

SÍNTESE DE DERIVADOS PIRAZOLIL BENZESSULFONAMÍDICOS COM POTENCIAL ATIVIDADE ANTIBACTERIANA.

Thaís Ribeiro H. Quinteiro¹ (PG), Vinicius Rangel Campos^{1*} (PQ), Alice M. R. Bernardino¹ (PQ)
*e-mail: viniciuscampos@id.uff.br

¹Universidade Federal Fluminense, Instituto de Química, Programa de Pós-Graduação em Química da UFF, Niterói, Rio de Janeiro, Brasil.

Palavras Chave: Síntese, Pirazol, Sulfonamidas, Antibacteriano.

Introdução

O processo de resistência de várias bactérias Gram-positivas e Gram-negativas aos antibióticos clinicamente disponíveis vem sendo considerada uma grave ameaça à saúde pública mundial. Portanto, pesquisadores buscam por novas substâncias de origem natural ou sintética que possuam atividade antibacteriana frente as cepas multirresistentes. O objetivo deste projeto envolve a síntese e a caracterização estrutural de novos derivados do sistema pirazolil benzenossulfonamídico **la-e** (Figura 1) com prospecção para atividade antibacteriana, onde o núcleo benzenossulfonamídico, encontrado em fármacos antibacterianos como o sulfametoxazol, é inserido ao anel pirazólico.¹

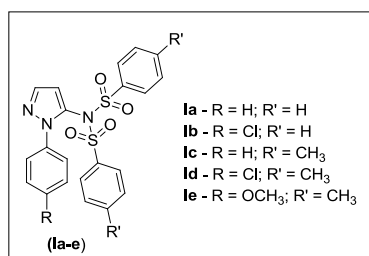


Figura 1: Estrutura química dos novos derivados **la-e**.

Resultados e Discussão

A rota sintética utilizada para a obtenção dos novos derivados **la-e** está representada na figura 2:

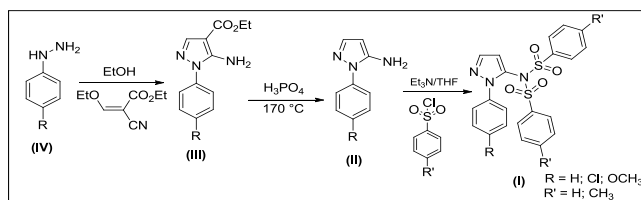


Figura 2: Rota sintética para a obtenção dos derivados pirazolil benzenossulfonamídicos **la-e**.

Inicialmente para a obtenção dos derivados 5-amino-1-aryl-1H-pirazol-4-carboxilatos de etila (**IIIa-c**) foi realizada uma reação de ciclização utilizando-se arilidrazinas e etoximetilenocianoacetato de

etila. Os intermediários 5-amino-1-aryl-1H-pirazóis (**IIa-c**) foram obtidos por hidrólise e descarboxilação dos carbonilados (**IIIa-c**). Finalmente os derivados pirazolil benzenossulfonamídicos (**la-e**) foram obtidos por reação de sulfonação com excesso de cloretos de sulfonila correspondentes.^{2,3}

Tabela 1: Rendimentos e P.F das substâncias **1a-e**.

Substância	P.F. (°C)	Rendimento (%)
la	174-176	60
lb	211-213	58
lc	154-156	61
ld	195-197	60
le	199-201	30

Todos os compostos sintetizados até o momento foram devidamente caracterizados por métodos espectroscópicos como IV, RMN de ¹H e ¹³C.

Conclusões

A rota sintética escolhida para a síntese dos derivados pirazolil benzenossulfonamídicos foi considerada eficiente e os produtos desejados foram obtidos de forma satisfatória. As substâncias sintetizadas e caracterizadas serão devidamente avaliadas quanto a sua provável atividade antibacteriana frente às diferentes cepas de bactérias Gram-negativas e Gram-positivas pelo grupo de pesquisa coordenado pela Profa. Dra. Helena Carla Castro, do Instituto de Biologia da UFF.

Agradecimentos

CAPES, FAPERJ, CNPq, UFF.

¹ Marra, R. K. F., Planejamento e Síntese de Novos derivados Contendo o Anel Pirazol Candidatos à atividade Biológica, Tese de Doutorado, UFF, 2014.

² Silva, T. B., Bernardino A. R., Ferreira M. L. G., *Bioorg. Med Chem.*, 2016, v. 24, 4492-4498.

³ Lynch, B. M.; Khan, M. A.; Teo, H. C.; Pedrotti, F.; *Can J. Chem.*, 1987, 66, 420-428.