

Síntese e Avaliação do Potencial Leishmanicida de Derivados benzenosulfonamídicos.

Luiz Everson da Silva^{1*} (PQ), Elton Francisquini¹ (IC), Mário Steindel ²(PQ), Rebeca Korting Nunes(PG)², Marivania Saletete Conte (IC)² [*luiz_everson@yahoo.de](mailto:luiz_everson@yahoo.de)

¹ Laboratório de Pesquisa Química em Produtos Naturais – Departamento de Química, Universidade Federal de Mato Grosso – UFMT, ² Departamento de Microbiologia e Parasitologia, Universidade Federal de Santa Catarina – UFSC.

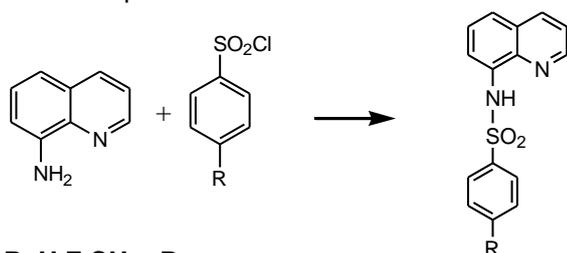
Palavras Chave: *quinolina sulfonamidas, antiparasitários.*

Introdução

Doenças parasitárias têm atormentado a humanidade durante séculos e continuam a causar graves problemas de saúde pública. A leishmaniose é uma das mais importantes parasitoses existentes em todo o planeta, dado ao seu quadro clínico distinto causado por diferentes tipos de leishmania. Tratamentos atuais são insatisfatórios devido à sua via de administração, toxicidade e efeitos colaterais. Por conseguinte, o desenvolvimento de novos, eficientes e seguros agentes quimioterápicos com atividade leishmanicida é imperativo. Neste contexto, sulfonamidas têm sido objeto de interesse farmacêutico, como resultado de suas potentes atividades biológicas. Nosso grupo tem concentrado seus esforços em busca de um composto protótipo. Assim, uma série de derivado aminoquinolinobenzenosulfonamídicos têm sido estudados.¹⁻²

Resultados e Discussão

Os compostos (1-4) foram obtidos a partir da reação da 8-aminoquinolina com diferentes cloretos de sulfonila *p*-substituídos, nominalmente H, F, CH₃ e Br. As reações se deram a 0° C, utilizando piridina como solvente.¹



Os espectros dos compostos sintetizados apresentam dados compatíveis com as estruturas propostas. Os compostos foram submetidos a ensaios de avaliação antiparasitária, nominalmente leishmanicida, frente a cepas de *leishmania brasiliensis*. Os resultados são sumarizados na **tabela 1**.

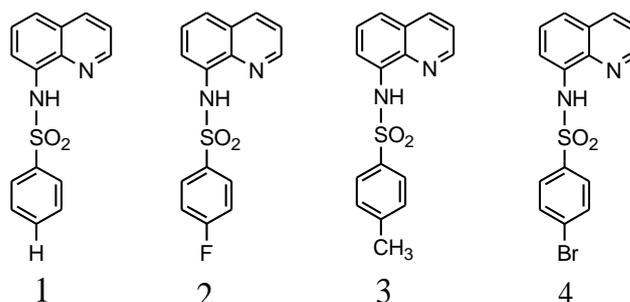


Tabela1. Atividade Antiparasitária.

Composto	L. brasiliensis(promastigota) CI ₅₀
1	54,55uM
2	36,09uM
3	24,15uM
4	2,12uM

CI= concentração inibitória.

Os compostos **1, 2 e 3** mostraram-se citotóxicos. O composto **4** apresentou um índice de seletividade (IS=10) e podem se tornar um interessante modelo para futuras farmacomodulações.

Conclusões

O screening inicial mostrou resultados promissores para a inibição da forma promastigota de *L. brasiliensis* com o composto **4**. A atividade contra formas intracelulares do parasito e o estudo do mecanismo de ação dos compostos estão em andamento

Agradecimentos

CNPq, CPP, UFMT.

¹Silva, L.E.da.; Joussef, A.C.; Pacheco, L.K.; Silva, D.G.da.; Steindel, M. Rebelo, R.A. *Bioorg. Med. Chem.* **2007**, *15*, 755

²Croft, S.L.; Barret, M.P.; Urbina, J.A. *Trends in Parasitology.* **2005**, *19*, 502