



Proyecto n° PI-06-00-7078-2007

Síntesis de derivados de 7-clorobezoilalquilulfanilquinolina. Evaluación como antimaláricos

Responsable: Charris Charris, Jaime Enrique

Etapas cumplidas / Etapas totales 1/2

Especialidad: Síntesis, química medicinal

Resumen: La ruta sintética planteada involucra una reacción de sustitución nucleofílica selectiva sobre la 4,7-dicloroquinolina, empleando mercaptoalcoholes o las aminoacetofenonas para- o meta-sustituidas, a fin de generar los núcleos 4-sulfanilquinolinas o 4-aminofenilquinolinas, respectivamente, los cuales en forma independiente se hicieron reaccionar con los ácidos o aldehídos correspondientes para obtener los derivados de las series 4-sulfanilquinolonas o 4-aminoquinolinchalconas. Ambos tipos de derivados fueron activos como inhibidores de la formación de hemozoina / β -hematina. Varios derivados de la serie sulfanil, además redujeron en forma estadísticamente significativa la parasitemia de los ratones infectados, razón por la cual se postulan como antimaláricos potenciales cuyo mecanismo de acción pudiera estar relacionado con su capacidad para interferir con la detoxificación del hemo. Además la serie de las 4-cloroquinolinchalconas se evaluaron como citotóxicos sobre la línea celular LNCaP (próstata humana) resultando tres de estos compuestos con una muy buena actividad como potenciales agentes anticancerígenos.

Productos

Publicaciones

Artículos

1. A. Barazarte, N. Gamboa, J. Rodrigues, T. González, y J. Charris, "Crystal structure of two N-phenylated tricyclic benzothiazines with antimalarial activity", *J. Chem. Res.*, 41-43, 2009.
2. R. Ferrer, G. Lobo, N. Gamboa, J. Rodrigues, C. Abramjuk, K. Jung, M. Lein, y J. Charris, "Synthesis of 7-chloroquinolinyl-4-aminophenylchalcones. Potential antimalarial and anticancer agents", *Sci. Pharm. (en prensa)*.

Eventos

J. Charris, R. Ferrer, N. Gamboa, J. Rodrigues, T. González, y R. Atencio, "Synthesis and antimalarial activity of side modified 7-chloro-sulfidequinoline derivatives", *4th. Brazilian Symposium on Medicinal Chemistry*, Porto de Galinhas, P.E. Brazil, 2008.