

Facing Chagas' Disease: Trypanocidal Properties of New Coumarin-chalcone Scaffolds

Por: [Vazquez-Rodriguez, S](#) (Vazquez-Rodriguez, Saleta)^[1]; [Guinez, RF](#) (Guinez, Roberto F.)^[2]; [Matos, MJ](#) (Matos, Maria J.)^[1]; [Olea-Azar, C](#) (Olea-Azar, Claudio)^[2]; [Maya, JD](#) (Maya, Juan D.)^[3]; [Uriarte, E](#) (Uriarte, Eugenio)^[1]; [Santana, L](#) (Santana, Lourdes)^[1]

MEDICINAL CHEMISTRY

Volumen: 12

Número: 6

Páginas: 537-543

DOI: 10.2174/1573406412666160107111809

Fecha de publicación: 2016

[Ver información de revista](#)

Resumen

With the aim of finding new chemical entities based on coumarin and chalcone scaffolds, new hybrid compounds 2-5 were designed and synthesized. The trypanocidal activity of these compounds was tested against the epimastigote, trypomastigote and amastigote stages of the *Trypanosoma cruzi* parasite. Cytotoxicity assays were also performed in RAW 264.7 and VERO cells. Compound 5 presented the highest trypanocidal activity of the series, with trypanocidal values higher than nifurtimox for the trypomastigote and epimastigote stages., but presenting cytotoxic effects in the mammalian cells. A SAR study suggested that methoxy substitution at positions 2 and 5 in the designed scaffold seemed to be a key feature for the trypanocidal activity. Therefore, the coumarin-chalcone scaffold can be taken into account for further lead optimization and design new and more effective trypanocidal compounds.

Palabras clave

Palabras clave de autor: [Chagas disease](#); [Chalcone](#); [Coumarin](#); [Cytotoxicity](#); [Natural products](#); [Structure-activity relationship](#); [Trypanosoma cruzi](#)

KeyWords Plus: [TRYPANOSOMA-CRUZI](#); [ANTILEISHMANIAL ACTIVITY](#); [MEDICINAL CHEMISTRY](#); [DERIVATIVES](#); [ANTIOXIDANT](#); [BENZNIDAZOLE](#); [COMPLEXES](#); [MECHANISM](#); [TOXICITY](#); [ASSAY](#)

Información del autor

Dirección para petición de copias: Vazquez-Rodriguez, S (autor para petición de copias)

+ Univ Santiago Compostela, Fac Pharm, Dept Organ Chem, Campus Vida S-N, Santiago De Compostela 15782,

Direcciones:

+ [1] Univ Santiago Compostela, Fac Pharm, Dept Organ Chem, Campus Vida S-N, Santiago De Compostela 15

+ [2] Univ Chile, Fac Chem & Pharmaceut Sci, Dept Inorgan & Analyt Chem, Casilla 233, Santiago, Chile

+ [3] Univ Chile, Fac Med, Dept Mol & Clin Pharmacol, Av Libertador Bernardo OHiggins 1058, Santiago, Chile

Direcciones de correo electrónico: svre77@gmail.com

Financiación

Entidad financiadora	Número de concesión
Foundation for Science and Technology (FCT) of Portugal	PEst-C/QUI/UI0081/2013
FONDECYT	1150175 1130189
Xunta de Galicia	ED481B 2014/027-0
CONICYT-Chile	21100132 24121574
Fundacao para a Ciencia e Tecnologia (FCT)	SFRH/BPD/95345/2013
POPH (Programa Operacional Potencial Humano)	SFRH/BPD/95345/2013
QREN (Quadro de Referencia Estrategica Nacional)	SFRH/BPD/95345/2013

[Ver texto de financiación](#)

Editorial

BENTHAM SCIENCE PUBL LTD, EXECUTIVE STE Y-2, PO BOX 7917, SAIF ZONE, 1200 BR SHARJAH, U ARAB EMIRATES

Categorías / Clasificación

Áreas de investigación: Pharmacology & Pharmacy

Categorías de Web of Science: Chemistry, Medicinal

Información del documento

Tipo de documento: Article

Idioma: English

Número de acceso: [WOS:000385568700005](#)

ISSN: 1573-4064

eISSN: 1875-6638

Información de la revista

- Impact Factor: [Journal Citation Reports®](#)

Otra información

Número IDS: DZ0ZR

Referencias citadas en la Colección principal de Web of Science: **30**

Veces citado en la Colección principal de Web of Science: **0**