

Preparação de isoxazóis intermediários nos estudos da síntese de furano-heliangolidos

Viviani Nardini (IC)*, Gil Valdo José da Silva (PQ)

*vivinardini@hotmail.com

Laboratório de Síntese Orgânica, Departamento de Química, Faculdade de Filosofia Ciências e Letras de Ribeirão Preto, Universidade de São Paulo.

Palavras Chave: isoxazol, cicloadição 1,3 dipolar, furano-heliangolido.

Introdução

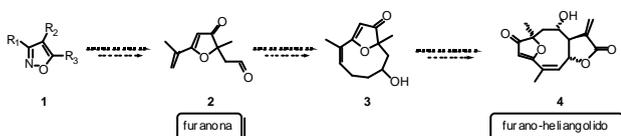
As reações de cicloadição [3+2] 1,3 dipolar entre óxidos de nitrila e álcoois propargílicos ou vinil cetonas são métodos eficazes para a construção de sistemas isoxazólicos (figura 1). Muitos compostos que possuem este tipo de estrutura apresentam atividades anticonvulsivas, antibactericidas,



antiasmáticas e farmacológicas.¹

Figura 1

Além de serem biologicamente ativos, esses compostos também são de grande importância na



química orgânica, pois servem de intermediários para a síntese de furanonas (esquema 1).²

Esquema 1

Resultados e Discussão

O 1-nitropropano (5) foi transformado em óxido de nitrila pelo POCl_3 e realizada uma cicloadição [3+2] com o 3-butin-2-ol para a síntese do composto (6) com 50% de rendimento.²

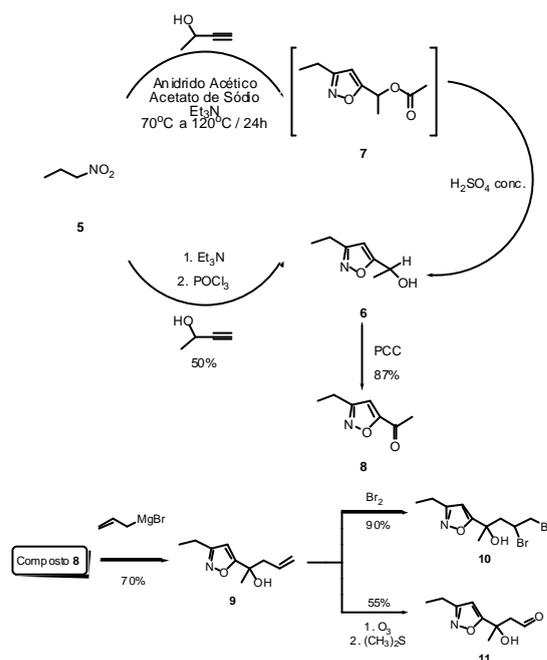
Uma alternativa interessante foi a obtenção do intermediário isoxazólico (7) na ausência de POCl_3 .³ Este produto, depois de observado no espectro de RMN ^1H , foi submetido a uma hidrólise ácida para a formação do composto (6).

Em seguida, o composto (8) foi obtido com 87% de rendimento a partir do composto (6) através da oxidação com PCC (clorocromato de piridínio).

Em trabalho anterior⁴, este composto (8) foi preparado a partir do mesmo nitrocomposto com rendimento global de 49%, porém por uma rota sintética diferente.

O composto (9) foi obtido em 70% de rendimento após tratamento do isoxazol (8) com brometo de alílmagnésio.

A partir do composto (9), foi possível sintetizar o composto (10) com 90% de rendimento



por uma bromação vinílica. O composto (11) foi obtido a partir do composto (9) através de uma ozonólise, fornecendo 55% de rendimento. (esquema 2).

Esquema 2

Conclusões

Neste trabalho, o composto (8) foi obtido com bons rendimentos globais através de duas rotas sintéticas distintas. Além disso, a síntese deste produto proporcionou a formação de outros derivados de isoxazóis com rendimentos satisfatórios, como os compostos (10) e (11).

Todos os produtos alcançados até o momento são intermediários importantes para a síntese de furanona (3).

Esta furanona será utilizada como material de partida para a síntese de furano-heliangolidos (4).

Agradecimentos

Agradecemos à FAPESP, CAPES e CNPq pelo apoio financeiro concedido.

Sociedade Brasileira de Química (SBQ)

¹Lin, ST.; Kuo, SH.; Yang, FM. *J. Org. Chem.* **1997**, *62*, 5229-5231.

²Chimichi, S.; Boccalini, M.; Cosimelli, B.; Dall'Acqua, F; Viola, G. *Tetrahedron* **2003**, *59*, 5215-5223.

³McKillop, A.; Kobylecki, R. J. *Tetrahedron* **1974**, *30*, 1365-1371.

⁴da Silva, G. V. J.; Costa e Silva, R.; Nardini, V. *29ª Reunião Anual da SBQ, Águas de Lindóia*, **2006**, QO-152.