

Síntese de benzofuranas substituídas com potencial atividade antichagásica

Vanessa A. de Souza (PG),* Arlene G. Corrêa (PQ)

Departamento de Química, Universidade Federal de São Carlos, 13565-905, São Carlos-SP, Brasil.

*Tel.: +55 16 33518215; e-mail: valmeidadesouza@yahoo.com.br.

Palavras Chave: anel benzofurano, síntese.

Introdução

A doença de Chagas é causada pelo protozoário *Trypanosoma cruzi* e transmitida por algumas espécies do inseto-vetor conhecido como “barbeiro”. Cerca de 18 milhões de pessoas encontram-se infectadas pelo *T. cruzi* em toda a América Latina. Luize *et al.* relataram a atividade tripanocida de uma série de neolignanas isoladas de *Piper regnellii*. Entre os compostos mais ativos frente a formas epimastigotas de *T. cruzi* estão os euponatenoides (Figura 1).¹

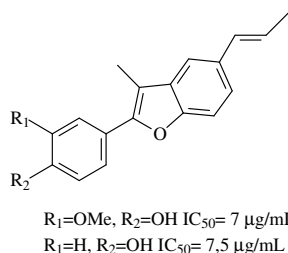
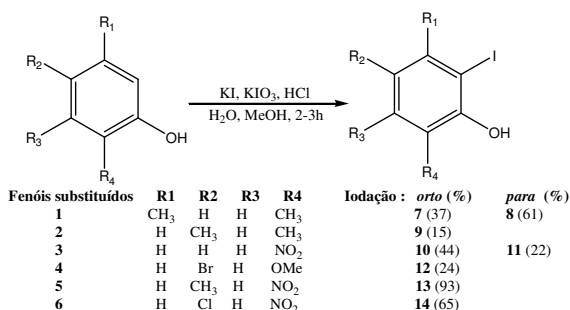


Figura 1

Neste trabalho foi sintetizada uma série de benzofuranas substituídas visando o desenvolvimento de novos fármacos antichagásicos.

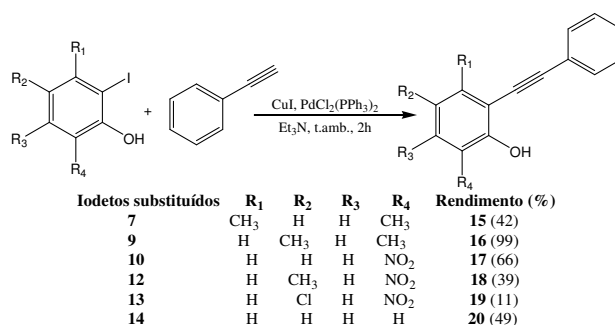
Resultados e Discussão

A metodologia empregada na síntese foi o acoplamento cruzado de Sonogashira e posterior ciclização. Primeiramente fez-se necessário o preparo dos reagentes, através da reação de iodação de alguns fenóis.²



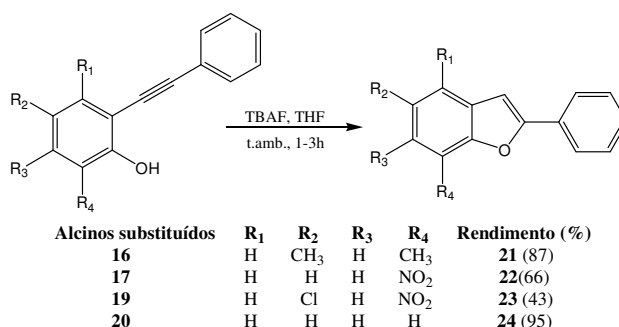
Esquema 1. Iodação dos fenóis com KI, KIO₃ e HCl

Após a iodação, os compostos foram submetidos ao acoplamento de Sonogashira com fenilacetileno.³



Esquema 2. Acoplamento cruzado de Sonogashira

Alguns intermediários obtidos pela reação de Sonogashira foram ciclizados mediados por uma base.⁴



Esquema 3. Anéis benzofuranos obtidos

Conclusões

A rota empregada na síntese de anéis benzofuranos permitiu a obtenção dos produtos de interesse em apenas duas etapas reacionais. A utilização da base como fonte de flúor promoveu a ciclização 5-endo-dig. As condições reacionais ainda precisam ser otimizadas. Os compostos obtidos serão avaliados frente a enzima gGAPDH e formas epimastigotas de *T. cruzi*.

Agradecimentos

FAPESP, CNPq e CAPES.

¹ Luize, P.S., et al. *Biol. Pharm. Bull.* **2006**, 29, 2126.

² Adimurthy, S.; et al. *Tetrahedron Lett.* **2003**, 44, 5099.

³ Koradin, C.; et al. *Tetrahedron.* **2003**, 59, 1571.

⁴ Fiandanese, A.; et al. *Tetrahedron.* **2008**, 64, 53.