

Síntese de benzofuranos funcionalizados por meio de reação de iodociclização de alquinilanisóis.

Carlise Frota¹ (PG), Allan F. C. Rossini¹ (IC) e Cristiano Raminelli^{2,*} (PQ)

¹Faculdade de Ciências Exatas e Tecnologia, Universidade Federal da Grande Dourados, Dourados, MS

²Departamento de Ciências Exatas e da Terra, Universidade Federal de São Paulo, Diadema, SP

*raminelli@unifesp.br

Palavras Chave: iodociclização, benzofuranos

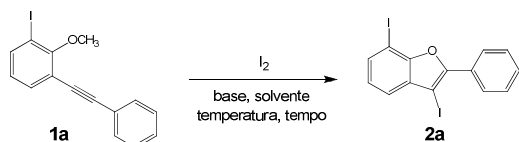
Introdução

Os benzofuranos são importantes blocos sintéticos presentes em um número elevado de produtos naturais biologicamente ativos, possuindo propriedades farmacológicas de interesse.¹ Em conformidade, neste resumo apresentamos nossos resultados preliminares envolvendo a reação de iodociclização de 2-iodo-6-alquinilanisóis, empregando iodo molecular em condições brandas, visando à formação de benzofuranos funcionalizados, potenciais precursores de fármacos e materiais funcionais.

Resultados e Discussão

Inicialmente utilizamos 2-iodo-6-(feniletinil)anisol (**1a**) na reação de iodociclização para a síntese do benzofurano diiodado **2a**, empregando iodo molecular, variando as condições reacionais, na tentativa de obter o produto de interesse em um rendimento considerável (Tabela 1).

Tabela 1. Otimização das condições para síntese do composto **2a**.



Exp.	I ₂ (equiv)	Base (equiv)	Solvente	Temp. (°C)	Tempo (h)	Rend. isolado (%)
1	2	--	CH ₂ Cl ₂	t.a.	3	Traços
2	2	--	CH ₂ Cl ₂	t.a.	12	34
3	2	--	CH ₂ Cl ₂	40	12	44
4	2	NaHCO ₃ (2)	CH ₂ Cl ₂	40	12	65
5	2	K ₂ CO ₃ (2)	CH ₂ Cl ₂	40	12	51
6	2	Bu ₄ NI (2)	CH ₂ Cl ₂	40	12	63
7	2	NaHCO ₃ (2)	CICH ₂ CH ₂ Cl	70	12	83
8	2	NaHCO ₃ (3)	CICH ₂ CH ₂ Cl	70	12	85
9	2	NaHCO ₃ (3)	CICH ₂ CH ₂ Cl	70	24	88
10	3	NaHCO ₃ (3)	CICH ₂ CH ₂ Cl	70	12	87
11	3	NaHCO ₃ (3)	CICH ₂ CH ₂ Cl	70	24	97

Fazendo uso das condições reacionais otimizadas para a reação de iodociclização, Tabela 1, Exp. 11, sintetizamos uma série de quatro benzofuranos funcionalizados (**2**) (Tabela 2).

Tabela 2. Síntese de benzofuranos diiodados (**2**).^a

Exp.	2-Iodo-6-alquinil-anisól (1)	Benzofurano funcionalizado (2)	Rendimento isolado (%)
1			97
2			71
3			57
4			46

^aCondições reacionais: 0,25 mmol de **1**, 0,75 mmol de I₂, 0,75 mmol de NaHCO₃ e 5 mL de CICH₂CH₂Cl foram mantidos sob agitação a temperatura de 70°C por 24 h.

Conclusões

Otimizamos as condições para a reação de iodociclização de 2-iodo-6-alquinilanisóis (**1**) que resultou na formação de benzofuranos funcionalizados (**2**) em bons rendimentos.

Agradecimentos

Ao CNPq, a Capes e a FUNDECT pelo suporte financeiro.

¹ (a) Zeni, G.; Larock, R. C. *Chem. Rev.* **2006**, *106*, 4644. (b) Cacchi, S.; Fabrizi, G. *Chem. Rev.* **2005**, *105*, 2873. (c) Alonso, F.; Beletskaya, I. P.; Yus, M. *Chem. Rev.* **2004**, *104*, 3079.