

EXTRATO BRUTO E FRAÇÕES COMO INIBIDORES ENZIMÁTICOS EM TRIPANOSSOMATÍDEOS

José Roberto de Sousa FILHO¹, Marcos José MARQUES², Thamyris Reis MORAES³, Ivan de Oliveira PEREIRA⁴

¹Estudante de Odontologia/UNINCOR e Ciências Biológicas/UNIFAL- e-mail:

joseroberto.sousafilho@gmail.com

²Co-Orientador e Professor da UNIFAL

³Estudante de Farmácia/UNINCOR

⁴Orientador e Pró-Reitor de Pós-Graduação, Pesquisa e Extensão da UNINCOR – e-mail:

ivan.farma@yahoo.com.br

Palavras-Chave: *Leishmania*, Tripanossomatídeos, Inibição Enzimática

Resumo:

Infecções causadas por tripanossomatídeos do gênero *Leishmania* representam um dos maiores problemas de saúde pública mundial atualmente, com alta endemicidade, sobretudo em países em desenvolvimento. As drogas de escolha para o tratamento das leishmanioses são os antimoniais pentavalentes, que causam toxicidade renal e cardíaca, além de induzirem resistência no parasito. Como parte de nossas pesquisas visando o desenvolvimento de novas drogas com atividade leishmanicida, foram avaliados quanto à atividade inibitória de proteases provenientes de amastigotas de *Leishmania (Leishmania) amazonensis*, *in vitro* extratos bruto e frações (hexânica, acetato etílico, etanólica e aquosa) obtidos de *Arrabidaea brachypoda*, uma planta nativa típica do bioma Cerrado brasileiro. Os amastigotas de *L. (L.) amazonensis* foram isolados de camundongos infectados, lavados com PBS e lisados por ultrassom. Após centrifugação, o sobrenadante (proteases) foi recolhido e utilizado nas avaliações. Para avaliação da atividade inibitória sobre as proteases, usou-se o substrato fluorogênico Z-FR-AMC e os extratos dissolvidos em DMSO. As soluções foram incubadas por 30 minutos após adição das substâncias a serem testadas. Então, o substrato foi adicionado, seguido por análise espectrofluorométrica a cada 0,5 segundos, com um comprimento de onda de excitação de 380 nm e emissão de 460 nm. Cada experimento foi realizado em triplicata em três ocasiões diferentes, e a percentagem de inibição calculada em relação ao controle apenas com DMSO. O extratos bruto, hexânico, acetato etílico, butanólico e aquoso apresentaram IC₅₀ de 136.3 ± 36.2, 132.1 ± 6.1, 65.3 ± 15.5, 116.7 ± 8.5 e >200 ug/mL, respectivamente. Estes resultados sugerem que o extrato acetato etílico é o mais eficiente e um potente inibidor de proteases de *L. (L.) amazonensis*, provendo novas perspectivas para o desenvolvimento de drogas mais efetivas e menos tóxicas com atividade tripanocida provenientes do Cerrado brasileiro, tendo como alvo as proteases do parasito.

APOIO: O aluno José Roberto de Sousa Filho agradece a Bolsa de Iniciação Científica fornecida pela Fundação de Apoio a Pesquisa do Estado de Minas Gerais - Fapemig