

Estudo comparativo de atividade larvídica frente ao mosquito *Aedes aegypti* com estudo cinético da atividade Anticolinesterásica de Compostos Organofosforados da Classe dos Fosforamidatos

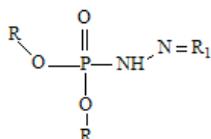
Aline Figueira Lira¹(PG)*, Vinicius Tomaz Gonçalves¹(PG), João Batista Neves da Costa¹(PQ) e Victor M. Rumjanek¹(PQ) e-mail: alinefigueiralira@hotmail.com

1 Departamento de Química – Universidade Federal Rural do Rio de Janeiro BR 465 km 7 Seropédica 23890-000 RJ

Palavras Chave: organofosforados, cinética enzimática, atividade biológica, *Aedes Aegypti*

Introdução

O controle de insetos que atuam como pragas é feito, em grande parte, com o uso de compostos organofosforados (OFs). Os OFs atuam inibindo a enzima acetilcolinaesterase (AChE), responsável pela hidrólise do neurotransmissor acetilcolina (ACh) e é desta maneira que agem como pesticidas em geral¹. Apresentam baixa ação residual, com pouca estabilidade no meio ambiente e acumulação limitada em organismos vivos, sendo que 80 a 90% dos compostos são eliminados após 48 h do contato. Novas estruturas são necessárias devido ao processo de desenvolvimento de resistência às estruturas conhecidas por muitas espécies de insetos.



- (1) R=Isopropil e R₁=C(CH₃)₂
- (2) R=Isopropil e R₁=cicloexilideno
- (3) R=Butil e R₁= C(CH₃)₂
- (4) R=Butil e R₁=C(CH₃)CH₂ CH₃
- (5) R=Butil e R₁=C(CH₃)CH₂ COCH₃

A determinação dos valores de IC₅₀ e o estudo cinético fez uso do método de Ellman modificado em conjunto com uma leitora de microplacas de 96 poços³. O pesticida comercial acefato, da classe dos fosforamidatos e a fisostigmina foram empregados como controles.

A atividade larvídica frente ao mosquito *Aedes Aegypti* foi realizada em triplicata nas concentrações de 1,25mM, 1,062mM, 0,812mM, 0,567mM e 0,312mM. As amostras foram dissolvidas em 0,3 mL de metanol, completando-se o volume com água e foram utilizadas 15 larvas do mosquito no 3º estágio até a obtenção do volume final de 20 mL. Após 24h e 48h as larvas mortas foram contadas.

Resultados e Discussão

Apenas o composto **4** apresentou uma inibição significativa apresentando uma DL₅₀=0,862mM. Os compostos **1 e 3** apresentaram os menores valores de IC₅₀ e não apresentaram atividade larvídica, mesmo na concentração de XII Encontro Regional da Sociedade Brasileira de Química

1,25mM após 48 horas de contato com a larva, já os compostos **2 e 5** só apresentaram atividade larvídica respectivamente de 53,33% e 20% após 48 horas na concentração de 1,25mM.

A **tabela 1** correlaciona a natureza de inibição e o valor de CI₅₀ com o valor de K_i.

Tabela 1: Tabela de correlação da natureza de inibição e o valor de IC₅₀ com o valor de K_i

Composto	Natureza de inibição	K _i (mM)	IC ₅₀ (mM)
1	incompetitiva	0,227	0,5031
2	não-competitiva	0,394	0,394
3	não-competitiva	0,666	0,666
4	Irreversível	-	0,095
5	incompetitiva	0,108	0,024

Conclusões

Uma vez que os compostos mais ativos são **4 e 5**, nota-se que estes dois possuem em comum o grupo butila e se diferenciam pela presença de uma carbonila de cetona no composto **5**, que é mais ativo que o composto **4**. Assim, pode-se concluir que esses dois grupamentos são importantes para a atividade inibitória. O composto **4** é o único para o qual pode-se obter o valor de DL₅₀, assim pode-se concluir que o inibidor irreversível tem maior atividade pesticida quando comparado com os inibidores reversíveis, devido à maior interação entre enzima e substrato.

Agradecimentos

Ao CNPq e CAPES por bolsas e auxílios.

1Pardio.V.T., Ibarra. N. & Rodriguez. M.A., *J. Agric. Food Chem.*, V.49, pp.6057-6062, 2001.

3Rhee.I.K., de Ment.M., Ingkaninan.K. & Verpoorte. R., *J. Chromatography A*, V. 915, pp.217-223, 2001.

4 Lineweaver.H. & Burk.D., *J. Amer. Chem. Soc.* V.56, pp.658-666, 1934.