

Síntese de 3-(4-bromobenzil)-5-(arilideno)-furan-2(5H)-onas e Avaliação de Seus Efeitos Sobre a Inibição da Reação de Hill

Marcelo Eça Rocha¹ (PG), Luiz Cláudio de Almeida Barbosa^{1*} (PQ), Róbson Ricardo Teixeira^{1,2} (PG); Giuseppe Forlani³ (PQ), Antônio Jacinto Demuner¹ (PQ); Célia Regina Álvares Maltha¹ (PQ)

1 – Universidade Federal de Viçosa; 2 – Universidade Federal de Minas Gerais; 3 – Università degli Studi di Ferrara

*lcab@ufv.br

Palavras Chave: nostoclídeos, lactonas, inibição da Reação de Hill

Introdução

Na busca por herbicidas mais seletivos e menos danosos ao meio ambiente, a utilização de metabólitos secundários é uma interessante estratégia que pode ser empregada. Estes compostos podem ser utilizados diretamente como herbicidas ou como compostos modelos para obtenção de novos herbicidas¹.

Os nostoclídeos (**1**) correspondem a um par de lactonas isoladas a partir de uma alga verde-azul (*Nostoc sp*), que é encontrada em simbiose com um líquen *Peltigera canina*². Estas substâncias são estruturalmente semelhantes à cianobacterina (**2**), um composto que apresenta uma elevada atividade fitotóxica³ (Figura 1).

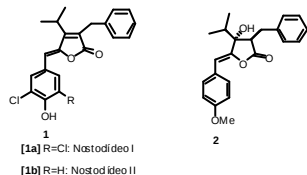


Figura 1. Estrutura dos nostoclídeos e cianobacterina

Em vista desta similaridade estrutural, vislumbrou-se que os nostoclídeos poderiam ser utilizados como modelos ("lead structures") em programas de pesquisa que levem à descoberta de novos herbicidas.

Descrevemos nesse trabalho a síntese de 3-(4-bromobenzil)-5-(arilideno)-furan-2(5H)-onas e a avaliação da atividade destes compostos como inibidores da Reação de Hill.

Resultados e Discussão

As lactonas (**4a**)-(4h) foram preparadas via reação de condensação entre (**3**) e aldeídos aromáticos³. A síntese do composto (**3**) é mostrada na Figura 2.

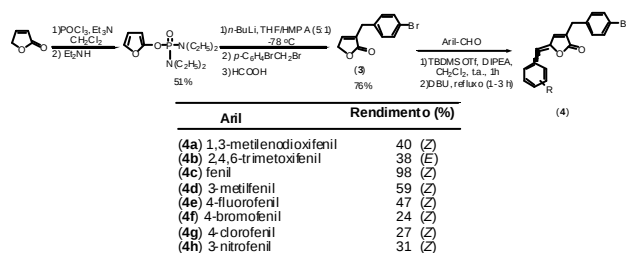


Figura 2 – Metodologia sintética utilizada para preparação dos compostos (**4a**)-(4h).

Os compostos foram completamente caracterizados (IV, RMN e Espectrometria de Massas). A estereoquímica (Z) da dupla ligação exocíclica foi confirmada em todas as lactonas, exceto no caso de (**4b**) que apresentou estereoquímica (E).

As lactonas sintetizadas foram submetidas a testes para avaliação da inibição da síntese de ATP (Reação de Hill) em cloroplastos isolados de espinafre (Tabela 1). Os compostos (**4a**) e (**4g**) não mostraram atividade inibitória significativa ($ID_{50} > 1000 \mu M$). A maior atividade inibitória foi observada com a lactona (**4h**) ($ID_{50} = 13,3 \pm 1,1 \mu M$).

Tabela 1 – Resultados da avaliação da atividade inibitória das lactonas **4a-4h** sobre a reação de Hill

Compostos	ID ₅₀ (μM)
4a	>1000
4b	148 ± 74
4c	25,9 ± 7,5
4d	181 ± 150
4e	56,2 ± 23,0
4f	86,7 ± 50
4g	>1000
4h	13,3 ± 1,1

Conclusões

Os rendimentos obtidos nas reações para obtenção das lactonas **4a-4h** (31-98%) mostraram a viabilidade da metodologia empregada para a síntese de análogos aos nostoclídeos.

Os resultados obtidos mostraram que o padrão de substituição do anel benzilidênico tem forte influência na atividade dessa classe de substâncias na Reação de Hill.

Agradecimentos

CNPq, FAPEMIG, CAPES

¹ Duke, S. O.; Dayan, F. E.; Romagni, J. G. e Rimando, A. M. J. C. *Weed Research* **2000**, 40, 99.

² Xuemin, Y.; Yuzuru, S.; Steiner, J.R.; Clardy, J. *Tetrahedron* **1993**, *34*, 761.

³ Gleason, F.K.; Porwoll, J. *J. Org. Chem.* **1986**, *51*, 1615.

⁴ Boukouvalas, J.; Maltais, F.; Lachance, N. *Tetrahedron Letters* **1994**, *35*, 1994.