

# Oxidação de Swern: Um novo procedimento para obtenção de 3-Trifluoracetilpirróis *N*-aril Substituídos

Nilo Zanatta (PQ), Estefania da C. Aquino\* (PG), Helio G. Bonacorso (PQ) e Marcos A. P. Martins (PQ).

Núcleo de Química de Heterociclos (NUQUIMHE), Departamento de Química, Universidade Federal de Santa Maria-UFSM, Av. Roraima, 1000, Bairro Camobi, 97.105-900, Santa Maria, RS, Brasil.

\*Autor: Tel./Fax: (55) 3220-8756, e-mail: estefaniacaquino@gmail.com

Palavras Chave: Pirróis *N*-Substituídos, aril aminas, oxidação Swern.

## Introdução

Pirróis constituem uma importante classe de compostos orgânicos encontrados em muitos produtos naturais e moléculas bioativas. Estes compostos bioativos apresentam notáveis atividades, como antitumoral, imunossupressora, antiinflamatória, antioxidante, anti-HIV, dentre outras.<sup>1</sup>

A utilização de reações de oxidação na obtenção de pirróis foi evidenciada por Zanatta e col.<sup>2</sup>, com o uso da oxidação com PCC. No entanto, esse método não foi eficiente para a obtenção de pirróis *N*-aril substituídos.

A oxidação de Swern é um método clássico de transformação de álcoois primários e secundários em aldeídos e cetonas, respectivamente. Este tipo de oxidação evita o uso de metais pesados, como cromo, e podem ser realizadas em condições muito suaves.<sup>3</sup> Portanto, este trabalho apresenta um novo procedimento reacional, através da utilização da oxidação de Swern, que permitiu a preparação de uma série de 3-trifluoracetilpirróis *N*-aril substituídos.

## Resultados e Discussão

Os pirróis foram obtidos a partir da reação do 3-trifluoracetil-4,5-dihidrofurano (**1**) com aril aminas gerando os intermediários 1,1,1-trifluoro-3-(2-hidroxi-1-*N*-arilamino-3-buten-2-ona) (**2**). Esses intermediários **2** foram diretamente submetidos à reação de oxidação de Swern, produzindo os intermediários 1,1,1-trifluoro-3-(2-etanal)-4-*N*-arilamino-3-buten-2-ona (**3**) que sofreram reação de ciclização intramolecular produzindo os 3-trifluoracetilpirróis *N*-aril substituídos **4a-f**, conforme descrito no **Esquema 1**.

A oxidação de Swern consiste no tratamento do intermediário **2** com DMSO "ativado" a baixa temperatura, para formação do íon sulfônio que é convertido no aldeído mediante tratamento com trietilamina. Depois de decorrido o tempo reacional o solvente utilizado na reação foi evaporado e o sólido formado foi solubilizado com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com uma solução de H<sub>2</sub>O ácida 3% e posteriormente com uma solução 1M de NaHCO<sub>3</sub>. A fase orgânica depois de seca com Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> foi concentrada em rotaevaporador.

## Esquema 1:

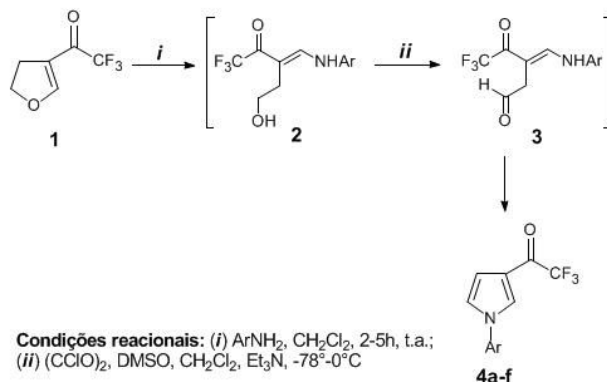


Tabela 1: Aril aminas utilizadas.

Composto	Ar	Composto	Ar
<b>4a</b>	3-CH <sub>3</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	<b>4d</b>	4-OCH <sub>3</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
<b>4b</b>	4-CH <sub>3</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	<b>4e</b>	3-F(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
<b>4c</b>	3-OCH <sub>3</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	<b>4f</b>	4-F(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )

Os pirróis obtidos **4a-f** apresentaram elevado grau de pureza e rendimentos globais de 60-90%. Este sistema pôde ser aplicado a diversas aril aminas como as citadas na **Tabela 1**. Os pirróis obtidos neste trabalho foram identificados por RMN de <sup>1</sup>H e <sup>13</sup>C e Espectroscopia de Massas.

## Conclusões

Este trabalho apresentou um novo procedimento de oxidação em condições suaves e simples, sem geração de subprodutos, que originou uma série de 3-trifluoracetilpirróis *N*-aril substituídos. Os compostos foram obtidos com bons rendimentos e elevado grau de pureza.

## Agradecimentos

Os autores agradecem as entidades financiadoras CNPq, CAPES, FAPERGS.

<sup>1</sup> Reddy, V. P.; Kumar, A. V.; Rao, K. R. *Tetrahedron Lett.* **2011**, 52, 777-780.

<sup>2</sup> Zanatta, N.; Wouters, A. D.; Fantinel, L.; Da Silva, F. M.; Barichello, R.; Da Silva, P. E. A.; Ramos, D. F.; Bonacorso, H. G. e Martins, M. A. P. *Synlett* **2009**, 5, 0755-0758.

<sup>3</sup> Cunha, A. C.; Paixão, F. M. Da; Souza, M. C. B. V. De; Ferreira, V. F. *Quim. Nova* **2006**, 29, 3, 520-527.