

Dimitri STANICKI

Synthèse et sélection de nouveaux antipaludiques potentiels

RESUME

Quatre bisbenzamidines (**13-16**) articulées sur un motif éthylène-1,2-diamine, éventuellement substitué, ont été préparées en trois étapes. La première étape est commune et consiste en l'attaque de la diamine par deux équivalents de 4-fluorobenzonitrile. Les bisbenzonnitriles ainsi obtenus ont alors été convertis en bisbenzamidines soit par la réaction de Pinner (**13** et **15**), soit par réduction catalytique des bisbenzamidoximes correspondantes (**14** et **16**).

La 4-(4-phényl-1,4-pipérazinediyl)benzamidine **17** a également été obtenue par une réaction de Pinner. Les (4-aminophényl)-4-phénylpipérazine **19** et 1,4-bis(4-aminophényl)-pipérazine **18** ont été synthétisées par réduction des dérivés nitrés correspondants.

Parmi tous les composés préparés, les bisbenzamidines **13-16**, la benzamidine **17** et les dérivés aminés **18** et **19** sont capables de complexer l'hème en milieu abiotique neutre ou légèrement acide. Ils constituent donc des antipaludiques potentiels dont l'activité *in vitro* sera déterminée ultérieurement.

MOTS-CLES : paludisme, bisbenzamidine, hème, hémozoïne, complexe