تصميم، تخليق، والتقييم الحيوي لمشتقات البنزوفينون هايدرازون كمثبطات لانزيم الفسفوانوسيتايد-3- كاينز الفا

إعداد

براءه أحمد خلف الازايدة

المشرف

د. ديما عزام صبّاح

المشرف المشارك

أ.د. غسان أبو شيخة

الملخص

الفسفوانوسيتايد-3- كاينز الفا (PI3Kα) هو هدف واعد لتصميم الأدوية المضادة للسرطان. بناءً على ذلك لقد تم تصنيع سلسلة من بنزين سلفونوهيدرازيد "ثنائي فينيل ميثيلين" وتميزت باستخدام FT-IR وجهاز (H^1 NMR و C^{13}) .

أظهرت المركبات المستهدفة نشاطًا مضادًا ضد سرطان خلايا القولون البشري (HCT-116)، أظهرت المشتقات المصممة (p-NO_2 و p-CF_3) نشاطًا مثبطًا أعلى، حيث استنتجت أن المجموعة الساحبة للالكترون و / أو الرابطة الهيدروجينية على موقع بارا تظهر القابلية لتربط PI3Kα بشكل كبير.

على النقيض من ذلك ، فإن النشاط التثبيطي لمركبات الاورثو يبرز من خلاله أن الرابطة الدهنية المحاطة بها ومع ذلك ، فإن مركبات الميتا تفسر أن التأثير الاستاتيكي يعزز تفاعل الارتباط. توضح نتائج النمذجة و الدراسات الارتباطية تجاه PI3Kα أن السلسلة تسكن جيب الربط PI3Kα وتقترح أن يكون التفاعل الأروماتى قائدا للارتباط ligand / PI3Kα.