

2-cloro acetoacetato de etila como precursor de sistemas heterocíclicos.

Mara E. F. Braibante(PQ), Hugo T.S.Braibante(PQ), Giovanna S.Silva (IC) e André C. Sauer (IC).

¹Departamento de Química, Universidade Federal de Santa Maria (UFSM), 97105-900, Santa Maria-RS-Brasil
mara@quimica.ufsm.br

Palavras Chave: heterociclos, diazetina, pirimidinona, triazinona, micro-ondas.

Introdução

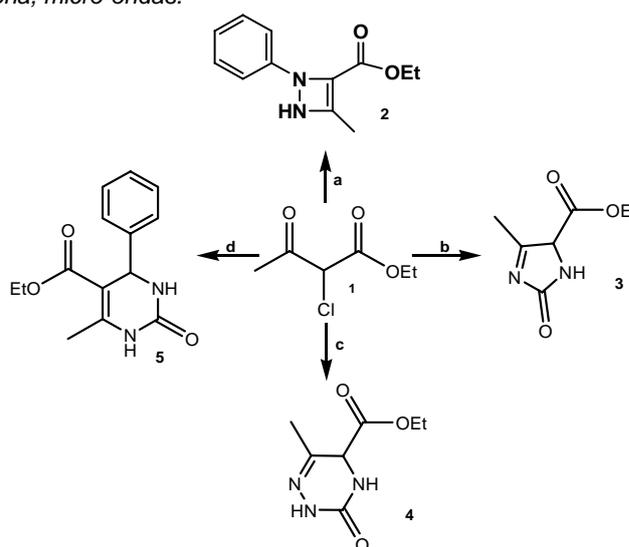
Neste trabalho avaliamos a reatividade do 2-cloro acetoacetato de etila **1**, visando a obtenção de diferentes sistemas heterocíclicos, através de reações com dinucleófilos como fenil hidrazina, uréia e semicarbazida, obtendo-se anéis de quatro, cinco e seis membros. As reações foram feitas em meio heterogêneo, utilizando montmorillonita, K-10 como suporte sólido, em solução, utilizando tolueno como solvente e micro-ondas (MO), como fonte de irradiação.

Resultados e Discussão

Para a obtenção da diazetina **2**, reagiu-se 2-cloro acetato de etila **1** com fenil hidrazina, tanto em meio homogêneo quanto em meio heterogêneo (condição reacional **a**), obtendo-se quantitativamente a 3-carboxilato de etila-2-fenil-4-metil-1,2 diidro-1,2 diazetina **2**. Resultados anteriores obtidos¹ com β -enamino ésteres α -clorados, demonstraram a influencia do Cloro na ciclização, pois obteve-se também a diazetina **2**, ocorrendo ciclização [2+2] reação no carbono carbonílico e no carbono- α que contém o cloro, independente do substituinte no nitrogênio do enaminoéster. Desta forma testamos outros dinucleófilos para comprovar o padrão de reatividade deste centro, obtendo-se a imidazolona **3**, triazinona **4** e pirimidinona **5**, conforme Esquema reacional.

A pirimidinona **5**, foi obtida utilizando o procedimento de Biginelli modificado², reação multicomponente sem solvente, misturou-se o 2-cloroacetato de etila **1**, benzaldeído e uréia em um béquer, submeteu-se a irradiação de MO, potência de 600 W por 6 min (intervalos de 3 x 2 min).

As demais reações foram efetuadas em potência de 200 W por 4 min (intervalos de 2 x 2 min), utilizando forno de micro-ondas doméstico, calibrado, obteve-se de 40-60 % de rendimento os quais estão sendo otimizados, sendo que para o heterociclo **2** o rendimento foi quantitativo.



- a** – NH₂NHPh.HCl / Tolueno / Piridina /MO ou NH₂NHPh.HCl /K-10/ Piridina /MO.
b – NH₂CONH₂ / K-10 / Trietilamina /MO.
c – NH₂CONHNH₂, HCl / K-10 / Trietilamina/ MO.
d – NH₂CONH₂ / Benzaldeído / MO.

Conclusões

Os heterociclos obtidos neste trabalho são de grande importância, visto que existem patentes com várias aplicações na área medicinal. Imidazolonas por exemplo encontram aplicações em doenças cardio e cerebrovasculares, derivados de diazetina são vaso dilatadores pirimidinas e seus derivados apresentam atividade anti-hipertensiva, anti-inflamatória e cardiovascular.³

Agradecimentos

CNPq (Bolsa PIBIC-UFSM G.S.S.), FAPERGS (Bolsa IC, A.C.S).

¹ Oriques, D.A. Dissertação de mestrado- UFSM, **2005**.

² Khunt,R.C.; Akbari,J.D.;Manvar, A.T.; Tala, S.D.; Dhaduk,M.F.;Josi, H.S.; Shah, A. *ARKIVOC(xi)*277-284, **2008**.

³ Khania, E. L.; Sillinietsse, G. O.; 0201, Ya. Ya.; Dabur, G. Ya.; Kimenis, A. A. *Khin Pharm. Zh.* **1978**, 78, 1321.