

OBTENÇÃO DE LACTONA, OXIMA E LACTAMA DE OXOFRIEDELANOS COM POTENCIAL ATIVIDADE BIOLÓGICA

Mariana Guerra de Aguiar
Lucienir Panis Duarte e Grasiely Faria de Sousa

Os produtos naturais têm sido muito úteis para a descoberta de novos compostos com atividade biológica. Vários metabólitos e derivados da classe dos triterpenos foram reportados na literatura com diferentes atividades biológicas.¹

Nesse trabalho foram feitas modificações estruturais em triterpenos pentacíclicos de esqueleto friedelânico para a obtenção de lactona, oxima e lactama correspondente a cada substrato. Após a síntese, purificação e caracterização, os triterpenos semissintéticos foram submetidos a testes de atividade antifúngica e antibacteriana.

Os triterpenos empregados nas modificações estruturais foram 3-oxofriedelano (**1**) e 3,16-dioxofriedelano (**2**). Na Tabela 1 tem-se os derivados obtidos bem como seus respectivos rendimentos. As lactonas e as oximas foram obtidas com excelentes rendimentos, já o rendimento da lactama foi baixo e a reação precisa ser otimizada. Os produtos obtidos foram caracterizados através dos seus espectros no infravermelho e de ressonância magnética nuclear 1D (¹H, ¹³C, DEPT 135) e 2D (HSQC, HMBC, COSY e NOESY). Os produtos inéditos tiveram todos os deslocamentos químicos de hidrogênio e carbono atribuídos.

Tabela 1: Compostos semissintéticos obtidos.

Código composto	Identificação	Rend. (%)
P1a	Friedelina-3-oxima	79
P1b	3,4-lactona-16-oxofriedelano	74
P2a	Friedelina-3,4-lactona	87
P2b	3-oxima-16-oxofriedelano	92
P3a	Friedelina-3,4-lactama	7
P3b	3,4-lactama-16-oxofriedelano	5

Os materiais de partidas bem como os produtos foram submetidos a teste frente aos fungos: *Candida albicans*, *Cryptococcus gatti*, *Cryptococcus neoformans* e *Arpergillus fulmigatus* no entanto, não apresentaram atividade, nas concentrações utilizadas.

No teste antibacteriano foram utilizadas culturas da bactéria Gram-negativa *Escherichia coli* e da bactéria Gram-positiva *Staphylococcus aureus*. Apenas as amostras **2** (3,16-dioxofriedelano) e **P1b** apresentaram atividade frente às bactérias testadas. O composto **2** apresentou alta inibição na concentração de 500 µg/L, (92,5% ± 1,9%) e (66,5% ± 11,5%), frente às bactérias *E. coli* e *S. aureus*, respectivamente. **P1b** também apresentou alta inibição frente à bactéria *E. coli* na concentração de 500 µg/L, (96,3% ± 12,6%). Frente à bactéria *S. aureus*, **P1b** apresentou inibição de (71,4% ± 7,0%) na concentração de 500 µg/L. Observando as porcentagens de inibição obtidas, pode-se inferir que a modificação química feita para obter a lactona (**P1b**) a partir do composto **2** levou à obtenção de um composto mais ativo frente às duas bactérias avaliadas.

Neste trabalho foram obtidos seis derivados de triterpenos friedelânicos. Três deles, obtidos a partir do triterpeno **2**, são inéditos na literatura. Foi também avaliada a atividade biológica de alguns derivados semissintéticos obtidos, verificando-se resultado promissor para o composto 3,4-lactona-16-oxofriedelano.

Referências

- SHENG, H.; SUN, H. *Natural Product Reports*, 28, 543-593, 2011.