

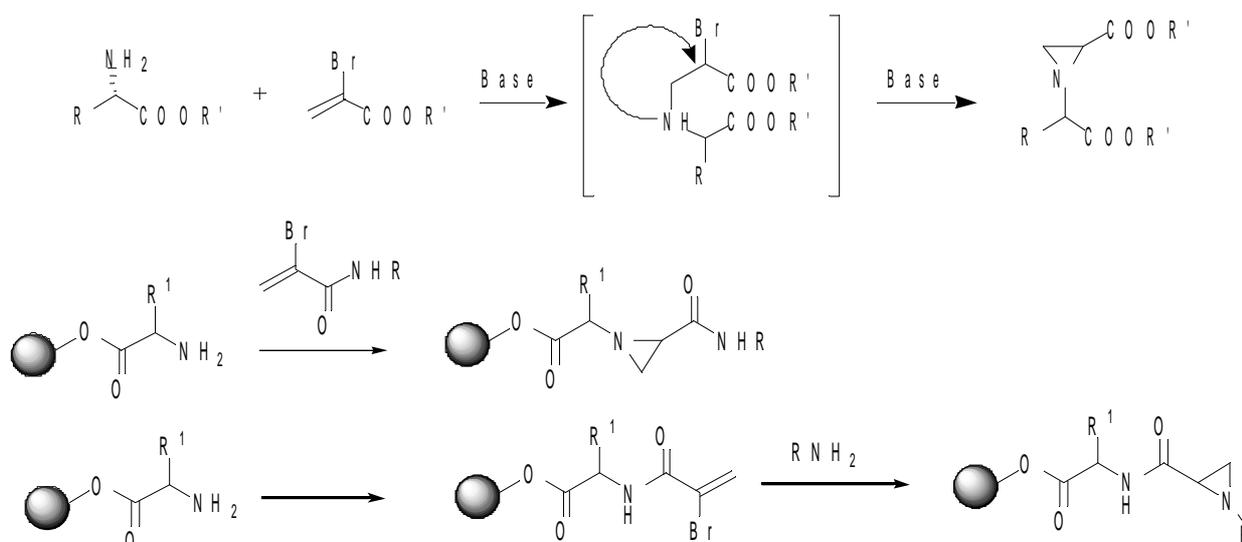
Sintesi di Peptidomimetici Aziridinici come Potenziali Inibitori di Metallo Proteasi.

Alessia Cosseddu, Simonetta Masala, Maurizio Taddei

Dipartimento di Chimica dell'Università degli Studi di Sassari, Via Vienna 2, 07100 Sassari.

E-mail: mtphd@ssmain.uniss.it

La ricerca di inibitori efficienti per le metallo proteasi é uno dei principali obiettivi della “medicinal chemistry” contemporanea. La diversità molecolare associata a strutture efficienti é elevata, anche se una costante strutturale sembra essere la presenza di un gruppo legante molto forte (tipo un acido idrossamico) ed un raggruppamento lipofilo situato in una posizione particolare. Recentemente abbiamo utilizzato la reazione di Gabriel-Cromwell per sintetizzare aziridine peptidomimetiche derivate da ammino acidi.¹ Tale reazione molto versatile ed applicabile sia alla fase omogenea che alla fase solida potrebbe essere utilizzata anche per preparare molecole di tipo aziridinico contenenti un legante ed un gruppo lipofilo adeguato.



In questo approccio l'aziridina é considerata sia un centro potenzialmente legante sia un semplice “template” per inserire i potenziali ligandi del sito enzimatico delle metallo proteasi come, ad esempio, un gruppo idrossamico o un uretano costruiti sul gruppo carbossilico.

- 1) S.N. Filigheddu, M. Taddei *Tetrahedron Lett.* **1998**, 39, 3857. S.N. Filigheddu, S. Masala, M. Taddei *Tetrahedron Lett.* **1999**, 40, 6503.