جامعة الموصل

كلية العلوم

تشييد وتقييم الفعالية البايولوجية لبعض كيتونات البريميدنيل بايرازونيل ومشتقات البايروليدين

سيوگي سامح هدايت محمد أرسلان

أطروحة دكتوراه

الكيمياء / الكيمياء العضوية

بإشراف

الأستاذ الدكتور عبد الوهاب جعفر حمدي الحمداني

1438 هـ **2018 م**

خلاصة البحث

إن تكاثف 2- اسيتايل نفثالين مع معوضات البنزالديهايد تحت ظروف قاعدية أدى إلى تكوين الكيتونات α،β -غير المشبعة المقابلة الجالكونات (1-5) 1-(2-naphthyl)-3-aryl-2-propen-1-ones من خلال تفاعل (كليزن - شمدت)

إن التفاعل المتضمن ثلاثة مواد هي أسيتو خلات الاثيل واليوريا ومعوضات البنزالديهايد من خلال تفاعل بجينلي قاد إلى تكوين البريميدينونات المعوضة المتوقعة

5-Ethoxy carbonyl-4-aryl-6-methyl-3,4-dihydro pyrimidine-2-(1H)-ones (6-13)

ولقد تمت مفاعلة هذه البريميدينونات مع الهيدرازين المائي لإعطاء الهيدرازايدات المقابلة

5-Haydrazido-4-aryl-6-methyl-3,4-dihydro pyrimidine-2-(1H) ones (14-21)

التي بدورها أدخلت بتفاعل مع الجالكونات المحضرة (1-5) لتؤدي إلى تكوين 2- بايرازولينات

6-Methyl-5-(5-(2-naphthyl)-3-aryl-4,5-dihydro-1H-pyrazolylamido)-4-aryl-3,4-dihydropyrimidin-2-(1H)-ones (22-56) ومن جهة أخرى فإن معاملة البنزايل أمين مع البنزالديهايدات المعوضة في محيط قلوي أعطى ما يسمى N- ارايليدين بنزايل أمين (قواعد شيف) N-Arylidenebenzyl amine (57-62) وأخيرا فإن الإضافة الإنيونية نوع 3،1 لقواعد شيف (57-62) على الجالكونات (1-5) أدى إلى تكوين البايروليديدينات المقابلة 2,3-Diaryl-4-(β-naphthoyl)-5-phenyl pyrrolidine (63-85)

ودعمت التراكيب اعتمادا على بعض الصفات الفيزياوية والبيانات الطيفية (^{13}C-NMR, ^{1}H-NMR, FT-IR, UV) وتم التحقق من الميكانيكيات المقترحة لهذه التفاعلات اعتماداً على تحليل البيانات الطيفية فضلاً عَن عوامل نظرية مثل طاقة التكوين H.F وطاقة الإعاقة S.E لتوقع الناتج الأكثر استقراراً نظريا.

وكذلك فُحصت الفعالية البايولوجية لبعض المركبات تجاه البكتريا المرضية التالية الموجبة لصبغة كرام (Gram + ve) متمثلة بـ ***Staphylococcus aureus (Staph)*** والسالبة لصبغة كرام (Gram ve -) متمثلة بـ ***Escherichia Coli (E.coli)*** ومقارنتها مع مضادات مرجعية.

University of Mosul

College of Science

SYNTHESIS AND EVALUATION OF THE BIOLOGICAL ACTIVITY OF SOME PYRIMIDINYL PYRAZONYL KETONES AND PYRROLIDINE DERIVATIVES

Sevgi Samih Hidayet Mohammed Arslan

Ph.D. / Thesis

Chemistry / Organic Chemistry

Supervised by

Prof.Dr. Abdul Wahab Jafar Al-Hamdany

1439 A.H **2018 A.D**

Abstract

The condensation of 2-acetyl naphthalene with substituted benzaldehydes under basic conditions afforded the corresponding α,β-unsaturated carbonyl compound chalcones (1-5) via Claisen-Schmidt reaction. The one-pot reaction of ethyl acetoacetate, urea and substituted benzaldehydes led to the formation of the expected substituted pyrimidinones (6-13) by Biginelli Reaction. These pyrimidinones had been reacted with hydrazine hydration to give the corresponding hydrazides (14-21) which in turn brought to react with the prepared chalcones (1-5) to afford the 2-pyrazolines (22-56). On the other hand, the treatment of benzyl amine with substituted benzaldehydes in an alkaline medium gave the so-called N-arylidene benzyl amine (Schiff bases) (57-62). Finally, the 1,3-anionic addition of Schiff's bases (57-62) to the chalcones (1-5) afforded the corresponding pyrrolidines (63-85).

The structures of the products were supported according to their physical properties and spectral data (UV, FT, IR, ^{1}H-NMR & ^{13}C-NMR). The suggested mechanism for these reactions were investigated depending on the spectral evidences as well as some theoretical parameters such as head of formation (H.F) and steric energy (S.E), to expect the more stable product theoretically.

The biological activity of some compounds had been tested against Gram positive (+ve) and gram negative (-ve) bacteria and compared with references.