

# CHIMIE FARMACEUTICĂ ȘI CONTROLUL MEDICAMENTULUI

## SINTEZA ȘI CARACTERIZAREA SPECTRALĂ A UNOR NOI AMINALI CU POTENȚIALĂ ACTIVITATE ANTIBACTERIANĂ ȘI ANTIFUNGICĂ

**Lorena Nicoleta Bologan**

(Conducător științific: Teodor O. Nicolescu, dr. șt. farm.,  
conf. univ., Facultatea de Farmacie, Disciplina Chimie  
Organică)

Universitatea de Medicină și Farmacie „Carol Davila”,  
București, ROMÂNIA

**Introducere.** Sunt raportate în literatură utilizări ale pirazolilor și ftalimidei în sinteza unor compuși cu acțiune analgezică, antioxidantă, antifungică sau bacteriostatică.

**Scopul lucrării.** Lucrarea prezintă sinteza și caracterizarea spectrală a unor noi aminali heterociclici nesimetrice folosind N-clorometilftalimidă și pirazoli.

**Material și metode.** Ftalimida a fost sintetizată pornind de la anhidrida ftalică prin tratare cu amoniac la reflux, 3 ore. A urmat transformarea în sare de potasiu folosind KOH în etanol absolut, la reflux și alchilarea cu  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  în DMF. N-Clorometilftalimida a fost folosită pentru a alchila la azot diferiți pirazoli.

**Rezultate.** La sinteza ftalimidei mediată prin microunde s-a constatat reducerea timpului de lucru (8 min.) și un randament superior. Sinteza N-clorometilftalimidei, s-a realizat prin încălzire clasică. Alchilarea unor pirazoli cu N-clorometilftalimidă, s-a realizat atât prin reflux în solvenți polari cât și prin încălzire cu microunde. În cazul sintezei mediate de microunde randamentele sunt mai mari și timpii de lucru semnificativ scăzuți.

**Concluzii.** Încălzirea cu microunde folosind solvenți polari cu *pf* scăzute (ex. DMF) este o metodă eficientă. Încălzirea clasică în solvenți foarte polari (DMSO, HMPA) este costisitoare, îndepărtarea solventului se face mai greu și cu pierderi de produs. Spectrele de UV, IR, RMN și MS confirmă structurile moleculare deduse pe baza ecuațiilor reacțiilor chimice.

### Referințe bibliografice.

1. T.O. Nicolescu, Florica Nicolescu, L. Iscrulescu, Isabela Țârcomnicu, Corina Dalia Toderescu, *Noi compuși din clasa acidului barbituric O,N-disubstituit cu inele imidazolice prin punte acetoxi, cu potențială acțiune analgezică și anticonvulsivantă*, CNFR Iași, 24-27 septembrie 2014

**Cuvinte cheie.** aminali heterociclici nesimetrice

## SYNTHESIS AND SPECTRAL CHARACTERIZATION OF NEW AMINALS WITH ANTIBACTERIAL AND ANTIFUNGAL POTENTIAL ACTIVITY

**Lorena Nicoleta Bologan**

(Scientific advisor: Teodor O. Nicolescu, PhD, associate  
professor, Faculty of Pharmacy, Department of organic  
chemistry)

University of Medicine and Pharmacy "Carol Davila",  
Bucharest, ROMANIA

**Introduction.** It has been reported that pyrazoles and phthalimide have found use in the synthesis of compounds with analgesic, antioxidant, antifungal or bacteriostatic activity.

**The aim of the study.** This paper presents the synthesis and spectral characterization of new non-symmetrical heterocyclic aminals using N-chloromethylphthalimide and pyrazoles.

**Material and methods.** Phthalimide was synthesized by treatment of phthalic anhydride with ammonia at reflux during 3 h. This was followed by conversion to the potassium salt using KOH in absolute ethanol at reflux and alkylation with  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  in DMF. N-Chloromethylphthalimide was used to alkylate different pyrazoles at the nitrogen site.

**Results.** It has been found that during microwave mediated synthesis of the phthalimide the work time is reduced (8 min) and a higher yield is observed. Synthesis of N-Chloromethylphthalimide, was achieved by conventional heating. Alkylation of pyrazoles with N-Chloromethylphthalimide, was carried out as by reflux in polar solvents, as by microwave heating. In case of microwave mediated synthesis yields are higher and working time is significantly reduced.

**Conclusions.** Microwave heating using polar solvent with low *pf* (eg. DMF) is an effective method. Classical heating in highly polar solvents (DMSO, HMPA) is expensive, the solvent removal is difficult and with product loss. The UV, IR, NMR and MS spectra confirmed the molecular structures deduced from the equations of chemical reactions.

### Bibliographical references.

1.T.O. Nicolescu, Florica Nicolescu, L. Iscrulescu Isabella, Tarcomnicu Corina, Dalia Toderescu, *Novel compounds from the class A barbituric acid, N-disubstituted imidazole ring bridged acetoxi, with potential analgesic and anticonvulsant*, CNFR Iasi, 24-27 September 2014

**Keywords.** Unsimetric heterocyclic aminals