

# RESULTADO DE I+D

Patente

### **Ámbito Temático**

- Salud. Farmacología
- Química orgánica

### Colaboración

- Tecnología disponible para Licenciar
- Otras formas de colaboración

Ref. OTRI 201003R-Fustero, S.



Avda. Blasco Ibáñez, 13 46010 Valencia (España) Tel. +34 96 3864044 otri@uv.es www.uv.es/otri

© 2013 Universitat de València Documento NO Confidencial

# Agentes antituberculosos



## Etanolaminas difluorobencílicas con actividad antimicrobiana

### Inventores:

Santos Fustero (Unidad Mixta Universitat de València - Centro de Investigación Príncipe Felipe), Ana C. Cuñat, Sonia Flores y Claribel Báez (Universitat de València).

Antecedentes: Las bacterias patógenas de los géneros *Mycobacterium y Nocardia* están implicadas en enfermedades como tuberculosis, lepra y otras infecciones a nivel pulmonar, cutáneo o del sistema nervioso central. Concretamente *Mycobacterium tuberculosis (TB)* es la causante de la tuberculosis humana y responsable de casi dos millones de muertes por año en el mundo, siendo además uno de los patógenos oportunistas de mayor incidencia en pacientes con VIH+. Existen actualmente diversos compuestos activos contra la *TB*, como la isoniazida y la piracinamida, que afectan la síntesis de ácidos grasos por parte de la bacteria, o el etambutol que se encuentra implicado en los procesos de biosíntesis de la pared celular de la bacteria. No obstante, es una prioridad encontrar y desarrollar nuevos fármacos que acorten la duración de los tratamientos existentes y solucionen los problemas de resistencia de las drogas en uso.

La invención: Investigadores de la UV y de la Unidad Mixta UV - Centro de Investigación Príncipe Felipe han sintetizado nuevos compuestos que presentan actividad inhibitoria del crecimiento de especies de los géneros *Mycobacterium y Nocardia*. Los nuevos compuestos obtenidos pertenecen a la familia de las etanolaminas fluoradas, concretamente etanolaminas difluorobencílicas, y han demostrado *in vitro* una actividad antimicrobiana selectiva frente los mencionados microorganismos. Esta selectividad sugiere un mecanismo de acción específico sobre características especiales de estas especies. Además, las moléculas sintetizadas presentan valores de concentración mínima inhibitoria (CMI) similares o inferiores a los de un agente antituberculoso de primera línea como el etambutol, utilizado actualmente en el tratamiento de diversas formas de tuberculosis.

**Aplicaciones**: La principal aplicación de la tecnología es en el **sector farmacéutico**, como principio activo para el tratamiento de enfermedades infecciosas producidas por *Mycobacterium y Nocardia*.

Ventajas: Las principales ventajas aportadas por la invención son:

- Selectividad de las moléculas frente a especies de los géneros Mycobacterium y Nocardia.
- Potente actividad antimicrobiana in vitro, con valores de CMI similares o inferiores a los de agentes terapéuticos en uso como el etambutol.
- Mejora de la farmacodinámica de los compuestos potencialmente activos, debido a la estabilidad que aporta la agrupación difluorobencílica.
- Menor número de etapas sintéticas en el procedimiento de obtención de los cuatro diastereoisómeros posibles de las moléculas.



Ejemplo de actividad antimicrobiana in vitro de los nuevos compuestos frente a N. asteroides y N. farcinica