

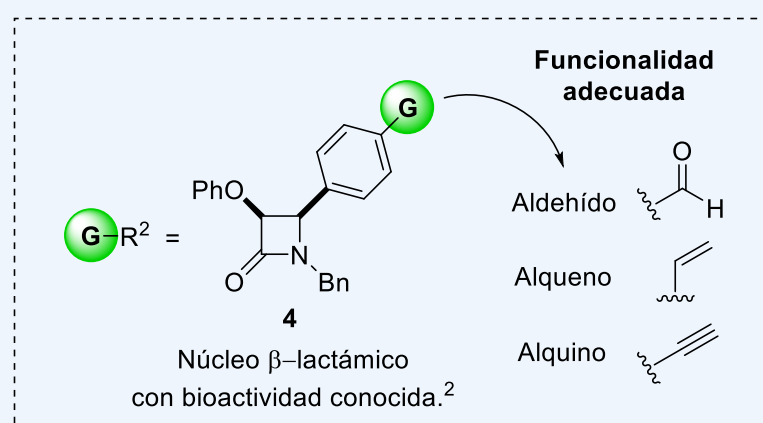
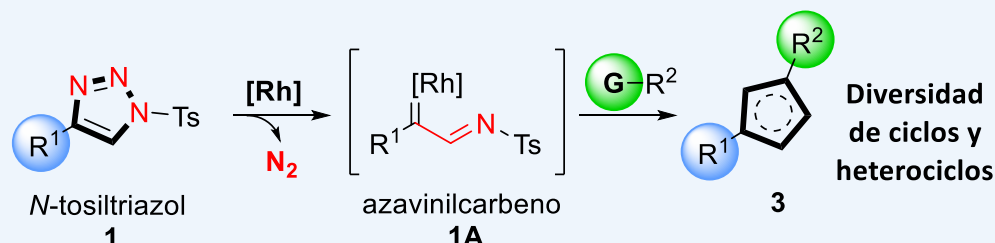
FUNCIONALIZACIÓN DE BLOQUES ESTRUCTURALES PARA LA GENERACIÓN DE BIBLIOTECAS DIVERSAS

SCAGNETTI, Felipe; BORGOGNO, Matias; CENTURION, Enzo F. G.; MARTIREN, Nadia L.; DELPICCOLO, Carina M. L.

Instituto de Química Rosario "Dr. Edmundo A. Rúveda" (QUIR-CONICET),
Departamento de Química Orgánica, Facultad de Ciencias Bioquímicas y Farmacéuticas, Universidad Nacional de Rosario,
Rosario, Argentina.
fscagnetti@fbioyf.unr.edu.ar

INTRODUCCIÓN

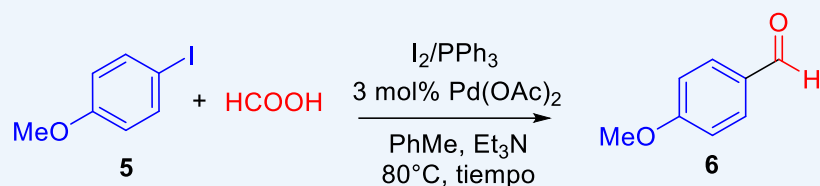
Con el objetivo de generar quimiotecas con diversidad estructural (**3**), se ha desarrollado una plataforma para conjugar bloques de interés mediante química de azavinilcarbenos (**1A**).¹ Para esto, se propone la construcción de diversas β -lactamas (**4**) correctamente funcionalizadas para la formación de híbridos de interés.



RESULTADOS y DISCUSIÓN

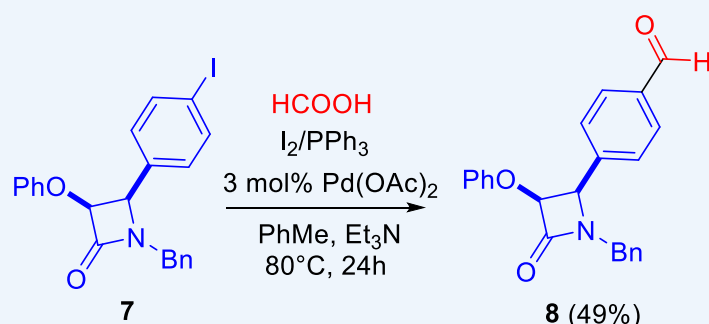
Formilación

La obtención de aldehídos en grupos arilos se realizó a partir de ácido fórmico como fuente de monóxido de carbono. Para ello, se evaluó la formilación catalizada por Pd del haluro de arilo modelo **5**.



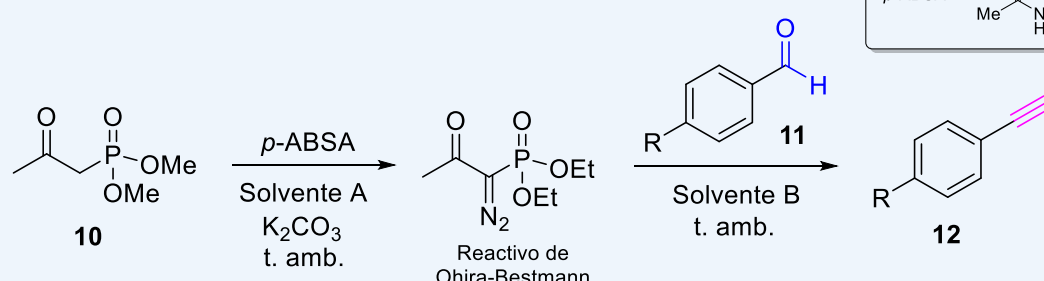
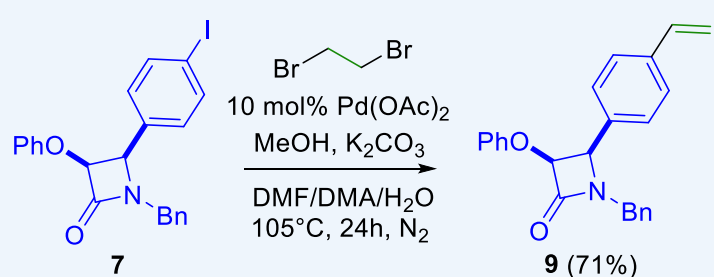
Entrada	Tiempo (h)	HCOOH (eq)	PPh ₃ (eq)	I ₂ (eq)	Et ₃ N (eq)	Relación 6:5
1	2	4	1,2	1,2	6	1:2
2	24	4	1,2	1,2	6	2:1
3	24	6	2	2	10	2:0,3

Luego se realizó la formilación sobre la β -lactama iodada **7** obteniendo así el derivado formilado **8**.



Estrategia hacia la formación de dobles y triples enlaces

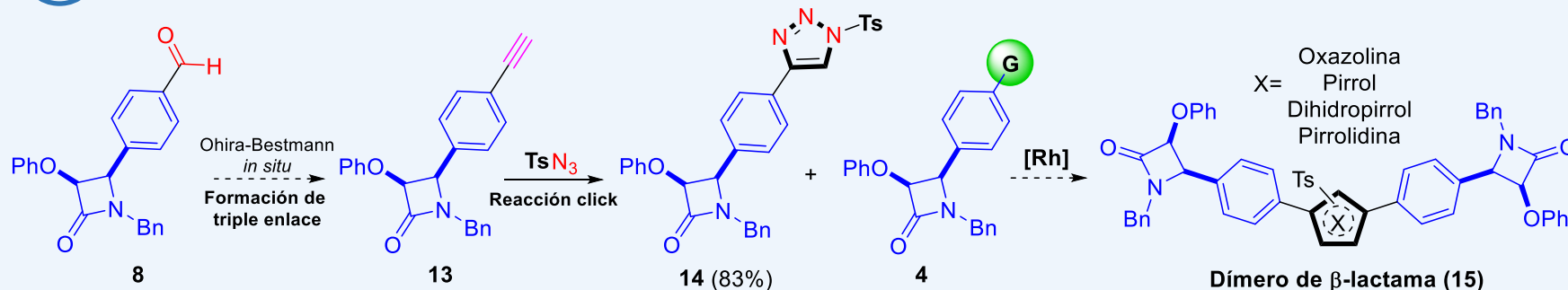
La obtención del estireno **9** partiendo del derivado **7** se realizó a partir del 1,2-dibromoetano el cual genera *in-situ* bromuro de vinilo.



Entrada	R	Solvente A/B (1:1)	Rendimiento 12
1	-NO ₂	MeCN/MeOH	16%
2	-Br	MeCN/MeOH	18%
3	-Br	THF/MeOH	n.r

Condiciones: **10** (0,78 eq), *p*-ABSA (0,83 eq), K₂CO₃ (2,80 eq).

ESTUDIOS FUTUROS



A partir de **8** se proyecta la formación de **15** en tres pasos.

CONCLUSIONES

Se logró la funcionalización de una estructura compleja, utilizando metodologías simples a partir de reactivos seguros y de fácil acceso. Esto nos permitirá obtener sustratos adecuados hacia el desarrollo de bibliotecas diversas.

AGRADECIMIENTOS

Agradecemos a CONICET, ANPCyT, UNR y ASaCTel.

REFERENCIAS

- 1-(a) Akter, M.; Rupa, K.; Anbarasan. *P. Chem. Rev.* **2022**, 122, 13108. (b) Permingeat Squizzato, C. *et al. J. Org. Chem.* **2023**, 88, 16091.
2-De Rosa, M.; Verdino, A.; Soriente, A.; Marabotti, A. *Int. J. Mol. Sci.* **2021**, 22, 617.