

تشبيد بعض مشتقات ال 8,1- نافثيردين الجديدة المتوقع لها فاعلية بيولوجية نسرين سعيد إسماعيل، ايمان سالم السلمي

المستخلص

تحضير سلسلة جديدة من مشتقات ٢-فينيل-٧-ميثيل-١,٨- نفثارين 104,105a-d,103a-e, 109a-d, 108a-c,107, 106a-d, مع التشكيل الكيميائي في مواقع C-3 و C-7 وقد لوحظ تحسن في نسب النواتج تحت تأثير أشعة الموجات فوق الصوتية مقارنة بالطريقة الكلاسيكية. تم تقييم المركبات المحضرة لتثبيط نمو الخلايا HepG2. وأظهرت النتائج التي تم الحصول عليها أن المركبات المختبرة لها تأثير مثبط على نمو خلايا سرطان الكبد HepG2. وتراوحت قواعد مانس (103a-e) نشاط جيد تراوح بين ($IC_{50}:0.03 - 0.08\mu M$) ومشتقات الاستريل-109 b (d) أظهر نشاطاً معتدلاً ($IC_{50}: 0.18-0.25 \mu M$) ، عند مقارنته بدوكسوروبيسين ($IC_{50} = 0.016 \mu M$). من ناحية أخرى، أظهرت المركبات 105c,106c فاعلية ملحوظة والتي تتلاءم مع النمذجة الجزيئية نشاطاً أفضل من الدواء المرجعي دوكسوروبيسين (0.015 ، $IC_{50}:0.017$ على التوالي).

Synthesis of Some Novel 1,8-Naphthyridine Derivatives of Anticipated Biological Activity

N.S Ahmed ^{a, b*}, E.S. Alsolami ^a

^a Department of Chemistry, Faculty of Science, King Abdul-Aziz University, Jeddah 21589, Saudi Arabia

^b Department of Medicinal Chemistry, National Research Center, Cairo, Egypt.

Abstract

A new series of 2-phenyl-1,8-naphthyridin-ol derivatives **103a-e**, **104**, **105a-d**, **106a-d**, **107** and **108a-c**, **109a-d** were synthesized with chemical modification at C-3 and C-7 positions. An improvement in rates and yields were observed when the reactions were carried out under ultrasonic irradiation compared with the classical method of synthesis. The newly synthesized compounds were evaluated for HepG2 cell growth inhibition. The results obtained revealed that the tested compounds possess an inhibitory effect on the growth of HepG2 liver cancer cells. The Mannich bases (**103 a,c,d,e**) show good activity ranging from (IC₅₀: 0.03- 0.08 μM) and the styryl derivative (**109 b-d**) showed moderate activity (IC₅₀: 0.18 - 0.25 μM), when comparable to that of the reference drug doxorubicin (IC₅₀ = 0.016 μM). On the other hand, compounds **105c** the most potent agent and **106c** which fit with molecular modeling exhibited better activity than doxorubicin with IC₅₀ values (0.015, 0.017 μM, respectively).