

Avaliação da atividade tóxica em *Artemia salina* Leach. de sete adutos aromáticos de Baylis-Hillman

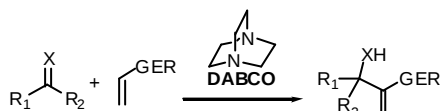
Mário L. A. A. Vasconcellos¹(PQ)*, Claudio G. L. Junior¹(IC), Fábio P. L. Silva¹(IC), Horacimone M. Lopes ¹(IC), Kelly M. Lacerda¹(IC), Tania M. S. Silva²(PQ), Thiago G. da Silva²(IC). mlaav@quimica.ufpb.br

¹Departamento de Química, Universidade Federal da Paraíba, Campus I, João Pessoa, PB, Brasil.² Laboratório de Tecnologia Farmacêutica, Universidade Federal da Paraíba, Campus I, João Pessoa, PB, Brasil.

Palavras Chave: Baylis-Hillman, *Artemia salina*, Toxicidade.

Introdução

A reação de Baylis-Hillman (Esquema) foi descoberta em 1972 e é hoje amplamente utilizada para síntese química¹



Esquema. GRE= grupo eletrôn-retirador, CO₂R, CN, CHO, COR. R₁ e R₂ = H, alquila ou arila.

Nosso grupo vem concentrando esforços na preparação eficiente de adutos de Baylis-Hillman aromáticos (ex. **1-7**, Figura) para suas subseqüentes avaliações como novos quimioterápicos ou para a profilaxia de doenças tropicais endêmicas (ex. Esquistossomose, Leishmaniose e Malária) e também como possíveis anti-neoplásicos. Em relatos recentes, o aduto **1** mostrou ser um composto ativo como antimalarial² e moluscicida³. A avaliação prévia de toxicidade em *Artemia salina* Leach. em substâncias candidatas à novas drogas vem tendo a sua importância reconhecida, uma vez que indica com eficiência atividades biológicas, como por exemplo antifúngicas, anti-microbiana e anti-neoplásica. Esta metodologia é também altamente econômica e de fácil implementação laboratorial. Neste trabalho apresentamos a atividade tóxica dos adutos **1-7**(figura) em *A. salina*.

Resultados e Discussão

Os adutos de BH **1-7** foram preparados e caracterizados como previamente descritos na literatura.^{2,3} A avaliação tóxica em *A. salina* foi realizado em quadruplicata de acordo com a metodologia de McLaugh⁴. A preparação das soluções “estoque” das substâncias **1-7** foram realizadas utilizando DMSO, TWEEN 80 e água do mar. Os micro-crustáceos foram expostos as soluções de 5 concentrações diferentes, por um período de 24h, seguido da contagem dos vivos e dos mortos. Os dados de CL₅₀ estão mostrados na tabela.

Figura. Adutos de BH **1-7**, preparados e avaliados neste trabalho.

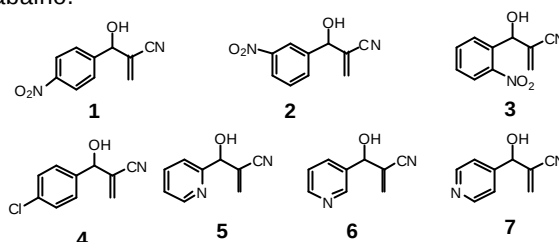


Tabela. Atividades tóxica de **1-7** (µg/mL) em *A. salina*.

aduto	CL ₅₀	aduto	CL ₅₀
1	51.9	5	87.2
2	96.1	6	88.8
3	87.8	7	70.9
4	97.2		

Conclusões

Uma vez que a Organização Mundial de Saúde considera tóxica as substâncias que apresentam valores de CL₅₀ < 1000 µg/mL em *Artemia salina* Leach., nossos resultados, em consonância aos resultados obtidos previamente para **1**, tornam os adutos **1-7** de Baylis-Hillman e análogos, uma nova classe promissora de substâncias para avaliações subseqüentes como quimioterápicos.

Agradecimentos

CNPq, CAPES, FAPESQ

¹Basavaiah, D.; Rao, J.; Satyanarayana, T. *Chem. Rev.* **2003**, 103, 811.

²de Souza, R. O. M. A.; Meireles, B. A.; Sequeira, L. S.; Vasconcellos, M. L. A. A. *Synthesis* **2004**, 1595.

³Vasconcellos, M. L. A. A.; Silva, T. M. S.; Camara, C. A.; Martins, R. M.; Lacerda, K. M.; Lopes, H. M.; Pereira, V. L. P.; de Souza, R. O. M. A.; Crespo, L. T. C.; *Pest. Manage. Sci* **2006**, 62, 000-000 (no prelo).

⁴Barbosa, T. P.; Câmara, C. A.; Silva, T. M. S.; Martins, R. M.; Pinto,

Sociedade Brasileira de Química (SBQ)

A. C.; Vargas, M. D. Bioorg.; Med. Chem. **2005**, *13*, 6464.