

SÍNTESE DE NOVAS AMIDINOPIRAZOLINAS 3-(2- HIDROXIFENIL) SUBSTITUÍDAS PROMOVIDA POR ULTRASSOM

Luis Henrique Silva Guimenes (luishensg@gmail.com)

Danilo Yano Albuquerque (danilo_ya@hotmail.com)

Caren Letícia Centurión (carenletis@hotmail.com)

Eliandro Faoro (eliandrofaoro@ufgd.edu.br)

Lucas Pizzuti (lucas.pizzuti@gmail.com)

Pirazóis e pirazolininas são proeminentes nas áreas de química medicinal e agroquímica. Essas classes de compostos apresentam variadas atividades biológicas, como antimicrobianas, anti-inflamatórias, antitumorais, analgésicos, anticonvulsivantes, anti-helmínticos, antioxidantes e herbicidas. Por esta razão, numerosos métodos sintéticos para a preparação de pirazóis foram desenvolvidos nos últimos anos. As abordagens convencionais envolvem a formação de ligações CN e CC através de cicloadições [3+2] intermoleculares entre 1,3-dipolos e dipolarófilos ou formação de duas ligações CN pela condensação entre derivados de hidrazina e compostos 1,3-dicarbonílicos ou os seus equivalentes 1,3-dieletrofilos, tais como chalconas. Embora cada método tenha as suas utilidades e vantagens, a reação de chalconas com hidrazinas é a abordagem mais útil para a preparação de pirazolininas 1,3,5-trissubstituídas devido à simplicidade do trabalho, à disponibilidade de materiais de partida e à grande regioselectividade. Como parte de nossa pesquisa em andamento, apresentamos aqui a síntese de uma série de 4,5-diidro- 1H-pirazóis em condições sonoquímicas. Os cloridratos de 3,5-diidro- 1H-pirazol- 1-carboximidamidas foram obtidos pelas reações de ciclocondensação entre 1-(2- hidroxifenil)enonas (1 mmol) e cloridrato de aminoguanidina (0,22 g, 2 mmol) utilizando etanol (15 mL) como solvente na presença de hidróxido de potássio (0,11 g, 2 mmol) sob irradiação ultrassônica. Após o consumo do precursor, a mistura foi acidificada e os 4,5-diidro- 1H-pirazóis foram extraídos em clorofórmio. O solvente foi evaporado para dar sólidos que foram lavados duas vezes com uma mistura de AcOEt/MeOH e secos para dar rendimentos isolados de 15 a 83%. A reação tolera tanto grupos retiradores de elétrons como doadores de elétrons, mas, em geral, os produtos orto-substituídos foram obtidos em rendimentos mais baixos quando comparados com os para-substituídos. Os piores rendimentos foram observados para os produtos que contêm grupos na posição 3 da fenila. Os grupos retiradores de elétrons nas posições 2 e 4 no anel aromático proporcionaram rendimentos mais baixos quando comparados com grupos doadores de elétrons. As estruturas moleculares dos compostos foram estabelecidas por RMN de ¹H e ¹³C. A estrutura de um dos pirazóis foi confirmada por análise de raios X. Em conclusão, treze novos cloridratos de 4,5-diidro- 1H-pirazol- 1-carboximidamidas foram sintetizados de forma eficiente, sob condições sonoquímicas em tempos de reação curtos, a partir de 1-(2- hidroxifenil)enonas e cloridrato de aminoguanidina. Os produtos foram obtidos com rendimentos moderados a bons sem a necessidade de purificação por cromatografia em coluna.

Palavras-chave: pirazolininas, amidinopirazolininas, carboximidamidas, sonoquímica.