



| | |
|-------------------|---|
| Evento | Salão UFRGS 2014: FEIRA DE INOVAÇÃO TECNOLÓGICA DA UFRGS – FINOVA |
| Ano | 2014 |
| Local | Porto Alegre |
| Título | Síntese total do antirretroviral Atazanavir visando desenvolver a produção nacional de medicamentos |
| Autores | BRUNA BENTO CASANOVA MAURO NEVES MUNIZ GRACE GOSMANN |
| Orientador | SIMONE CRISTINA BAGGIO GNOATTO |

Desde o início da epidemia, em 1980, até junho de 2012, o Brasil tem 656.701 casos registrados de SIDA (Síndrome da Imunodeficiência Adquirida), de acordo com o último Boletim Epidemiológico em 2014. Porém o país é referência mundial no enfrentamento ao HIV e à doença propriamente dita. Desde 1993, o SUS garante acesso universal a todos os medicamentos necessários para o combate ao HIV, além de exames e acompanhamento médico, que beneficiam 217 mil brasileiros. O Ministério da Saúde disponibiliza gratuitamente 20 antirretrovirais, que representam investimentos de R\$ 850 milhões por ano na aquisição dos medicamentos. Desses 20, oito são objeto de PDP (Parceria de Desenvolvimento Produtivo) projeto de desenvolvimento do Ministério da Saúde para a síntese nacional desses medicamentos e assim a redução dos custos de distribuição desses medicamentos. Dentre esses antirretrovirais está o Atazanavir, um fármaco da classe dos inibidores da protease, cuja patente em vigor finaliza em 2017. O objetivo do projeto é, então, sintetizar o atazanavir para que possamos desenvolver sua produção nacionalmente. A proposta de rota sintética para a molécula consiste numa síntese convergente, na qual dois fragmentos são sintetizados de formas independentes e assim acoplados para dar sequência à rota sintética. O projeto é realizado em parceria com outro grupo de pesquisa da Universidade de São Paulo, e cada grupo é responsável pela síntese de um dos fragmentes citados. A síntese total está demonstrada na Figura 1, iniciando com acoplamento Suzuki entre o ácido 4-formilfenilborônico (1) e a 2-bromopiridina (2) o resultado foi 4-(Piridin-2-il) benzaldeído (3), que foi condensado com *tert*-butil carbazato (4) produzindo *N*-1-(*tert*-butiloxcarbonil)-*N*-2-[4-(piridin-2-il)benzilideno]- hidrazona (5) que foi reduzido com catálise de Pd/C gerando a molécula de nosso interesse *N*-1-(*tert*-butiloxcarbonil)-*N*-2-[4-(piridin-2-il)benzilideno]- hidrazina (6) com rendimento total de 60%. O próximo passo é a utilização deste fragmento para o acoplamento com o epóxido 7 e a finalização da síntese total do Atazanavir.

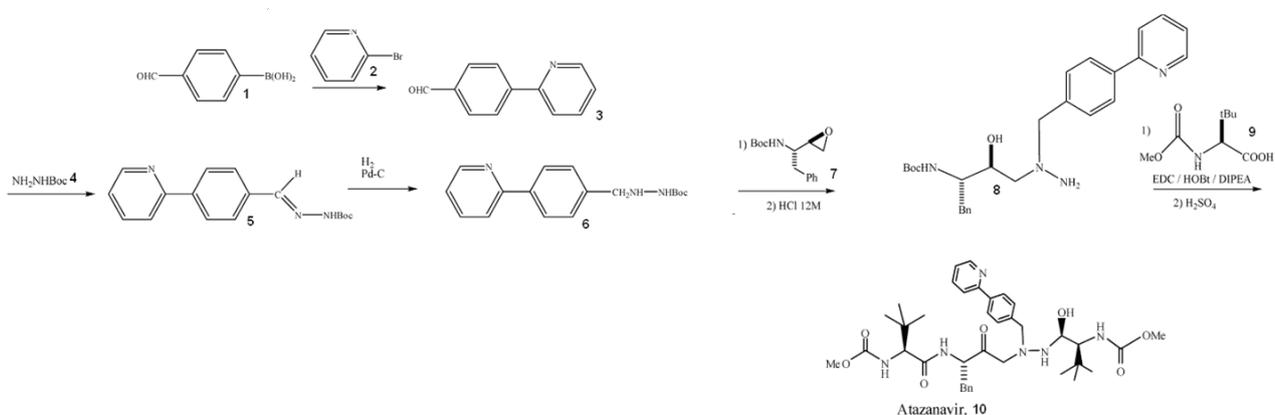


Figura 1. Síntese total do Atazanavir