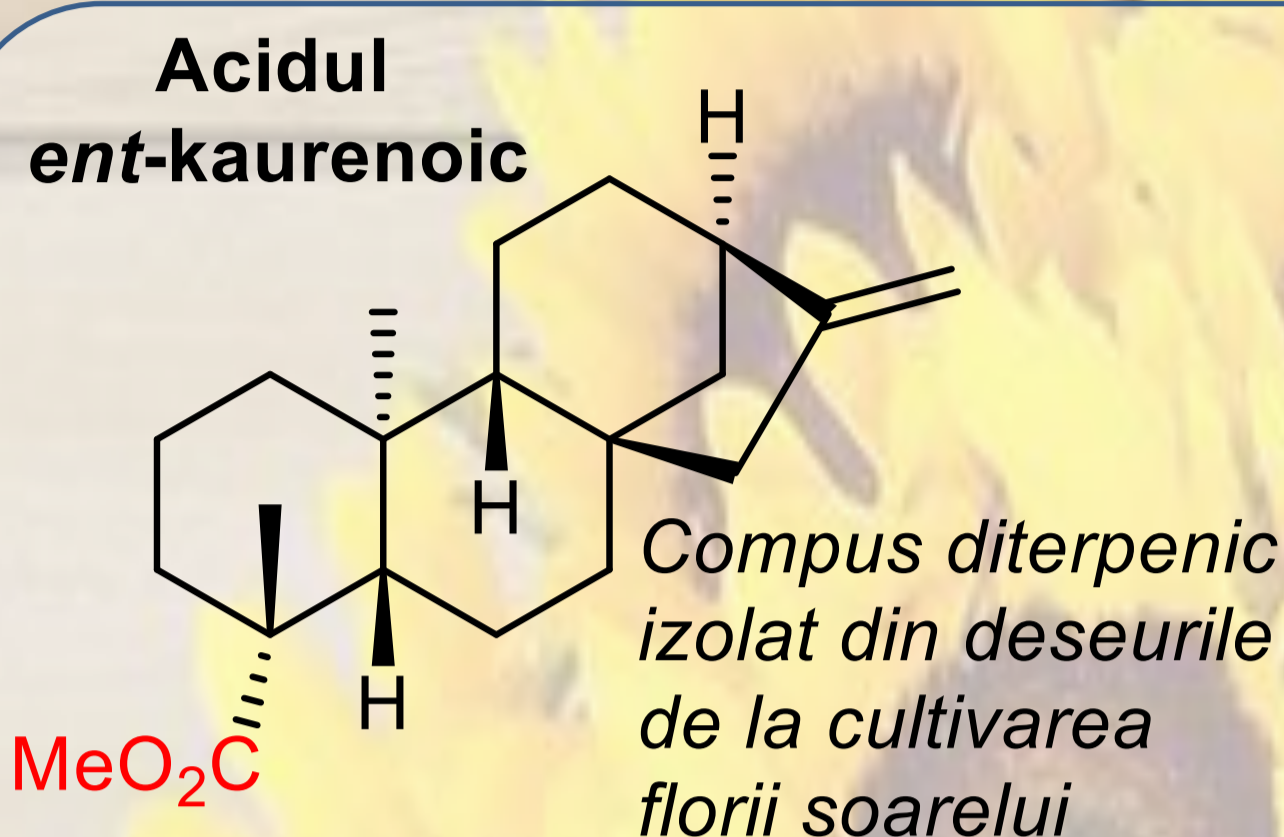


METIL ENT-15-HIDROXI-16-AZIDO-17-CARBOXIMETOXIMETILKAURANOAT CU ACTIVITATE CITOTOXICĂ SELECTIVĂ

Brevet de invenție MD 4785 (13) B1

Autori: Kulcițki Veaceslav, Gîrbu Vladilena, Pruteanu Elena, Renaud Philippe, Daelemans Dirk, Ungur Nicon
Universitatea de Stat din Moldova, Institutul de Chimie (MD), Katholieke Universiteit Leuven (BE), Universitat Bern (CH)



SCOPUL INVENȚIEI

Identificarea noilor derivați ai acidului ent-kaurenoic cu citotoxicitate selectivă față de tumorile maligne.

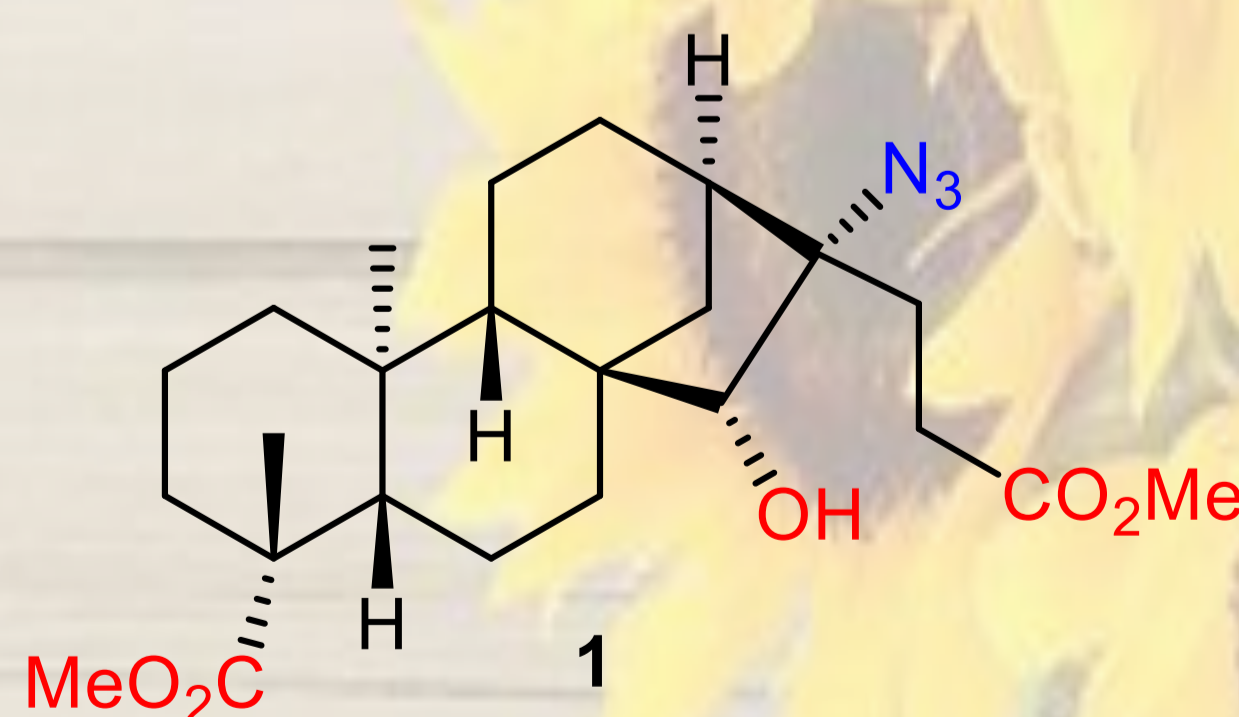
SOLUȚIA PROPUȘĂ

Invenția constă în sinteza chimică a unui derivat diterpenic cu structură ent-kauranică care manifestă citotoxicitate selectivă față de o serie de linii celulare tumorale umane și poate fi utilizat în calitate de agent chimioterapeutic pentru tratarea bolilor oncologice. În particular, este descrisă structura chimică și activitatea citotoxică a derivatului acidului ent-kaurenoic cu structura 1, care conține patru grupe funcționale heteroatemică, inclusiv o grupă funcțională azidă terțiară.



IC ₅₀ , μM								
hTERT RPE-1 Celule normale de retină	Capan-1 Adenocarcinomă pancreatică	Hap-1 Leucemie cronică mieloidă	HCT-116 Cancer de colon	NCI-H460 Cancer pulmonar	DND-41 Leucemie limfoblastică	HL-60 Leucemie	K-562 Leucemie cronică mieloidă	Z-138 Limfomă non-Hodgkin
25.9±0.3	8.3±1.1	40.4±8.6	9.9±2.7	0.6±0.2	6.6±1.3	41.1±15.9	36.9±0.2	21.6±5.4

Activitatea antiproliferativă a azidei ent-kauranice 1.



Etapa de elaborare

Teste de laborator
"in vitro".

AVANTAJE

- Materie primă ieftină, disponibilă din deșuri agricole;
- Procedură de sinteză simplă;
- Citotoxicitate selectivă la concentrații micromolare și sub-micromolare.

Invenția a fost realizată cu suportul financiar al ANCD în cadrul proiectului „Noi substanțe cu potențial preventiv și terapeutic în baza compușilor naturali de origine vegetală și a metodelor moderne de sinteză organică”, cifru 20.80009.8007.03.