Síntese Seletiva de Benzoxantenos em Meio Livre de solvente

Paula F. Carneiro (PG)¹, Maria do Carmo F. R. Pinto (PQ)¹, Roberta K. F. Marra (PQ)², Carolina S. Bortolot (IC)², Fernando de C. da Silva (PQ)², Vinícius R. Campos (PG)², Jackson A. L. C. Resende (PQ)², Vitor F. Ferreira (PQ)².

Orgânica, Instituto de Química – CEG, Outeiro de São João Batista, s/nº - Valonquinho. 24020-150 Niterói / RJ.

cegvito@vm.uff.br

Palavras Chave: 1,4-naftoguinonas, xantenos, benzoxantenos

Introdução

Quinonas são muito comuns na natureza com grande interesse em suas atividades biológicas e farmacológicas. As principais atividades biológicas relatadas para esses derivados são microbicidas, tripanocida, virucidas, antifúngicas, antimalarial e antitumorais.¹

Os xantenos e benzoxantenos são heterociclos biologicamente ativos importantes, pois apresentam atividades antibacterianas, antivirais e antiinflamatórias. Além disso, estes compostos têm emergido como sensibilizadores em terapia fotodinâmica, um método de controle dos tumores localizados. E como corantes, devido às suas propriedades fotoquímicas e fotofísicas.²

Diante disso, nosso grupo de pesquisa estudou a síntese de uma série de dibenzoxantenos com diferentes condições reacionais para otimização de obtenção seletiva dos isômeros de α , α e α , β .

Resultados e Discussão

A rota sintética empregada no presente trabalho envolveu a reação da lausona (1) com diferentes benzaldeídos (2a-k), em duas rotas diferentes onde a primeira, a partir do tratamento com ácido p-toluenossulfônico, sem solvente a 80-100°C, foi possível obter exclusivamente o isômero 6H-dibenzo[b,h]xanteno (tipo α , β , 3a-k) em rendimentos que variaram de 54-85%.

Por outro lado, a reação da lausona (1) com os aldeídos aromáticos (2a-k) em presença de cloreto de lítio e água levou a formação das bis-1,4-naftoquinonas (4a-k) que posteriormente foram submetidas à reação de desidratação catalisada por ácido sulfúrico formando-se 6H-dibenzo[b,l]xanteno (tipo α , α , 5a-k), com rendimentos que variaram de 50-89% (Esquema 1).

As estruturas de todos os derivados obtidos foram confirmadas por métodos espectroscópicos de análise como ¹H e ¹³C-APT RMN e infravermelho. Em relação aos derivados 3a-k, a não simetria da molécula confirma sua forma isomérica a partir da análise dos espectros de ¹H-RMN.

OOH HO OOH
$$H_2SO_4$$
 conc.

(4a-k)

(4a-k)

(5a-k)

R = Aril 50-89%

11 exemplos

OOH

 R_1
 R_2
 R_3
 R_3
 R_4
 R_2
 R_3
 R_4
 R_5
 R_5

Esquema 1. Reação de formação dos derivados 6*H*-dibenzo[*b,h*]xanteno (3a-k) e 6*H*-dibenzo[*b,i*]xanteno (5a-k)

Adicionalmente foi realizada também a difração de raios X do derivado do 3c e a figura ortep corrobora com o isômero proposto (Figura 1).

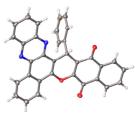


Figura 1. Estrutura ORTEP do derivado da substância 3c. Elipsoide 50% de probabilidade

Conclusões

Neste trabalho, foi desenvolvido um método eficiente de síntese para derivados os dibenzo[b,h]xanteno (3a-k) е otimização dibenzo[b,i]xanteno (5a-k). Os derivados obtidos foram confirmados através de espectros de IV, RMN e difração de raios X em monocristais.

Agradecimentos

CNPg, FAPERJ-PRONEX, FINEP e CAPES.

¹ Universidade Federal do Rio de Janeiro, Núcleo de Pesquisas de Produtos Naturais, 21944-970, RJ, Brasil;

² Universidade Federal Fluminense, Programa de Pós-Graduação em Química Orgânica, Departamento de Química

¹ Ferreira, V. F. . β-Lapachona: Sua importância em química medicinal e modificações estruturais. *Revista Virtual de Química*, **2010**, v. 2, 140-160

² Amini, M. M.; Fazaeli, Y.; Yassaee, Z.; Feizi, S.; Bazgir, A. *The Open Catalysis Journal*, **2009**, 2, 40 - 44.