

Síntese de derivados da 2-benzilideno-1- α -tetralona e avaliação preliminar da atividade antioxidante

Gustavo Silva Queiroz (PG)*, Louise Domeneghini Chiaradia (PG), Rosendo Augusto Yunes (PQ), Ricardo José Nunes (PQ), Inês Maria Costa Brighente (PQ). *queiroz.gs@hotmail.com

Departamento de Química - Universidade Federal de Santa Catarina – UFSC, 88040-900, Florianópolis-SC.

Palavras Chave: α -tetralona, 2-benzilideno-1- α -tetralona, antioxidantes

Introdução

Chalconas são flavonóides de cadeia aberta, em que dois anéis aromáticos são unidos por três carbonos em um sistema α,β -insaturado em função da carbonila, ou seja, 1,3-difenil-2-propen-1-ona.¹ Chalconas e derivados têm mostrado uma grande variedade de atividades biológicas, como anti-inflamatória, antitumoral e também em doenças negligenciadas, dependendo da substituição dos anéis aromáticos.^{2,3} Derivados 2-benzilideno-1- α -tetralona, que possuem em sua estrutura o esqueleto C6-C3-C6 das chalconas, foram relatados por apresentarem atividade anti-fúngica.⁴ Neste sentido, o objetivo deste trabalho foi sintetizar e caracterizar uma série de compostos derivados da α -tetralona para avaliar suas atividades biológicas.

Resultados e Discussão

Síntese: Em um balão de 50mL e uma boca, adicionou-se α -tetralona (1,0 mmol), benzaldeído (1,0 mmol) e etanol (10 mL). Os reagentes foram dissolvidos sob agitação magnética e, em seguida, dez gotas de KOH 50% (m/v) foram lentamente adicionadas. A reação foi deixada sob agitação magnética à temperatura ambiente. Após 24 horas, adicionou-se água destilada e acidificou-se com ácido clorídrico 10% (v/v), o que aumentou a precipitação dos compostos. A mistura reacional foi deixada na geladeira por algumas horas para aumentar a precipitação e, em seguida, filtrada em funil de Büchner. A pureza dos compostos foi verificada por CCD e, quando necessário, os produtos obtidos foram recristalizados em etanol ou diclorometano/hexano (Figura 1).

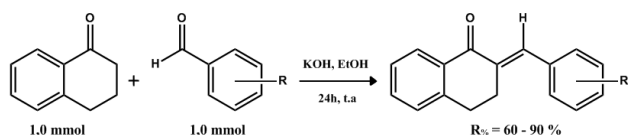


Figura 1. Síntese das 2-benzilideno-1- α -tetralonas.

Os compostos foram obtidos com rendimentos entre 60% e 90%, e submetidos às análises de ponto de fusão, espectroscopia de infravermelho e RMN de ^1H e ^{13}C (Tabela 1).

Os espectros de RMN de ^1H dos compostos apresentaram um sinal em $\sim 7,78$ ppm, característico do hidrogênio olefínico, e os espectros de infravermelho, uma banda em ~ 1666 cm^{-1} , característico de estiramentos de ligações C=C, evidenciando a formação do produto da reação.

Atividade biológica: Avaliou-se o poder redutor dos compostos sintetizados, que é baseado na redução do ferricianeto de potássio a ferrocianeto de potássio, medindo-se a absorbância em 720nm.⁵ Do composto com maior atividade, foi avaliada a ação sequestradora de radicais livres utilizando DPPH (1,1-difenil-2-picril-hidrazil); o resultado foi expresso como IC_{50} , que é a concentração de amostra necessária para reduzir em 50% a absorbância do DPPH em 517nm⁶ (Tabela 1).

Em geral, os compostos apresentaram baixas atividades antioxidantes, com exceção do composto **8** que apresentou uma atividade de 422,66 mg ác. ascórbico/g amostra, porém não foi considerado ativo como sequestrante de radicais livres.

Tabela 1. Rendimentos, p.f. e atividade antioxidante das 2-benzilideno-1- α -tetralonas.

| | R | Rend.(%) | p.f.(°C) | Poder Redutor ^(a) | IC_{50} ^(b) |
|----|----------------------|----------|------------|------------------------------|---------------------------------|
| 1 | 4-Cl | 60,8 | 134,5-5,0 | 13,33 \pm 0,63 | |
| 2 | 4-NO ₂ | 77,6 | 183,0-3,5 | 27,46 \pm 0,82 | |
| 3 | 4-BuO | 64,5 | 97,0-8,5 | 7,43 \pm 0,17 | |
| 4 | 3-Br | 80,1 | 101,9-4,6 | 9,76 \pm 0,24 | |
| 5 | 4-MeO | 64,2 | 98,5-9,7 | 26,36 \pm 0,71 | |
| 6 | H | 74,9 | 102-2,6 | 6,61 \pm 0,57 | |
| 7 | 4-Br | 92,8 | 151,2-3,6 | 23,69 \pm 1,02 | |
| 8 | 4-N(Me) ₂ | 61,5 | 144,1-7,0 | 422,66 \pm 1,63 | >200 |
| 9 | 4-F | 80,7 | 109,7-10,8 | 0,00 \pm 0,87 | |
| 10 | 3-NO ₂ | 79,3 | 137,5-8,4 | - | |
| 11 | 3-Cl | 71,4 | 108,0-8,8 | 5,24 \pm 0,16 | |

^(a) mg ác. ascórbico/g amostra; ^(b) Conc. amostra em ppm.

Conclusões

Foram obtidas com bons rendimentos (60-90%), e caracterizadas, onze 2-benzilideno-1- α -tetralonas. Os compostos foram avaliados quanto a sua atividade antioxidante, onde o composto **8** apresentou a melhor atividade redutora, porém não foi considerado bom sequestrante de radicais livres.

Agradecimentos

CAPES, CNPq, UFSC.

- Giraldi, M, Hanazaki, N. *Brasil. Acta bot. bras.*, 24(2): 395-406, 2010.
- Dimmock, J. R.; Elias, D. W.; Beazely, M. A.; Kandepu, N. M. *Current Medicinal Chemistry*, 6(12), 1125-1149, 1999.
- Ni, L.; Meng, C. Q.; Sikorski, J. *Expert Opinion Ther Patents*, 14(12), 1669-1691, 2004.
- Nakib, T. Al. Bezjaka, V. Meegan, M.J. Chandy, R. *Eur. J. Med. Chem.*, 25(5), 455-462, 1990.
- Waterman, P. G. & Mole, S., *Blackwell Scientific Publications*, 238, 1994.
- Cavin, A.; Hostettmann, K.; Dyatmyko, W.; Potterat, O. *Planta Medica*, 64, 393-396, 1998.