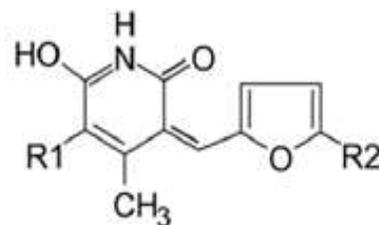


NEK6 KINASE INHIBITORS USEFUL FOR THE TREATMENT OF SOLID TUMORS

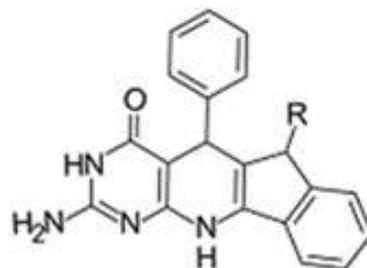
DESCRIZIONE

Le chinasi mitotiche che regolano la dinamica dei centrosomi e le funzioni del fuso mitotico sono potenziali target per la terapia antitumorale. Il team di ricerca identificato alcune molecole con attività inibitoria su NEK6 (serin treonin protein chinasi appartenente alla famiglia delle "NIMA-related kinase". Sono oggetto della presente invenzione tali molecole e le composizioni che le comprendono per uso come inibitori di NEK6 in un metodo di trattamento dei tumori sia in mono terapia che in combinazione con altri farmaci..

È stata innanzitutto esaminata la capacità d'inibire in vitro l'attività chinasi di NEK6 in diversi saggi d'inibizione e successivamente è stata dimostrata l'attività citotossica di tali inibitori su diverse linee cellulari tumorali di origine umana. Inoltre il composto C8 secondo la presente invenzione è stato saggiato in combinazione con altri farmaci chemioterapici su una linea di carcinoma ovarico mostrando un effetto sinergico. Sono state così individuate due famiglie di composti capaci d'inibire NEK6 e di inibire la crescita di linee cellulari tumorali. I composti identificati dalla presente invenzione potrebbero avere l'ulteriore vantaggio di migliorare l'efficacia terapeutica e ridurre gli effetti tossici. L'inibizione dell'attività di NEK6, infatti, potrebbe determinare un effetto citotossico selettivo sulle cellule neoplastiche e non sulle cellule normali.



A



B

Farmaco	IC50 (nM ± SEM)
Paclitaxel	7.0 ± 0.001
Paclitaxel+C8 (44 µM)	0.64 ± 0.057

Valori di IC50 per la combinazione Paclitaxel-composto 8 nelle PEO-1

Punti di forza e possibili applicazioni

Sono oggetto dell'invenzione i composti dotati di attività d'inibizione della proteina NEK6 aventi formula generale scelta tra le formule di struttura (A) o (B), definite loro enantiomeri, tautomeri sali, ed il loro uso nel trattamento di un tumore.

Un ulteriore oggetto della presente invenzione sono i composti aventi formula generale scelta tra le formule di struttura (A) o (B) come qui definite per uso come inibitori della proteina NEK6 in un metodo di trattamento, in particolare in un metodo di trattamento di un tumore.

Un ulteriore oggetto della presente invenzione sono composizioni farmaceutiche comprendenti le formule di struttura (A) o (B) come qui definite ed eccipienti farmaceuticamente idonei.

Stato di sviluppo

Il brevetto è collocabile nel mercato. I composti riportati necessitano di ulteriori studi per la valutazione di biodisponibilità e sicurezza. TLR3-TLR4 Tecnologia convalidata in laboratorio

Disponibile per

Ricerca, Sviluppo, Sperimentazione e Collaborazione.

KEYWORDS

- ☐ CHEMIOTERAPIA
- ☐ PROTEIN CHINASI
- ☐ TUMORI SOLIDI

AREA

- ☐ FARMACEUTICA

Inventori

Petrillo Marco
Righino Benedetta
Pirolli Davide
De Rosa M.Cristina
De Donato Marta
Gallo Daniela
Scambia Giovanni

Priorità

n. 10201800004177 del 03.04.2018
n. 10201800004172 del 03.04.2018

Tipologia Deposito

Brevetto per invenzione.

Titolarità:

Molipharma R&D srl - CNR

Settore industriale & commerciale di riferimento

Aziende biotecnologiche, aziende del settore diagnostico in vitro

CONTATTI

+39.0874.412101
alessia.camperchioli@molipharma.com

