

# Reação de cicloadição formal aza-[3+3] de arilidenos-oxazolonas e 2-aminopiridinas: síntese de pirido-tiazinonas e pirido-pirimidinonas

Geiziane Alves\*<sup>1</sup>(IC), Jéssika A. Amparo<sup>1</sup>(IC), Raimundo Francisco<sup>1</sup>(PG), Silvio Cunha<sup>1</sup>(PQ).

\* e-mail: geisy-alves1@hotmail.com

<sup>1</sup>Instituto de Química, Universidade Federal da Bahia, Campus de Ondina, 40170-290, Salvador – BA, Brasil/ Instituto Nacional de Ciência e Tecnologia - INCT em Energia e Ambiente, Universidade Federal da Bahia, Campus de Ondina, Salvador, BA, 40170-290, Brasil

Palavras Chave: oxazolona, 2-aminopiridina, tiazinona, pirimidinona, aza-anelação.

## Introdução

Anéis heterocíclicos altamente funcionalizados com propriedades biológicas são de grande interesse na indústria farmacêutica e agrícola.<sup>1</sup>

Algumas pirimidinonas têm sido descritas recentemente na literatura de patentes por ter atividade antimalarial e inflamatória.<sup>2</sup>

Em função dos cenários acima, investigamos o desenvolvimento de metodologias para a síntese de pirido-tiazinonas e pirido-pirimidinonas, empregando a reação de ciclo adição formal aza-[3+3] de arilidenos-oxazolonas empregando aquecimento por micro-ondas para preparar uma biblioteca de substâncias químicas para avaliação biológica.

## Resultados e Discussão

A reação em etanol entre a oxazolona **A** e 2-aminopiridinas substituídas **B** sob a condição de aquecimento por micro-ondas a 120°C e 150W levou a formação dos produtos **1** e **2** quando R = 3-PhCH<sub>2</sub>O, 5-NO<sub>2</sub>; formação exclusiva de **1** quando R = 3-NO<sub>2</sub> e formação de apenas **2** para os demais substituintes. Visando obter majoritariamente produtos **1**, uma nova condição foi estabelecida, 250W e 150°C, e apenas quando R = 5-NO<sub>2</sub> e 6-CH<sub>3</sub> houve formação do produto **2**.

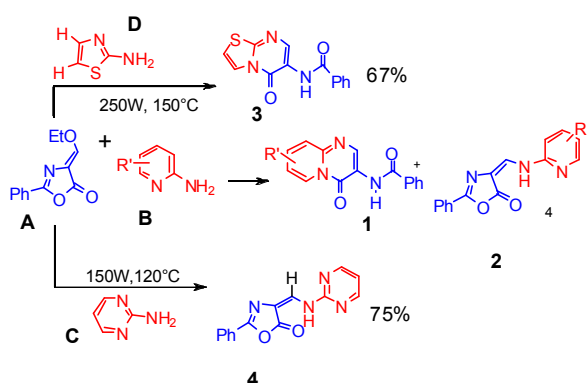


Figura 1. Síntese de pirido-tiazinonas e pirido-pirimidinonas.

Quando as mesmas condições foram estendidas para outros nucleófilos como 2-aminotiazol e 2-aminopirimidina verificou-se que houve formação do

produto cíclico **3**, e para a reação com 2-aminopirimidina a 150W e 120°C, formou **4**. Tentativas de ciclizar **4** não obtiveram sucesso.

Tabela 1. Produtos e rendimentos.

Reagente	Rend (%) 1	Rend. (%) 2
R = 5-NO <sub>2</sub>	15	7
R = 3-NO <sub>2</sub>	37	-
R = 3-PhCH <sub>2</sub> O	48	13
R = 5- Cl	-	79
R = 5-Br	-	97
R = 3-CH <sub>3</sub>	70	-
R = 4-CH <sub>3</sub>	84	-
R = 5-CH <sub>3</sub>	81	-
R = 6-CH <sub>3</sub>	-	40
R = 5-NO <sub>2</sub>	33	8
R = 3-PhCH <sub>2</sub> O	77	-
R = 5- Cl	38	-
R = 5-Br	28	-
R = 3-CH <sub>3</sub>	62	-
R = 4-CH <sub>3</sub>	84	-
R = 5-CH <sub>3</sub>	85	-
R = 6-CH <sub>3</sub>	-	53

## Conclusões

Diante dos resultados obtidos, pode-se afirmar que o aquecimento por micro-ondas, nova condição reacional, proporcionou a obtenção de produtos heterocíclicos 1-3 pirido-tiazinonas e pirido-pirimidinonas. A atividade biológica dos produtos obtidos está sob estudo.

## Agradecimentos

Ao CNPq, CAPES e FAPESB.

<sup>1</sup>Westman, J., Lundin, R. *Synthesis*. No 7 2003. 1025-1030.

<sup>2</sup> Mane, R. U., Li, H., Huang, J., Gupta, R. C., Nadkarni, S.S., Giridhar, R., Naik, P.P., Yadav, R. M. *Bioorganic & Medicinal Chemistry* Vol.20 2012. 6296-6304.