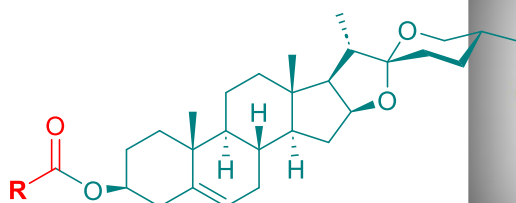


Pochodne diosgeniny, sposób ich otrzymywania i zawierające je środki farmaceutyczne

OPIS TECHNOLOGII

Przedmiotem technologii są pochodne diosgeniny, sposób ich otrzymywania i zawierające je środki farmaceutyczne. Wynalazek dostarcza szeregu nowych pochodnych diosgeniny o budowie hybrydowej, w których układ diosgeniny jest połączony poprzez atom tlenu w pozycji C-3 wiązaniem estrowym z odpowiednim ugrupowaniem acylowym, wywodzącym się z m.in. z α -aminokwasu, dipeptydu, kwasu karboksylowego.



PODSTAWOWE DANE

- ✓ BRANŻA: farmaceutyczna
- ✓ WŁASNOŚĆ: Łukasiewicz – Instytut Chemii Przemysłowej (Łukasiewicz – IChP) 100%
- ✓ FORMA OCHRONY: Pat. 240 834
- ✓ POZIOM GOTOWOŚCI WG TRL: 2/3
- ✓ ŹRÓDŁO FINANSOWANIA/ROK: badania statutowe IChP

ZASTOSOWANIE

Przedmiotem wynalazku jest również zastosowanie medyczne nowych pochodnych diosgeniny, które ze względu na korzystne właściwości fizykochemiczne i farmakologiczne, mogą stanowić składnik aktywny środków farmaceutycznych do leczenia lub zapobiegania różnym rodzajom nowotworów u człowieka, takich jak nowotwory głowy i szyi, sutka, szyjki macicy, prostaty, chłoniaki, mięsaki i gruczolaki. Natomiast pochodne diosgeniny, które wykazują działanie immunomodulacyjne, mogą odgrywać znaczącą rolę w leczeniu i zapobieganiu schorzeniom zakaźnym, zwłaszcza w dobie narastającej oporności drobnoustrojów i zwiększonej liczby pacjentów z obniżoną reaktywnością układu immunologicznego. Ponadto związki takie mogą być stosowane w leczeniu wielu chorób autoimmunologicznych, jak np. reumatoidalne zapalenie stawów, nieswoiste zapalenie jelit.

Pochodne diosgeniny, sposób ich otrzymywania i zawierające je środki farmaceutyczne

PRZEBIEG PROCESU

Proces otrzymywania nowych pochodnych diosgeniny, można podzielić na kilka etapów. W pierwszym etapie diosgeninę poddaje się acylowaniu N-zabezpieczoną pochodną pierwszego α -aminokwasu, po czym ewentualnie tak otrzymaną pochodną diosgeniny, po usunięciu grupy N-zabezpieczającej, ponownie poddaje się reakcji acylowania N-zabezpieczoną pochodną drugiego α -aminokwasu do otrzymania pochodnej dipeptydowej diosgeniny.

Na ostatnim etapie N-zabezpieczoną pochodną diosgeniny ewentualnie poddaje się oczyszczaniu i odbezpiecza się grupy funkcyjne aminokwasu lub dipeptydu znanymi metodami. W innym wariantcie diosgeninę poddaje się acylowaniu odpowiednimi kwasami karboksylowymi (kwas cynamonowy, kwas nikotynowy, kwas 4-acetylobenzoowy, kwas lewulinowy, kwas kawowy, kwas 4-hydroksybenzoowy i kwas 4-aminobenzoowy (PABA)) i po oczyszczeniu oraz ewentualnym odbezpieczeniu grup funkcyjnych uzyskuje się odpowiednie pochodne diosgeniny.

KONKURENCYJNOŚĆ

Rynek firm zajmujących się opracowaniem nowych substancji leczniczych charakteryzuje się ciągłą potrzebą rozwoju portfela produktów związaną m.in. z oczekiwaniem pacjenta dotyczącym nowych skuteczniejszych terapii, w tym terapii niwelujących zjawisko lekooporności leków obecnie stosowanych. Projektowanie i screening są na tyle kosztowne, że wiele innowacyjnych firm farmaceutycznych decyduje się na zakup licencji patentowych do dalszej weryfikacji przydatności danej grupy molekuł do rozwoju potencjalnego leku.

Po selekcji opartej na kolejnych etapach rozwoju produktu związki proponowane dopiero są tzw. Big Pharmie do przeprowadzenia metaanalizy kandydata na lek. Niniejsze rozwiązanie pozwala na uniknięcie badań wstępnych i wyselekcjonowanie związku wiodącego do dalszego rozwoju.

RYNEK/REFERENCJE

Choroby nowotworowe to dziś bardzo poważny problem cywilizacyjny. W Polsce, choroby nowotworowe są przyczyną ponad 20% wszystkich zgonów, a w 70% przypadków kończą się śmiercią pacjenta. Obecnie medycyna dysponuje setkami leków przeciwnowotworowych, które można zaliczyć do kilku głównych grup. Są: leki cytostatyczne, leki hormonalne, przeciwciała monoklonalne, leki działające pośrednio (tzw. modulatory odpowiedzi biologicznej), inhibitory onkogenów lub ich produktów. Wiele obecnie stosowanych leków przeciwnowotworowych charakteryzuje niewielka specyficzność względem komórek nowotworu.

W konsekwencji niszczeniu ulegają także komórki prawidłowe, a leczeniu towarzyszą dotkliwe skutki uboczne. Z tego powodu konieczne jest opracowanie nowych, skutecznych chemioterapeutyków. Analogi podlegające ochronie należą do pochodnych wtórnych metabolitów roślinnych, co jest jednym z wiodących kierunków w rozwoju leków oryginalnych. Klasa ta wzbudza szczególne zaufanie u potencjalnych pacjentów z uwagi na fakt, że wyciągi roślinne wykorzystywane są od lat w naturalnej medycynie, w terapii oraz prewencji schorzeń.