Síntese de novos glico-1,2,3-triazóis derivados da 3-fenil-D-ribose

David R. da Rocha (PG)[a], Vitor F. Ferreira* (PQ)[a], Wilson da C. Santos* (PQ)[b]

[a]*Universidade Federal Fluminense, Instituto de Química, Departamento de Química Orgânica, Campus do Valonguinho, CEG, 24020-150, Niterói, RJ.* [b]*Universidade Federal Fluminense, Faculdade de Farmácia, 24241-000, Niterói, RJ*

e-mail:cegvito@vm.uff.br; wsantos@vm.uff.br

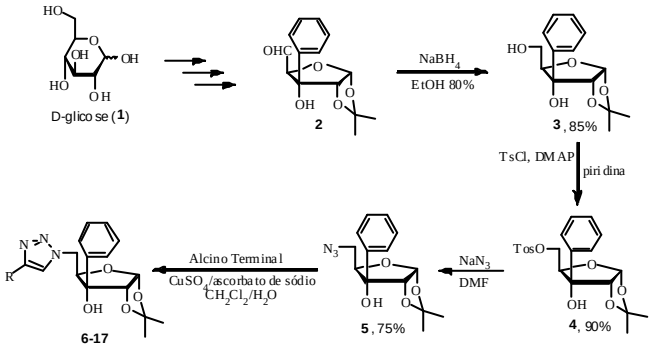
Palavras Chave: *1,2,3-triazóis, carboidratos, cicloadição 1,3-dipolar*

Introdução

Os compostos heterocíclicos possuem importância incontestável, particularmente no que se refere ao fato de que inúmeros deles possuem usos como medicamentos[1]. Dentre os sistemas heterocíclicos mais estudados na atualidade encontram-se os triazóis, que têm despertado muito interesse pelo fato de possuírem um vasto campo de aplicações, que vão desde usos como explosivos, até como agroquímicos e fármacos[2]. Nosso grupo tem sintetizado e estudados triazóis contra *Micobaterium tuberculosis*, microorganismo causador da tuberculose[3].

Os 1,2,3-triazóis podem ser sintetizados por diversas rotas sintéticas clássicas ou modernas com destaque para a cicloadição 1,3-dipolar. As referidas cicloadições 1,3-dipolares entre azidas e alcinos, de modo geral ocorrem rapidamente, sendo um dos métodos mais versáteis para preparação de 1,2,3-triazóis.

Resultados e Discussão

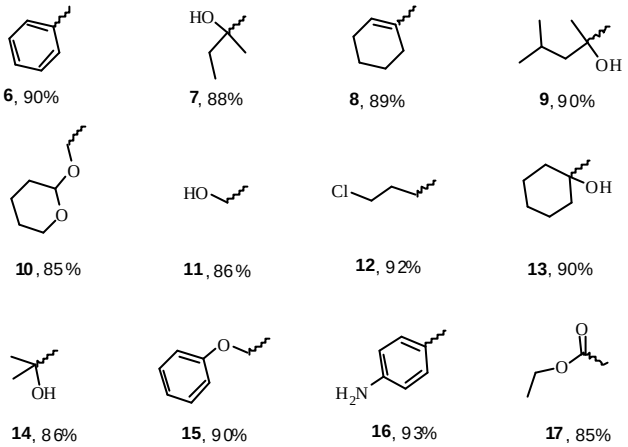


A rota sintética executada está apresentada a seguir (Figura 1).

Figura 1. Síntese de 1,2,3-triazóis derivados de carboidrato

Utilizando a D-glicose (**1**) como material de partida, foram realizadas 5 etapas reacionais até a obtenção do aldeído **2**. Posteriormente, o álcool **3** foi preparado a partir de **2** com 85% de rendimento através de uma redução com $NaBH_4$. Então, procedeu-se a tosilação da hidroxila ligada ao carbono C5 obtendo-se o intermediário **4** em 90%. Tendo-se **4** em mãos, realizou-se a substituição do grupo tosil por uma azida, obtendo-se **5** com 75% de rendimento. Por fim, fez-se uma cicloadição de Huisgen a partir de **5**, a qual foi realizada com doze alcinos terminais utilizando um sistema catalítico contendo sulfato de cobre e ascorbato de sódio obtendo-se os 1,2,3-triazóis 1,4-disubstituídos **6** a **17** em rendimentos que variaram de 85 a 93%. Os radicais R presentes nestes triazóis estão apresentados na Figura 2, com seus respectivos rendimentos.

Figura 2. Radicais presentes nos 1,2,3-triazóis sintetizados.



Conclusões

Neste trabalho apresentamos a síntese de doze glico-1,2,3-triazóis inéditos derivados da D-ribose usando a metodologia de cicloadição 1,3-dipolar Estes triazóis estão sendo avaliados quanto a sua inibição frente ao *Micobaterium tuberculosis*, microorganismo causador da tuberculose na FIOCRUZ.

Agradecimentos

CNPq, FAPERJ e CAPES.

[1] Brunton, L. L.; Lazo, J. S.; Parker, K. L. Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 11th ed., McGraw-Hill: New York, 2006.

[2] Melo; J. O. F.; Donnici, C. L.; Augusti, R.; Ferreira, V. F.; de Souza, M. C. B. V.; Ferreira, M. L. G.; Cunha, A. C. *Quim. Nova* **2006**, *29*, 569.

[3] a) Gallardo, H.; Conte, G.; Bryk, F.; Lourenço, M. C. S.; Costa, M. S.; Ferreira, V. F. *J. Braz. Chem. Soc.* **2007**, *18*, 1285. b) Costa, M. S.; Boechat, N.; Rangel, E. A.; da Silva, F. C.; de Souza, A. M. T.; Rodrigues, C. R.; Castro, H. C.; Junior, I. N.; Lourenço, M. C. S.; Wardell, S. M. S. V.; Ferreira, V. F. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *14*, 8644.