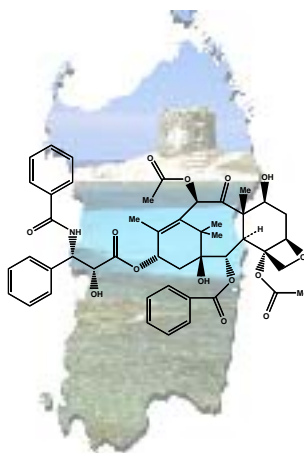




SardiniaChem2004

GIORNATA DI STUDIO DEDICATA ALLA CHIMICA ORGANICA
DELLE MOLECOLE BIOLOGICAMENTE ATTIVE

31 Maggio 2004, Aula Magna della Facoltà di Scienze - Sassari



COMITATO ORGANIZZATORE:

Giampaolo Giacomelli, *Univ. Sassari*; Giovanna Delogu *CNR Sassari*;
Salvatore Cabiddu, *Univ. Cagliari*; PierPaolo Piras, *Univ. Cagliari*

HANNO CONTRIBUITO ALLA REALIZZAZIONE DEL CONVEGNO:

UNIVERSITA' di Sassari-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di Chimica Biomolecolare, sez. Sassari; UNIVERSITA' di Cagliari; AGILENT TECHNOLOGIES, ITALIA, S.p.A. - Agenzia Sardegna; DEPECO s.r.l.; Apparecchiature Scientifiche; DIAGEN s.a.s.; JASCO s.r.l.; SIGMA-ALDRICH s.r.l.

2-ARILBENZIMIDAZOLI COME POTENZIALI AGENTI ANTIVIRALI E ANTITUMORALI

Gabriella Vitale^a, Mario Loriga^a, Giuseppina Sanna^b, Bernardetta Busonera^b, Marta Mureddu^b
Giuseppe Paglietti^a

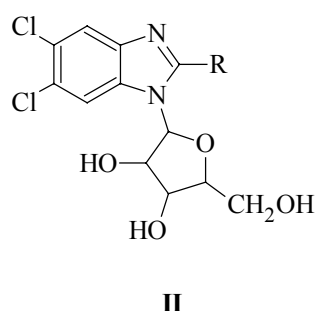
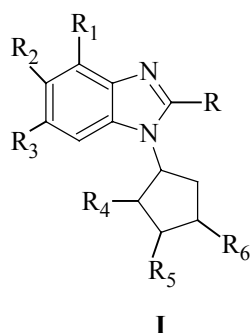
^a Dipartimento Farmaco Chimico Tossicologico, Università degli Studi di Sassari

^b Dipartimento di Scienze e Tecnologie Biomediche, Università degli Studi di Cagliari

I derivati benzimidazolici trovano impiego in numerose patologie. Tra gli esempi di più estesa applicazione si ricordano i farmaci antelmintici per il loro meccanismo d'inibizione mitotica.¹

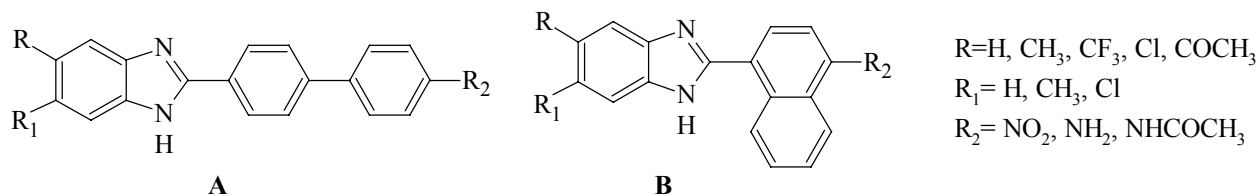
Recentemente sono stati oggetto di valutazione anche come farmaci antivirali.

Gli esempi sottoriportati rappresentano la struttura di composti che mimano i nucleosidi purinici, nei quali la base è stata sostituita con il nucleo benzimidazolico. I composti di formula **I** sono dotati di attività antivirale nei confronti del virus dell'epatite B alla concentrazione di 0.7 μM ,² quelli di formula **II** sono classificati come antivirali nei confronti di DNA e RNA virus in vitro.^{3,4}



R=H, Cl, Br, SCH₂Ph

Nell'ambito di un vasto programma di ricerca per l'individuazione dell'attività antivirale e antitumorale riscontrata in altri termini di serie benzimidazoliche,⁵ sono stati progettati i composti di formula A e B, in cui si è voluta verificare l'influenza dei sostituenti nelle posizioni 2, 5 e 6 dell'eterociclo.



Vengono descritti i metodi di sintesi, i risultati dello screening per l'attività antivirale e le correlazioni struttura-attività.

Bibliografia

- ¹ Nare B., Liu Z., Prichard R. K., Georges E., *Biochem. Pharmacology*, **12**, 2215-2222 (1994)
- ² S. Daluge, (Burroghs Wellcome Co) US Pat 5,399,580, 21.03.1995 *C.A.* **123** 257270n (1995)
- ³ R. V. Deviar, E. Kawashima, G. R. Revankar, J. M. Breitenbach, E. D. Kreske, J. C. Drach and L. B. Townsend, *J. Med. Chem.*, **37**, 2942 (1994)
- ⁴ L. B. Townsend, R. V. Deviar, S. R. Turk, M. R. Nassiri and J. C. Drach, *J. Med. Chem.*, **38**, 4098 (1995)
- ⁵ Boido V., Mina L., Sparatore F., Paglietti G., Doratiotto S., Setzu M.G., Delpiano D., La Colla P. *XVIth International Symposium on Medicinal Chemistry*, Bologna 18-22 Settembre 2000.