

N-Acilação de benzotriazóis empregando irradiação de ultrassom

Hélio A. Stefani (PQ), ^a * Aline T. G. Orfão (IC), ^a Karla P. Guzen (PG) ^b e
Claudio M. P. Pereira (PQ) ^a *

^aLaboratório de Síntese de Moléculas Bioativas, Departamento de Farmácia, Faculdade de Ciências Farmacêuticas,
Universidade de São Paulo 055083-000 São Paulo, SP, Brasil

^bDepartamento de Biofísica, Universidade Federal de São Paulo, SP, Brasil.

hstefani@usp.br e claudiom@usp.br

Palavras Chave: benzotriazóis, ultrassom

Introdução

Nos últimos 30 anos a aplicação de irradiação de ultrassom vem sendo extensivamente explorada em processos orgânicos. Devido ao fenômeno da cavitação, o mesmo é capaz de promover reações mais rápidas em comparação com os métodos convencionais.¹⁻²

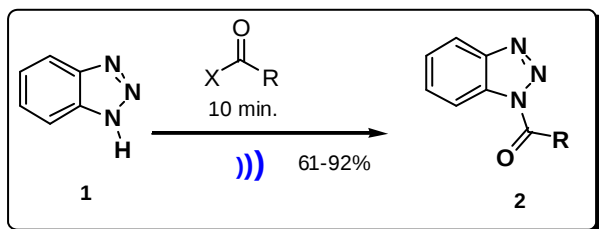
Recentemente nosso grupo de pesquisa tem se especializado no estudo de várias reações empregando esse tipo de energia: preparação de acetilenos, ciclocondensação de diidropirimidinonas, halogenação de pirazóis, preparação de iminas e reações de acoplamento.³⁻⁷

A preparação de triazóis faz parte de uma das nossas extensões de pesquisa (FAPESP 03/13475-5). Esses heterociclos tem ampla representatividade na química medicinal, com representantes: antiinflamatórios, analgésicos e fungicidas.⁸

Resultados e Discussão

Dentro desse contexto é apresentado aqui uma metodologia alternativa para N-acilação de benzotriazóis, empregando irradiação de ultrassom. (Esquema).

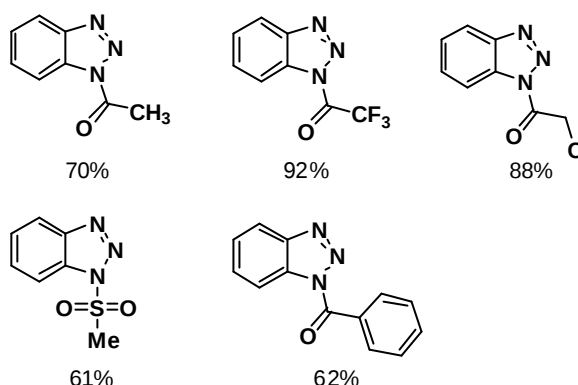
Esquema



Apesar de utilizar diclorometano como solvente de reação (Esquema), também ainda estamos estudando algumas alternativas de solventes, como acetona, acetato de etila, incluindo, reações sem solvente. Aqui são descritas algumas vantagens do método proposto (reação em ultrassom), podemos citar: (i) dispensa o uso de bases, como piridina ou trietilamina; (ii) os compostos 2 são obtidos em curto tempo de reação (10 minutos) e (iii) fácil isolamento.

29^a Reunião Anual da Sociedade Brasileira de Química

Tabela de compostos e rendimentos (%)



Os benzotriazóis acilados (2) foram identificadas por espectrometria de infra-vermelho, RMN de ¹H, ¹³C, e tiveram suas estruturas confirmadas por espectrometria de massas.

Conclusões

Os benzotriazóis 2 foram isolados com bons rendimentos (Tabela). Ainda dentro de nossa perspectiva de trabalho consta a reação com novos benzotriazóis, bem como a de verificação da bioatividade desses compostos.

Agradecimentos

FAPESP (03/13475-5, 03/01751-8), CAPES e CNPq

1. Manson, T. J. *Chem. Soc. Revs.* **1997**, 26, 447.
2. Cintas, P.; Luche, J. L. *Green Chem.* **1999**, 1, 115
3. Stefani, H. A.; Cella, R.; Dorr, F. A.; Pereira, C. M. P.; Gomes, F. P.; Zeni, G. *Tetrahedron Lett.* **2005**, 46, 2001.
4. Stefani, H. A.; Pereira, C. M. P.; Almeida, R. B.; Braga, R. C.; Guzen, K. P.; Cella, R. *Tetrahedron Lett.* **2005**, 46, 6833.
5. Stefani, H.A., Oliveira, C. B.; Almeida, R. B.; Pereira, C. M. P.; Braga, R. C.; Cella, R.; Borges, V. C.; Savegnago, L.; Nogueira, C. W. *J. Eur. Med. Chem.* **2006**, No prelo

Sociedade Brasileira de Química (SBQ)

6. Stefani, H. A.; Braga, R. C.; Guzen, K. P.;
Guarezemini, A. S.;
Örfão, A. T. G.; Pereira, C. M. P. *Synthesis* **2006**, *Submetido*.
7. Stefani, H. A.; Cella, R. *Tetrahedron* **2006**, *Submetido*.
8. Bräse, S.; Gil, C.; Knepper, K.; Zimmermann, V.
Angewandte
Chemie Int. Ed. **2005**, 44, 5188.