

Cicloadição formal aza-[3+3] de enaminonas cíclicas catalisadas por bismuto: síntese de indolizidínona e quinolizidínona polifuncionalizados

Raimundo F. Santos Filho^{*1,2} (PG), Sílvia Cunha^{1,2} (PQ)
e-mail: raifilho2@yahoo.com.br^{*}



Grupo de Pesquisa em Síntese Química e Bioatividade Molecular

¹Universidade Federal da Bahia, Campus de Ondina - Instituto de Química, 40170-290 Salvador, BA Brasil

²INCT Instituto de Energia e Ambiente, Universidade Federal da Bahia, 40170-290 Salvador, BA – Brasil

Palavras Chave: Reação de aza-anelação, enaminona, oxazolona.

Introdução

Enaminonas é qualquer composto que apresente o sistema conjugado N-C=C-C=O. São substâncias de fácil obtenção, densamente funcionalizadas com vários centros reativos, o que lhes confere comportamento ambifílico e ambidentado¹. Enaminonas apresentam vasta aplicação em síntese orgânica e diversificada aplicação biológica.¹

Em virtude do potencial sintético das enaminonas, nosso grupo de pesquisa tem se dedicado à exploração destas substâncias como intermediários na síntese de novas substâncias nitrogenadas, com potencial atividade biológica.

A necessidade de investigar deferentes classes de compostos com potencial biológico nos remete aos estudos de reação de aza-anelação formal [3 + 3] de enaminonas com intuito de construir diferentes núcleos de azabiciclos.

Foi utilizado com aceptor de Michael, oxazolonas (**1-4 e 10**) que são versáteis substratos em síntese orgânica, tendo diversificadas aplicações sintéticas incluindo síntese de heterociclos, α,β -deidro- α -aminoácidos, peptídeos, etc.²

Resultados e Discussão

Iniciamos o estudo reacional de **1** com **2** em refluxo, não observou produto, resolveu se introduzir catalise de bismuto, onde obtivemos o produto desejado porém em longo tempo reacional isso nos levou a mudar as condições reacionais realizando a reação em banho de ultrassom e radiação de microondas, obtivendo excelentes resultados (Figura 1).

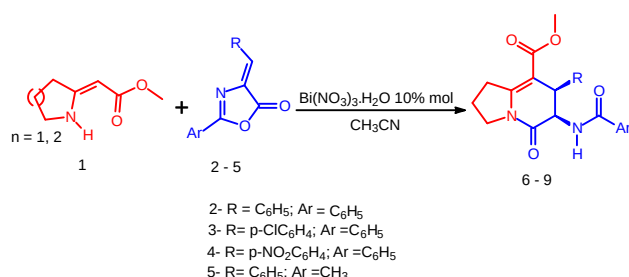


Figura 1: Reação de aza-anelação formal [3+3] com oxazolona 2-5.

35^a Reunião Anual da Sociedade Brasileira de Química

Tabela 1. Síntese das indolizidinonas catalisadas por Bi(NO₃)₃·5H₂O.

	Condição	Tempo	Rend. (%)
6	Refluxo	96 hs	93
6	Ultrassom	38 hs	50
6	Microondas*	120 mim	75
6	Microondas	40 mim	93
7	Microondas	40 mim	72
8	Microondas	40 mim	64
9	Microondas	30 mim	94

*Sem catalise

Com objetivo de expandir a metodologia reagiu-se as enaminonas cíclicas **1** e **10** com eletrófilo **11**, obtendo núcleos indolizidinonas (**12**), quinolizidinonas (**13**), (Figura 2).

Conclusões

A reação de cicloadição formal entre as enaminonas cíclicas **1** e **10** e as oxazolonas **2-5** e **11** foi muito eficiente, sendo reagentes economicamente viáveis, possibilitando a obtenção de heterociclos nitrogenados polifuncionalizados.

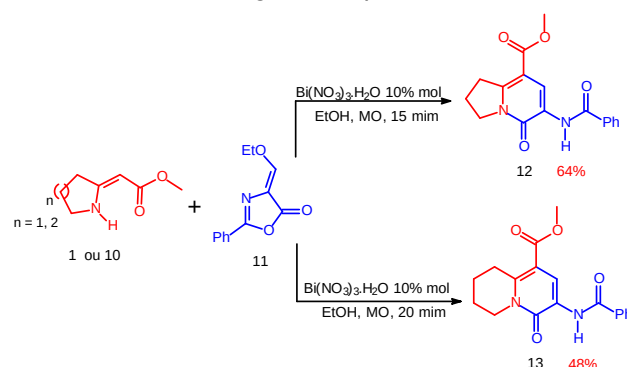


Figura 2: Reação de aza-anelação formal [3+3] com oxazolona 11.

Agradecimentos

A CAPES, FAPESB e ao CNPq pela bolsa concedida.

1 Elassar, A.-Z. A.; El-Khair, A. A. Tetrahedron **2003** 59, 8463-8480.

2 Afonso, C. A. M.; Matos, M. R. P. N.; Gois, P. M. P.; Mata, M. L. E. N.; Cabrita, E. J. Synthetic Communications. **2003** 33, 8, 1285-1299.