

Síntese de chalconas triazólicas com potencial atividade farmacológica

Pâmela da S. Fonsêca (IC), Thaíssa Pasquali F. Rosalba (IC), Wender A. Silva (PQ), Carlos Kleber Z. Andrade (PQ)*

*ckleber@unb.br

Laboratório de Química Metodológica e Orgânica Sintética (LaQMOS), Instituto de Química, Universidade de Brasília, CP-4478, 70910-970 Brasília-DF, Brasil.

Palavras Chave: Chalconas, condensação de Claisen-Schmidt, anéis triazólicos.

Introdução

As chalconas têm despertado interesse científico no âmbito mundial, em virtude das diversas atividades biológicas apresentadas, tais como: antimalárica, bacteriostática e antiinflamatória.ⁱ

Quimicamente, estas substâncias podem ser definidas como cetonas α - β -insaturadas em que tanto a carbonila quanto a porção olefínica estão ligadas a grupamentos aromáticos.ⁱⁱ A adição de substituintes aos anéis aromáticos geralmente alteram fatores como solubilidade e atividade farmacológica, possibilitando assim a obtenção de funções biológicas variadas.

Substituintes como grupos triazóis podem possuir características interessantes na química de chalconas, uma vez que são polares e têm demonstrado uma gama de aplicações desde explosivos, até agroquímicos e fármacos.^{iii,iv} Esta maior polaridade pode contribuir para uma melhor dissolução do composto em água sem o auxílio de solventes orgânicos mediadores, os quais comumente apresentam alta toxicidade em sistemas biológicos, bem como possibilitar o sinergismo das funções biológicas ou desenvolvimento de novas atividades.

Resultados e Discussão

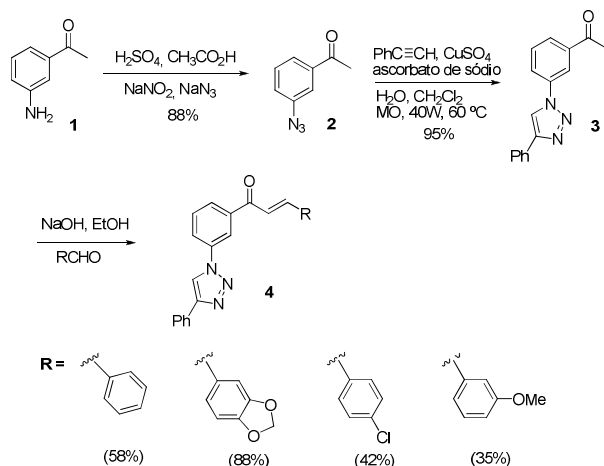
Em uma perspectiva sintética, é possível produzir chalconas substituídas mediante um processo com três etapas, conforme a Figura 1. A primeira etapa consiste na diazotação seguida da introdução do grupo azida na estrutura da cetona utilizada (1,3-aminoacetofenona). Por sua vez, a etapa 2 descreve a reação de Huisgen, na qual se realiza uma cicloadição 1,3-dipolar para obtenção do grupo triazólico. Por fim, na terceira etapa as chalconas foram preparadas a partir da reação de diversos aldeídos com a cetona **3** obtida na etapa anterior. Foram utilizados os seguintes aldeídos: benzaldeído, piperonal, *p*-clorobenzaldeído, *m*-nitrobenzaldeído e *m*-metoxibenzaldeído.

Os rendimentos não otimizados obtidos foram em sua maioria moderados, destacando-se a reação com o piperonal, que apresentou melhor rendimento.

Todos os produtos formados em cada etapa foram caracterizados por RMN de ^1H e ^{13}C . As chalconas triazólicas obtidas serão submetidas a testes farmacológicos para avaliação de suas atividades.

33ª Reunião Anual da Sociedade Brasileira de Química

Outras chalconas serão obtidas variando-se os alcinos e utilizando-se aldeídos heteroaromáticos.



Esquema 1. Rota sintética para obtenção de chalconas triazólicas.

Conclusões

As chalconas triazólicas foram obtidas a partir de uma metodologia simples e satisfatória, possibilitando a posterior realização de testes farmacológicos, a fim de se verificar a existência de atividade farmacológica das estruturas sintetizadas.

Agradecimentos

IQ-UnB, PIC-UnB, CNPq e Capes.

ⁱ Dimmock, J. R.; Elias, D. W.; Beazealy, M. A.; Kandepu, N. M.; *Curr. Med. Chem.* **1999**, 6, 1125.

ⁱⁱ Satyanarayana, K.; Rao, M. N. A. *Indian Drugs* **1993**, 30, 313.

ⁱⁱⁱ *Rod's Chemistry of Carbon Compounds IVF*; New York: Elsevier, 1986; Grimmett, M. R. Em *Comprehensive Organic Chemistry*; Barton, D.; Ollis, D., eds.; Pergamon Press: UK, 1979, p. 357.

^{iv} Ferreira, V. F.; Souza, M. C. B. V.; Ferreira, M. L. G.; Cunha, A. C.; Heterociclos Contendo o Núcleo Triazólico: Métodos de Síntese, Reatividade e Atividade Biológica, *Cadernos do Instituto de Química-UFRJ*; Pinto, A. C.; Bicca, R. A., eds.; 1999.