

DE NUEVOS COMPUESTOS CON ACTIVIDAD TRIPANOCIDA PREVIAMENTE IDENTIFICADA

Teresa Espinosa-Buitrago¹, Niurka Mollineda², Ángel Cores³, Mercedes Villacampa³,
 José Carlos Menendez³, Cristina Fonseca-Berzal¹, Alfredo Meneses²
 Presentador: Frank Manuel Wilford González²

¹Departamento de Microbiología y Parasitología, Facultad de Farmacia, Universidad Complutense de Madrid

²Centro de Bioactivos Químicos, Universidad Central "Marta Abreu" de Las Villas

³Departamento de Química en Ciencias Farmacéuticas, Facultad de Farmacia, Universidad Complutense de Madrid

ENFERMEDADES TROPICALES DESATENDIDAS

Protozoos parásitos del O. Kinetoplastida

Trypanosoma cruzi

ENFERMEDAD DE CHAGAS

Leishmania spp.

LEISHMANIASIS

Trypanosoma brucei

ENFERMEDAD DEL SUEÑO

Pese a su elevada prevalencia

- No existen medicamentos seguros y eficaces
- Aparición de cepas resistentes a los fármacos disponibles

Urge la búsqueda de nuevas terapias

MATERIAL Y MÉTODOS

En el presente trabajo

Determinación de la actividad *in vitro* frente a *Leishmania amazonensis*

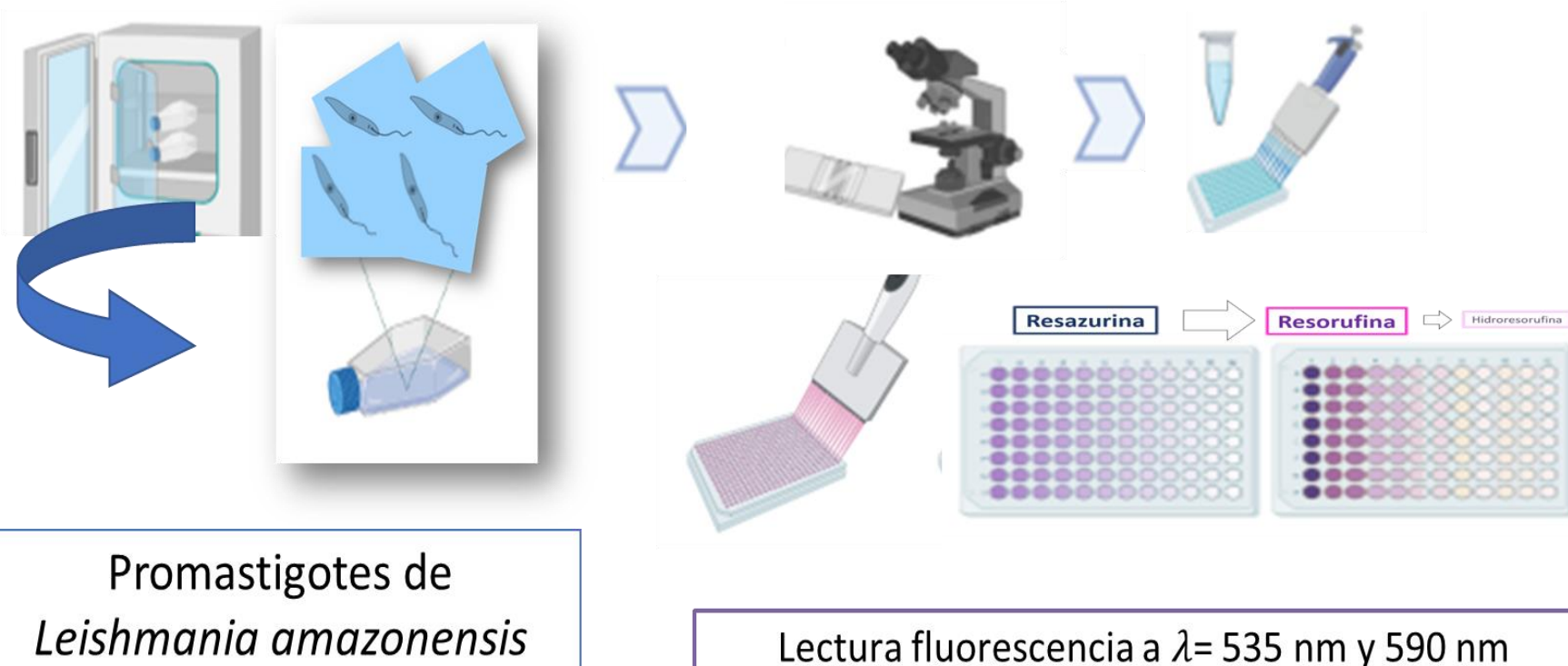
6 nuevos compuestos de 2 series de síntesis diferentes (entre más de 40 moléculas)

Identificados previamente por nuestro grupo de investigación

- Potenciales agentes tripanocidas frente a dos cepas de *T. cruzi*: CL-B5 lacZ (DTU TcVI) e Y (DTU TcII)

- No citotóxicos sobre las dos líneas celulares empleadas: fibroblastos L929 y macrófagos J774

Método fluorimétrico: resazurina



CONCLUSIONES

En base a los resultados obtenidos, los compuestos fueron objeto de estudio de **citotoxicidad** en **cultivos primarios** de **macrófagos peritoneales**, además de determinar su **actividad** en **amastigotes**, la **forma intracelular** del parásito.

Financiación: Grupos de Investigación UCM 911120 y 920234, PR87/19-22691 y RTI2018-097662-B-I00. Proyecto cooperación Nº Ref VR/22.

Nagle, A. S. *et al Chem. Rev.* 2014, 114, 11305-11347; Changtam, C. *et al Eur. J. Med. Chem.* 2010, 45, 941-956.; WHO, 2012.

RESULTADOS Y DISCUSIÓN

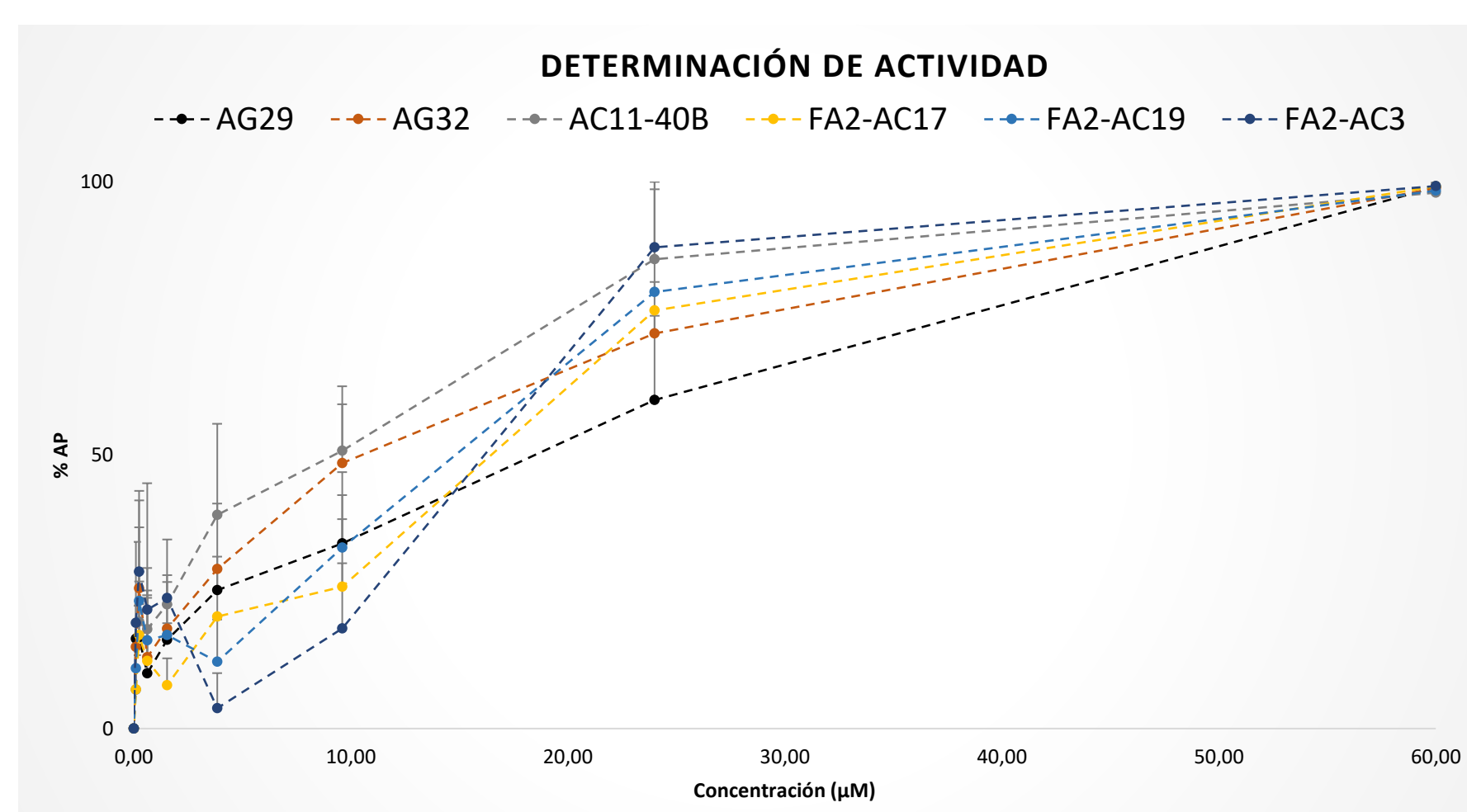


Figura 1. Perfil de actividad *in vitro* sobre promastigotes de *L. amazonensis*. Resultados expresados como el porcentaje de actividad frente a promastigotes (% AP). Media \pm desviación estándar (SD) (n = 3)

Compuesto	AP (%)	IC ₅₀ (µM)
AG29	99,00 \pm 1,73	18,18 \pm 8,33
AG32	98,79 \pm 2,09	11,40 \pm 3,53
AC11-40B	97,96 \pm 3,53	11,75 \pm 2,07
FA2-AC17	99,15 \pm 1,47	14,90 \pm 1,10
FA2-AC19	98,37 \pm 1,46	12,73 \pm 1,45
FA2-AC3	99,20 \pm 1,38	14,14 \pm 1,70

Tabla 1. Actividad *in vitro* sobre promastigotes de *L. amazonensis*. Resultados expresados como valores IC₅₀ (µM) y AP (%) a 60 µM. Media \pm SD (n = 3). utilizando como fármaco de referencia anfotericina B (IC₅₀).

Los 6 compuestos presentan actividad frente a *L. amazonensis*, destacando los compuestos AG32, AC11-40B y FA2-AC19