

### 3-Picolilamina como precursor na síntese de 1,3-tiazolidin-4-onas

Maiéli C. Soares<sup>1</sup> (IC), Luciara V. Gonsalves<sup>1</sup> (IC), Patrícia D. Neuenfeldt<sup>1</sup> (PG), Bruna B. Drawanz<sup>1</sup> (IC), Auri R. Duval<sup>1,2</sup> (PG), Wilson Cunico<sup>1\*</sup> (PQ). \*wilson.cunico@ufpel.edu.br

1. Departamento de Química Orgânica, UFPel, Pelotas, RS, Brasil

2. Instituto Federal Sul-rio-grandense, Pelotas, RS, Brasil

Palavras Chave: Tiazolidinonas, 3-Picolilamina, Heterociclos.

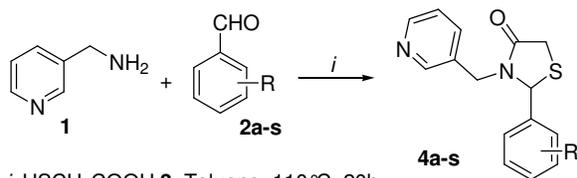
#### Introdução

Tiazolidinonas são compostos heterocíclicos de 5 membros que apresentam em sua estrutura um átomo de enxofre, um átomo de nitrogênio e uma carbonila. Esses heterociclos podem ser obtidos a partir de reações de ciclocondensação entre uma amina, um composto carbonílico (aldeído ou cetona) e o ácido mercaptoacético.<sup>1,2</sup> São encontradas na literatura diversas aplicações de tiazolidinonas na medicina: como agentes antiretrovirais, antiinflamatórios, antibacterianos entre outros.<sup>3</sup> O objetivo desse trabalho foi explorar a versatilidade sintética da 3-picolilamina na síntese de tiazolidinonas funcionalizadas.

#### Resultados e Discussão

Os compostos **4a-s** foram sintetizados através da reação entre a 3-picolilamina **1**, os benzaldeídos substituídos **2a-s** com excesso de ácido mercaptoacético **3** em refluxo de tolueno por 20 horas em bons rendimentos (Esquema 1, Tabela 1). A água formada na reação foi removida por destilação azeotrópica. Após o tempo reacional, a mistura foi tratada com solução saturada de NaHCO<sub>3</sub> para remoção do excesso do ácido mercaptoacético e os heterociclos **4a-s** puros foram obtidos após purificação por lavagem com hexano a quente.

#### Esquema 1.



Todos os compostos foram confirmados por RMN de <sup>1</sup>H e <sup>13</sup>C.

Tabela 1. Rendimentos dos heterociclos **4a-s**.

	R	Rend. (%)	p.f. (°C)
<b>4a</b>	2-NO <sub>2</sub>	82	-
<b>4b</b>	3-NO <sub>2</sub>	85	-
<b>4c</b>	4-NO <sub>2</sub>	90	-
<b>4d</b>	2-Cl	98	92
<b>4e</b>	3-Cl	83	-
<b>4f</b>	4-Cl	98	-
<b>4g</b>	2-F	77	-
<b>4h</b>	3-F	97	105
<b>4i</b>	4-F	96	-
<b>4j</b>	2-OCH <sub>3</sub>	70	-
<b>4l</b>	3-OCH <sub>3</sub>	69	-
<b>4m</b>	4-OCH <sub>3</sub>	60	-
<b>4n</b>	2-CN	-	-
<b>4o</b>	3-CN	79	-
<b>4p</b>	4-CN	99	85
<b>4q</b>	2-OH	79	96
<b>4r</b>	3-OH	98	-
<b>4s</b>	4-OH	98	-

#### Conclusões

Como conclusão, dezessete novas tiazolidinonas foram sintetizadas com alto grau de pureza e bons rendimentos. De forma não esperada, o produto **4n** (R=2-CN) não foi obtido devido a identificação de uma complexa mistura de sub-produtos na cromatografia em camada fina (CCF).

#### Agradecimentos

UFPel, CNPq, Capes, IF-Sul

<sup>1</sup> Cunico, W.; Gomes, C.R.B.; Vellasco Jr, W.T. *Mini-Rev. Org. Chem.* **2008**, *5*, 336.

<sup>2</sup> Cunico, W.; Gomes, C.R.B.; Ferreira, M.L.G.; Capri, L.R.; Soares, M.; Wardell, S.M.S.V. *Tetrahedron Lett.* **2007**, *48*, 6217.

<sup>3</sup> a) Kavitha, C.V.; Basappa; Swamy, S.N.; Mantelingu, K.; Doreswamy, S.; Sridhar, M.A.; Prasad, J.S.; Rangappa, K.S. *Bioorg. Med. Chem.* **2006**, *14*, 2290. b) Ravichandran, V.; Prashantha Kumar, B.R.; Sankar, S.; Agrawal, R.K. *Eur. J. Med. Chem.* **2009**, *44*, 1180. c) Sharma, S.; Singh, T.; Mittal, R.; Saxena, K.K.; Srivastava, V.K. Kumar, A. *Arch. Pharm. Chem. Life Sci.* **2006**, *339*, 145.