

Avaliação da atividade antibacteriana de chalconas derivadas do lapachol frente a bactérias hospitalares

Carla C. Diederichs¹ (IC), Louise F. de Matos¹ (IC),IVALDO Itabaiana Júnior¹ (PG), Thelma de B. Machado² (PQ), Leandro M. Soter³ (PQ), Rodrigo O. M. A. de Souza¹ (PQ) e Ivana C. R. Leal⁴ (PQ)

¹ Grupo de Biotransformação e Síntese Orgânica, Instituto de Química – Universidade Federal do Rio de Janeiro, CEP:22941-909;² Faculdade de Farmácia-Universidade Federal Fluminense; ³Instituto Federal de Educação, Ciência e Tecnologia do Rio de Janeiro (IFRJ); ⁴ Faculdade de Farmácia, Campus Macaé – Universidade Federal do Rio de Janeiro (FF – UFRJ), CEP:27930-560 *ivanafarma@yahoo.com.br

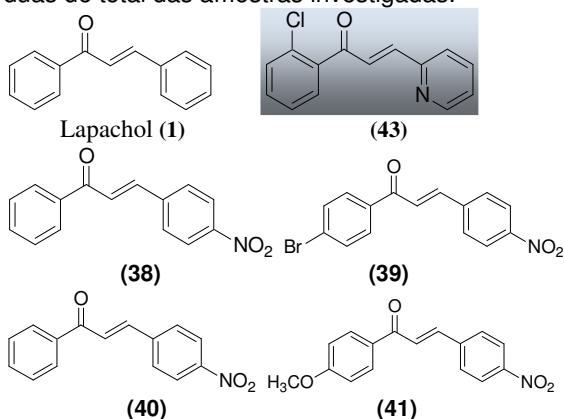
Palavras Chave: Atividade antibacteriana, chalconas, lapachol, *Staphylococcus aureus*.

Introdução

Chalconas são 1,3-difenil-2-propene-1-onas, em que dois anéis aromáticos estão ligados por uma carbonila α,β -insaturada. Possuem ligações duplas conjugadas e um sistema de elétron completamente deslocalizado em ambos os anéis benzênicos. Esta classe química tem mostrado uma variedade de atividades biológicas, incluindo: inseticida, antimicrobiana, antiviral e antituberculose. Em um estudo recente¹ os autores fizeram um *screening* com uma série de chalconas substituídas (58) frente a microorganismos humanos patogênicos. Observou-se que a presença dos substituintes -OH, -Cl, e -NH₂ e, em particular, os anéis furano, resultaram em aumentada atividade antimicrobiana. Este trabalho tem como objetivo rastrear a atividade antibacteriana de uma série de 43 chalconas com diferentes substituintes, dentre eles: -Cl, -Br, -OCH₂ e -NO₂ frente a amostras padrão ATCC e amostras clínicas isoladas de sítios de infecção hospitalar.

Resultados e Discussão

Resultados preliminares frente a amostras padrão ATCC de diferentes espécies do gênero *Staphylococcus* sp. (13) e demais gêneros (11) (Tabela 1), conferiram às chalconas **1** (lapachol) e **43**, com um anel piridínico, os melhores potenciais de inibição a 512 $\mu\text{g}\cdot\text{mL}^{-1}$. Outras chalconas, como a **38**, **39**, **40** e **41**, com grupo nitro, também apresentaram atividade frente a, pelo ou menos, duas do total das amostras investigadas.



33ª Reunião Anual da Sociedade Brasileira de Química

Ensaios posteriores com amostras clínicas de *S. aureus* para determinação da concentração mínima inibitória (CMI) mostraram que a 32 $\mu\text{g}/\text{mL}$ todas as amostras clínicas multirresistentes (12) bem como as sensíveis (6) de *S. aureus* foram inibidas pelo lapachol. O derivado **43** apresentou CMI de 256 $\mu\text{g}\cdot\text{mL}^{-1}$ frente a 30% das amostras clínicas de *S. aureus* e CMI de 512 $\mu\text{g}\cdot\text{mL}^{-1}$ frente as espécies *S. haemolyticus*, *S. epidermidis* e *S. hominis*.

Tabela 1. Descrição das espécies bacterianas avaliadas.

Espécie bacteriana	Fonte	Espécie bacteriana	Fonte
<i>S. haemolyticus</i>	ATCC 29970	<i>Enterococcus faecalis</i>	ATCC 29212
<i>S. haemolyticus</i>	JCSC 1435	<i>E. faecalis</i>	ATCC 51299
<i>S. aureus</i>	ATCC 25923	Enterobacter	HON 334
<i>S. aureus</i>	ATCC 33591	<i>Escherichia coli</i>	ATCC 11229
<i>S. aureus</i>	ATCC 29213	<i>E. coli</i>	ATCC 25922
<i>S. cohnii</i>	ATCC 29974	<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	ATCC 154421
<i>S. warneri</i>	ATCC 10209	<i>Acinetobacter spp</i>	OXA 51
<i>S. lugdunensis</i>	DSMZ 24804	<i>Acinetobacter spp</i>	A29009
<i>S. epidermidis</i>	ATCC 12228	<i>Acinetobacter baumannii</i>	A8695
<i>S. simulans</i>	ATCC 27851	<i>Klebsiella pneumoniae</i>	ATCC 4352
<i>S. schleiferi</i>	DSM 4807	<i>K. pneumoniae</i>	ATCC 700603
<i>S. hominis</i>	ATCC 27844		
<i>S. capitis</i>	ATCC 27840		

ATCC American Type Culture Collection.

Conclusões

Esta é a primeira investigação *in vitro* em busca da atividade antibacteriana de uma série de chalconas frente a bactérias hospitalares. Chalconas já são reconhecidas por exibirem esta atividade^{2,3}, entretanto, nenhuma descrição havia sido relatada frente a amostras clínicas de *S. aureus* isoladas de sítios de infecção. Nossos resultados, considerando especialmente a atividade do derivado **43**, é de grande relevância, o que pode ser explicado pela presença do anel piridínico, que o difere dos demais derivados. Diante dos resultados promissores para **38**, **39**, **40** e **41**, sugere-se que o grupo nitro é importante para a atividade observada.

Agradecimentos

À CAPES, FINEP e CNPq pelo apoio financeiro.

¹Karaman *et al. Chem. Biodiv.* **2010**, 7, 400.

²Ansari *et al. Chem. Biodiv.* **2005**, 2, 1656.

³Sivakumar *et al. Chem. Biol. Drug Des.* **2009**, 74, 68.