

Síntese de 1,2,3 triazóis biologicamente ativos frente ao vírus HIV

Daniel T. G. Gonzaga¹ (PG)*, Vitor F. Ferreira¹ (PQ), Fernando C. da Silva¹ (PQ), Thiago M. L. Souza² (PQ)

¹Instituto de Química, Valonguinho, Universidade Federal Fluminense,² Pavilhão Helio e Peggy Pereira, sala B105, Instituto Fiocruz

¹ Av. Outeiro de São João Batista, s/nº, Campus do Valonguinho, Niterói; ² Rua Leopoldo Bulhões 1480, Manguinhos, Rio de Janeiro

danieltadeugonzaga@yahoo.com.br

Palavras-chave: 1,2,3-triazóis, AIDS, síntese, heterociclos

Introdução

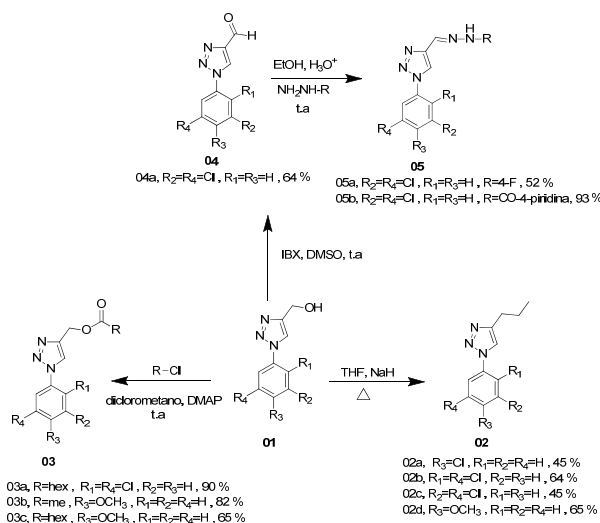
A AIDS é uma doença do sistema imune humano causado pelo vírus da imunodeficiência humana (HIV). A AIDS foi reconhecida como uma pandemia pelo centro americano de controle e prevenção de doença (CDC). Foi calculado que 33,2 milhões de pessoas vivem com a doença no mundo e que 2,1 milhões de pessoas já morreram em decorrência da AIDS, dentre estas 330.000 eram crianças.¹

Os 1,2,3-triazóis, são compostos heterocíclicos nitrogenados que têm despertado muito interesse pelo fato de possuírem um vasto campo de aplicações na área biológica como: antibacteriana², antiviral³, antifúngica⁴ dentre outras.

Este trabalho buscou a síntese de -1,2,3-triazóis com potencial atividades contra o vírus HIV.

Resultados e Discussão

A partir do álcool triazólico **01** foram realizadas reações de alquilação para formar o éter triazólico **02**, acilação para o éster triazólico **03** e oxidação para o aldeído triazólico **04**. Já a partir do aldeído triazólico adicionou-se fenil-hidrazina devidamente substituída ou isoniazida resultando nas hidrazonas e acilhidrazonas triazólicas **05**.²



Esquema 1: Síntese de 1,2,3 triazóis bioativos

Os compostos foram avaliados frente ao vírus HIV e os resultados obtidos estão apresentados na Tabela 1.

Tabela 1: Atividade biológica dos compostos triazólicos

Triazóis	% inibição em 10 μM	IC ₅₀ (μM)
02a	89,3	0,4
02b	91,1	0,1
02c	90,0	0,1
02d	88,4	0,5
03a	85,0	1,3
03b	82,6	0,2
03c	80,8	0,3
04	87,0	1,2
05a	98,0	0,1
05b	81,4	0,7
nevirapina	98,4	0,8

Conclusões

A rota sintética utilizada na preparação dos triazóis se mostrou satisfatória, obtendo-se os compostos em rendimentos que variaram de medianos a excelentes.

Os triazóis foram ativos frente ao vírus HIV, causador da AIDS, inclusive sendo melhores que o padrão testado (nevirapina).

Agradecimentos

Ao CNPQ pela bolsa de doutorado.

¹Huo, H.; Feng, L.; *Applied Mathematical Modelling*, **2013**, 37 (3), 1480-1489.

²Boechat, N.; Ferreira, V. F.; Ferreira, S. B.; Ferreira, et al.; *Journal of Medicinal Chemistry*, 2011,54 (17), 5988-5999

³da Silva, F. C.; de Souza, M. C. B. V. S.; Frugulhetti, I. P.; Castro, H. C; et al.; *European Journal of Medicinal Chemistry*, **2009**, 44 (1), 373-383.

⁴da Silva, F. C.; Martins, P. R. C.; da Silva, E. G; et al.; *Medicinal Chemistry*, **2013**, 9 (8), 1085-1090