

NUOVI DERIVATI 2-ACETAMMIDOBENZAMMIDICI: ATTIVITÀ ANTIPROLIFERATIVA E POSSIBILE MECCANISMO DI AZIONE

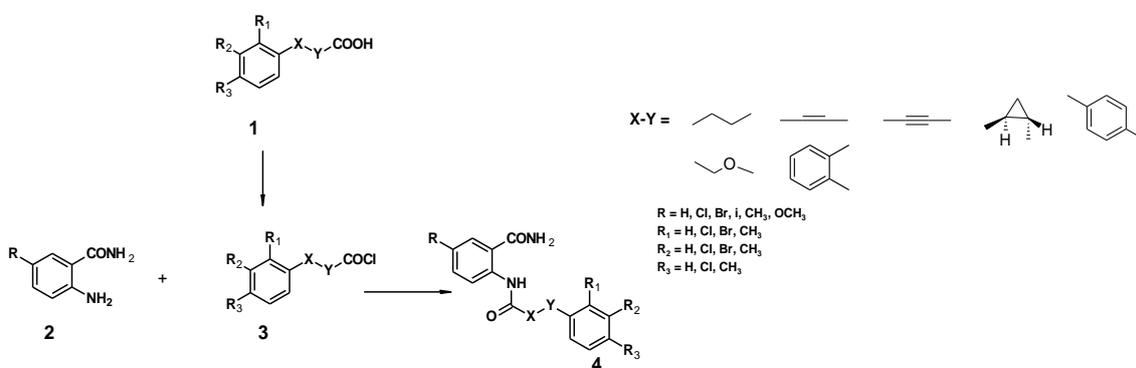
Stella Cascioferro^a, Demetrio Raffa^a, Benedetta Maggio^a, Fabiana Plescia^a, Maria Valeria Raimondi^a, Ruoli Bai^b, Ernest Hamel^b, Giuseppe Daidone^a.

^a Dipartimento di Scienze e Tecnologie Biologiche Chimiche e Farmaceutiche, Università degli Studi di Palermo, Via Archirafi, 32, Cap 90123, Palermo.

^b Division of Cancer Treatment and Diagnosis, National Cancer Institute at Frederick, Frederick, MD 21702, USA.

stellamaria.cascioferro@unipa.it

Le cinnammido benzammidi rappresentano una classe di sostanze biologicamente attive di grande interesse farmaceutico (1). Nonostante siano state descritte per svariate attività biologiche, nessun dato è stato riportato sulla loro attività antitumorale. Inizialmente una serie di 2-cinammidobenzammidi variamente sostituite sono state sintetizzate e valutate per la loro attività antiproliferativa. Partendo dal derivato risultato più attivo, il 2-cinnammido-5-iodobenzammide, che ha mostrato una percentuale di inibizione della crescita sulle K562 del 74% a 10 μ M, sono stati sintetizzati una serie di derivati al fine di approfondirne la SAR secondo quanto descritto nello schema 1 (2).



Schema 1

I composti **4** così ottenuti sono risultati attivi nei confronti di numerose linee cellulari tumorali a concentrazioni micromolari e submicromolari inducendo un blocco del ciclo cellulare delle K562 in fase G2M. Inoltre alcuni derivati sintetizzati sono in grado di indurre apoptosi nelle cellule HEP G2 con un indice apoptotico ≤ 2 .

Bibliografia

¹ Gray, N.S., Wodicka, L., Thunnisen A.M.W.H., Norman, T.C., Known, S., Espinoza, F.H., Morgan, D.O., Barnes G., LeClerc, S., Meijer L.M., *Science*, **1998**, 281, 533.

² Raffa, D., Maggio, B., Plescia, F., Cascioferro, S., Plescia, S., Raimondi M.V., Daidone, G., Tolomeo, M., Grimaudo, S., Di Cristina A., Pipitone, R.M., Bai, R., Hamel,E.; *Eur. J. Med. Chem.*, **2011**, 46, 2786.