

# Síntese de 1H-1,2,3-triazóis conjugados ao núcleo tiofênico com potencial atividade anti-inflamatória.

Danielle P. Portella\*(PG)<sup>2</sup>, Danielle M. da Surreição (IC)<sup>1</sup>, Maria Eduarda L. de Lima (IC)<sup>1</sup>, Fernando de Carvalho da Silva (PQ)<sup>2</sup>, Vitor Francisco Ferreira (PQ)<sup>2</sup>, Daniel Tadeu Gomes Gonzaga (PQ)<sup>1</sup>

<sup>1</sup> Laboratório de Síntese Orgânica, UEZO

<sup>2</sup> Laboratório de Síntese Orgânica aplicada, UFF

\* E-mail de contato: pagliaminutodanielle@id.uff.br

Palavras-chave: Síntese orgânica, 1H-1,2,3-triazol, anti-inflamatória

## Introdução

O 1,2,3-triazol resume-se em um anel heterocíclico de cinco membros contendo três nitrogênios adjacentes.<sup>1</sup>

O triazol é um importante grupo farmacofórico encontrado em importantes fármacos como os antibióticos beta-lactâmicos tazobactam e a cefalosporina cefatrizina. literatura científica de inúmeras atividades biológicas como antiviral, anti-chagásico, anti-inflamatório dentre outros.<sup>2</sup>

O núcleo tiofênico consiste em um anel aromático, de cinco membros, contendo enxofre como heteroátomo e se encontra bastante consolidado na química medicinal, diversos fármacos apresentam o anel tiofênico em seu esqueleto químico, tendo como exemplo o clopidogrel, agente antiagregante plaquetário.<sup>3</sup>

Além dos fármacos, vários relatos na literatura apresentam compostos contendo o núcleo tiofênico com variadas propriedades biológicas que incluem atividade antimicrobiana, anti-inflamatória,, dentre outras.<sup>4</sup>

A junção dos dois núcleos tem como objetivo uma possível ação sinérgica.

## Resultados e Discussão

A metodologia consiste na acilação do álcool triazol (01) com o cloreto de acila tiofênico (02) catalizado por DMAP, na presença da piridina como base (Figura1)

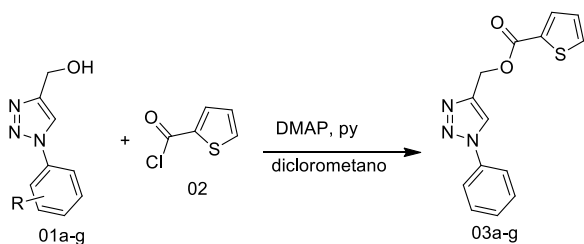


Figura 1: Síntese de triazóis tiofênicos 03a-g.

Os compostos foram obtidos com bons rendimentos de acordo com a seguinte tabela:

Tabela 1. Rendimentos dos produtos sintetizados.

Composto	Substituinte	Rendimento
3a	Ph	80%
3b	2,5-diClPh	85%
3c	3,4-diClPh	60%
3d	4-NO <sub>2</sub> Ph	73%
3e	4-OCH <sub>3</sub>	85%
3f	4-F	>98%
3g	4-Cl	82%

Os rendimentos variaram de 60% a quantitativo.

## Conclusões

A metodologia aplicada se apresentou reprodutível e de fácil execução.

Os rendimentos foram altos, variando de bons (60%) a excelente (quantitativo).

## Agradecimentos

LabSOA, FAPERJ, CNPq e CAPES.

1- Melo; J. O. F. et al (2006), Heterociclos 1,2,3-triazólicos: histórico, métodos de preparação, aplicações e atividades farmacológicas, Química Nova, 29 (3), 569-579.

2- Agalave, S. A, et al (2011),; Click Chemistry: 1,2,3-Triazoles as Pharmacophores,, Chemistry Asian Journal 6, 2696 – 2718.

3- Lahsasni, S, et al (2018), Synthesis, Characterization, and Antibacterial and Anti-Inflammatory Activities of New Pyrimidine and Thiophene Derivatives, Journal of Chemistry, Volume 2018, Article ID 8536063, 11 pages.

4- Chaudhari, P. S, et al (2018), Synthesis and Biological Evaluation of Novel 2-(4-acetyl-3-methyl-5-(arylamino) thiophen-2-yl)-3-arylquinazolin-4(3H)-one Derivatives

as Potential Anti-inflammatory and Antioxidant Agents, Anti-Inflammatory & Anti-Allergy Agents in Medicinal Chemistry, 17, 102-114.