

Obtenção de álcoois 2-alquinil benzílicos visando à síntese de benzofuranos e isocromenos

Henrique Gonçalves Leite^{1*} (IC), Leandro Helgueira da Andrade² (PQ), Álvaro Takeo Omori^{1*} (PQ)

¹Centro de Ciências Naturais e Humanas (CCNH)-UFABC, ²Instituto de Química – Universidade de São Paulo (IQ-USP)

* alvaro.omori@ufabc.edu.br

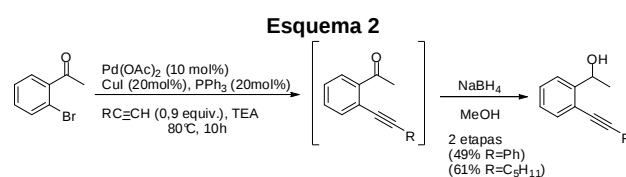
Palavras Chave: Teluretos, Sonogashira, ciclização.

Introdução

Muitos isocromenos¹ e benzofuranos² estão presentes nas estruturas de compostos naturais biologicamente ativos. Entre os métodos de preparação, uma delas envolve a ciclização de alcoóis 2-alquinilbenzílicos.³

Neste trabalho preliminar, foram desenvolvidos duas metodologias na preparação de 1-feniletanol *orto* alquinil substituídos.

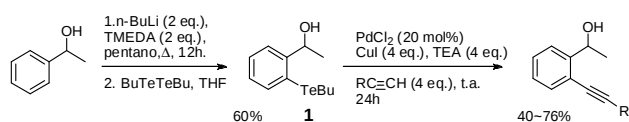
A outra metodologia, mais eficiente, envolveu o uso da *orto*-bromoacetofenona como material de partida. Primeiramente foi feita a reação de Sonogashira, seguida da redução da cetona, sem prévia purificação (esquema 2).



Resultados e Discussão

Para inserirmos o grupo alquinil na posição *orto* e usando 1-feniletanol como reagente, adotamos inicialmente o método de *orto*-metalacão⁴ utilizando ditelureto de dibutila como eletrófilo seguida de acoplamento do tipo Sonogashira, usando cloreto de paládio (esquema 1).

Esquema 1



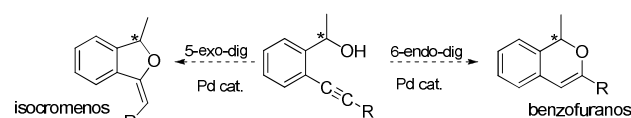
Diferentes rendimentos foram obtidos para cada alcino terminal utilizado (tabela 1).

Tabela 1. Produtos de acoplamento entre telureto 1 e diversos alcinos.

Alcino	Produto	Rend.
Ph-C≡CH		46%
C ₅ H ₁₁ -C≡CH		40%
HOH ₂ C-C≡CH		76%
H ₃ C-C(H) ₂ -C(H)(OH)-C≡CH		45%

Os próximos estudos envolverão a aplicação destes alcoóis nas formas quirais na tentativa de obtenção de benzofuranos e/ou isocromenos opticamente puros (esquema 3).

Esquema 3



Conclusões

Desenvolvemos duas metodologias para obtenção de álcoois 2-alquinil benzílicos com rendimentos moderados.

Agradecimentos

Ao programa PIBIC da Universidade Federal do ABC, ao CNPq e à FAPESP.

- Kang, H.-S.; Jun, E.-M.; Park, S.-H.; Heo, S.-J.; Lee, T.-S.; Yoo, I.-D.; Kim, J.-P. *J. Nat. Prod.* **2007**, 70, 1043.
- Pahari, P.; Senapati, B.; Mal, D. *Tetrahedron Lett.* **2004**, 45, 5109
- Mancuso, R.; Mehta, S.; Gabriele, B.; Salerno, G.; Jenks, W. S.; Larock, R. C. *J. Org. Chem.* **2010**, 75, 897.
- Cunha, R. L. O. R.; Omori, A. T.; [Comasseto, J.V.](#); Andrade, L. H. *Alternative process for o-chalcogenation of aromatic by ortho-metallation and anion capture by diorganyl dichalcogenides. In: 10th Brazilian Meeting on Organic Synthesis, 2003, Abstracts book Campinas: UNICAMP.*