

Síntese de 2-aminotiofenos via reação de *Gewald* sem o uso de solventes orgânicos

Josué Sebastián Bello*¹ (PG), Joel Jones Jr¹ (PQ), Flavia M. Silva¹ (PQ), Erika Martins de Carvalho²(PQ)

¹Síntese Orgânica Ambiental (SOA)-Instituto de Química, Dept. Química Orgânica-UFRJ -CP 68.584, 21941-972Rio de Janeiro-RJ, Brasil

²Instituto de Tecnologia em Fármacos, Far-Manguinhos, Rua Sizenando Nabuco no.100, Manguinhos, 21041-250 Rio de Janeiro-RJ, Brasil

*soa@iq.ufrj.br

Palavras Chave: 2-aminotiofenos, reação de *Gewald*, solventes orgânicos

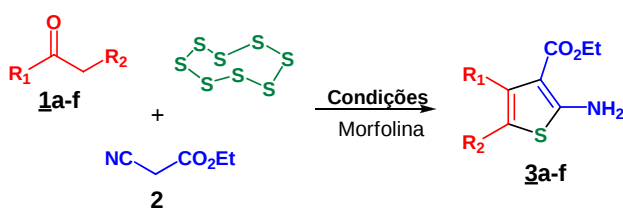
Introdução

O interesse científico para os tiofenos sempre tem sido constante e notável, devido a suas aplicações praticas na indústria, na medicina e na agricultura¹. Por isso, os derivados tiofênicos têm atraído a atenção durante muitas décadas, principalmente por suas excelentes propriedades biológicas e como blocos de construção na geração de estruturas mais complexas².

O objetivo deste trabalho é desenvolver duas rotas de síntese para 2-aminotiofenos, sem o uso de solventes orgânicos.

Resultados e Discussão

Foram sintetizados seis compostos 2-aminotiofenos (**3a-f**), empregando diferentes cetonas (**1a-f**), enxofre, cianoacetato de etila (**2**) e morfolina como base (Esquema 1).



Esquema 1. Síntese de 2-aminotiofenos

Encontrou-se que utilizando água como solvente (sem necessidade de catalisador de transferência de fase) a reação acontece com irradiação de microondas. A outra metodologia consiste em simples agitação dos componentes a temperatura ambiente na ausência de solvente (Tabela 1). Segundo nosso conhecimento, as duas metodologias não estão reportadas na literatura. Observar-se que os melhores rendimentos são obtidos na ausência de solvente. Entretanto, o tempo de reação é bem maior comparado à metodologia com irradiação com micro-ondas e água como solvente.

Tabela 1. Dados obtidos na síntese de 2-aminotiofenos através de duas novas metodologias.

Comp.	Cetona		Condições			
	R ₁	R ₂	Sem solvente		Micro-ondas	
			Rend. (%)	Tempo (dia)	Rend. (%)	Tempo (min)
3a	CH ₃	CO ₂ Me	82	1	—	—
3b	CH ₃	CO ₂ Et	70	1	30	3
3c			60	2	25	3
3d			75	1	80	3
3e			100	1	30	3
3f			77	1	26	3

A caracterização das moléculas sintetizadas foi feita através de IV, CG-ES e RMN (¹H, ¹³C). Comparação feita com os dados experimentais reportados na literatura ratificaram o êxito das metodologias implementadas.

Conclusões

Duas novas metodologias, simples e rápidas, foram desenvolvidas para a síntese de 2-aminotiofenos sem o uso de solventes orgânicos.

Agradecimentos

Os autores agradecem à CNPq pelo apoio financeiro.

¹Koike, K.; Jia, Z.; Nikaido, T.; Liu, Y.; Zhao, Y.; Guo, D. *Org. Lett.* **1999**, *1*, 197.

²Ogawa, K.; Radke, K.; Rothstein, S.; Rasmussen, S. *J. Org. Chem.* **2001**, *66*, 9067