

Estudos visando a síntese assimétrica de novos triptofóis derivados de terpenos naturais.

Ronaldo C. da Silva Junior (PG)^{1*}, Marilúcia S. Pina (IC)¹, Marcus P. F. Silva (IC)¹, Florence M. C. de Farias (PQ)¹, Angelo C. Pinto (PQ)² e Sergio Pinheiro (PQ)¹.

*rcsjunior@hotmail.com

¹ Departamento de Química Orgânica, Instituto de Química, UFF.

² Departamento de Química Orgânica, Instituto de Química, UFRJ.

Palavras Chave: triptofol, pineno, isatinal.

Introdução

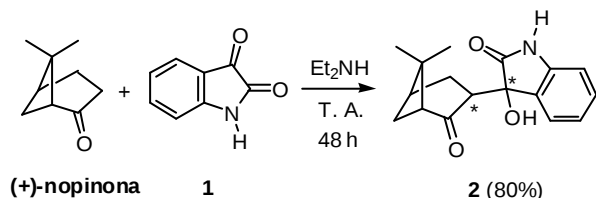
Triptofóis pertencem a uma classe de compostos com importantes atividades biológicas e têm sido sintetizados por meio de uma seqüência constituída de condensação aldólica de cetonas com isatinas, seguida por redução.¹

Anteriormente nosso grupo mostrou a reação de aldol da (+)-nopinona com aldeídos na síntese de novos aminoálcoois farmacologicamente ativos.^{2,3}

Neste trabalho relatamos a reação de aldol na síntese de novos aminoálcoois, pertencentes à classe dos triptofóis, derivados do terpeno natural beta-pineno.

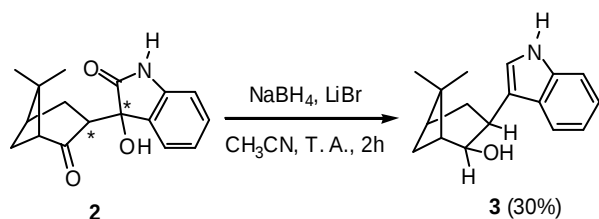
Resultados e Discussão

A reação de condensação aldólica da (+)-nopinona com a isatina (**1**) forneceu a cetona **2** em 80% de rendimento (**Esquema 1**).



Esquema 1: Preparação da cetona **2**.

O espectro de ¹H-RMN (300 MHz) demonstrou que tal produto é constituído de uma mistura de diastereoisômeros, a qual foi utilizada na etapa seguinte da rota sintética. A cetona **2** foi reduzida com NaBH₄ na presença de LiBr/acetonitrila,⁴ levando a formação do aminoálcool **3** em rendimento moderado (**Esquema 2**).



Esquema 2: Preparação do aminoálcool **3**.

Estudos de ¹H-RMN usando a técnica nOe diferencial demonstraram que o produto obtido se tratava de um único diastereoisômero, cuja configuração absoluta está mostrada na **Figura 1**.

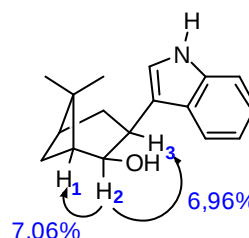


Figura 1: nOe diferencial do aminoálcool **3**.

Tal seletividade se deve à perda de um dos centros quirais associada à alta diastereosseletividade da etapa de redução da carbonila do sistema pinânico, a qual já foi relatada por nosso grupo anteriormente.²

Conclusões

A condensação aldólica seguida de redução com hidreto se mostrou um método eficaz para a síntese diastereosseletiva de um novo triptofol derivado do beta-pineno. Tal método está sendo utilizado na síntese de análogos de **3** com substituintes no anel indólico.

Agradecimentos

CNPq, CAPES e FAPERJ.

¹Garden, S. J.; Silva, R. B.; Pinto, A. C. *Tetrahedron* **2002**, 58, 8399.

³Silva Junior, R. C.; Ferreira, V. F.; Pinheiro, S. *Tetrahedron: Asymmetry* **2004**, 15, 3719.

² Silva Junior, R. C. Dissertação de Mestrado, IQ-UFF, **2005**.

⁴ Garden, S. J.; Côrrea, M. B.; Pinto, A. C. *Tetrahedron Lett* **2003**, 44, 7617.