



# Reação de Acoplamento de Heck entre Sais de Arenodiazônio e Aminas Alílicas: Síntese de Arilalilaminas e dos Compostos Naftifina e Abamina.

UNICAMP

Laís Ferreira Barbosa <sup>1</sup>(IC), Patrícia Prediger<sup>1</sup>(PG), Carlos Roque Duarte Correia<sup>1\*</sup>(PQ).

<sup>1</sup>Universidade Estadual de Campinas- Instituto de Química- Departamento de Química Orgânica – Caixa Postal 6154- 13084-971- Campinas, São Paulo, Brazil.

\*Autor Principal: Telefone: 19 3521-3086; Fax: 19 3521-3023; e-mail: roque@iqm.unicamp.br

Agência Financiadora: Fundação de Amparo a Pesquisa do Estado de São Paulo (FAPESP)

Palavras Chave: Sais de Arenodiazônio, Reação de Heck – Alilaminas - Paládio - Naftifina.

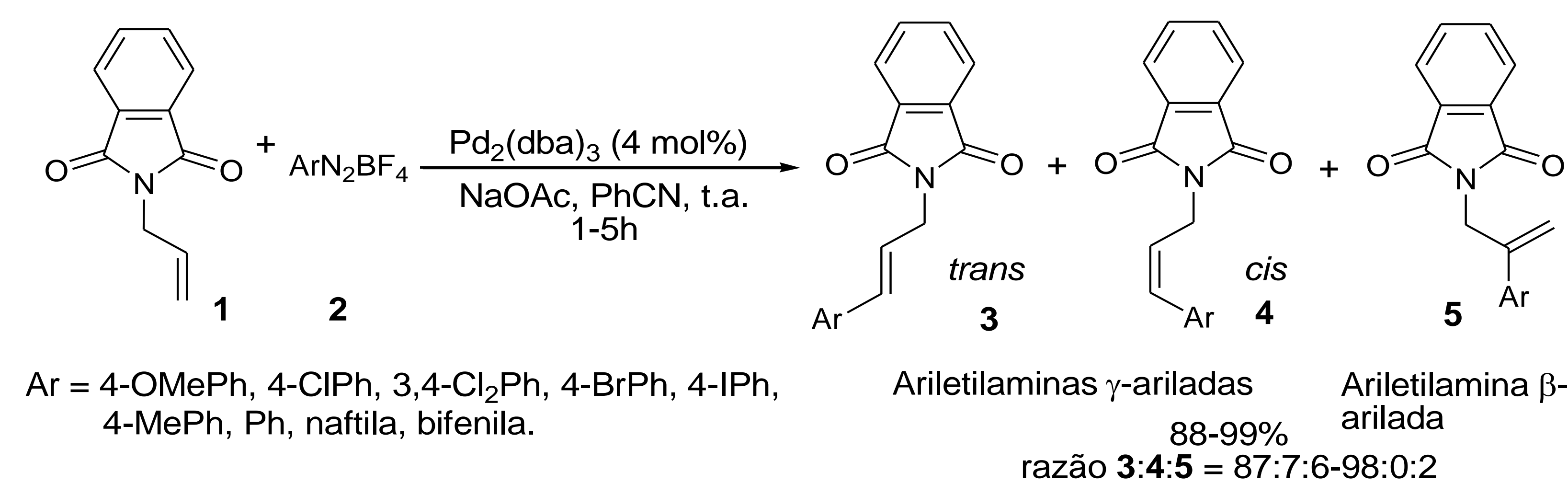
## INTRODUÇÃO

A unidade alilamina está presente no arcabouço de diversos produtos que apresentam atividade biológica, como por exemplo, a Naftifina **16**, um fármaco com atividade antifúngica e Abamina **22**, um importante inibidor do ABA. <sup>1</sup>Esta unidade pode sofrer inúmeras transformações, dentre elas, a inserção de um anel aromático na ligação dupla. Um dos métodos mais utilizados para arilação de olefinas é a reação de Heck, sendo que a utilização de sais de arenodiazônio oferece inúmeras vantagens. <sup>2</sup>

## PARTE EXPERIMENTAL

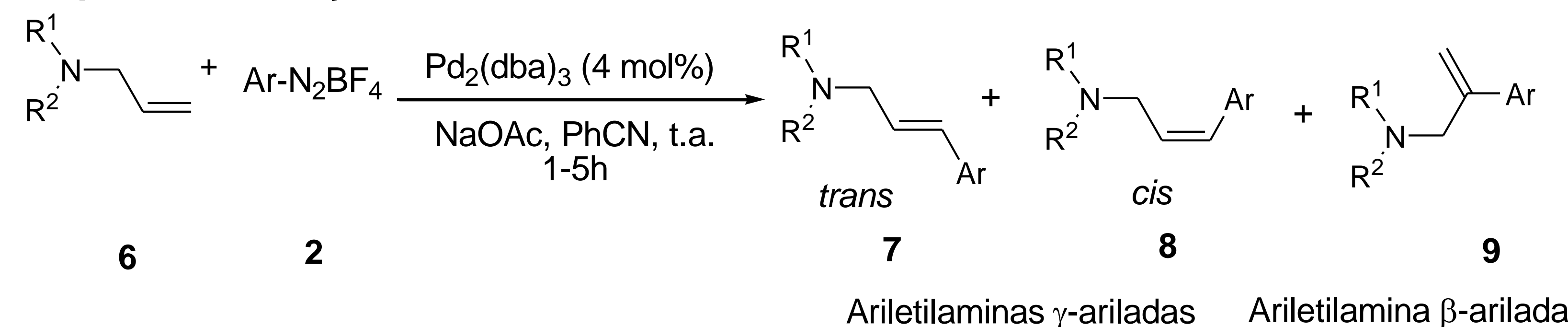
Foi realizado o estudo da reação de Heck entre a alilamina **1** com diferentes sais de arenodiazônio (Esquema 1).

Esquema 1. Reação de Heck entre **1** e sais de diazônio.



Avaliou-se também o desempenho de diferentes aminas alílicas na reação de Heck com sais de arenodiazônio.

Esquema 2. Reação de Heck entre diferentes aminas alílicas e sais de diazônio.



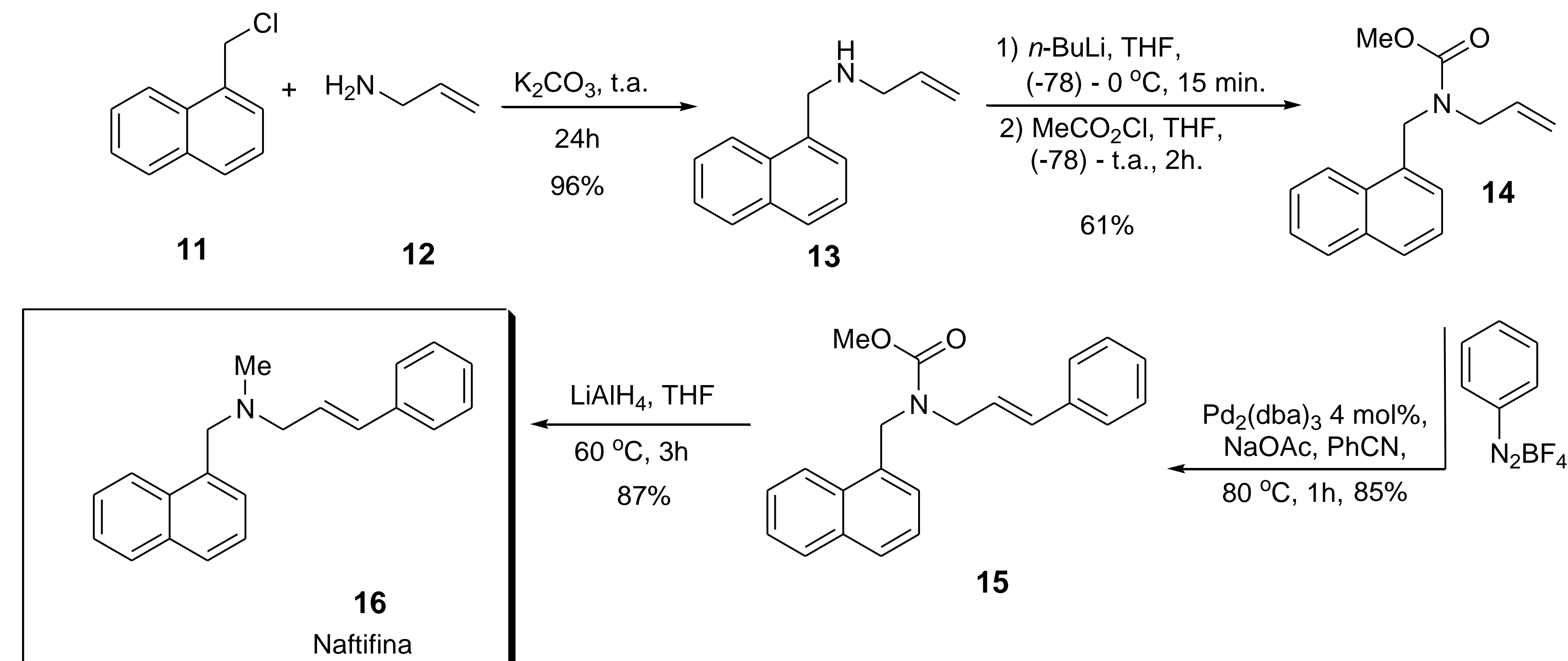
## RESULTADOS E DISCUSSÃO

Tabela 1. Resultados obtidos na reação de Heck entre diferentes alilaminas e diferentes sais de diazônio.

| Ar      | Olefina | Rend (%) | Razão (7:8:9) |
|---------|---------|----------|---------------|
| 4-OMePh |         | 93       | 92:3:5        |
| 4-CIPh  |         | 92       | 94:4:2        |
| 4-OMePh |         | 98       | 93:2:5        |
| 4-BrPh  |         | 99       | 94:3:3        |
| 4-OMePh |         | 77       | 91:2:7        |
| 4-OMePh |         | 97       | 100:0:0       |
| 4-OMePh |         | 92       | 100:0:0       |
| 4-OMePh |         | 36       | 100:0:0       |
| 4-OMePh |         | 98       | 100:0:0       |

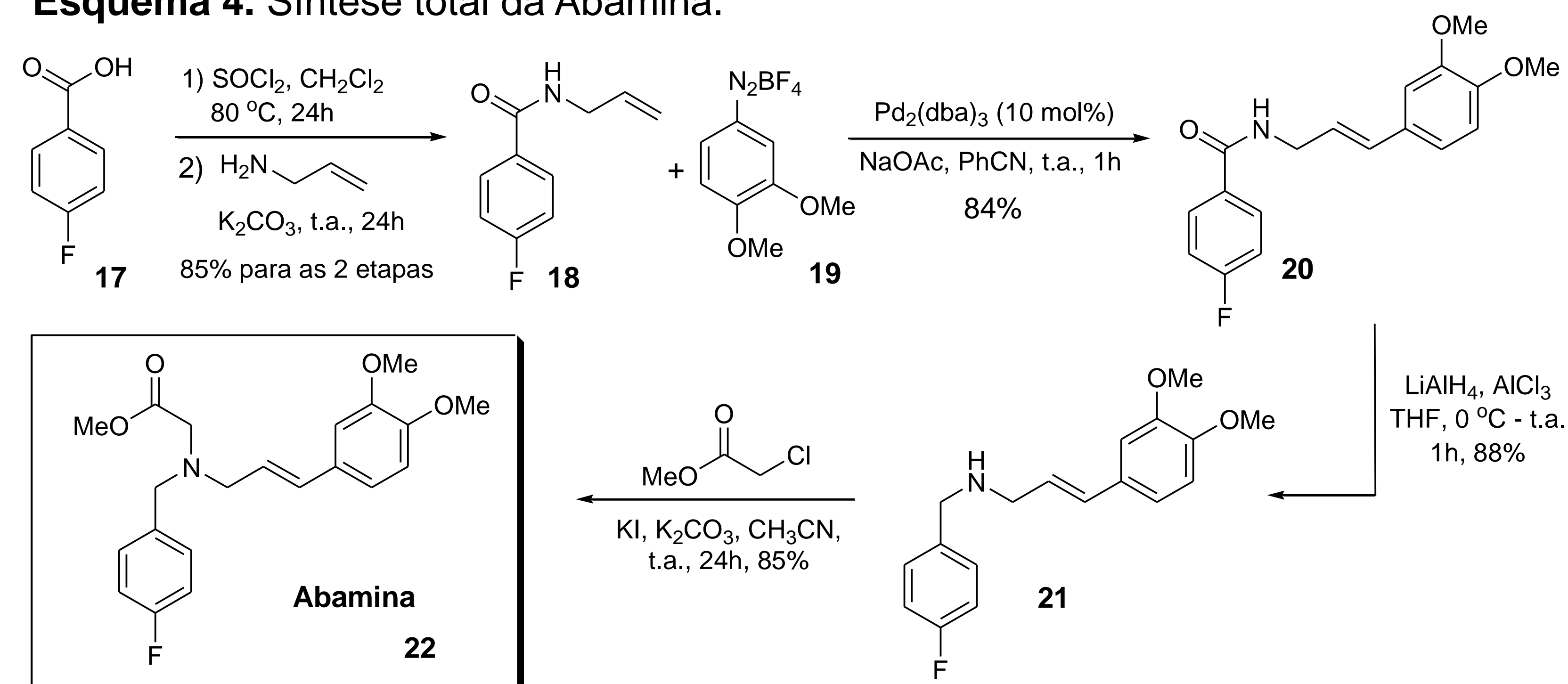
A síntese do antifúngico naftifina foi realizada, resultando no produto final em 43% de rendimento. A etapa-chave foi a reação de Heck, que ocorreu de forma régio e estereosseletiva, fornecendo o aduto de Heck **15** em 85%.

Esquema 3. Síntese total da Naftifina.

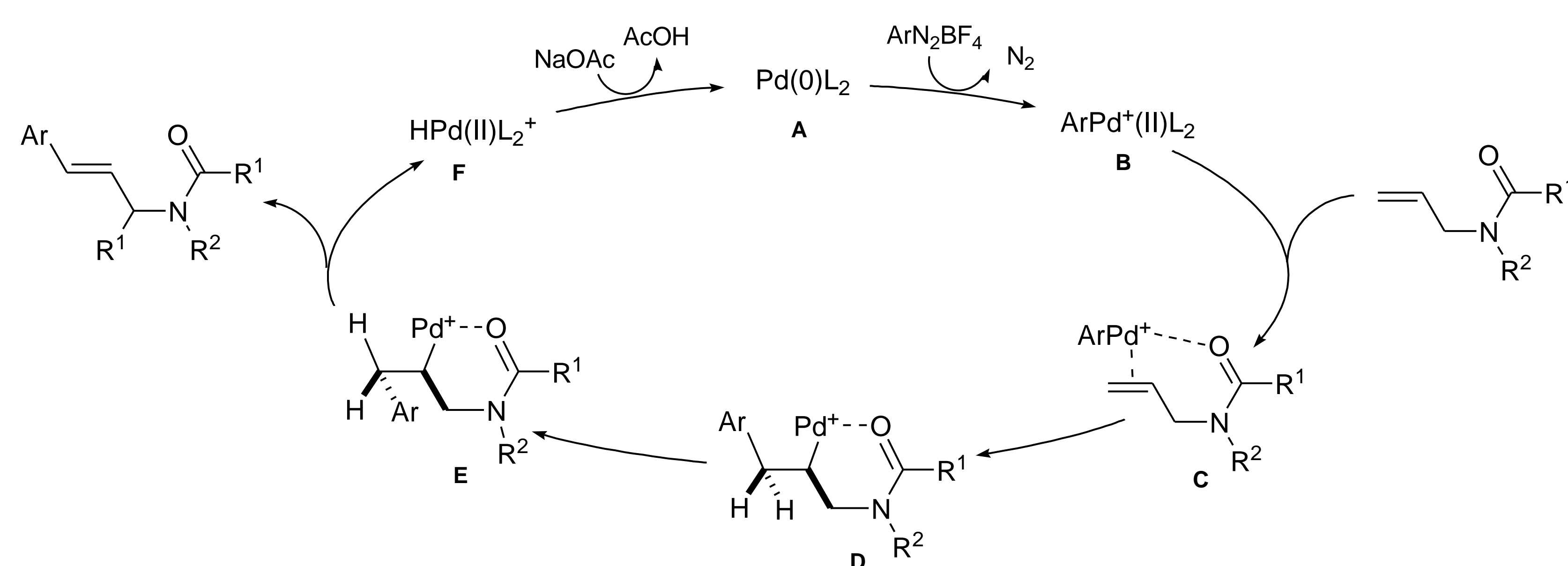


Também foi realizada a síntese do composto Abamina, sendo este obtido em 53% de rendimento. A etapa-chave foi a reação de Heck, fornecendo o aduto de Heck **20** em 84%.

Esquema 4. Síntese total da Abamina.



O mecanismo proposto para racionalização destes resultados:



## CONCLUSÃO

A reação de Heck entre diversas aminas alílicas e sais de arenodiazônio é uma potente ferramenta para obtenção de arilalilaminas ariladas.

## AGRADECIMENTOS



<sup>1</sup>Stuetz, A.; Georgopoulos, A.; Granitzer, W.; Petranvi, G.; Berney, D. *J. Med. Chem.* **1986**, 29,112.

<sup>2</sup>(a) Kikukawa, K.; Matsuda, T. *Chem. Lett.* **1977**, 159. (b) Kikukawa, K.; Nagira, K.; Wada, F.; Matsuda, T. *Tetrahedron* **1981**, 37, 31.