

Evaluación antibacteriana de derivados nitrogenados fluorosustituídos de lawsona por química verde

Iliana Rodríguez^a, Lluvia López^{a*}, Aidé Sáenz^a, Elisa Leyva^b

^aFacultad de Ciencias Químicas, Universidad Autónoma de Coahuila, Blvd. Venustiano Carranza e Ing. J. Cárdenas, 25280 Saltillo, Coahuila, México.

^bFacultad de Ciencias Químicas, Universidad Autónoma de San Luis Potosí. Manuel Nava No. 6, 78210 San Luis Potosí, S.L.P. México.

*lluviaperez@uadec.edu.mx.

Palabras clave: lawsona, reacción de Mannich, ultrasonido, actividad antibacteriana.

Introducción

Las naftoquinonas son pigmentos naturales que se encuentran distribuidas en la naturaleza en una amplia variedad de organismos mayoritariamente en plantas superiores, las cuales presentan propiedades farmacológicas muy significativas debido a sus propiedades redox¹. La 2-hidroxi-1,4-naftoquinona o lawsona es un pigmento color naranja obtenido de las hojas y tallos de la henna (*Lawsonia inermis*)². Se ha demostrado que la incorporación de grupos amino a las naftoquinonas incrementa su potencial como agentes antibacterianos, antifúngicos, antivirales, entre muchos otros³. En el presente trabajo se describe la síntesis de una serie de derivados nitrogenados de 2-hidroxi-1,4-naftoquinona con aminas fluoradas por metodología verde, así como su evaluación antibacteriana.

Parte experimental

Se realizó la síntesis de nuevos compuestos mediante la reacción de Mannich utilizando 2-hidroxi-1,4-naftoquinona (2.5 mmol), benzaldehído (3 mmol), diversas anilinas fluoradas (2.75 mmol) y etanol como solvente. La reacción fue monitoreada por cromatografía en capa fina (TLC). El método de activación empleado fue la Síntesis Asistida por Ultrasonido (SAU).

La evaluación del efecto antibacteriano se realizó por el método de microdilución en placa utilizando concentraciones desde 1000 hasta 1.95 ppm. Los compuestos se evaluaron frente a *Escherichia coli* (ATCC 11229), *Salmonella choleraesuis* (ATCC 1070), *Pseudomonas aeruginosa* (ATCC 15442) y *Staphylococcus aureus* (ATCC 6538).

Resultados y Discusión

Se sintetizaron cuatro derivados de 2-hidroxi-1,4-naftoquinona nombrados como NQA [2-hidroxi-3-[fenil(fenilamino)metil]naftalen-1,4-diona], NQF2 [[(2-fluorofenil)amino](fenil)metil]-3-hidroxinaftalen-1,4-diona], NQF2,5 [2-[(2,5-difluorofenil)amino](fenil)metil]-3-hidroxinaftalen-1,4-diona] y NQF2-6 [2-hidroxi-3-[(pentafluorofenil)amino](fenil)metil]naftalen-1,4-diona], obteniéndose rendimientos superiores a los reportados en la literatura⁴ (88%, 92%, 87% y 21% respectivamente) en tiempos más cortos de reacción.

Todos los compuestos mostraron tener actividad antibacteriana contra las bacterias evaluadas (Figura 1), observándose los mejores resultados en todos los casos a una concentración de 1000 ppm. El porcentaje de inhibición

conseguido fue superior al 49% en todas las bacterias, destacándose un 100% de inhibición de *Escherichia coli* con el compuesto que fluoro sustituye completamente a la amina primaria (NQF2-6).

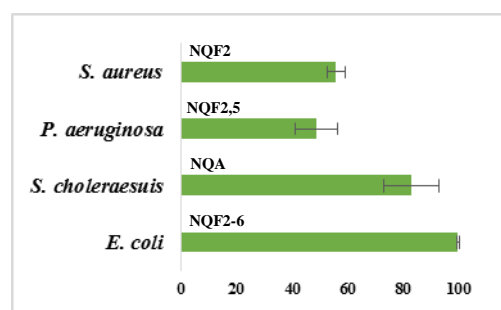


Figura 1. Porcentaje de inhibición de compuestos sintetizados contra bacterias evaluadas.

Conclusiones

Se sintetizaron cuatro derivados de lawsona utilizando la Síntesis Asistida por Ultrasonido como medio de activación, demostrando ser este un buen método ya que se obtuvieron rendimientos de alrededor del 80% en tiempos cortos de reacción. La evaluación antibacteriana detalla que en general, las bacterias Gram negativas presentan una mayor susceptibilidad a los compuestos sintetizados, siendo *Escherichia coli* la bacteria más susceptible (100% de inhibición) a dichos compuestos.

Agradecimientos

Este trabajo fue patrocinado por CONACyT 167668 CB-2011.

Referencias

- Cantú R.; Palomo L.; Nery S.; López LI.; Barajas L. *Biol.* 2012, 14, 48-56.
- López LI.; Leyva E.; García R. *Rev. Mex. C. Farm.* 2011, 42, 6-17.
- López LI. I.; Nery S. D.; Silva S. Y.; Sáenz A. *Vitae.* 2014, 21, 248-258.
- Neves A.; Barbosa C.; Greco S.; Vargas M.; Visentin L.; Pinheiro C.; Mangrich A.; Barbosa J.; Costa G. *J. Braz. Chem. Soc.* 2009, 20, 712-727.