

Síntese e atividade antifúngica de novas ciano-alilsulfonamidas derivadas de adutos de Morita-Baylis-Hillman.

Larissa R. Terra (IC)¹, Mayura M. M. Rubinger (PQ)^{*1}, Giovanna R. N. Silva (PG)¹, Eder C. Tavares (PQ)²

¹Universidade Federal de Viçosa,²Universidade Federal de Itajubá

Laboratório de síntese Orgânica e Inorgânica (422), Departamento de Química, Universidade Federal de Viçosa, Campus Viçosa 36570-900, Viçosa-MG, Brasil.

Palavras Chave: sulfonamidas, Morita-Baylis-Hillman, fungicidas

Introdução

Sulfonamidas podem atuar como bactericidas, fungicidas ou antitumorais, por exemplo.¹ Este trabalho visou a preparação de alilsulfonamidas para estudos de atividade contra microrganismos causadores de doenças de plantas. Esses compostos foram preparados a partir de adutos de Morita-Baylis-Hillman, uma estratégia de síntese onde novas ligações C-C são formadas a partir de um aldeído e um alceno com grupo eletrofílico. Esta reação apresenta total economia de átomos e produz intermediários multifuncionalizados em uma etapa.² Este trabalho apresenta a síntese de quatro alilsulfonamidas, sendo três delas inéditas, e resultados de ensaios de atividade antifúngica.

Resultados e Discussão

O aduto de Morita-Baylis-Hillman(1) foi preparado a partir de reação entre benzaldeído e acrilonitrila, catalisada por trimetilamina. O produto foi acetilado com anidrido acético, na presença de DMAP(4-dimetilaminopiridina) formando acetato 2 (Figura 1).

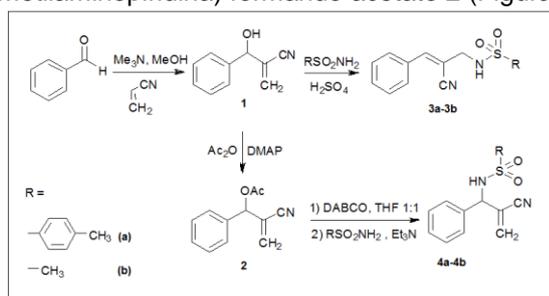


Figura 1. Esquema da rota sintética utilizada

Para a obtenção de **3a** e **3b** realizou-se a reação do aduto **1** com as sulfonamidas primárias correspondentes, em meio ácido, sob refluxo. As alilsulfonamidas **4a** e **4b** foram preparadas a partir do acetato **2**, pela adição de 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO), trietilamina e a sulfonamida adequada. As alilsulfonamidas foram caracterizadas por CCD, temperaturas de fusão (TF), espectroscopias no infravermelho (IV) e de RMN de ¹³C e ¹H e por espectrometria de massas

de alta resolução. Apenas o composto **3b** já está descrito na literatura.¹ Algumas das propriedades dos produtos obtidos, estão apresentados na Tabela 1.

Tabela 1. Temperaturas de fusão e Pico do íon molecular (m/z) das alilsulfonamidas.

| Produto | Aspecto | TF (°C) | EM |
|-----------|---------------|-------------|----------|
| 3a | Sólido branco | 140,1-141,2 | 311,0856 |
| 3b | Sólido branco | 110,6-112,6 | 311,0863 |
| 4a | Sólido branco | 120,4-121,4 | 235,0548 |
| 4b | Óleo incolor | - | 235,0551 |

Os espectros no IV de **3** e **4** apresentam banda em 3290 cm⁻¹ referente a νN-H, e em 2220 cm⁻¹ devido ao grupo ciano. Nos espectros de RMN ¹H dos compostos **4** aparecem 2 dupletos em torno de δ 6, enquanto nos dos isômeros **3** observa-se 1 simpleto em torno de δ 7, confirmando que as novas alilsulfonamidas contêm o grupo C=CH₂ terminal, enquanto aquelas obtidas diretamente do aduto **1** apresentam o grupo HC=C interno.

Através do teste de atividade antifúngica das sulfonamidas a 1,5 mmolL⁻¹ contra *Botrytis cinerea*, pelo método *Poison food*¹ observou-se que apenas **3a** foi ativa.

Conclusões

Foram sintetizadas quatro alilsulfonamidas, sendo três inéditas. Apenas uma delas foi ativa contra *B. cinerea*, indicando que a posição da ligação C=C e a natureza do substituinte na sulfonamida interferem significativamente em sua atividade biológica. Ensaios contra outros microrganismos serão realizados para aprofundamento desses estudos.

Agradecimentos

FAPEMIG, CNPq

¹Tavares, E. C.; Rubinger, M. M.M.; Zacchi, C. H.C.; Silva, S. A.; Oliveira, M. R. L.; Guilardi, S.; Alcântara, A. F. C.; Piló-Veloso, D.; Zambolim, L., J. Molec. Struct., **2014**, *1067*, 43.

²Basavaiah, D.; Veeraghavaiah, G., Chem. Soc. Rev. **2012**, *41*, 68.