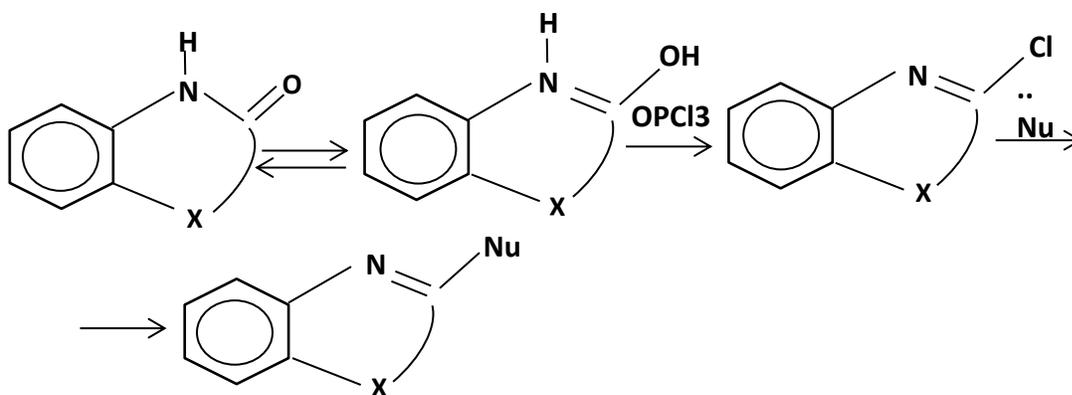


03) Química Orgánica

ESTERES METANOSULFONICOS DE HETEROCICLOS

Carlos H. Gaozza, Desynth S.A., Atuel 266, Hurlingham, Prov. De Buenos Aires, iszijn@fibertel.com.ar

Algunos heterociclos benzolactámicos reaccionan con oxiclorigo de fósforo originando el correspondiente derivado clorado con variable rendimiento. Esos halogenados son muy reactivos a la sustitución nucleofílica.



Las benzo-1,4-diazepinonas tratadas con oxiclorigo de fósforo o cualquier otro reactivo halogenante, solo originan productos de descomposición. La sustitución en 2 por aminas o hidracinas solo puede lograrse por conversión del carbonilo al 2-mercapto derivado por reacción con pentasulfuro de fósforo en piridina. Esta reacción ocurre con bajo rendimiento y es de realización incómoda.

El grupo metano-sulfónico como éster es un reconocido grupo saliente. Sin embargo, la literatura no registra su aplicación en heterociclos. Por esto, se intentó su introducción partiendo de benzolactamas. Se tomaron como compuestos testigos a ensayar la 3-quinoxalina-2-ona y diversas benzodiazepinonas. La reacción de mesilación de la quinoxalinona se logró utilizando cloruro de metanosulfonilo en un solvente polar aprótico en presencia de trietilamina.

Este procedimiento fue también exitoso aplicado a las benzodiazepinonas. Se describirá la reacción de estos mesilatos con dietilamina y monoacetil hidracina.

