

Isabela Gabriel de Lade^{1*} (PG), Adilson David da Silva¹ (PQ),
 *e-mail: isaglade@hotmail.com

¹Departamento de Química, Instituto de Ciências Exatas, Universidade Federal de Juiz de Fora, 36036 - 330, Juiz de Fora, MG, Brasil.

Palavras Chave: Heterociclos, carboidrato, síntese

Introdução

Os compostos heterocíclicos contendo núcleos tiazólicos ou imidazólicos são freqüentemente encontrados em organismos marinhos e terrestres, sendo de grande importância devido ao seu amplo espectro de atividade biológica, tais como, atividades anticancerígena, antibacteriana, antidepressiva, antiinflamatória, herbicida, dentre outras¹.

Exemplos de heterociclos são os benzotiazóis e benzimidazóis. Estes possuem inúmeras aplicações, tanto biológicas como em outras áreas, por exemplo, na química de novos materiais. Dados da literatura mostram que derivados do 2-mercaptobenzimidazol e 2-mercaptobenzotiazol, substituídos na posição 2 do anel, possuem considerável atividade antibacteriana.

Sendo assim, com base nos resultados estudados, a substituição do átomo de hidrogênio do grupo SH por carboidrato, pode contribuir para a atividade biológica de tais compostos^{2,3}.

Portanto, tivemos como objetivo, a síntese de derivados de heterociclos condensados ao carboidrato Psicofuranose, com a expectativa de verificar atividades antibacterianas e/ou antituberculosas.

Resultados e Discussão

A frutose protegida foi preparada em presença de acetona e ácido sulfúrico catalítico, levando ao **1,2:4,5-Di-O-isopropilideno-β-D-frutopiranosse (1)**. O álcool **1** foi transformado no **1,2:4,5-Di-O-isopropilideno-β-D-eritro-2,3-hexodiulo-2,6-piranosse (2)** utilizando CrO₃(s) em uma solução formada por anidrido acético e piridina⁴. A redução de **2** ocorreu em presença de borohidreto de sódio para fornecer o **1,2:4,5-Di-O-isopropilideno-β-D-psicopiranosse (3)**.

Após a purificação de **3**, o álcool foi submetido ao rearranjo para fornecer o composto de cinco membros **1,2:3,4-Di-O-isopropilideno-β-D-psicofuranose (4)**, em presença acetona, dimetoxipropano e ácido perclórico⁵. Em seguida, foi feita a iodação do álcool **4** com adição de trifetilfosfina, imidazol e I₂(s), em tolueno, à 80 °C durante 12 horas, obtendo o **6-(iodo)-1,2:3,4-Di-O-isopropilideno-β-D-psicofuranose (5)**.

Posteriormente, a reação de acoplamento em **5** com os sais do 2-Mercaptobenzimidazol e 2-Mercaptobenzotiazol, em DMF à 100 °C, ocorreu

em 72h, fornecendo os compostos **6-(2-mercaptobenzimidazol)-1,2:3,4-Di-O-isopropilideno-β-D-psicofuranose (6)** e **6-(2-mercaptobenzotiazol)-1,2:3,4-Di-O-isopropilideno-β-D-psicofuranose (7)**.

Finalmente, as desproteções das hidroxilas foram feitas com adição de ácido trifluoracético (TFA) 100% em água, produzindo os compostos finais totalmente desprotegidos e hidrossolúveis **6-(2-mercaptobenzimidazol)-psicofuranose (6a)** e **6-(2-mercaptobenzotiazol)-psicofuranose (7a)**.

Todos os compostos foram caracterizados por RMN de ¹H e ¹³C. Os compostos **6**, **6a**, **7** e **7a** foram também caracterizados por Espectrometria de Massas de Alta Resolução.

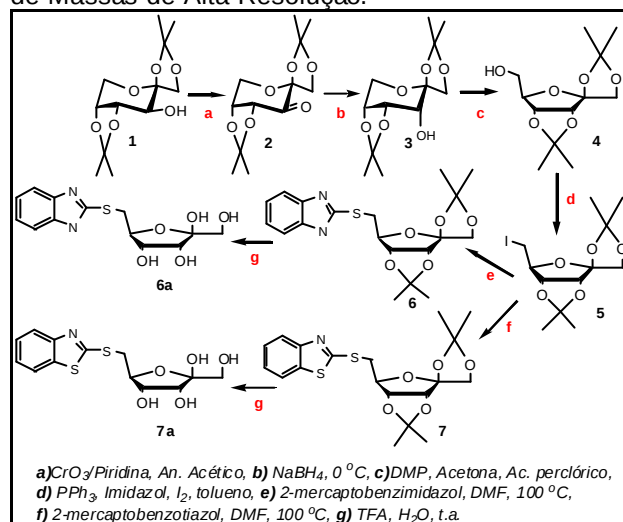


Figura 1: Esquema de síntese dos compostos **6a** e **7a**.

Conclusões

Os produtos almejados foram sintetizados com sucesso e estão sendo testados quanto a atividade farmacológica.

Todas as etapas da síntese ocorreram com rendimentos satisfatórios, além da utilização de reagentes acessíveis, o que torna a metodologia bastante viável.

Agradecimentos

À Capes pela bolsa concedida.

¹ Souza, M. V. N.; Ferreira, S. B.; Mendonça, J. S.; Costa, M.; Rebello, F. R.; *Quim. Nova*, **2005**, 28, 77 – 84.

² Zitouni, G. T.; Demirayak, S.; Ozdemir, A.; Kaplancikli, Z. A.; Yildiz, M. T.; *Eur. J. Med. Chem.*, **2003**, 39, 267.

³ Andrzejewska, M.; Yopez-Mulia, L.; Cedillo-Rivera, R.; Tapia, A.; Vilpo, L.; Vilpo, J.; Kazimierzczuk, Z.; *Eur. J. Med. Chem.*, **2002**, 37, 973.

⁴ Hansske, F.; Madej, D.; Robins, M. J.; *Tetrahedron*, **1984**, 40, 125.

⁵ Prisbe, E. J.; Smejkal, J.; Verheyden, J. P. H.; Moffat, J. G. J. *Org. Chem.* **1976**, 41, 1836-1846.

