

Síntese e Avaliação da Atividade Antimicrobiana de Análogos da Primina 5 e 6 Alquil-Substituídos

Dalci J. BRONDANI *¹, Álvaro A. Silva FILHO ³, Ana C. Lima LEITE ¹,
Célio R. Melo do NASCIMENTO ¹, Pedro J. Rolin NETO ¹ & Lothar W. BIEBER ²

¹ *Depto. de Ciências Farmacêuticas - Laboratório de Planejamento, Avaliação e Síntese de Fármacos-LabSINFA,*

² *Depto. de Química Fundamental- Laboratório de Química Orgânica*

³ *Depto Antibiótico Universidade Federal de Pernambuco, Recife, PE, Brazil. CEP: 50740-520,*

RESUMO. Foram obtidos duas séries de compostos análogos da primina, 6- e 5-alkil-2-metoxibenzoquinonas. As quinonas 6-alkil-substituídas foram obtidas a partir do guaiacol em três etapas: proteção, metalação seguido de alquilação, hidrólise e subsequente oxidação catalisada por salcomina. Os isômeros 5-alkil substituídos foram obtidos a partir da alquilação seletiva da 2-metoxi-1,4-benzoquinona com trialkilboranos e subsequente oxidação. Os produtos foram testados quanto a sua atividade antimicrobiana para a determinação da CIM contra 21 germes representativos. As quinonas 6-alkil-substituídas apresentaram uma maior inibição que as 5-alkilsubstituídas. Em geral, os compostos foram mais ativos frente aos microorganismos gram-positivos que aos demais tipos.

SUMMARY. "Synthesis and Evaluation of Antimicrobial Activity of Primin Analogues 5- and 6-alkylsubstituted". Both 6- and 5-alkyl-2-methoxy-1,4-benzoquinone derivatives, analogues of primin, were obtained. To obtain the 6-alkyl substituted compound, tetrahydropyranylated guaiacol was treated with n-butyllithium followed by alkylation with alkyl bromides. Hydrolysis to the corresponding 6-substituted 2-methoxyphenols and subsequent oxidation catalyzed by salcomine afforded high yields of the quinones. 5-alkyl-2-methoxy-1,4-benzoquinones were obtained by selective alkylation in position 5 and oxidative work up of 2-methoxy-1,4-benzoquinone with trialkylboranes. All compounds were tested in order to evaluate the antimicrobial activity. In general, the 6-alkyl derivatives revealed to be more active than the 5-alkyl series. Some of them showed interesting antimicrobial activity selectively against gram-positive bacteria.

PALAVRAS CHAVE: Atividade antimicrobiana, primina, quinonas.

KEY WORDS: Antimicrobial activity, primin, quinones.

* Autor a quem a correspondência deverá ser enviada. E-mail: dalci@ufpe.br