

## OBTENCIÓN DE LACTONAS BISNORCOLANICAS MEDIANTE LA RUPTURA INUSUAL DE UN ENLACE C-C

Bertha Fuentes Portillo,<sup>1</sup>

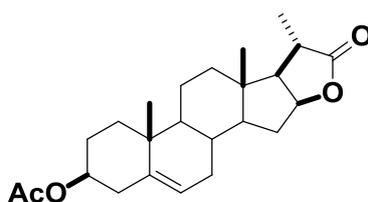
Jesús Sandoval Ramírez,<sup>1</sup> María A. Fernández Herrera.<sup>2</sup>

<sup>1</sup>Benemérita Universidad Autónoma de Puebla, Facultad de Ciencias Químicas. Puebla, Pue. <sup>2</sup>Centro de Investigación y de Estudios Avanzados, Unidad Mérida. Mérida, Yuc. [bertha.fuentes@alumno.buap.mx](mailto:bertha.fuentes@alumno.buap.mx)

**Sección:** Química Orgánica

### Introducción

Las lactonas bisnoscolánicas (LBC) son importantes compuestos esteroidales que se obtienen a partir de fuentes naturales, o se sintetizan a partir de sapogeninas y furostenos.<sup>1,2</sup> Uno de los ejemplos más comunes es la vespertilina (Fig. 1). Las LBC son de gran interés sintético y biológico debido a que presentan importante actividad citotóxica.<sup>3</sup> En la literatura se han reportado diferentes rutas sintéticas para obtener LBC; sin embargo, aún no se ha desarrollado un método que las produzca eficientemente.

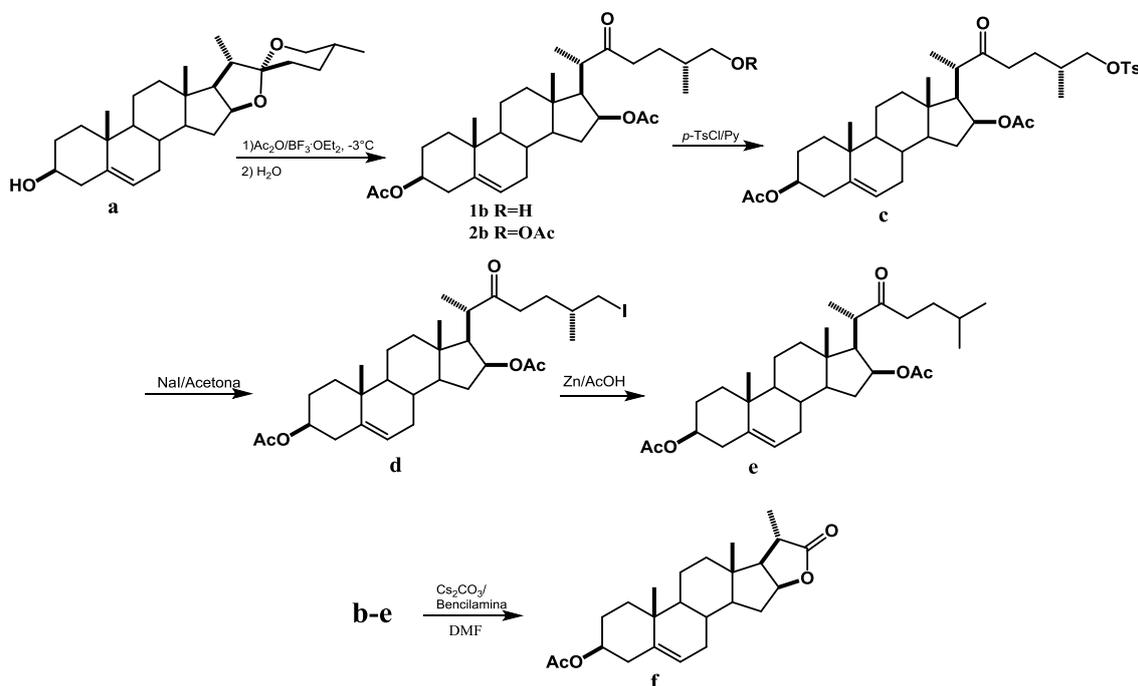


**Figura 1. (20S)-3β-hidroxipregn-5-eno-20,16β-carbolactona (vespertilina)**

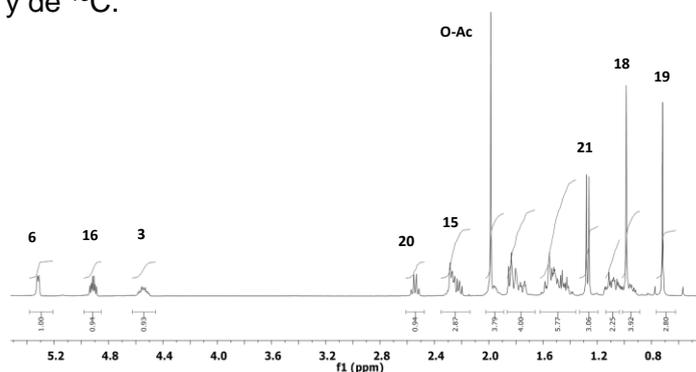
### Resultados

En este trabajo, se describe la formación de LBC (Esq. 1) mediante la siguiente metodología: se realizó la apertura regioselectiva de los anillos E y F de la diosgenina (**a**) mediante el uso de un ácido de Lewis, obteniendo como producto mayoritario **1b**, en el transcurso de la reacción el grupo hidroxilo de la posición C-26 es acetilado, obteniendo en menor proporción el compuesto **2b**; posteriormente usando diferentes

condiciones de reacción se formaron los compuestos **b-e** cada uno de estos compuestos se hizo reaccionar bajo condiciones básicas a 140 °C por un tiempo de 2 horas observando la formación de **f** debido a la ruptura inusual del enlace C22-C23.

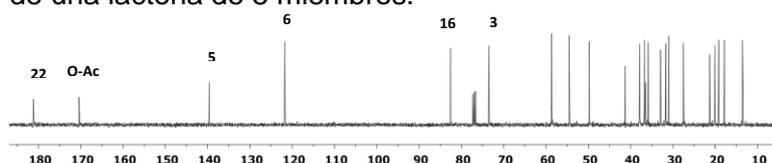


El uso de técnicas como RMN de  $^1\text{H}$  y  $^{13}\text{C}$  permitió caracterizar el producto formado, en este compuesto es apreciable la disminución de la cantidad de señales tanto en los espectros de  $^1\text{H}$  y de  $^{13}\text{C}$ .



**Figura 2. Espectro de  $^1\text{H}$  correspondiente al compuesto f.**

En  $^{13}\text{C}$  se aprecian solamente 24 átomos de C. La señal hacia 170 ppm tiene un  $\delta$  típico para un carbonilo de éster (en C-3) y la señal hacia 180 ppm tiene el  $\delta$  característico de una lactona de 5 miembros.



**Figura 3. Espectro de  $^{13}\text{C}$  correspondiente al compuesto f.**

Por otra parte, mediante el uso de espectrometría de masas se confirmó el producto obtenido correspondiente a **f** teniendo los siguientes datos,  $m/z$  (%): 386 ( $M+.+1$ ) (2). Análisis calculado para  $C_{24}H_{34}O_4$  C 74.58; H 8.87; O 16.56; encontrada: C, 74.45 ; H, 8.98; O, 16.76.

## Conclusiones

En este trabajo se describe una nueva vía de acceso al acetato de vespertilina. La fisión del enlace C22-C23 de diferentes derivados de la apertura regioselectiva de los anillos **E** y **F** de **a** se logró usando un medio básico a una temperatura de 140 °C, el uso de técnicas analíticas como RMN y HRMS permitió caracterizar el compuesto obtenido.

## Referencias

<sup>1</sup> Tsukamoto, T.; Ueno, Y.; Ohta, Z.; *J. Pharm. Soc. Jpn.* **1936**, *56*, 931.

<sup>2</sup> Hernández-Linares, M. G.; Meza-Reyes, S.; Montiel-Smith, S.; Sandoval-Ramírez, J.; Gómez-Calvario, V.; Bernès, S. *J. Mex. Chem. Soc.* **2007**, *51*, 217.

<sup>3</sup> González, A G.; Darias, V; Suárez, M.C.; Janssen, K. *II Farmaco* **1983**, *38*, 2.