

## Síntese de Novos Derivados Triazólicos com Potenciais Atividades Anti-tuberculose.

Luiz Carlos S. Pinheiro (PG)<sup>1</sup>, Sérgio Pinheiro (PG)<sup>1</sup>, Gilberto A. Romeiro (PQ)<sup>1</sup>, Isakelly P. Marques (PG)<sup>1</sup>, Helena C. Castro (PQ)<sup>2</sup>, Alice Maria R. Bernardino (PQ)<sup>1\*</sup>

<sup>(1)</sup> Universidade Federal Fluminense, Departamento de Química Orgânica, Programa de Pós-Graduação em Química Orgânica, Outeiro de São João Batista, s/n° - Valonguinho. 24020-150 Niterói / RJ. [alice@rmn.uff.br](mailto:alice@rmn.uff.br)

<sup>(2)</sup> Universidade Federal Fluminense, Instituto de Biologia, Departamento de Biologia Celular e Molecular, Outeiro de São João Batista, s/n° - Valonguinho. Niterói / RJ.

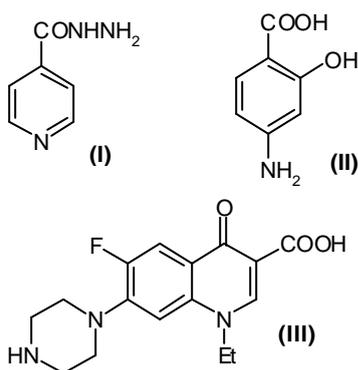
Palavras Chave: triazolopirimidina, Tuberculose.

### Introdução

A tuberculose (TB) é uma doença contagiosa grave transmitida basicamente pelo ar e pode atingir todos os órgãos do corpo, porém como o bacilo de Koch (BK), *Mycobacterium tuberculosis*, se reproduz e se desenvolve rapidamente em áreas do corpo com muito oxigênio, o pulmão é o principal órgão atingido pela doença.

Atualmente a tuberculose mata no mundo aproximadamente 3,0 milhões de pessoas por ano. Estima-se que cerca de 1,7 bilhões de indivíduos em todo o mundo estejam infectados pelo *M. tuberculosis*, com cerca de 2,8 milhões de mortes e 7,5 milhões de novos casos.

Entre os fármacos utilizados no tratamento da TB destaca-se a isoniazida (I) e o deapasil (II) porém, o tratamento pode durar de 6 a 12 meses. Fluoroquinolonas são atualmente uma importante classe de antimicrobianos sintéticos que têm sido objeto de intensos estudos, destacando-se o norfloxacin (III)<sup>1</sup>.



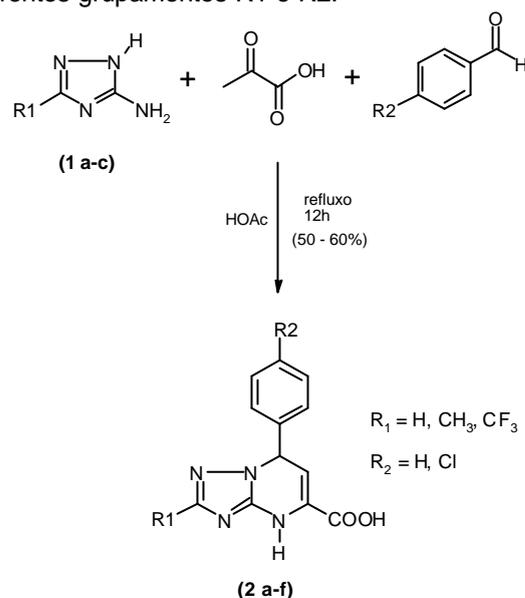
### Resultados e Discussão

Com o objetivo de obter compostos com potencial atividade antibacteriana e estudar a relação estrutura-atividade, foram sintetizados 6 derivados do sistema triazolopirimidina. Os derivados ácidos (2 a-f) foram delineados mantendo-se o grupamento ácido carboxílico, que está presente em vários compostos

que apresentam atividades anti-TB, como no deapasil (II) e nas fluoroquinolonas (III).

A preparação do derivado ácido 2a (R1= H), em uma etapa, por reação do aminotriazol (1) (R1= H) com aldeídos aromáticos na presença de ácido pirúvico foi descrita recentemente na literatura<sup>2</sup>.

Neste trabalho foi empregada esta metodologia para as preparações dos demais ácidos 2 a-f portadores de diferentes grupamentos R1 e R2.



### Conclusões

Este trabalho descreve a síntese de 6 derivados da classe 7-fenil-4,7-diidro[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidinas com rendimentos na faixa de 50-60%.

Estes mostram-se promissores protótipos na busca de novos fármacos utilizados no tratamento da Tuberculose.

### Agradecimentos

FAPERJ, CAPES, CNPq, PROPP, Programa de Pós-Graduação em Química Orgânica - UFF,

<sup>1</sup> Souza, M. V. N.; Vasconcelos, T. R. A. *Química Nova*, 2005, 28, 678-682.

<sup>2</sup> Chebanov, V. A. *et al., Synthesis* 2005, 15, 2597-2602.