

APLICACIÓN DE LA REACCIÓN DE PFITZINGER PARA LA SÍNTESIS DE DERIVADOS DE ÁCIDOS 4-QUINOLINCARBOXÍLICOS

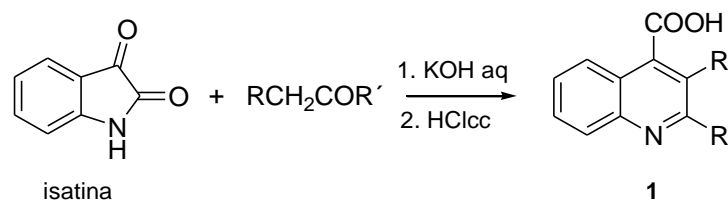
Juan P. Carnevale, Gisela C. Muscia, Leonardo O. De María, Graciela Y. Buldain, Silvia E. Asís.

Departamento de Química Orgánica, Facultad de Farmacia y Bioquímica, Universidad de Buenos Aires. Junín 956. C1113 AAD. Ciudad Autónoma de Buenos Aires. E-mail: gmuscia@ffyb.uba.ar

Introducción

En el desarrollo de nuevos agentes antiparasitarios, nuestro grupo de investigación sintetizó una serie de ácidos 2-fenil-4-quinolincarboxílicos empleando la reacción de Döbner promovida por radiación microondas¹. Los rendimientos alcanzados fueron mejores a los descriptos en la literatura por método convencional, salvo en el caso de aldehídos alifáticos.

Una ruta alternativa para la obtención de derivados de ácido 4-quinolincarboxílico **1** (ácido cinconínico) es la reacción de isatina con cetonas de fórmula general RCH_2COR' , descubierta a fines del siglo XIX por Pfitzinger^{2,3}. El interés actual de esta reacción se debe a la posibilidad de sintetizar en forma sencilla, sustancias con posible actividad biológica a partir de materiales fácilmente asequibles (Esquema 1).



Esquema 1

Con el objetivo de preparar con mejores rendimientos derivados de ácido cinconínico como productos intermediarios o finales, se diseñó y sintetizó una serie de nuevos compuestos mediante este método (Fig. 1).

Resultados

Una serie de 10 derivados de ácido 4-quinolincarboxílico se preparó por calentamiento convencional a partir de isatina y la correspondiente cetona en solución de hidróxido de potasio o bien en solución hidroalcohólica. Los tiempos de reacción variaron entre 8 y 20 horas y los productos fueron obtenidos con buenos rendimientos.

Se emplearon cetonas alifáticas, alicíclicas, metilcetonas y metilarilcetonas, dando los productos **1a-j** (Figura 1).

En el presente trabajo se compara la reactividad de las distintas cetonas empleadas y se discute la influencia del solvente.

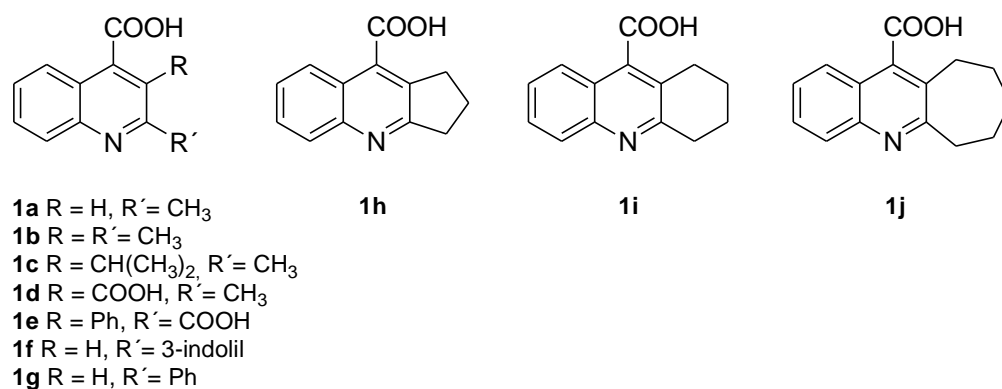


Figura 1

Referencias

1. G. C. Muscia, J. P. Carnevale, M. Bollini, S. E. Asís *J. Heterocyclic Chem.* (2008) **45**, 611-614.
2. W. Pfitzinger *J. Prakt. Chem.* (1886) **33**, 100.
3. Ng. Ph. Buu-Hoi, R. Royer, Ng. D. Xuong, P. Jacquignon *J. Org. Chem.* (1953) **18** (9), 1209–1224.