

Síntese e avaliação da atividade citotóxica de novas 5-benzilideno-4-tiazolidinonas

Daniel D. Feitoza^{a*}, Maria do D. Rodrigues^b, Alexandre J. S. Góes^b, Antônio J. Alves^b, Silene C. do Nascimento^b, José G. de Lima^b

^aDepartamento de Ciências Farmacêuticas, Centro de Ciências da Saúde – UFPE, Avenida Professor Moraes Rego s/n – Cidade Universitária – CEP 50670-90, Recife/PE – Brasil.

^bDepartamento de Antibióticos, Centro de Ciências Biológicas – UFPE, Avenida Professor Moraes Rego s/n – Cidade Universitária – CEP 50670-90 Recife/PE – Brasil.

RESUMO: As 4-tiazolidinonas são moléculas de grande interesse científico devido às suas propriedades químicas e ao extenso espectro de atividades biológicas, como antimicrobiana e antitumoral, dentre outras. Nesta presente comunicação objetivamos a síntese e a avaliação da atividade citotóxica frente a células neoplásicas de novos derivados 5-benzilideno-4-tiazolidinonas obtidos a partir de 4-piridinocarboxialdeído. A síntese dos derivados 5-benzilideno-4-tiazolidinonas foi realizada por condensação de Knoevenagel entre o grupo metileno do anel 4-tiazolidinona e o grupo carbonila de aldeídos aromáticos usando uma base, piperidina, em solução etanólica, com rendimentos entre 65% e 77%. Para os testes citotóxicos foram utilizadas células NCI-H292 (obtidas de carcinomas mucoepidermóide de pulmão humano) e Hep-2 (derivadas de carcinomas epidermóide de laringe humana). Os testes foram realizados em concentrações de 10, 5, 2,5 e 1,25 µg/mL. Dos compostos testados o 5-(4-dimetilamino-benzilideno)-4-tiazolidinona foi o que apresentou melhor porcentagem de inibição celular, com uma IC₅₀ de 1,74 µg/mL para células da linhagem NCI-H292. Compostos contendo o anel 4-tiazolidinona vêm, nos últimos anos, ganhando importância junto à comunidade científica. Neste trabalho destacamos o potencial deste composto para atividade antiproliferativa para células NCI-H292. Este resultado torna-se incentivador para novos estudos da atividade citotóxica de 4-tiazolidinonas.

Palavras-Chave: 4-tiazolidinona; antiproliferativo; benzilideno; citotóxico

Synthesis and cytotoxic activity of some new 5-benzylidene-4-thiazolidinones

ABSTRACT: From a biological perspective, the 4-thiazolidinones are of great scientific interest due to its chemical properties and the wide spectrum of biological activities such as antimicrobial and anti-tumor, among others. In this communication we aimed the synthesis and evaluation of cytotoxic activity against the neoplastic cells of some 5-

* Corresponding author. E-mail: danielufpe@gmail.com

benzylidene-4-thiazolidinone derivatives obtained from 4-pyridinecarboxaldehyde. The synthesis of the 5-benzylidene-4-thiazolidinone derivatives was performed by Knoevenagel condensation of 4-thiazolidinones and with suitable aromatic aldehydes, using piperidine as base in refluxing ethanol, providing compounds with a good yield ranging from 65% to 77%. The *in vitro* cytotoxic activity was performed by MTT assay against two human carcinoma cell lines: NCI-H292 (obtained from mucoepidermoid carcinoma of lung) and HEP-2 (obtained from epidermoid carcinoma of the larynx). The tests were conducted at concentrations of 10, 5, 2.5 and 1.25 $\mu\text{g}/\text{mL}$. Among the compounds tested 5-(4-dimethylamino-benzylidene)-4-thiazolidinone showed the best percentage of inhibition of cells with an IC_{50} of 1.74 $\mu\text{g}/\text{mL}$ for cell line NCI-H292. 4-Thiazolidinone compounds come in recent years with increasing attention to the scientific community. In this work we are highlighting the potential of this compound for anti-proliferative activity for NCI-H292 cells. This result is encouraging for further studies of the cytotoxic activity of 4-thiazolidinones.

Keywords: 4-thiazolidinone; anti-proliferative; benzylidene; cytotoxic





**III Workshop
Norte, Nordeste e
Centro-Oeste de
Síntese Orgânica**
Maceió, 25 a 26 de março de 2010

Tema:

Fronteiras da Síntese Orgânica

- Seminários
- Apresentação de Trabalhos Científicos
- Palestras com Pesquisadores Nacionais e Internacionais

Participe! Acesse o site abaixo e inscreva-se.

www.iqb.ufal.br/3wsoufal

Comissão Organizadora

Antônio Euzébio Goulart	IQB - UFAL
Carmem Lúcia de Paiva	IQB - UFAL
Dennis de Oliveira	IQB - UFAL
Marcelo Siqueira Valle	IQB - UFAL
Maria Cristina Caño	IQB - UFAL
Marília Oliveira Fonseca	IQB - UFAL
Sílvia Helena Cardoso	IQB - UFAL - Campus Arapiraca










arte: juliaojunior@gmail.com

Conference website: <http://www.evento.ufal.br/3wsoufal/index.html>