

Síntese, Avaliação da Atividade Citotóxica e Toxicidade Aguda de Análogos da Primina 3 e 6 Alquil-Substituídas

Dalci J. BRONDANI ^{1*}, Ana Cristina L. LEITE ¹, Silene C. NASCIMENTO ²,
Rosália M.O.C. LIMA ² & Lothar W. BIEBER ³

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

² Depto de Antibióticos,

³ Depto. de Química Fundamental- Laboratório de Produtos Naturais,
Universidade Federal de Pernambuco, Recife, PE, Brazil.

RESUMO. Foram obtidos análogos estruturais da primina via alquilação regioseletiva do composto 2-metoxihidroquinona. Compostos 3 e 6-alkil-2-metoxibenzoquinonas foram obtidos e submetidos a testes pré-clínicos com culturas de células. Testes *in vivo* para verificação da DL₅₀ também foram realizados. Entre os compostos testados, o composto 6-metil-2-metoxi-1,4-benzoquinona apresentou maior atividade frente as células KB, DI₅₀=0,27 µg/ml. O teste de toxicidade aguda revelou que os novos compostos são menos tóxicos que o protótipo, a primina, uma vez que a DL₅₀ ficou entre 80-50 mg/Kg.

SUMMARY. "Synthesis, Cytotoxicity Activity and Acute Toxicity Evaluation of Primin Analogues 3 and 6 Alkyl-Substituted". 3- and 6-alkyl-2-methoxy-1,4-benzoquinone derivatives primin analogues, were obtained by regioselective alkylation of 2-methoxyhydroquinone compounds. Tests were performed to evaluate the cytotoxicity activity with continuous chain KB cells (epidermoide carcinoma of the floor of the mouth). In this series 6-methyl-2-methoxy-1,4-benzoquinone was the most active that showed the highest inhibition on KB cells (DI₅₀ = 0.27 µg/ml). All tested compounds were less toxic that primin (LD₅₀ = 14 mg/Kg) precursory, *in vivo* tests of new compounds revealed a LD₅₀ between 80-50 mg/Kg.

PALAVRAS CHAVE: Citotoxicidade, Primina, Quinonas, Toxidade aguda.

KEY WORDS: Acute toxicity, Cytotoxicity, Primin, Quinones.

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