

## Síntese e Avaliação Biológica de Iminas Derivadas da Sulfanilamida

Isabela de Oliveira Souza (IC)<sup>1\*</sup>, Rafael Mafra de P. Dias<sup>1</sup> (PG), Daniela Trivelato da S. Paula<sup>2</sup> (PG), Fernando R. Pavan<sup>3</sup> (PG), Clarice Q. F. Leite<sup>3</sup> (PQ), Elaine Soares Coimbra<sup>2</sup> (PQ), Adilson D. da Silva<sup>1</sup> (PQ)

\*e-mail: isa\_bela98@hotmail.com

<sup>1</sup> Departamento de Química, ICE, Universidade Federal de Juiz de Fora, Brasil.

<sup>2</sup> Departamento de Parasitologia, Microbiologia e Imunologia, ICB, Universidade Federal de Juiz de Fora, Brasil.

<sup>3</sup> Faculdade de Ciências Farmacêuticas, Universidade Estadual Paulista "Júlio de Mesquita Filho", Brasil

Palavras Chave: sulfanilamida, tuberculose, leishmania, síntese, avaliação biológica.

### Introdução

As sulfas apresentam propriedades terapêuticas como antibacteriana, porém recentes abordagens exaltam tais compostos frente certos parasitos, demonstrando também atividade antimalárica e leishmanicida.<sup>1</sup>

As leishmanioses são doenças causadas por espécies de protozoários do gênero *Leishmania*. Consideradas como negligenciadas, acometem mais 12 milhões de pessoas em todo mundo.<sup>2</sup>

A Tuberculose é causada pela bactéria *Mycobacterium tuberculosis* e dentro das doenças infecto contagiosas, esta apresenta o maior número de mortes.<sup>3</sup>

Os fármacos utilizados no tratamento de ambas são em sua maioria tóxicos, e já induziram resistência nos patógenos. Em razão disso, é iminente a necessidade de desenvolvimento de novas alternativas terapêuticas no tratamento destas doenças.<sup>4</sup>

Os compostos finais foram testados em promastigotas de *Leishmania* e em *Mycobacterium tuberculosis*. Os resultados foram expressos em CI<sub>50</sub> (Concentração Inibitória de 50% do crescimento dos parasitos) e CIM (Concentração Inibitória Mínima), respectivamente (Tabela 1/ Tabela 2).

Tabela 1: Atividade Leishmanicida das Iminas **2a - f**

Composto	CI <sub>50</sub> (µM)		
	<i>L. amazonensis</i>	<i>L. braziliensis</i>	<i>L. major</i>
<b>2a</b>	> 87,00	> 87,00	> 87,00
<b>2b</b>	36,36±1,41	> 87,00	> 87,00
<b>2c</b>	> 87,00	> 87,00	29,31±0,56
<b>2d</b>	> 87,00	> 87,00	> 87,00
<b>2e</b>	> 87,00	> 87,00	> 87,00
<b>2f</b>	> 87,00	> 87,00	> 87,00

Tabela 2: Atividade Tubercular das Iminas **2a - f**

Composto	CIM (µg/mL)
<b>2a</b>	250,00
<b>2b</b>	31,25
<b>2c</b>	125,00
<b>2d</b>	125,00
<b>2e</b>	250,00
<b>2f</b>	125,00

### Resultados e Discussão

Para a obtenção das Bases de Schiff inicialmente solubilizou-se a sulfanilamida (**1**) em EtOH e posteriormente adicionou-se o aldeído de interesse, mantendo a mistura reacional sob refluxo por um período de 3 a 6 horas (Figura 1).

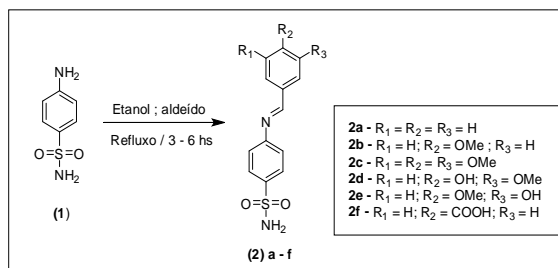


Figura 1. Esquema de Síntese das Iminas derivadas da Sulfanilamida

Os produtos formados (**2a - f**) com bons rendimentos (60 – 80%) foram caracterizados por diferentes técnicas espectroscópicas, a saber, infravermelho e RMN <sup>1</sup>H.

### Conclusões

Todos os compostos foram obtidos em rendimentos satisfatórios (60-90%). Os testes biológicos demonstraram bons resultados para moléculas de caráter mais apolar como os compostos **2b** e **2c** mais ativos em *Leishmania*; e o composto **2b** o mais ativo frente a *Mycobacterium tuberculosis*.

### Agradecimentos

A UFJF e a CAPES pelas bolsas concedidas.

<sup>1</sup> Chan, M.; Fong, D.; *Science* **1990**, Vol. 249; 924-926

<sup>2</sup> <http://www.dndi.org/> Acessado em janeiro de 2011.

<sup>3</sup> <http://www.who.int/tb/en/> Acessado em janeiro de 2011.

<sup>4</sup> Hopkins, A. L.; *Nature* **2007**; Vol. 449 (13); 166-169