República Federativa do Brasil
Ministério do Desenvolvimento, Indústria e do Comércio Exterior
Instituto Nacional da Propriedade Industrial.

(21) **PI0901157-9 A2**

(22) Data de Depósito: 27/03/2009
(43) Data da Publicação: 16/11/2010
(RPI 2080)

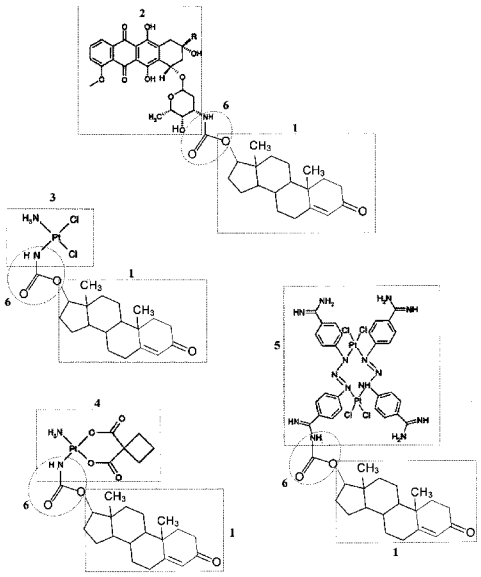
(51) Int.Cl.:
A61K 31/568
A61K 31/704
A61K 33/24
C07H 15/252
A61P 35/00

(54) Título: **COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA**

(73) Titular(es): Universidade Federal de Pernambuco

(72) Inventor(es): Gerson Silva Paiva

(57) Resumo: COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA. A presente invenção trata de um COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLASICO-TESTOSTERONA composto de uma cadeia molecular de testosterona (1), um fármaco antineoplásico e uma ponte molecular ou uma molécula. O presente composto está caracterizado por ser baseado em uma molécula de testosterona (1) unida quimicamente a um fármaco antineoplásico comercial, como a daunorrubicina ou doxorrubicina (2), cispiatina (3), carboplatina (4) ou cispíatina-berenil (5) por meio de uma ponte molecular do tipo carbamato (6) ou por uma molécula de N',N-disuccnimidil-carbonato (7). O complexo molecular é uma forma de "guiar" o fármaco anticâncer diretamente ao tumor, permitindo assim que o mesmo atue de forma seletiva na próstata, evitando assim efeitos em tecidos sadios uma vez que este tipo de câncer necessita de muita testosterona para se desenvolver.



PI0901157-9

COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA

A presente Patente de Invenção refere-se a "COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA", ou mais particularmente a um composto molecular capaz de atuar seletivamente no câncer de próstata sem danificar as células sadias.

O câncer de próstata é o mais freqüentemente diagnosticado e a segunda causa de óbito por câncer em homens no mundo. Atualmente são usados três métodos de privação androgênica no tratamento paliativo de câncer de próstata metastático: 1) castração cirúrgica por orquiectomia para remover os órgãos produtores primários de andrógenos; 2) castração clínica por terapia com estrogênio ou LHRH (hormônio de liberação de LH) para reduzir a produção de LH (hormônio luteinizante); 3) terapia antiandrogênica direcionada primariamente aos órgãos-alvos (ou seja, próstata e pontos metastáticos).

Por outro lado, os andrógenos (classe de moléculas, que incluem a testosterona e a progesterona, produzidas pelos testículos, ovários e glândulas supra-renais) entram em suas células-alvos por difusão passiva, existindo evidências de que certos tumores, como os de próstasta, possuem mecanismos que facilitam ou ativam o transporte de andrógenos. Por isso são chamados tumores dependentes de andrógenos.

Portanto, o objetivo da presente Patente de Invenção é propor uma forma de destruir o câncer de próstata metástico (aquele que se espalha, a partir da próstata, para outros órgãos dependentes de andrógenos, como os testículos e túbulos seminíferos) usando o próprio andrógeno como carreador do antineoplásico (no presente caso, a adriamicina, um fármaco anti-câncer comprovadamente eficaz no tratamento de vários tipos de cânceres). É uma forma de "enganar" o tumor, permitindo assim que o fármaco "drible" o processo MDR (de resistência multidroga) e atue de forma seletiva nos órgãos-alvos, uma vez que o câncer de próstata se necessita de muita testosterona para se desenvolver.

Para uma melhor compreensão do presente fármaco é feita a seguir uma descrição detalhada do mesmo, fazendo-se referência aos desenhos anexos, onde a:

Figura 1 representa a estrutura dos complexos moleculares que compõem o complexo molecular antineoplásico-testosterona;

Figura 2 representa as estruturas das subunidades moleculares que compõem o complexo molecular antineoplásico-testosterona;

De acordo com estas ilustrações e em seus pormenores, mais particularmente as figuras 1 e 2 a presente Patente de Invenção, "COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA" consta de uma cadeia molecular de testosterona (1) ligada quimicamente a um fármaco antineoplásico comercial, como a daunorrubicina ou doxorrubicina (2), cisplatina (3), carboplatina (4) ou cisplatina-berenil (5) por meio de uma ponte molecular do tipo carbamato (6) . O presente composto está caracterizado por ser baseado em uma molécula de testosterona (1) unida quimicamente a um fármaco antineoplásico comercial (2, 3, 4, 5) por meio de uma ponte carbamato (6).

Como se percebe após o que foi exposto e ilustrado, trata-se de um complexo molecular capaz de combater preferencialmente o câncer de próstata devido ao fato de o fármaco antineoplásico (de uso comercial) estar ligado a um hormônio, a testosterona, este último sendo o alimento do câncer e o carreador do fármaco.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA composto por uma cadeia molecular de testosterona, um fármaco antineoplásico e uma ponte molecular caracterizado por ser baseado na dita cadeia molecular de testosterona unida quimicamente ao fármaco por meio de uma ponte molecular.

2. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA conforme reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que o fármaco antineoplásico ser um fármaco comercial, como a daunorrubicina ou doxorrubicina (2), cisplatina (3), carboplatina (4) ou cisplatina-berenil (5).

3. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA conforme reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que a ponte molecular é o carbamato (6).

4. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA composto por uma cadeia molecular de testosterona, um fármaco antineoplásico e uma ponte molecular caracterizado por ser baseado na dita cadeia molecular de testosterona unida quimicamente ao fármaco por meio de uma molécula.

5. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA conforme reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que o fármaco antineoplásico ser um fármaco comercial, como a daunorrubicina ou doxorrubicina (2), cisplatina (3), carboplatina (4) ou cisplatina-berenil (5).

6. COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA conforme reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que a molecula é uma molécula de N',N-disuccnimidil-carbonato (7).

Fig. 1

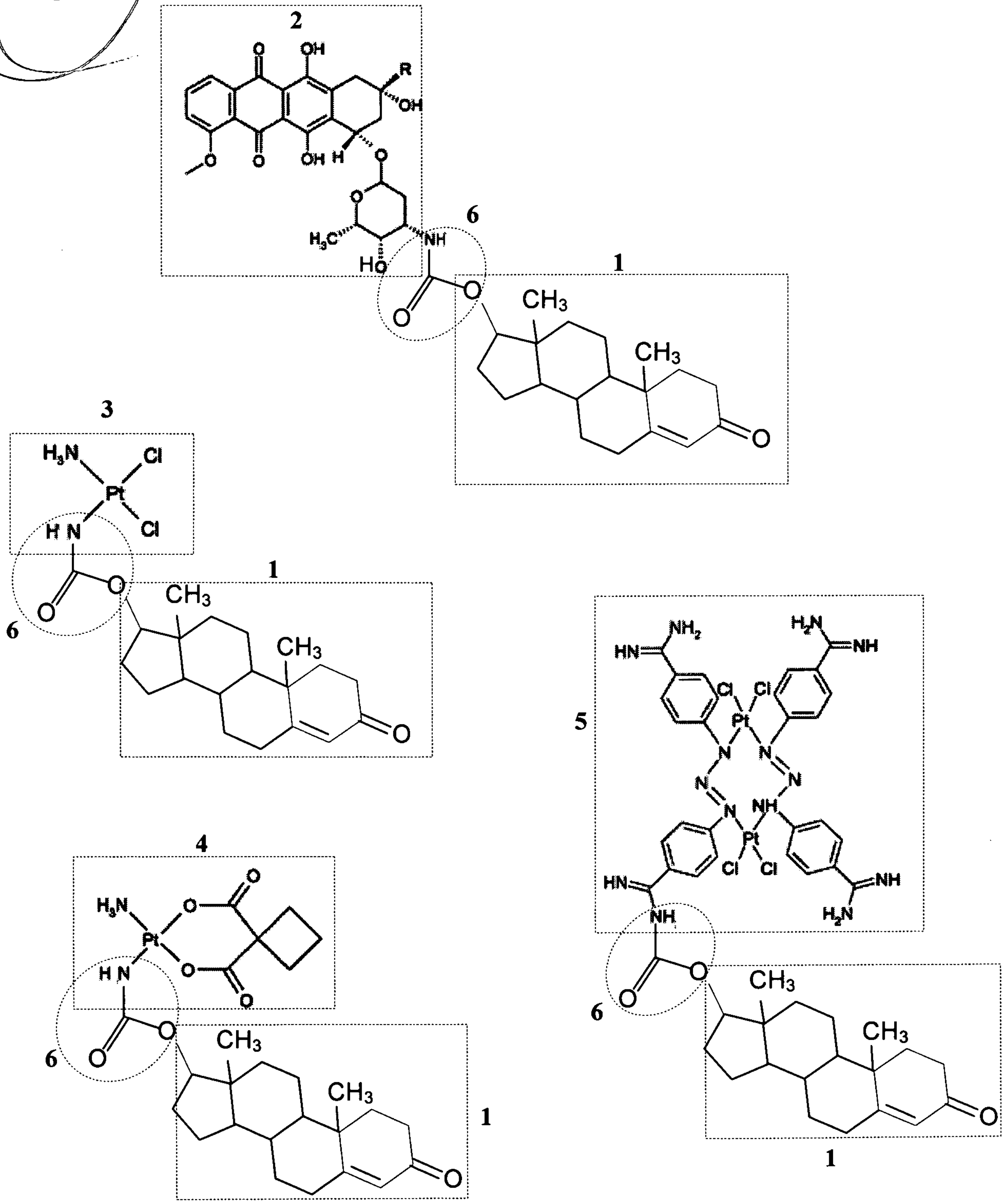
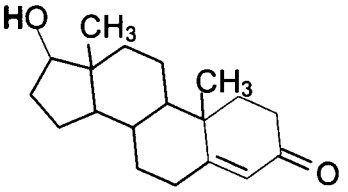
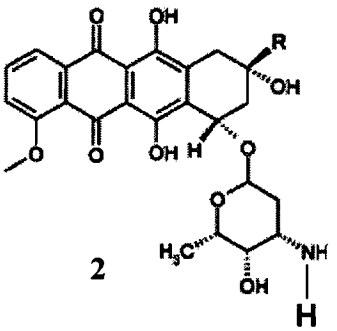


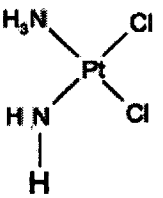
Fig. 2


HO
CH3
CH3
O

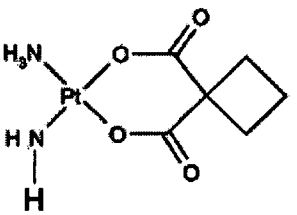
1


O
OH
R
OH
O
OH
H
O
O
H3C
NH
OH
H

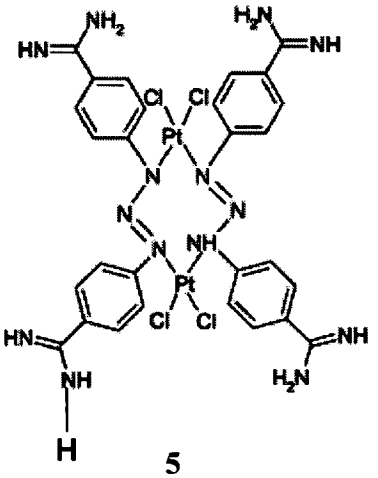
2


H3N
Cl
Pt
HN
Cl
H

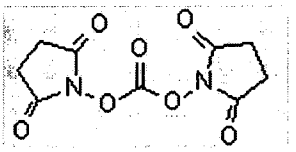
3


H3N
Pt
HN
H
O
O
O
O

4


NH2
HN
H2N
NH
Cl
Cl
Pt
N
N
N
N
N
NH
Pt
Cl
Cl
HN
NH
H
NH
H2N

5


O
O
O
N
O
O
N
O
O

7

PI0901157-9

COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA

RESUMO

A presente invenção trata de um COMPLEXO MOLECULAR ANTINEOPLÁSICO-TESTOSTERONA composto de uma cadeia molecular de testosterona (1), um fármaco antineoplásico e uma ponte molecular ou uma molécula. O presente composto está caracterizado por ser baseado em uma molécula de testosterona (1) unida quimicamente a um fármaco antineoplásico comercial, como a daunorrubicina ou doxorrubicina (2), cisplatina (3), carboplatina (4) ou cisplatina-berenil (5) por meio de uma ponte molecular do tipo carbamato (6) ou por uma molécula de N',N-disuccnimidil-carbonato (7).

O complexo molecular é uma forma de "guiar" o fármaco anticâncer diretamente ao tumor, permitindo assim que o mesmo atue de forma seletiva na próstata, evitando assim efeitos em tecidos sadios uma vez que este tipo de câncer necessita de muita testosterona para se desenvolver.