

Síntese de Indol-naftoquinonas com Potencial Atividade Bactericida

Ingrid C. Chipoline¹ (IC), Vitor F. Ferreira¹ (PQ), Fernando de C. da Silva¹ (PQ), Alessandro K. Jordão^{2*} (PQ)

* akjordao@gmail.com

¹ Universidade Federal Fluminense, Departamento de Química Orgânica, Programa de Pós-Graduação em Química, Outeiro de São João Batista, s/n, Niterói 24020-141, RJ, Brazil

² Unidade Universitária de Farmácia, Fundação Centro Universitário Estadual da Zona Oeste, 23070-200, Rio de Janeiro, RJ, Brazil

Palavras Chave: naftoquinonas, indol-naftoquinonas, amino-naftoquinonas.

Abstract

Synthesis of Indole-naphthoquinones with Potential Bactericidal Activity. In this work we present an efficiently synthesis of indole-naphthoquinones with potential biologic activity.

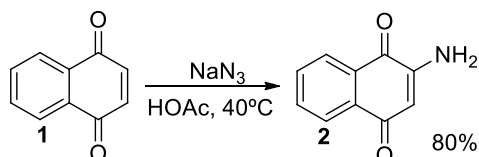
Introdução

Naftoquinonas são importantes substâncias naturais que são comumente encontrados em todas as diferentes famílias de plantas, fungos e certos animais. Esta classe de compostos tem sido estudada extensivamente para as suas possíveis atividades antitumoral, moluscicida, antiparasitários, leishmanicida, anti-inflamatório, antifúngica, antimicrobiana e tripanosomicidas.¹

A inserção de átomos como nitrogênio no radical quinona pode potencializar suas propriedades redox cujas características podem estar sintonizadas na indução do estresse oxidativo nas células, causando a morte das mesmas. Tais aminonaftoquinonas são encontradas em importantes compostos bioativos, tais como anti-tumor, antimalárica e antimicrobianos.²

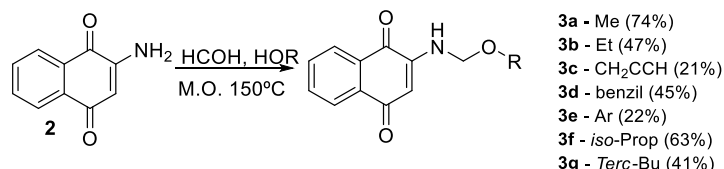
Resultados e Discussão

Inicialmente procedeu-se com a síntese da 2-amino-1,4-naftoquinona (**2**) a partir do tratamento da 1,4-naftoquinona (**1**) com azida de sódio em meio de ácido acético. (Esquema 1).



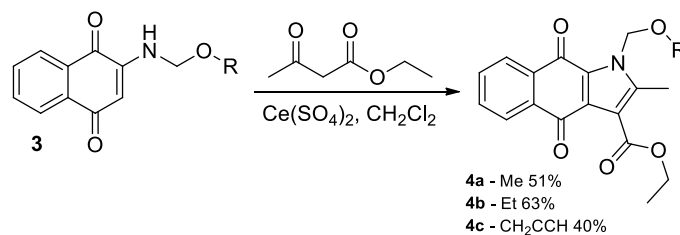
Esquema 1: Síntese do composto 2

Em seguida, realizou-se a dos N,O-acetais **3a-g** conforme mostrado no Esquema 2.



Esquema 2: Síntese dos N,O-acetais **3a-g**

Por fim, a reação de ciclização dos N,O-acetais **3a-g** acetoacetato de etila catalisada por sulfato de cério IV produziu as indol-naftoquinonas **4a-c** em rendimentos que variaram de 40-63% (Esquema 3).



Esquema 3: Síntese dos compostos **4**

A síntese com os demais substituintes estão sendo realizadas, para formar uma nova família e enviá-la para teste biológico.

Conclusões

Neste trabalho mostramos um síntese fácil e eficiente de 1-(alcoximetil)-2-metil-4,9-dioxo-4,9-diidro-1H-benzo[*f*]indole-3-carboxilato de etila do tipo **4** e de uma família de 2-((alcoximetil)amino)naftaleno-1,4-diona do tipo **3a-g** com potencial atividade biológica.

Agradecimentos

CNPq, FAPERJ-PRONEX, FINEP e CAPES

¹ C.F.J. Franco, A.K. Jordão, V.F. Ferreira, A.C. Pinto, M.C.B.V. de Souza, J.A.L.C. Resende, A.C. Cunha, *J. Braz. Chem. Soc.*, **2011**, 22, 187

²A. K. Jordão, J. Novais, B. Leal, A. C. Escobar, H. M. S. Junior, H. C. Castro, V. F. Ferreira, *EJ Med Chem*, **2013**, 63, 196