

ÜSİMP ULUSAL PATENT FUARI '23

22-23 Kasım 2023

AKT İNHİBİSYONU ARACILIĞIYLA A549 HÜCRELERİNDE SİTOTOKSİK VE APOPTOTİK ETKİ GÖSTEREN YENİ TRIAZOL VE TRIAZOLOTİYADİAZİN TÜREVLERİ

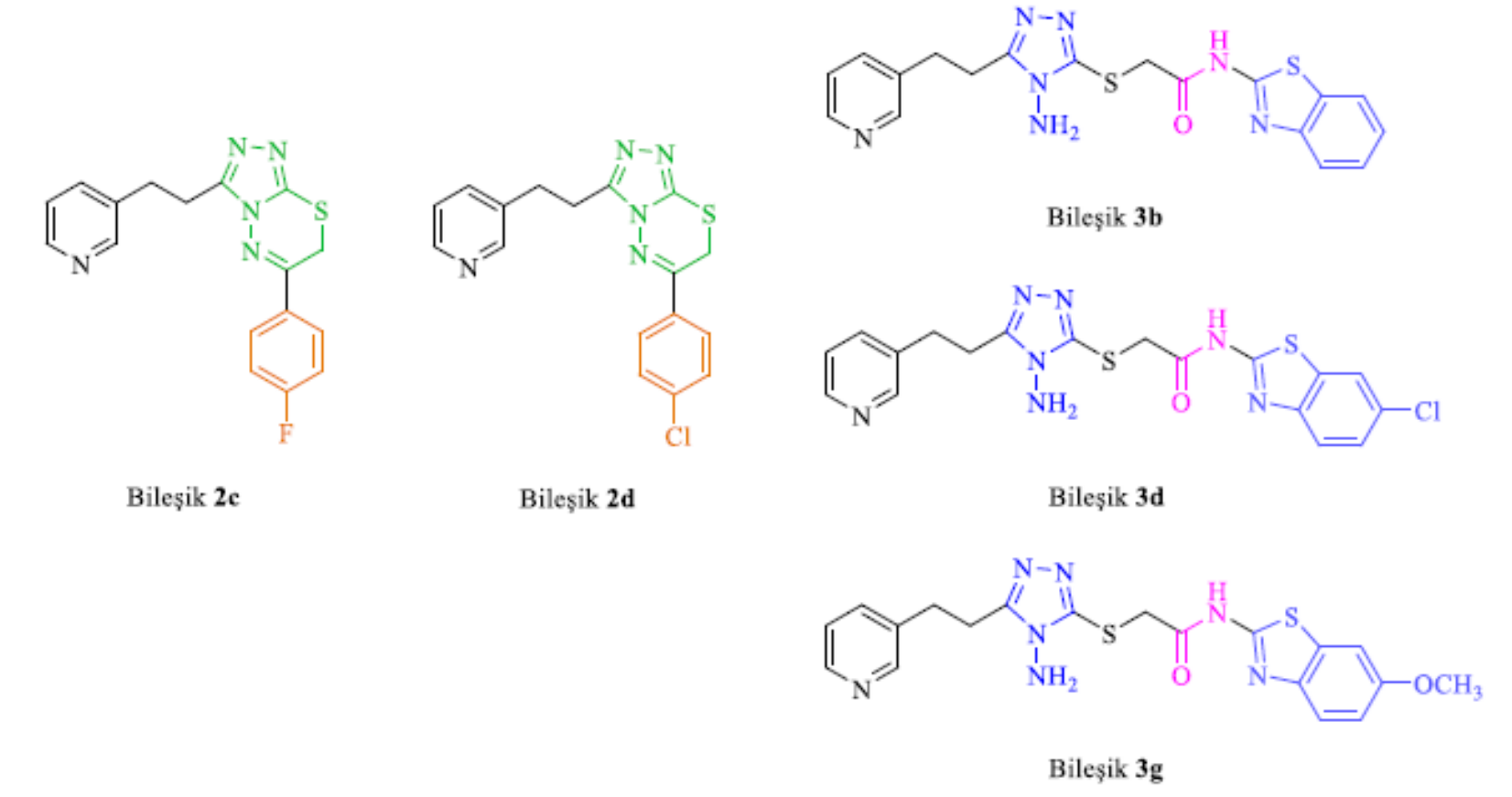
- **Sektör:** İlaç
- **Fikri Hak Koruma Durumu:** Ulusal Başvuru / Uluslararası PCT Başvurusu
- **Başvuru/Tescil Tarihi:** 30.06.2020
- **Koruma İstenen Ülkeler:** EP Tescil / Ulusal Tescil

ÖZET

Buluş, 10 adet yeni 1,2,4-triazolo[3,4-*b*]-1,3,4-tiyadiazin (**2a-j**) ve 7 adet yeni 1,2,4-triazol türevi (**3a-g**) bileşik ve bu bileşiklerin sentezi, *in vitro* antikanser etki çalışmaları ve moleküler docking ve *in silico* Absorpsiyon, Dağılım, Metabolizma ve Atılım (ADME) çalışmaları ile ilgilidir. Buluş bileşiklerinin çoğunun A549 insan akciğer adenokarsinom hücre dizisi üzerine cisplatinden (akciğer kanseri tedavisinde kullanılan antikanser ilaç) daha etkili olduğu bulunmuştur. Bu bileşiklerin apoptoz ve Akt inhibisyonu üzerine etkileri araştırılmıştır. **2c**, **2d**, **3b**, **3d** ve **3g** kodlu bileşiklerin A549 hücre dizisi üzerine sitotoksik ve apoptotik etkilerini Akt inhibisyonu yoluyla gösterdikleri tespit edilmiştir. **2d**, **3b**, **3d** ve **3g** kodlu bileşikler Akt inhibitörü GSK690693'den daha iyi Akt inhibitörü etki gösterirken, **2c** kodlu bileşik ise GSK690693'e benzer Akt inhibitörü etki göstermiştir. Moleküler docking çalışmalarına göre, bu bileşikler, Akt substrat bağlanma bölgesine yüksek affinite göstererek önemli amino asitlerle güçlü etkileşimler göstermişlerdir. Ayrıca Lipinski'nin beş kuralına ve Jorgensen'in üç kuralına göre, bu bileşiklerin oral biyoyararlanımlarının da iyi olması öngörülmektedir. *In vitro* ve *in silico* çalışmalar sonucu, **2c**, **2d**, **3b**, **3d** ve **3g** kodlu bileşikler, akciğer kanserinin hedefe yönelik tedavisi için potansiyel bileşikler olarak belirlenmiştir.

TANITIM

Buluş ile, akciğer kanserinin hedefe yönelik tedavisi için ilaç hazırlanmasında kullanılmak üzere, maliyeti düşük, oral yoldan kullanılma potansiyeline sahip, tümör hücrelerinde seçici antikanser etki gösteren yeni bileşikler tanımlanmıştır. Buluş bileşiklerinin ülkemizin ithalat bağımlılığını azaltma ve Türkiye ilaç sektörünün dünya üretim ve ihracatındaki payını artırma potansiyelinin bulunması önem arz etmektedir.



Beklenti

Buluşun lisans veya devir yolu ile ticerileştirilmesi planlanmaktadır.

Teknoloji Hazırlık Seviyesi

THS 4