

Síntese de 3,4-Diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas através da Reação de Biginelli sob Catálise de Ácido *p*-Toluenosulfônico

Samira Robadel Pacheco (IC)*, Daniel Leite Silva (PG), Ângelo de Fátima (PQ)

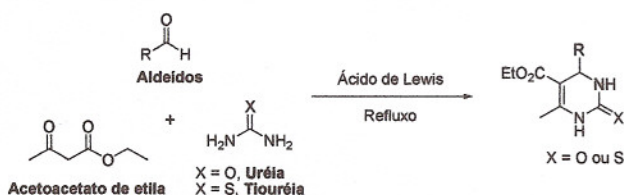
* E-mail: samirarp@hotmail.com

Grupo de Estudos em Química Orgânica e Biológica (GEQOB), Departamento de Química, Universidade Federal de Minas Gerais, Av. Antônio Carlos, 6627 - Pampulha - Belo Horizonte - MG, CEP 31270-901.

Palavras Chave: Compostos de Biginelli, Ácido *p*-Toluenosulfônico, Química Orgânica.

Introdução

A reação de Biginelli é uma reação multicomponente que envolve a ciclocondensação de ésteres acetoacéticos, aldeídos aromáticos e (tio)uréia, na presença de catalisadores ácidos de Lewis ou ácidos de Brønsted-Lowry (Esquema 1)^[1]. O grande interesse na reação de Biginelli se deve, em parte, às potenciais aplicações biológicas das 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas, a citar: atividades antiviral, antiproliferativa e anti-hipertensiva^[2].



Esquema 1. Esquema Geral para a Reação de Biginelli

O ácido *p*-toluenosulfônico (APTS) é um ácido orgânico forte, cerca de um milhão de vezes mais forte que o ácido benzóico. Ao longo dos últimos anos, sua utilização como catalisador tem recebido atenção considerável em diferentes áreas da síntese orgânica^[3-4]. Neste trabalho realizou-se o estudo do emprego do APTS como catalisador na síntese de 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas através da reação de Biginelli.

Resultados e Discussão

Uma série de oito 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas foi sintetizada empregando-se ácido *p*-toluenosulfônico (APTS) como catalisador. Os resultados obtidos são apresentados na Tabela 1. Os compostos obtidos foram devidamente caracterizados através das técnicas de Infravermelho e de Ressonância Magnética Nuclear (RMN) de 1H e ^{13}C . Os dados obtidos estão de acordo com aqueles descritos na literatura^[2].

Os compostos foram obtidos em bons rendimentos e o ácido *p*-toluenosulfônico (APTS) mostrou-se eficiente e útil na síntese de 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas.

Tabela 1. 3,4-Diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas Sintetizadas através da Reação de Biginelli sob Catálise de Ácido *p*-Toluenosulfônico (APTS)

R	X	Rendimento (%)
C_6H_5	S	66
2-OH- C_6H_5	S	71
3-OH- C_6H_5	S	69
4-OH- C_6H_5	S	77
C_6H_5	O	76
2-OH- C_6H_5	O	60
3-OH- C_6H_5	O	78
4-OH- C_6H_5	O	81

Conclusões

O ácido *p*-toluenosulfônico (APTS) apresentou-se como um catalisador orgânico eficiente para obtenção de 3,4-diidropirimidin-2(1H)-onas/-tionas através da reação multicomponente de Biginelli. Novos compostos estão sendo sintetizados em nosso laboratório empregando-se APTS como catalisador.

Agradecimentos

Os autores agradecem à FAPEMIG, ao CNPq e à CAPES pelo financiamento e concessão das bolsas de estudo.

¹ Kappe, C.O. *Acc. Chem. Res.* **2000**, *33*, 879.

² Russowsky, D.; Canto, R. F. S.; Sanches, S. A. A.; D'Oca, M. G. M.; de Fátima, A.; Pilli, R. A.; Kohn, L. K.; Antônio, M. A.; Carvalho, E. *Bioorg. Chem.* **2006**, *34*, 173

³ da Silva, D.L. *Synlett.* **2010** (Submetido).

⁴ Jin, T.; Zhang, S.; Li, T. *Synt. Comm.* **2002**, 1547.