b** عند تفاعلها مع ثيوسيانات الأمونيوم. كما تداد لما سبق، تفاعل **IIIa-b** مع مختلف الأدهيدات الحلقية المتجانسة والغير متجانسة أعطى **IVa-i**. بالإضافة الى ذلك، المركب **IIb** تفاعل مع نفسه بدلا من الإستبدال النيوكليوفيلى مع مشتقات الأنيلين المختلفة ليعطى المركب الغير متوقع **V** بدلا عن المركب **A**.

أيضا، تفاعل المركب **VI** مع مختلف الأدهيدات الحلقية المتجانسة والغير متجانسة أعطى مركبات شيف **VIIa-e** والتي بمجرد تفاعلها مع حمض الثيوجليكولك أعطت مركبات الثيازولدينون **VIIIa-e**.

تكوين مشتقات اليوريا والثيوبوريا شُيدت بواسطة تفاعل **VI** مع ٤-كلوروفينيل أيزوسيانات وإيثيل أيزوثيوسيانات ليعطى كلا من **IX** و **X**، على التوالي. بالإضافة الى تفاعل المركب **X** بالإستبدال النيوكليوفيلى مع كلورواسيتيك أسيد ليعطى حلقة الثيازولدينون **XI**.

تفاعل المركب **VI** مع كلورواسيتيل كلوريد أعطى مركب **XII** والذي من خلال تفاعله بالإستبدال النيوكليوفيلى مع مختلف الامينات سواء كانت اولية او ثانوية أعطى المركبات

XIIIa-c. وايضا ، تكوين حلقة الثيازولدينون في المركب **XIV** من خلال تفاعل مركب الكلور **XII** مع ثيوسيانات الامونيوم.

تكوين مركب يحتوى على حلقتين بنزوثيرازول **XV** تحقق من خلال تفاعل المركب **VI** مع ثيوسيانات البوتاسيوم في وجود البروم كمحفز.

مشتقات الفينول **XVIa-c** تكونت من خلال تفاعل ملح الديازونيوم للمركب **VI** مع مختلف الفينولات.

وقد تم تدعيم اثبات التركيب البنائى للمركبات المشيدة الجديدة عن طريق التحليل الدقى لعناصر الكربون والهيدروجين والنيروجين، استعمال الاشعة تحت الحمراء ، الرنين النووى المغناطيسى، طيف الكتلة.

بالإضافة الى ما سبق، تم شرح وصف موجز عن التأثير البيولوجى للمركبات الجديدة كمضادات للأورام سواء دراسة السو الجزئى من خلال مقارنة الشكل المتحد المناسب مع النشاط المضاد للأورام.

- **الجزء الرابع:** يحتوى على الأجزاء العملية التى اتبعت لتشيد المشتقات والطرق المفصلة لتحضير المركبات الاولية **Ia-b** و **VI**، المركبات الوسيطة **IIa-b**، **IIIa-b** و **XIII**. بالإضافة الى المركبات النهائية المستهدفة **IVa-i**، **V**، **VIIa-e**، **VIIIa-e**، **IX**، **X**، **XI**، **XIV**، **XIIIa-c** و **XVIa-c**.

بالإضافة الى النتائج المفصلة للتحاليل الدقيقة للعناصر والخواص الفيزيائية للمركبات. كما انه تم القاء الضوء على نشاط ثلاثين مركب من المركبات الجديدة كمضادات للأورام السرطانية مقارنة بالمركب (١٩) والتي انقسمت الى جزئين:

الجزء الأول: تم اختبار أربعة وعشرون مركب من المركبات المشيدة الجديدة و قياس نشاطهم ضد خلايا سرطان الثدي (MCF-7). وأوضحت النتائج ان المركب **XVIc** أظهر فاعلية مميزة كمضاد للأورام ($IC_{50} = 12.47 \mu M$).

التجربة الثانية: تم اختبار سبع مركبات من المركبات المشيدة الجديدة و قياس نشاطهم ضد خلايا سرطان الثدي (MCF-7) وايضا سرطان الرئة (A549) و أوضحت النتائج ان المركب **IVc** أظهر أعلى فاعلية كمضاد للأورام ($IC_{50} = 13.25 \mu M$) و ($IC_{50} = 12.08 \mu M$) بالنتابع.

ويوضح هذا الجزء ايضا الارتباط بين نتائج الرسو الجزئى والتقييم المعملى للمركبات كمضادات للأورام.