



**DESENVOLVIMENTO DE COMPOSTOS BIOATIVOS CONTENDO UMA
UNIDADE ACEPTORA DE MICHAEL: DESIGN, SÍNTESE E CARACTERIZAÇÃO.**

Rodrigo Ribeiro Alves Caiana¹, Juliano Carlo Rufino de Freitas²

RESUMO

Os carboidratos já são conhecidos há muito tempo como uma classe de macromoléculas que se destaca por suas distintas características, estando amplamente distribuídos nos mais variados seres vivos, onde se configuram como uma classe de moléculas indispensável para a manutenção das condições homeostáticas. As características químicas e biológicas peculiares dos carboidratos chamam a atenção dos diversos segmentos científicos, o que não é diferente com os químicos sintéticos, que buscam através de modificações estruturais diversificar e potencializar as atividades biológicas já existentes. Uma modificação pertinente nestas moléculas é a incorporação de grupos farmacofóricos em sua estrutura, como o grupo aceptor de Michael, encontrado em diversas moléculas de origem natural e sintética, promovendo suas variadas atividades farmacológicas. Diante disso, o projeto visa o desenvolvimento de compostos derivados da D-glicose contendo em sua arquitetura molecular uma unidade aceptor de Michael visando o desenvolvimento de moléculas farmacologicamente ativas. Para atingir o proposto foram realizadas sucessivas modificações na molécula da D-glicose, obtendo-se primeiramente o 3,4,6-tri-O-acetil-D-glucal, a partir do qual se obteve os O-glicosídeos-2,3-insaturados, que foram hidrolisados e em seguida oxidados para que se chegasse às moléculas com o grupo aceptor de Michael em sua estrutura. As reações empregadas mostraram-se simples, com rendimento médio de 91 a 94% a cada etapa, sendo as estruturas moleculares confirmadas por técnicas espectroscópicas, evidenciando o sucesso de cada metodologia empregada. As moléculas com o grupo aceptor de Michael foram obtidas com rendimentos que variaram de 75 a 88%, constando-se que o substituinte ligado ao carbono anomérico não exerce influencia significativa no tempo e no rendimento desta reação. Tais moléculas mostram-se bastante promissoras, fomentando mais estudos que possam evidenciar suas possíveis características farmacológicas e condições de uso seguro.

Palavras-chave: Carboidratos, Síntese Orgânica, Aceptor de Michael.

¹Aluno do Curso de Bacharelado em Farmácia, Centro de Educação e Saúde, UFPA, Campina Grande, PB, e-mail: rodrigoriibeiroalves@hotmail.com

²Doutorado em Química, Professor Adjunto de Química, Centro de Educação e Saúde, UFPA, Campina Grande, PB, e-mail: julianocrufino@yahoo.com.br

DEVELOPMENT OF BIOACTIVE COMPOUNDS CONTAINING A MICHAEL ACCEPTOR UNIT: DESIGN, SYNTHESIS AND CHARACTERIZATION.

ABSTRACT

Carbohydrates have been known for a long time as a class of macromolecules which stands out for its distinct characteristics, being widely distributed in a variety of living beings, which act as a class of molecules essential for the maintenance of the homeostatic conditions. The chemical and biological characteristics of the carbohydrates call the attention of various segments of science, which is different with the synthetic chemicals, seeking through structural changes to diversify and enhance the biological activities that already exist. A modification relevant in these molecules is the incorporation of pharmacophoric groups in its structure, such as the Michael acceptor group, found in various molecules of natural origin and synthetic, promoting their various activities. In view of this, the project aims at the development of compounds derived from D-glucose containing in its molecular architecture a unit of Michael accepting aiming at the development of molecules pharmacologically active. In order to achieve this, successive modifications were made to the D-glucose molecule, obtaining 3,4,6-tri-O-acetyl-D-glucal, from which O-glycosides-2,3 Unsaturated fatty acids which were hydrolyzed and then oxidized to the molecules with the Michael acceptor group in their structure. The reactions used were simple, with an average yield of 91 to 94% at each stage. The molecular structures were confirmed by spectroscopic techniques, evidencing the success of each methodology employed. The molecules with the group acceptor of Michael were obtained with yields ranging from 75 to 88%, showing that the substituent on the carbon anomérico does not exercise significant influence in time and yield of this reaction. These molecules are very promising, encouraging more studies that can demonstrate their potential pharmacological characteristics and conditions of safe use.

Keywords: Carbohydrates, Organic Synthesis, Michael acceptor.