

Alguns aspectos da história da aspirina

Angelo C. Pinto

Instituto de Química, Universidade Federal do Rio de Janeiro
Centro de Tecnologia, Bloco A, Ilha do Fundão
Rio de Janeiro, RJ, 21945-970- Brasil

A aspirina, como é conhecida nas farmácias o ácido acetilsalicílico, completou 100 anos em 1997 e é o medicamento mais conhecido e vendido em todo o mundo. Só nos EUA, são consumidos mais de 30 bilhões de comprimidos de aspirina por ano.

O ácido acetilsalicílico é provavelmente a droga mais associada com plantas, embora ele seja uma substância sintética. Sua síntese, no entanto, foi totalmente feita com base na estrutura química de uma substância natural isolada do salgueiro branco, a *Salix alba*.

As virtudes do salgueiro, porém, antecedem o uso da aspirina. William Shakespeare, um dos maiores poetas e dramaturgos da humanidade, já o louvava, com a canção do salgueiro cantada por Desdêmona, em Otelo.

Cantai salgueiro, salgueiro, salgueiro !

O amargo pranto que dos olhos lhe corria

As próprias pedras amolecia.

A história deste ácido, muito bem documentada, teve início no século V a.C. com Hipócrates, filósofo e médico grego, considerado o pai da medicina moderna. Hipócrates prescrevia preparações que incluíam cascas e folhas do salgueiro para o tratamento de febres e para aliviar as dores do parto. Assim como Hipócrates, Dioscórides, um dos mais notáveis médicos da Antiguidade, que viveu na Grécia no século I da era cristã e autor da obra "De Materia Medica", cujo uso se estendeu até o início do Renascimento, receitava emplastos feitos com cascas e folhas do salgueiro para o tratamento de dores reumáticas.

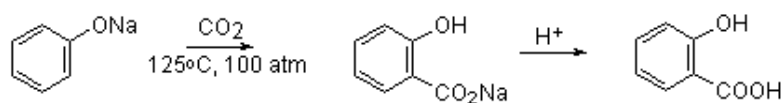


A salicilina (1), o princípio ativo do salgueiro branco, é encontrada em várias espécies dos gêneros *Salix* e *Populus*.

A substância foi isolada pela primeira vez em 1829 pelo farmacêutico francês H. Leroux. As propriedades anti-reumáticas da salicilina assemelham-se muito às do ácido salicílico (2), no qual se converte por oxidação no organismo humano.



Em 1838, o químico italiano Raffaele Piria mostrou que a salicilina era um glicosídeo, que purificou e do qual obteve, por hidrólise e oxidação da salicilina resultante, o ácido livre. A primeira síntese do ácido salicílico foi feita pelo célebre químico alemão Kolbe, que o preparou em 1859 pela reação entre o fenóxido de sódio e o dióxido de carbono. A produção em larga escala de salicilatos sintéticos começou em 1874, em Dresden, na Alemanha, no mesmo ano em que van't Hoff e Le Bel propuseram, independentemente, o arranjo tetraédrico do átomo de carbono. A despeito das irritações estomacais causadas pela ingestão do ácido salicílico e de seu gosto amargo, sua grande aceitação pela medicina como remédio eficaz para o tratamento de febres reumáticas agudas, artrites crônicas e gota levou a U.S. Salicylic Acid Company a obter de Kolbe o licenciamento para produção deste ácido nos EUA³.



Síntese de Kolbe

Mais uma vez a história da Química demonstrou que é nos laboratórios, entre reagentes químicos, vidros e pequenas engenhocas, que os atores entram em cena, sucedendo-se uns aos outros e legando à humanidade meios para prolongar a vida e diminuir o sofrimento humano. Desta vez, o teatro é um dos laboratórios da Bayer, o ano é 1897, e o ator é Felix Hoffman. O enredo da peça trata do sofrimento diário de um velho enfermo.

O pai de Hoffman sofria de reumatismo crônico que combatia diariamente com ácido salicílico, o que lhe causava sérios transtornos estomacais e um desagradável gosto na boca. Não suportando mais as dores e o gosto ruim do remédio, o velho pai pediu ao filho que lhe desse outro remédio que não provocasse tantos efeitos colaterais. Hoffman atendendo ao apelo do pai, preparou e lhe deu o ácido acetilsalicílico (3); daí para frente a história é bem conhecida⁴.



A aspirina foi patenteada pela Bayer em 1899, e o seu nome deriva de A de acetil e spirina de "spiric acid", o outro nome em inglês pelo qual era também conhecido o ácido salicílico. "Spiric" por sua vez tem origem em *Spiraea*, gênero ao qual pertence a *Salix alba*, planta de onde foi isolada a salicilina. Desde então, a medicina passou a dispor da aspirina como uma das mais potentes armas de seu arsenal terapêutico.

Mesmo ocupando um lugar no panteão dos químicos célebres por ter sido o primeiro a sintetizar o ácido

acetilsalicílico, Kolbe é o exemplo perfeito de que os heróis da Química, por serem humanos, também erram e podem ser preconceituosos, como pode ser visto na carta que escreveu sobre o trabalho de van't Hoff e Le Bel⁶.

Em um trabalho recentemente publicado com o mesmo título (Sinal dos Tempos), insisti no fato de que uma das causas do retrocesso atual da pesquisa química na Alemanha é a falta de conhecimento químico geral e, ao mesmo tempo, fundamental. Muitos de nossos professores de química estão nesta situação e causam muito mal à ciência. Uma consequência imediata disto é que se está espalhando uma teia de aparente escolaridade e conhecimento, que não passa da filosofia natural, superficial e estúpida, desmascarada há cinquenta anos pela ciência natural exata, e que, agora, ataca novamente, ajudada por pseudocientistas que tratam de disfarçá-la e apresentá-la como ciência, assim como se tentassem introduzir uma prostituta bem vestida e empoada na boa sociedade, à qual não pode pertencer.

Qualquer um que possa pensar que os conceitos acima são exagerados poderá ler, se conseguir, o livro dos senhores van't Hoff e Hermann sobre A Disposição dos Átomos no Espaço, recentemente publicado, e que está cheio de tolices e fantasias. Eu teria ignorado mais este livro se um químico de reputação não o tivesse recomendado calorosamente como uma realização de alto nível.

O tal Dr. J.H. van't Hoff, da Escola de Veterinária de Utrecht, aparentemente não tem tendência alguma à investigação química exata. Ele prefere montar Pégaso (aparentemente emprestado pela Escola de Veterinária) e proclamar em sua *La chimie dans l'espace* como lhe parecem estar os átomos dispostos no espaço, vistos do Monte Parnasso químico a que ele chegou voando."

O ácido acetilsalicílico, mesmo sendo uma substância simples, é um dos melhores exemplos do que a natureza pode nos oferecer. Basta que o homem perceba a beleza da vida observando as lágrimas derramadas pelos salgueiros, também conhecidos como chorões, as mesmas que Shakespeare colocou nos olhos de Desdêmona.

Para ler mais sobre o assunto:

- 1 - Agosta, W. C., *J. Chem. Ed.* (1997), **74**, 857.
- 2 - Shakespeare, W., *The Tragedy of Othello, the Moor of Venice*, ato 4, cena 3, em *The Complete Works*, Stanley Wells e Gary Taylor editores, 1988, p. 847, Clarendon Press, Oxford.
- 3 - Kiefer, D. M., *Today's Chemistry at Work* (1997), December, 38.
- 4 - Martin, C., *Chemistry in Britain* (1996), June, **132**, 8.
- 5 - Allinger, N. L., Cava, M. P., De Jongh, D. C., Johnson, C. R., Lebel, N. A., Stevens, C. L., *Química Orgânica*, Tradução de Alencastro, R. B., Peixoto, J. S., Pinho, L. R. N., 2ª. ed., Guanabara Dois (1976), p. 890.
- 6 - [A aspirina no projeto "Molecule of the Month"](#)