



## Presentaciones en carteles 39

## Derivados de la quinoxalina: evaluación de sus potenciales sobre *Leishmania amazonensis*.

### Quinoxaline derivatives: evaluation of their potential against *Leishmania amazonensis*.

### Derivados da quinoxalina: avaliação do seu potencial sobre *Leishmania amazonensis*.

Galina I. Buravchenko<sup>I</sup>, Alexander M. Scherbakov<sup>II</sup>, Andrey E. Shchekotikhin<sup>I</sup>, Lianet Monzote Fidalgo<sup>III</sup>.

#### RESUMEN

**Introducción:** Los fármacos actuales para el tratamiento de la leishmaniosis son tóxicos, caros y los casos de recaídas han aumentado. Es por ello, que la búsqueda de nuevas alternativas terapéuticas constituye una necesidad.

**Objetivos:** El objetivo de este trabajo es evaluar la actividad anti-leishmanial de derivados de la quinoxalina utilizando diferentes modelos.

**Método:** Para ello, se determinó la actividad y citotoxicidad *in vitro* de los compuestos estudiados sobre promastigotes de *L. amazonensis* y macrófagos peritoneales de ratón BALB/c, respectivamente. En paralelo, utilizando modelos computacionales, se analizó si cumplían la regla de Lipinski.

**Resultados:** En los estudios *in vitro*, 80 % (n=12) de los compuestos evaluados fueron capaces de inhibir el crecimiento del parásito con  $CI_{50}$  entre 7.5 y 85.5  $\mu$ M; aunque solamente dos de los derivados mostraron un índice de selectividad > 5. Todos los compuestos cumplieron con la regla de Lipinski.

**Conclusiones:** Este trabajo constituye una contribución a los resultados preclínicos básicos indispensables de actividad y selectividad que contribuyen a la búsqueda de tratamientos satisfactorios para pacientes infectados con *L. amazonensis*.

**Palabras claves:** *Leishmania amazonensis*, quinoxalina, actividad *in vitro*, regla de Lipinski.

<sup>I</sup> Gause Institute of New Antibiotics, Moscow, Russia.

<sup>II</sup> Blokhin N.N. National Medical Research Center of Oncology, Moscow, Russia.

<sup>III</sup> Instituto de Medicina Tropical Pedro Kourí, La Habana, Cuba.

#### Correspondencia:

Lianet Monzote Fidalgo  
monzote@ipk.sld.cu  
monzote@hotmail.com

#### Este artículo debe citarse como:

Buravchenko, B.I.; ScherbakovII, A.M.; Shchekotikhin, A.E. & Monzote Fidalgo, L. «Derivados de la quinoxalina: evaluación de sus potenciales sobre *Leishmania amazonensis*». UO Medical Affairs. 2025; 4(1): 120-121

## SUMMARY

**Introduction:** Current drugs for the treatment of leishmaniasis are toxic, expensive, and relapse rates have increased. Therefore, the search for new therapeutic alternatives is essential.

**Objective:** The objective of this study was to evaluate the antileishmanial activity of quinoxaline derivatives using different models.

**Method:** To this end, the *in vitro* activity and cytotoxicity of the studied compounds were determined on *L. amazonensis* promastigotes and peritoneal macrophages of BALB/c mice, respectively. In parallel, computational models were used to analyze whether they complied with Lipinski's rule.

**Results:** In *in vitro* studies, 80 % (n=12) of the evaluated compounds were able to inhibit parasite growth with IC<sub>50</sub>s ranging from 7.5 to 85.5  $\mu$ M; however, only two of the derivatives showed a selectivity index >5. All compounds complied with Lipinski's rule.

**Conclusions:** This work contributes to the essential basic preclinical activity and selectivity results that contribute to the search for satisfactory treatments for patients infected with *L. amazonensis*.

**Key words:** *Leishmania amazonensis*, quinoxaline, *in vitro* activity, Lipinski's rule.

## RESUMO

**Introdução:** Os medicamentos atuais para o trata-

mento da leishmaniose são tóxicos, caros e as taxas de recidiva aumentaram. É por isso que a busca por novas alternativas terapêuticas é uma necessidade.

**Objetivos:** O objetivo deste trabalho é avaliar a atividade antileishmaniana de derivados quinoxalínicos utilizando diferentes modelos.

**Método:** Para este propósito, a atividade *in vitro* e a citotoxicidade dos compostos estudados em promastigotas de *L. amazonensis* e macrófagos peritoneais de camundongos BALB/c foram determinadas, respectivamente. Paralelamente, utilizando modelos computacionais, analisou-se se estes atendiam à regra de Lipinski.

**Resultados:** Em estudos *in vitro*, 80% (n=12) dos compostos avaliados foram capazes de inibir o crescimento do parasita com IC<sub>50</sub> entre 7.5 e 85.5  $\mu$ M; embora apenas dois dos derivados tenham apresentado índice de seletividade > 5. Todos os compostos estavam em conformidade com a regra de Lipinski.

**Conclusões:** Este trabalho constitui uma contribuição aos resultados pré-clínicos básicos essenciais de atividade e seletividade que contribuem para a busca de tratamentos satisfatórios para pacientes infectados por *L. amazonensis*.

**Palavras-chave:** *Leishmania amazonensis*, quinoxalina, atividade *in vitro*, regra de Lipinski.

