



Proyecto n° PG-06-7548-2009

**Síntesis y caracterización de derivados de vic-4,9-dihidroxi-5-arilindeno [2,1-b] indol polisustituidos. Evaluación de la actividad antimalárica y citotóxica-antitumoral.**

Responsable: Charris Charris, Jaime Enrique

Etapas cumplidas / Etapas totales: 1/1

Especialidad: Química medicinal

**Resumen:** El proyecto se enmarca dentro de las líneas de investigación que desarrolla nuestro grupo en el área de la Química Medicinal. Los resultados nos permite mostrar la síntesis de más de 60 compuestos nuevos, tipo heterociclos polisustituidos del núcleo del indol-indeno y quinolinas, usando diferentes estrategias de síntesis y caracterizados mediante las diferentes técnicas espectroscópicas disponibles. A través, de análisis rnm y de rayos x, se pudo determinar que la reacción fue disateroespecífica. Además, los compuestos fueron evaluados como potenciales agentes antimaláricos y citotóxico-antitumoral in vivo e in vitro. Los resultados encontrados permiten sugerir algunas modificaciones sobre los “hits” obtenidos, con la finalidad de mejorada-potencia y biodisponibilidad de los mismos.

*Productos*

*Publicaciones*

*Artículos*

1. Lobo, G., Zuleta, K., Charris, J., Capparelli, M. y Briceño, J.A., “Synthesis and crystal structure of 5-(2,4-dimethoxyphenyl)-7,7-dimethyl-4b,9bdihydroxy-4b,5,7,8,9b-hexahydroindeno[1,2-b]indole-9,10-dione”, *J.Chem. Res.*, **35**: 222-224, 2011.
2. Lobo, G., González, T., Briceño, J.A. y Charris, J., “Synthesis and cristal structure of 3-[1-hydroxy-3-oxo-3-(4-methylphenylpropyl)]-quinolin-2-(1H)-one derivatives”, *J. Chem. Res.*, **35**: 509-512, 2011.
3. Camacho, J., Barazarte, A., Gamboa, N., Rodrigues, J., Rojas, R., Vaisberg, A., Gilman, R. y Charris, J., “Synthesis and biological evaluation of benzimidazole-5-carbohydrazide derivatives as antimalarial, cytotoxic and antitubercular agents”. *Bioorg. Med. Chem.*, **19**:2023-2029, 2011
4. Rodrigues, R. y Charris, J., Ferrer, R., Gamboa, N., Bianca, J., Höepfner M., Lein M., Jung, K. y Abramjuk, C., “Effect of quinolinyl acrylate derivatives on prostate cancer in vitro and in vivo”, *Invest New Drugs.*, **30**: 1426-1433., 2012.
5. Rodrigues, J., Charris, J., Camacho, J., Barazarte, A., Gamboa, N. y Antunes, F., “Cytotoxic effects of N'-formyl-2-(5-nitrothiophen-2-yl)-benzothiazole-6-carbohydrazide in human breast tumor cells by induction of oxidative stress”, *Anticancer Res.*, **32**: 2721-2726, 2012.
6. Rodrigues, J., Charris, J.; Camacho, J., Barazarte, A., Gamboa, N., Nitzsche, B., Höpfner, M., Lein, M., Jung, K. y Abramjuk, C., “N-formyl-2 -(5-nitrothiophen-2-yl)-benzothiazole-6-carbohydrazide as a potential anti-tumor agent for prostate cancer in experimental studies”, *J. Pharm. Pharmacol.*, (en prensa).

*Eventos*



1. Charris, J. y Camacho J., "Synthesis and biological evaluation of benzothiazole-5-carbohydrazide derivatives", *Twelfth Tetrahedron Symposium, Challenges in Organic and Bioorganic Chemistry*, Sitges, España, 2011.
2. Rodrigues, J., Charris, J. y Antunes F., "Potential antitumor and pro-oxidative effects of (E)-methyl 2-(7-chloroquinolin-4-ylthio)-3-(4-hydroxyphenyl) acrylate in human breast cancer cells", *Atualizações em Oncologia, 2012, 1o Congresso do CIMAGO*, Coimbra, Portugal, 2012.
3. Rodrigues J., Charris J. y Antunes F. "Effects of (E)-methyl 2-(7-chloroquinolin-4-ylthio)-3-(4-hydroxyphenyl) acrylate on the antioxidant pathways in human breast cancer cells", *Atualizações em Oncologia 2012, 1o Congresso do CIMAGO*, Coimbra, Portugal, 2012.

*Otros*

*Tesis de Pregrado*

Elimar Zuleta, "Síntesis y caracterización de derivados 4b, 9b-dihidroxi-4b, 5, 6, 7, 8, 9b-hexahidroindeno [1,2-b] indol-9, 10-dióna, con posible actividad citotóxica-anticancer", (Universidad del Zulia), 2010.