

## CHALCONAS SINTETICAS CON ACCIÓN INSECTICIDA SOBRE *SPODOPTERA FRUGIPERDA*

José Ruiz Hidalgo<sup>a</sup>, Melina Santillán<sup>a</sup>, Alicia Bardón<sup>a,b</sup>, Eduardo Alberto Parellada<sup>a</sup>, K L Ameta<sup>c</sup>, y Adriana Neske<sup>a</sup>

<sup>a</sup>Instituto de Química Orgánica, <sup>b</sup>INQUINOA-CONICET, Facultad de Bioquímica, Química y Farmacia, Universidad Nacional de Tucumán, Ayacucho 471, (4000) Tucumán, Argentina, <sup>c</sup>Department of Chemistry, Mody University of Science and Technology, Lakshmanagarh-332311, Rajasthan, India.

E-mail: [aneske@fbqf.unt.edu.ar](mailto:aneske@fbqf.unt.edu.ar),

### INTRODUCCION

Las chalconas han estado bajo investigación durante mucho tiempo debido a su importancia farmacológica [1]. Poseen un amplio espectro de actividades biológicas [2]. Ofrecen una oportunidad sin precedentes para los químicos sintéticos para diseñar diferentes heterociclos bioactivos debido a la presencia de  $\alpha,\beta$ -carbonilo insaturado. Por otra parte, las rutas de síntesis no convencionales como las reacciones orgánicas asistidas por microondas sobre soportes sólidos inorgánicos se han convertido en una nueva estrategia en la síntesis orgánica con varias ventajas, tales como aumento en la velocidad de reacción, mejora en el rendimiento y calidad de los productos [3,4].

Teniendo en cuenta las ventajas de estas técnicas, se sintetizaron mono y bis chalconas (Fig. 1), cuyos efectos insecticidas investigamos en el presente trabajo sobre el lepidóptero *Spodoptera frugiperda* [5].

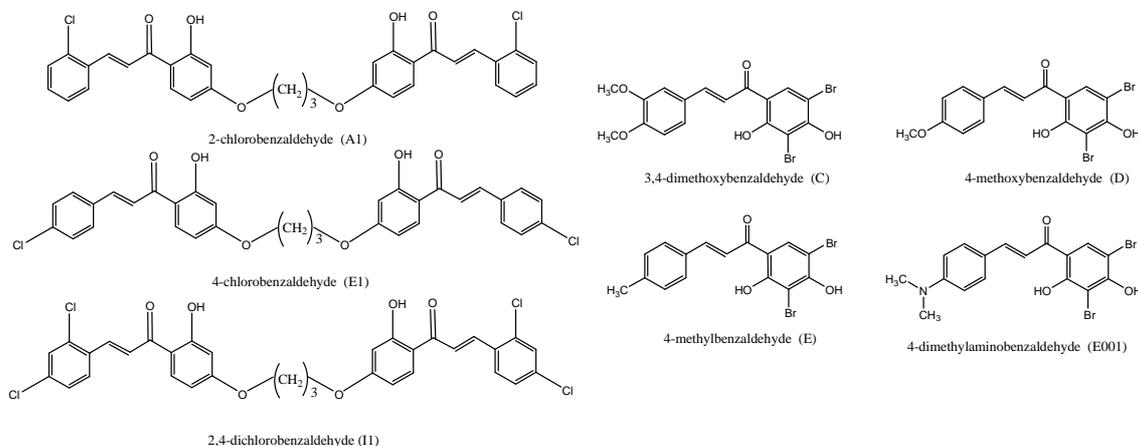


Figura 1. Chalconas sintéticas seleccionadas para su evaluación por sus alteraciones nutricionales y efectos tóxicos sobre *S. frugiperda*

### METODOLOGÍA

**Síntesis inducida por microondas (mono chalconas).** Se mezclan cantidades equimolares de 2, 4-dihidroxiacetofenona y aldehídos aromáticos sustituidos en etanol (5 ml) en matraz (100 ml), se añade con agitación a diferentes soportes sólidos inorgánico (4 g). La mezcla se seca bajo vacío para eliminar el disolvente. El material adsorbido se irradia en un horno de microondas durante 5-8 min. a nivel de media potencia (600 W). Finalizada la reacción (monitoreada por CCF), la mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente y el producto se extrae con

etanol (2x20 ml). La eliminación del disolvente y posterior recristalización con etanol da lugar a chalconas con buen rendimiento.

**Síntesis por método convencional (bis chalconas).** Se lleva a reflujo durante 10 a 15 h, la chalcona 2,4-dihidroxi (0,01 mol) y 1,3-dibromopropano (0,01 mol) en acetona seca (100 ml) y carbonato de potasio anhidro (0,02 mol). La reacción concluye cuando da negativo el ensayo con cloruro férrico alcohólico. Luego, la acetona se separa por destilación y el residuo se trata con agua enfriada con hielo y se agita. El sólido separado se filtra y se lava con solución de NaOH al 5% y finalmente con agua (3x30 ml). El sólido se seca, se disuelve con etanol y se filtra en caliente. Se vuelve a lavar con etanol en caliente para eliminar restos sólidos insolubles. El residuo etanólico sólido insoluble da como resultado bis chalconas.

**Acción insecticida.** Para el ensayo de actividad antialimentaria se coloca en diferentes tubos de ensayo dieta control (veinte repeticiones) y tratada con el compuesto a evaluar (veinte repeticiones), las que posteriormente son ofrecidas a larvas de segundo estadio de *Spodoptera frugiperda*. Cuando el 50% del control come el 50% de la dieta, se calcula el  $FR_{50}$ . Para el cálculo de los índices nutricionales, las larvas se pesan al comenzar el ensayo y a los 10 días de iniciado el mismo y se registra el peso de la dieta consumida en ese período. Para determinar la toxicidad se continúa alimentando a las larvas, tanto tratadas como control y se evalúa la mortalidad larval, pupal y la emergencia de la primera generación de adultos.

## RESULTADOS

El estudio químico condujo a la identificación de las mono chalconas **E001** y **D** y bis chalconas **E1**, **A1** and **I1** obtenidas por síntesis, las que fueron evaluadas por sus efectos sobre el lepidóptero *S. frugiperda*.

La incorporación de 100  $\mu\text{g/g}$  de dieta de bis-chalconas **A1**, **E1** y **I1** en la dieta artificial de *S. frugiperda* produjeron efectos antialimentarios leves ( $FR_{50}=0,78\pm 0,17$ ;  $0,74\pm 0,15$  y  $0,82\pm 0,19$ , respectivamente) a diferencia de las mono-chalconas que no presentaron acción antialimentaria bajo las condiciones del experimento (Tabla 1).

Los resultados obtenidos en las pruebas de toxicidad para cada una de las chalconas sintéticas muestran que las mono-chalconas **E001** y **D** provocaron efecto letal sobre las larvas de *S. frugiperda* en los primeros estadios y mortalidad pupal (Tabla 1). Los adultos que sobrevivieron mostraron malformaciones y disminución de tamaño en relación con el control, lo que provocó poca descendencia. Las bis-chalconas mostraron menor toxicidad que los mono-chalconas (tabla 1).

La adición de las mono-chalconas **D**, **C** y **E** a la dieta larval provocó cambios significativos en los índices nutricionales comparados con los del control. Se observó un significativo porcentaje de consumo (CIT/CIC), sin embargo se observó disminución en el crecimiento de las larvas (GRT/GRC) e ineficiencia en la conversión de los nutrientes absorbidos en biomasa (ECIT/ECIC) como se muestra en la Tabla 2.

## CONCLUSIONES

Los resultados obtenidos indican que la mono chalcona **D**, resulta promisoría por su acción insecticida sobre *S. frugiperda*.

Tabla 1. Efectos antialimentario y tóxicos de mono y bis chalconas sobre larvas de 2<sup>do</sup> estadio de *S. frugiperda*

Compounds	FR50 <sup>a,b</sup>	(%) Larval mortality	(%) Pupal mortality	(%) Emergency Adults
control	-	5	0	95
E001	1,2 ± 0,2a	40	5	55
D	1,1 ± 0,2a,b	60	5	35
C	0,9 ± 0,1c,d	0	5	95
E	1,0 ± 0,1b,c	0	0	100
A1	0,7 ± 0,1e	15	0	85
E1	0,7 ± 0,1e	25	5	70
I1	0,8 ± 0,2d,e	20	0	80

<sup>a</sup> Valor ± DE. FR<sub>50</sub>=Peso dieta Tratada/Peso dieta Control.

Tabla 2. Efectos nutricionales de mono y bis chalconas sobre larvas de 2do estadio de *S. frugiperda*

Compounds	Cl <sub>T</sub> /Cl <sub>C</sub> <sup>a</sup> (%)	GR <sub>T</sub> /GR <sub>C</sub> <sup>b</sup> (%)	ECI <sub>T</sub> /ECI <sub>C</sub> <sup>c</sup> (%)
E001	92 ± 9a,b	100 ± 28a	108 ± 30a
D	98 ± 6a	75 ± 21b,c	77 ± 22b,c
C	72 ± 7d	39 ± 10d	53 ± 10d
E	86 ± 6b,c	59 ± 11c	68 ± 9c,d
A1	85 ± 10b,c	93 ± 17a	111 ± 20a
E1	88 ± 9b,c	82 ± 16a,b	93 ± 16a,b
I1	79 ± 6c,d	71 ± 22a,b	99 ± 6a

<sup>a</sup>Valor ± DE. <sup>b</sup>Valores dentro de una columna seguidos por la misma letra no son significativamente diferentes (P> 0,05 prueba de Tukey).).

## Referencias

<sup>1</sup>Turgut, Z; Yolacan, C; Aydogan, F; Bagdatli, E; Ocal, N. (2007). *Molecules*. 12: 2151-2159.

<sup>2</sup>Wu, X; Wilairat, P; Go, MN. (2002). *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 12: 2299-2302.

<sup>3</sup>Ameta, KL; Kumar, B; Rathore, NS. *E-J.* (2011). *Chem.* 8: 665-670.

<sup>4</sup>Ameta, KL; Rathore, NS; Kumar, B; Malaga, ESM; Verastegui, MMP; Gilman, RH; Verma, BL. (2012). *I. J. Org. Chem.* 2: 295-301.

<sup>5</sup>Di Toto Blessing L, Budeguer F, Ramos J, Diaz S, Bardón A, Brovotto M, Seoane G, Neske A (2015). *J. Agric. Chem. Environ.* 4: 56-61.