

Síntese de Benzoeterociclos-1,2,3-Triazóis Conjugados com o Núcleo Naftoquinônico

Wagner de O. Valença (IC)*, Wilson S. do Nascimento (PG), Celso A. Câmara (PQ), Ronaldo N. de Oliveira (PQ)

Departamento de Química- Laboratório de Síntese de Compostos Bioativos- Universidade Federal Rural de Pernambuco, Rua Dom Manoel de Medeiros S/N, Dois Irmãos 52171-900 - Recife, PE – Brasil
e-mail: wagner_valenca87@hotmail.com

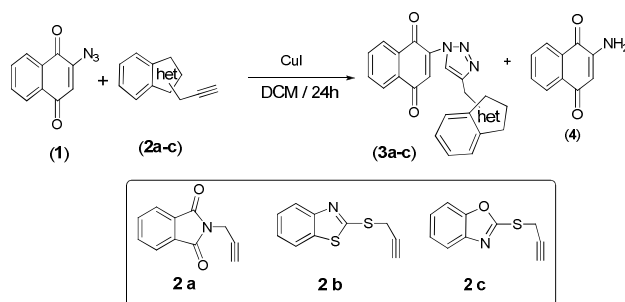
Palavras Chave: Benzoeterociclos Propargílicos, Cicloadição, 1,2,3-Triazol.

Introdução

As quinonas têm recebido considerável atenção desde o final da década de 50 devido sua atividade biológica antineoplásica.^[1] Por exemplo, a Mitomicina C é um antibiótico que contém a função quinona e também apresenta atividade antitumoral.^[2] Nos últimos anos, os 1,2,3-triazóis são alvo sintético, uma vez que diversas atividades biológicas têm sido relatadas, tais como anti-HIV e anti-bacteriana.^[3] Neste trabalho, temos o interesse de sintetizar novos triazóis conjugados com os benzoeterociclos e o núcleo naftoquinônico através da reação de cicloadição 1,3-dipolar entre os alcinos terminais (**2a-c**) e a azida-naftoquinônica (**1**).

Resultados e Discussão

Primeiramente, realizamos a síntese dos materiais de partida; a síntese da 2-azido-naftoquinona (**1**) foi realizada a partir da 2-bromo-naftoquinona empregando refluxo em etanol durante 2 minutos com rendimento de 87%. A síntese dos benzoeterociclos propargílicos foi realizada através da reação entre o brometo propargílico e os benzoeterociclos correspondentes. Utilizamos K₂CO₃/DMF à temperatura ambiente sob energia de ultrassom por 2 horas, dessa forma obtivemos os benzoeterociclos propargílicos (**2a-c**) com rendimentos entre 55-77%. Em seguida, realizamos a reação de cicloadição 1,3-dipolar entre 1 mmol da azida (**1**) e 1,5 mmol dos alcinos (**2a-c**), empregando 10 mol% de CuI, em uma mistura reacional com diclorometano como solvente (Esquema 1). A reação foi deixada sob agitação à temperatura ambiente por 24h. Os compostos (**3a-c**) foram obtidos em moderados a bons rendimentos 60-84% (Tabela 1). Os rendimentos moderados podem ser justificados pela identificação da formação da amina (**4**) como produto de redução da azida (**1**). A otimização do procedimento experimental para diminuir a formação de (**4**) está em andamento.



Esquema 1: Síntese dos benzoeterociclos-1,2,3-triazóis-naftoquinônicos (**3a-c**)

Tabela 1. Dados dos compostos (**3a-c**).

Produto	Tempo(h)/ Rend. (%) ^a	P. Fusão (°C)	R _f ^c
3a	15/84 ^b	214-216	0,6
3b	22/61	122-123	0,5
3c	23/60	138-139	0,5

^aApós coluna cromatográfica. ^b co-solvente: Hex/AcOEt (7:3). ^c CH₃CN.

Conclusões

Novas naftoquinonas conjugadas com 1,2,3-triazóis e *N,S*- benzoeterociclos propargílicos foram sintetizadas em rendimentos moderados a bons; o procedimento experimental está sendo otimizado. Os 1,2,3-triazóis foram caracterizados por análise de IV, RMN ¹H e ¹³C.

Agradecimentos

A FACEPE pelo apoio financeiro e pelas bolsas concedidas aos alunos Wagner de O. Valença e Wilson S. do Nascimento. A Central Analítica da UFPE pelos dados espectroscópicos.

[1] de Oliveira, R.B.; Alves, R.J. *Quim. Nova*, **2002**, 25, 976.

[2] Almeida, V.L.; Leitão, A.; Reina, L.C.B.; Montanari, C.A.; Donnici, C.L.; Lopes, M.T.P. *Quim. Nova*, **2005**, 28, 118.

[3] Barbosa, F.C.G.; de Oliveira, R.N. *J. Braz. Chem. Soc.*, **2011**, 22, 592.