

Synthesis and *In Vitro* Anti-inflammatory Activity of 5-Aryl-1,3,4-thiadiazol-2-amine Derivatives

Mazen ALMEHMADI¹, Ahad Amer ALSAIARI¹, Mamdouh ALLAHYANI¹,
Abdulelah ALJUAID¹, Abdulaziz ALSHARIF¹ & Mohammad ASIF^{2*}

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

²Department of Pharmaceutical Chemistry, Era College of Pharmacy,
Era University, Lucknow, 226003, Uttar Pradesh, India

SUMMARY. The 1,3,4-thiadiazole moiety is a therapeutically attractive drug candidates. So, we synthesize a series of 5-aryl-1,3,4-thiadiazol-2-amines (**2a-g**) from 2-arylidene hydrazine carbothioamides (**1a-g**). Compounds **1a-g** was prepared by the reaction of appropriate aryl aldehydes and thiosemicarbazide using phosphorous oxychloride. The structures of title compounds were elucidated based on their elemental, ¹H-NMR, IR, and Mass spectral analysis. The title compounds (**2a-g**) were tested as *in vitro* anti-inflammatory agent by using the Human Red Blood Cells (HRBC) membrane stabilization technique. Out of all the title compounds, compounds **2a**, **2b**, and **2e** exhibited significant *in vitro* anti-inflammatory activity whereas the compounds **2c**, **2d**, **2f**, and **2g** showed less activity when compared to the reference drug Diclofenac sodium.

RESUMEN. El resto 1,3,4-tiadiazol es un candidato a fármaco terapéuticamente atractivo. Entonces, sintetizamos una serie de 5-aril-1,3,4-tiadiazol-2-aminas (**2a-g**) a partir de carbotioamidas de 2-arilideno hidrazina (**1a-g**). Los compuestos 1a-g se prepararon mediante la reacción de aldehídos de arilo apropiados y tiosemicarbazida usando oxiclóruo de fósforo. Las estructuras de los compuestos del título se dilucidaron en base a su análisis espectral elemental, ¹H-NMR, IR y de masas. Los compuestos del título (**2a-g**) se probaron como agentes antiinflamatorios *in vitro* mediante el uso de la técnica de estabilización de membrana de glóbulos rojos humanos (HRBC). De todos los compuestos del título, los compuestos **2a**, **2b** y **2e** mostraron una actividad antiinflamatoria *in vitro* significativa, mientras que los compuestos **2c**, **2d**, **2f** y **2g** mostraron menos actividad en comparación con el fármaco de referencia diclofenaco sódico.

KEY WORDS: aldehydes, anti-inflammatory activity, 1,3,4-thiadiazole, synthesis, thiosemicarbazide.

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