Artemisia annua: Uma Solução Terapêutica Contra a COVID-19

Atualmente, não existe um tratamento específico contra o coronavírus SARS-CoV-2. A esperança recai naturalmente em vacinas que possibilitem a obtenção da imunidade de grupo. Contudo, a longo prazo, talvez seja necessário procurar alternativas terapêuticas. A partir deste pressuposto, vários tratamentos à base de extratos fitoquímicos usados na Medicina Tradicional Chinesa foram explorados para tratar infecções por coronavírus. Estudos iniciais mostraram que o extrato alcoólico de absinto doce (*Artemisia annua*) foi o segundo medicamento fitoterapêutico mais potente usado no surto de SARS-CoV de 2005, cujas propriedades biológicas se devem principalmente à artemisinina.

A artemisinina é uma lactona sesquiterpênica descoberta pela farmacologista chinesa Tu Youyou, permitindo-lhe arrecadar em 2015 o Prêmio Nobel de Fisiologia ou Medicina. Em termos químicos, a particularidade estrutural da artemisinina que lhe confere a respetiva atividade é o endoperoxido, incorporada no anel de 1,2,4-trioxano, que está envolvida no mecanismo de ação, ainda não totalmente elucidado. No entanto, os estudos realizados indicam que o anel de endoperoxido sofre clivagem oxidativa na presença de ferro(II) presente em hemoproteínas, originando radicais livres altamente reativos que danificam proteínas e material genético do parasita, resultando na respetiva morte, daí o seu uso no tratamento da malária.

Investigadores do Instituto Max Planck de Colóides e Interfaces, de Potsdam, Alemanha, avaliaram o potencial dos extratos vegetais de *Artemisia annua* e derivados de artemisinina contra o novo coronavírus SARS-CoV-2 e descobriram que os extratos fitoquímicos

Crédito: Kerry Gilmore

evidenciavam atividade antiviral após serem extraídos com etanol puro ou água destilada, e que a atividade aumenta consideravelmente quando os extratos obtidos são combinados com alcaloides, sobretudo com a cafeína. Apesar dos resultados relativos aos ensaios *in vitro* serem promissores, a próxima etapa passará por testar a atividade dos extratos vegetais de *Artemisia annua* no tratamento da COVID-19 em humanos, com o uso de chás e cafés, no centro médico académico da Universidade de Kentucky, de forma a determinar se a *Artemisia annua* pode ser efetivamente usada contra o SARS-CoV-2.

>

José R. A. Coelho

pg42590@alunos.uminho.pt

Fontes

Artemisia annua to be tested against Coronavirus, mpg.de/14663263/artemisia-annua-corona-virus (acedido em 20/02/2021).

K. Gilmore, Y. Zhou, S. Ramirez, L. V. Pham, U. Fahnøe, S. Feng, A. Offersgaard, J. Trimpert, J. Bukh, K. Osterrieder, J. M. Gottwein, P. H. Seeberger, *BioRxiv*. DOI: 10.1101/2020.10.05.326637.

Síntese de N-Alquilanilinas Através de Aminação C-H Aromática com Ferro

As aminas aromáticas são particularmente importantes devido à sua utilização em produtos farmacêuticos, agroquímicos, catalisadores ou corantes. A preparação destes compostos através de reações de aminação de arenos obriga à construção de ligações C(sp²)-N. Geralmente, as abordagens tradicionais para a aminação de arenos envolvem vários passos sintéticos e condições experimentais bastante exigentes.

Eric Falk e colaboradores, do Instituto Federal de Tecnologia de Zurique, na Suíça, desenvolveram uma metodologia mais simples para a aminação de arenos, usando sais de ferro(II) como catalisadores e derivados de hidroxilamina como agentes de aminação altamente eletrofílicos, possibilitando a síntese de *N*-metilanilinas e tetra-hidroquinolinas. Esta equipa de investigação estabeleceu que o catalisador ($\text{FeSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$) e o reagente de aminação $[\text{NsO}-\text{NH}_2-\text{CH}_3]^+\text{OTf}^-$ (Ns = nosilo, OTf = triflato), utilizando 1,1,1,3,3,3-hexafluoroisopropanol (HFIP) como solvente, permitem a eficaz *N*-metilaminação do benzeno. A reação pode ser realizada ao ar, a 40 °C, pelo que é operacionalmente simples, não requerendo equipamento especializado. Usando esta abordagem foi possível transformar arenos neutros e ricos em elétrons nos correspondentes produtos com o grupo *N*-metilamina com rendimentos moderados a elevados (44–89%). Além disso, as condições de reação permitem a preparação de tetra-hidroquinolinas através da reação intramolecular de arenos com um substituinte propílico, funcionalizado com o grupo $\text{N}(\text{OTs})\text{Boc}$ (Ts = tosilo, Boc = *tert*-butiloxicarbonilo), na presença de ácido trifluoroacético para promover *in situ* a desproteção do material de partida. Os derivados de tetra-hidroquinolina foram obtidos com rendimentos razoáveis (34–56%).

O processo descrito por Eric Falk e colaboradores permite a síntese de *N*-metilanilinas e tetra-hidroquinolinas a partir de arenos simples, promovidas por sais de ferro(II), sem necessidade de controlo de exposição ao oxigénio do ar ou à humidade e facilmente realizadas em condições suaves.

Crédito: ChemistryViews

>

José R. A. Coelho

pg42590@alunos.uminho.pt

Fontes

Iron-Catalyzed Synthesis of *N*-Alkyl Anilines, chemistryviews.org/details/news/11288171/Iron-Catalyzed_Synthesis_of_N_Alkyl_Anilines (acedido em 22/02/2021).

E. Falk, V. C. M. Gasser, B. Morandi, *Org. Lett.* **2021**, 23, 1422–1426. DOI: 10.1021/acs.orglett.1c00099.

Espectroscopia de RMN Usada para Certificar Café

Crédito: ChemistryViews

O café é uma das bebidas mais consumidas no mundo. Entre cerca de 500 espécies de café, existem duas variedades com maior importância comercial: a *Coffea arabica* e a *Coffea canephora* var. Robusta, conhecidas como cafés arábica e robusta, respetivamente. O café arábica é considerado, geralmente, de qualidade superior em comparação com o robusta, tendo um preço superior. A adulteração do café arábica com o robusta, mais barato, pode ser difícil de detetar uma vez que os grãos são torrados e moídos. A deteção dessas adulterações é importante de modo a garantir a proteção do consumidor e a capacidade da indústria alimentar e de bebidas para obter produtos de alta qualidade. Assim, há necessidade de desenvolver soluções analíticas inovadoras que permitam garantir a autenticidade e qualidade das matérias-primas e de produtos alimentares.

Fabrice Berrué (Centro de Pesquisa de Desenvolvimento de Recursos Aquáticos e Culturais, Conselho