



SÍNTESE E AVALIAÇÃO DA ATIVIDADE ESQUISTOSSOMICIDA DE DERIVADOS SIMÉTRICOS DA DIBENZALACETONA

Ana L. O. Fonseca^{1*}, Juliana M. Galvão¹, João G. S. Carvalho¹, Monique C. Amaro², Josué de Moraes², Mara R. C. Couri¹

¹ Universidade Federal de Juiz de Fora, Departamento de Química, Juiz de Fora, MG, Brasil, 36036-900.

² Universidade Guarulhos, Instituto Adolfo Lutz, Guarulhos, SP, Brasil, 07023-070.

*e-mail: ana_fonseca321@hotmail.com

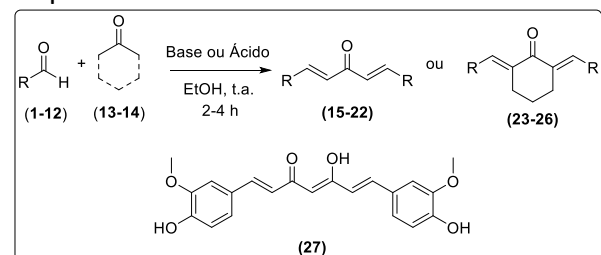
A esquistossomose é uma doença parasitária responsável por provocar a morte de cerca de 200.000 pessoas anualmente¹. Atualmente, a OMS recomenda somente o praziquantel como medicamento para seu tratamento. Contudo, há relatos na literatura de diversas problemáticas relacionadas a ele, em especial, o risco de aparecimento de novas cepas do verme que possam ser resistentes².

As dibenzalacetonas (DBAs) são amplamente reportadas na literatura quanto as suas atividades antiviral, antiparasitária, antitumoral etc.³ Todavia, ainda não há relatos na literatura quanto a sua atividade esquistossomicida. Desta forma, objetivou-se no presente trabalho sintetizar uma série de derivados da dibenzalacetona simétricas e avaliar a sua atividade frente ao verme *Schistosoma mansoni*.

Neste trabalho, as DBAs foram sintetizadas via reação de condensação aldólica em meio básico ou ácido variando as cetonas (13-14) e os aldeídos aromáticos (1-12). Foram obtidas 13 DBAs com rendimentos que variaram de 31 a 92% (Esquema 1). Estas tiveram suas atividades esquistossomicidas avaliadas juntamente com a curcumina, análogo dicarbonilado da DBA (Tabela 1). Dos resultados obtidos, 4 DBAs (19, 20, 21 e 26) destacaram-se pelas suas atividades anti-esquistossomose.

Dentre elas a DBA 20 apresentou atividade mais promissora, com o menor valor

de CE₅₀. Destaque também para a DBA 26, indicando uma possível importância da presença do anel heterocíclico de cinco membros na atividade. Comparando-se os resultados das DBAs 21 e 25 é possível notar a importância da posição do substituinte no anel aromático. Por fim, a DBA 19 e a curcumina (27) revelaram que os grupos 3-OCH₃ e 4-OH são importantes para atividade esquistossomicida.



Esquema 1: Reação de obtenção das DBAs e estrutura da curcumina

#	Estrutura	CE ₅₀ (µM)
15	R = 4-bromofenil	>50
16	R = 3,4,5-trimetoxifenil	>50
17	R = 4-metilfenil	>50
18	R = 4-hidroxifenil	>50
19	R = 3-metoxi-4-hidroxifenil	26,2±5,5
20	R = 2-tiofeno	7,1±2,1
21	R = 2-metoxifenil	15,1±4,6
22	R = piperonil	>50
23	R = 4-fluorofenil	>50
24	R = 4-clorofenil	>50
25	R = 4-metoxifenil	>50
26	R = 2-furano	28,4±4,8
27	Curcumina	24,8±5,1

Tabela 1: Atividade esquistossomicida das DBAs

Agradecimentos: CAPES, FAPEMIG, CNPq, PPG-Química (UFJF).

[1] Vasconcelos, G. Anaphylactic reaction to praziquantel following schistosomiasis treatment, v. 7,2023, p. 268.

[2] Castro, C. C. B., DIAS, M. M., REZENDE, T. P., MAGALHÃES L. G. FILHO, A. A. S. Fighting Multidrug Resistance with Herbal Extracts, Essential Oils and Their Components, Academic Press, ed. 1, 2013, Brasil.

[3] Francisco, K. R. Structure-activity relationship of dibenzylideneacetone analogs against the neglected disease pathogen, v. 81, 2023, p. 129.