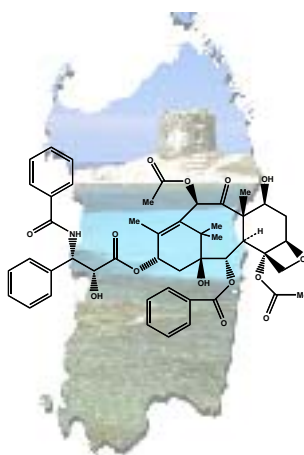




SardiniaChem2004

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:

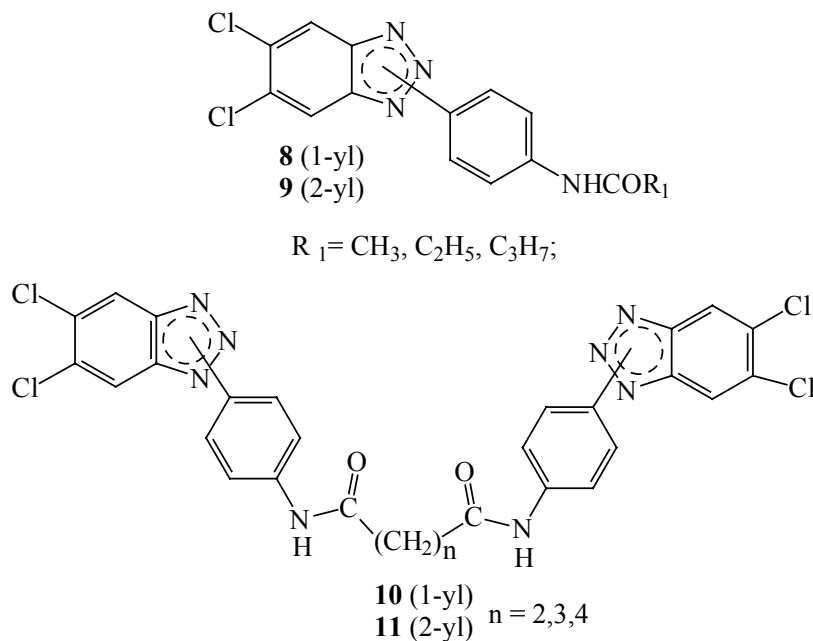
*UNIVERSITA' di Sassari-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di Chimica
Biomolecolare, sez. Sassari; UNIVERSITA' di Cagliari; AGILENT TECHNOLOGIES,
ITALIA, S.p.A. - Agenzia Sardegna; DEPECO s.r.l.; Apparecchiature Scientifiche;
DIAGEN s.a.s.; JASCO s.r.l.; SIGMA-ALDRICH s.r.l.*

SINTESI DI UNA NUOVA SERIE DI N-[4-(1H(2H)-BENZOTRIAZOL-1(2)-IL)FENIL]ALCHILCARBOSSIAMMIDI E N,N'-BIS[4-(1H(2H)-BENZOTRIAZOL-1(2)-IL)FENIL]ALCHILDICARBOSSIAMMIDI A POTENZIALE ATTIVITÀ ANTIVIRALE

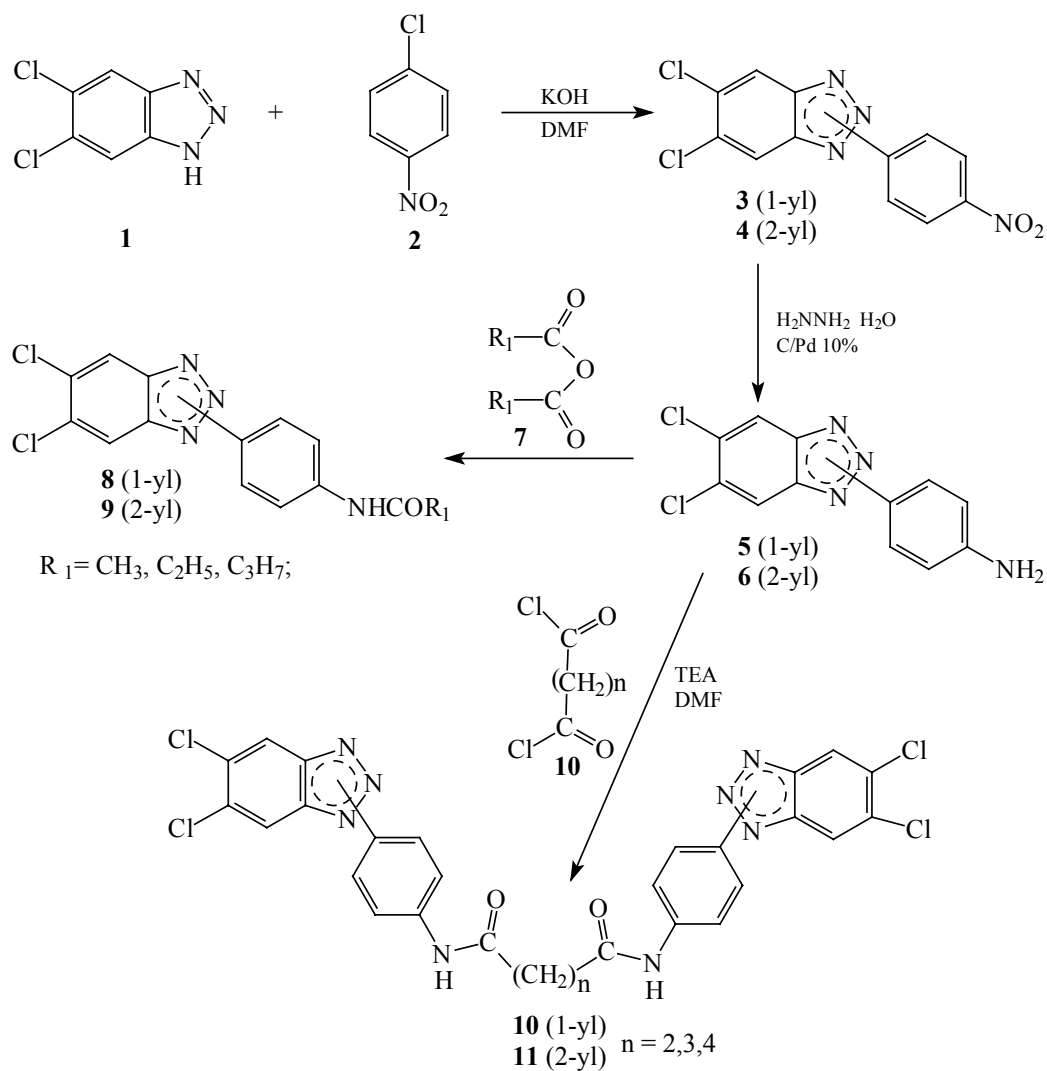
S. Piras, A. Carta, M. Loriga, M. Fnaeian and G. Paglietti

Dipartimento Farmaco-Chimico-Tossicologico, Università degli Studi di Sassari, Via Muroni 23/a, 07100 Sassari.

Recentemente abbiamo riportato la sintesi e l'attività antivirale di un'ampia serie di N-[4-(1H(2H)-benzotriazol-1(2)-il)fenil]alchilcarbossiammidi e N,N'-bis[4-(1H(2H)-benzotriazol-1(2)-il)fenil]alchildicarbocossiammidi [1]. La valutazione biologica nei confronti di vari RNA e DNA virus, ha messo in evidenza una generale interessante attività su alcune specie rappresentative dei Picornavirus, quali Polio Sabin 1 e Coxsackie B1. I derivati più attivi hanno mostrato una $EC_{50} < 10 \mu M$, associata con una bassa o nulla citotossicità. Come ulteriore sviluppo di questa ricerca è stata ora progettata la nuova serie di derivati benzotriazolici di formula generale **8-11**, recanti in posizione 5 e 6 dell'eterociclo due atomi di cloro al fine di valutare se l'introduzione di atomi ad attrazione elettronica, unitamente al maggior ingombro sterico possano influenzare positivamente l'attività biologica.



Nello Schema seguente sono riassunte le procedure sintetiche adottate per l'ottenimento dei semplici derivati carbocossiammidici e dei loro corrispondenti dimeri dicarbocossiammidici.



Bibliografia

- [1] A. Carta, C. Congiatu, M. Loriga, E. Marongiu, F. Esposito and R. Loddo, Synthesis and biological evaluation of N-[4-(1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-yl)fenyl]alkylcarboxamido and N,N'-bis[4-(1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-yl)fenyl]alkyldicarboxamido derivatives, Polish-Austrian-German-Hungarian-Italian Joint Meeting on Medicinal Chemistry, Krakow, Poland, 15-18 October 2003. Atti P133, p182.