



MINISTÉRIO DA EDUCAÇÃO  
UNIVERSIDADE FEDERAL DE PELotas - UFPEL  
CENTRO DE CIÊNCIAS QUÍMICAS FARMACÊUTICAS  
E DE ALIMENTOS  
PROGRAMA DE PÓS-GRADUAÇÃO EM QUÍMICA  
SEMINÁRIOS II



**Título do seminário:** Compostos Benzodiazepínicos: História, Farmacologia, Aplicações e Síntese

**Apresentador:** Guilherme Araújo.

**Resumo:** Compostos benzodiazepínicos representam uma importante classe de compostos químicos com atividade farmacológica ansiolítica e antiepiléptica. Descobertos em 1957 pelo pesquisador *Leo Sternbach*, tiveram sua síntese rapidamente patenteada e logo comercializados para a população. Seu modo de ação nos organismos demorou cerca de 15 anos para serem elucidados, e em alguns pontos, ainda há algumas lacunas. Sabe-se que os benzodiazepínicos atuam nos canais de cloreto nas células cerebrais junto dos neurotransmissores de ácido  $\gamma$ -aminobutírico (GABA). Ajudando a liberar mais cloretos na célula e diminuir a excitabilidade neural. Na síntese do primeiro fármaco contendo benzodiazepino, o Clorodiazepóxido, proposta por *Sternbach* em 1957, temos 4 etapas reacionais com diferentes particularidades. O mesmo pesquisador, realizou a síntese do conhecido fármaco Diazepam a partir do Clorodiazepóxido acrescentando mais duas etapas reacionais. No geral os processos sintéticos para a síntese de 1,4-benzodiazepínicos e 1,5-benzodiazepínicos contém a presença de catalisadores metálicos que os tornam menos sustentáveis. Estudos recentes procuram realizar a síntese de benzodiazepínicos sem a utilização de metais e com um olhar mais crítico para a sustentabilidade. Assim como o processo de hibridação molecular, onde diferentes estruturas farmacológicas são combinadas, também vem sendo utilizada nas pesquisas com benzodiazepínicos.

**Title of seminary:** Benzodiazepine Compounds: History, Pharmacology, Applications and Synthesis

**Presenter:** Guilherme Araújo.

**Abstract:** Benzodiazepine compounds represent an important class of chemical compounds with anxiolytic and antiepileptic pharmacological activity. Discovered in 1957 by researcher *Leo Sternbach*, their synthesis was quickly patented and soon commercialized to the population. Its mode of action in organisms took around 15 years to be elucidated, and in some areas, there are still some gaps. It is known that benzodiazepines act on chloride channels in brain cells along with  $\gamma$ -aminobutyric acid (GABA) neurotransmitters. Helping to release more chlorides into the cell and decrease

neural excitability. In the synthesis of the first benzodiazepine-containing drug, Chlorodiazepoxide, proposed by Sternbach in 1957, we have 4 reaction steps with different particularities. The same researcher carried out the synthesis of the well-known drug Diazepam from Chlorodiazepoxide, adding two more reaction steps. In general, synthetic processes for the synthesis of 1,4-benzodiazepines and 1,5-benzodiazepines contain the presence of metallic catalysts that make them less sustainable. Recent studies seek to synthesize benzodiazepines without the use of metals and with a more critical look at sustainability. Just like the process of molecular hybridization, where different pharmacological structures are combined, it has also been used in research with benzodiazepines.