

Síntese de Diidropirimidonas através da reação de Biginelli utilizando NH₄Br e TBAB como catalisadores

Andréa Luzia Ferreira de Souza* (PQ), Mara Rita Pereira de Oliveira (PQ), Emerson Teixeira da Silva (PQ) e Octavio Augusto Ceva Antunes (PQ)

Instituto de Química, Universidade Federal do Rio de Janeiro- Ilha do Fundão - Rio de Janeiro - RJ

*e-mail: andrealuzia@hotmail.com

Palavras Chave: *Biginelli*, NH₄Br, TBAB

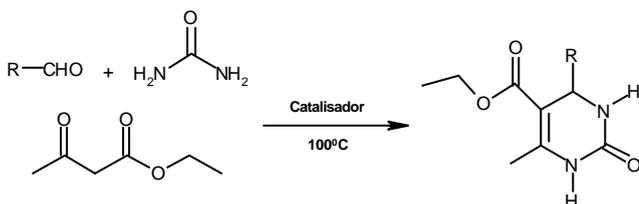
Introdução

Uma grande variedade de heterociclos nitrogenados apresenta importantes propriedades farmacológicas. Dentre estes se destacam as 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas (DHPMs), cujos derivados apresentam amplo espectro de efeito biológico, incluindo atividade anti-hipertensiva, antiviral, antitumoral, antibacteriana e antiinflamatória¹. A síntese de DHPMs foi realizada por Pietro Biginelli pela primeira vez e consiste numa reação multicomponentes em uma única etapa². Recentemente tem sido prepradas DHPMs a partir da modificação do protocolo de Biginelli, com ou sem solvente e na presença de diferentes catalisadores³. Neste trabalho, foi realizado um estudo do comportamento dos catalisadores brometo de amônio e brometo de tetrabutilamônio, sem a utilização de solvente, na preparação de DHPMs.

Resultados e Discussão

Para investigar a possibilidade do uso de NH₄Br e do TBAB como catalisadores na preparação de DHPMs foram sintetizadas várias destas substâncias com diversos substituintes.

As DHPMs foram sintetizadas a partir de aldeídos aromáticos, uréia e acetoacetato de etila na presença de 10% de catalisador, esquema 1.



Esquema 1. Reação de Biginelli entre aldeídos aromáticos substituídos, uréia e acetoacetato de etila.

Procedimento geral: o aldeído (5 mmol), a uréia (5 mmol) o acetoacetato de etila (15 mmol) e o catalisador (10% mol) foram aquecidos a 100°C até o consumo dos materiais. Após o término da reação, água foi adicionada, o material foi filtrado a vácuo e o produto foi recristalizado de etanol. Na tabela 1, estão descritos os resultados das reações.

Tabela 1. Resultados obtidos da reação de Biginelli entre aldeídos aromáticos, uréia e acetoacetato de etila, utilizando NH₄Br e TBAB*

Entrada	aldeído	(%) NH ₄ Br	(%) TBAB
1	4-bromo-benzaldeído	80	85
2	3-flúor-benzaldeído	83	77
3	3-cloro-benzaldeído	66	92
4	4-nitro-benzaldeído	97	-
5	4-CF ₃ -benzaldeído	85	58
6	4-SO ₂ Me-benzaldeído	90	61
7	4-N(Me) ₂ -benzaldeído	66	54
8	piperonal	80	36
9	Indol-3-carboxaldeído	-	18
10	Piridine-3-carboxaldeído	-	53

*produtos analisados e confirmados por ponto de fusão e RMN de ¹H

O catalisador brometo de amônio foi mais satisfatório do que o brometo de tetrabutilamônio pois a maioria dos aldeídos forneceram produtos com altos rendimentos.

Conclusões

Neste trabalho, demonstrou-se a generalidade dos catalisadores brometo de amônio e brometo de tetrabutilamônio na reação de Biginelli, através da síntese de diferentes DHPMs. Uma das vantagens observadas, em comparação com alguns métodos existentes na literatura, foi que os catalisadores se mostraram compatíveis com diferentes grupos funcionais, levando à formação de DHPMs com bons rendimentos.

Agradecimentos

Ao CNPq pelo apoio financeiro.

¹ Bose, D. S.; Sudharshan, M. e Chavhan, S. W. *Arkivoc.* **2005**, 3, 228.

² Kappe, C. O. e Falsone, F. S. *Arkivoc.* **2001**, 2, 122.

³ Godoi, M. N.; Costenaro, H. S.; Kramer, E.; Machado, P. S.; D'Oca, M. G. M. e Russowsky, D. *Quím. Nova.* **2005**, 28, 1010.