

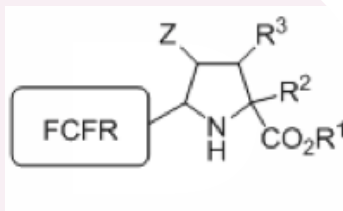
## NUEVA FAMILIA DE MOLÉCULAS PARA COMBATIR BACTERIAS, VIRUS Y CÁNCER

### DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

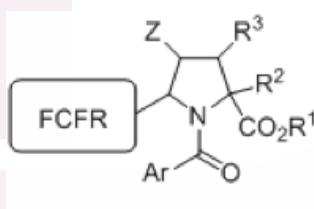
El grupo de investigación Procesos catalíticos en síntesis orgánica de la Universidad de Alicante ha desarrollado un novedoso procedimiento para sintetizar compuestos homólogos de nucleósidos (denominados azanucleósidos), que se caracterizan por ser potenciales agentes antibacterianos, antivíricos, antifúngicos y anticancerígenos (poseen una eficiente capacidad para intercalarse en las hebras de DNA y provocar inhibiciones en el desarrollo de las células tumorales). Se trata, por tanto, de una nueva batería de fármacos que minimiza la resistencia de los patógenos a los actuales tratamientos.

Este novedoso procedimiento se caracteriza por que comprende las siguientes etapas:

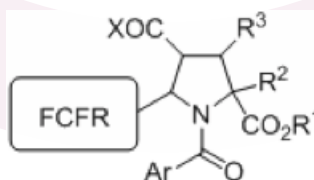
a) Obtención del siguiente compuesto intermediario a partir de la reacción de un derivado aldehídico de base nitrogenada (bases púricas y/o pirimidínicas) con un aminoéster y un dipolarófilo, bajo determinadas condiciones de reacción:



b) Reacción del compuesto obtenido en a) bajo determinadas condiciones de reacción con el objetivo de mejorar la solubilidad del siguiente compuesto intermediario en los sistemas vivos:

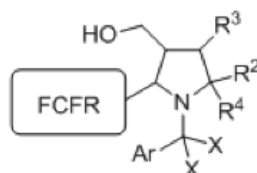


c) Hidrólisis de los ésteres de los compuestos obtenidos en b) a los correspondientes ácidos bajo determinadas condiciones de reacción, para obtener el siguiente compuesto intermediario:



d) Reducción quimioselectiva del compuesto obtenido en c) para obtener el compuesto de fórmula general descrito al principio de la descripción técnica.

Con este procedimiento se consiguen sintetizar compuestos cuya fórmula general es:



## NUEVA FAMILIA DE MOLÉCULAS PARA COMBATIR BACTERIAS, VIRUS Y CÁNCER

### SECTORES DE APLICACIÓN EMPRESARIAL

Esta tecnología pertenece al sector de la Salud.

La presente invención se enmarca dentro del campo de la Química Farmacéutica, y se refiere a un procedimiento de síntesis de compuestos homólogos de azanucleósidos y su uso en la elaboración de medicamentos para el tratamiento de:

- Enfermedades bacterianas (E. coli...).
- Enfermedades virales (por ejemplo: retrovirus como la hepatitis C, VIH, Herpes Simplex Virus...).
- Cáncer (por ejemplo, línea celular de cáncer de mama MCF-7...).

Esta familia de compuestos también se puede aplicar en agricultura (en tratamientos fitosanitarios, preferiblemente en infecciones causadas por hongos), y en la industria alimentaria (por ejemplo, para films de recubrimiento de alimentos con el fin de evitar su contaminación microbiana).

### VENTAJAS TÉCNICAS Y BENEFICIOS EMPRESARIALES

- La presente invención se refiere a la síntesis de compuestos homólogos de nucleósidos (denominados azanucleósidos) mediante una reacción 1,3-dipolar multicomponente, utilizando aldehídos que contienen una base púrica o pirimidínica, o un heterociclo relacionado con éstas (o bien él a partir del iminoéster), similares a los que se encuentran en el material genético de los seres vivos.
- Los compuestos finales y sus posibles derivatizaciones son totalmente novedosos, y en la mayor parte de los casos, los aldehídos no se han descrito en la bibliografía científica.
- Se trata, por tanto, de una nueva variante de fármacos que son, potencialmente, más letales que los actuales, y que dificultan los mecanismos de defensa de bacterias, virus y otros agentes patógenos (por ejemplo, hongos).
- Otra ventaja de estos nuevos productos consiste en la eficiente capacidad que tienen para intercalarse en las hebras de DNA y provocar inhibiciones en el desarrollo de las células tumorales.

### ESTADO DE DESARROLLO DE LA TECNOLOGÍA

El grupo de investigación Procesos catalíticos en síntesis orgánica de la Universidad de Alicante está formado por un equipo multidisciplinar comprometido en la búsqueda de las soluciones científico-tecnológicas más adecuadas para resolver los problemas y las necesidades técnicas relacionadas con la Química Farmacéutica.

En este sentido, ha sintetizado a nivel laboratorio los nuevos compuestos homólogos de azanucleósidos que tienen potencial como agentes antibacterianos, antivirales, antifúngicos y anticancerígenos.

Para comprobar la actividad de los compuestos obtenidos mediante el procedimiento aquí descrito, se han realizado una batería de ensayos preliminares con dichos compuestos (concretamente con derivados de 5-formiluracilo, glicinato de metilo y N-metilmaleimida). Se han obtenido los siguientes resultados:

## NUEVA FAMILIA DE MOLÉCULAS PARA COMBATIR BACTERIAS, VIRUS Y CÁNCER

- Reducción de Herpes Simplex Virus (HSV-1) un 15% a 50 µg/mL, CC50>200 µg/mL, EC50 36.
- Escherichia coli (E. coli), con una media de inhibición del 13% a 5.6 µM.
- Inhibición del crecimiento de la línea celular de cáncer de mama MCF-7 en un 8% a 1 mg/mL.

Además, el grupo de investigación dispone de una planta piloto que trabaja bajo la normativa ISO 9001:2000 en condiciones de completa trazabilidad (GMPs), y es posible el escalado a nivel pre-industrial e industrial.



*Instalaciones de la planta piloto*

### DERECHOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

Esta tecnología se encuentra protegida mediante solicitud de patente nacional:

- Título: "Procedimiento de síntesis de compuestos homólogos de azanucleósidos"
- Número de solicitud: P201300304.
- Fecha de solicitud: 27 de marzo de 2013.

### COLABORACIÓN BUSCADA

Se buscan empresas interesadas en adquirir esta tecnología para su explotación comercial mediante:

- Acuerdos de licencia de la patente.
- Búsqueda de oportunidades de financiación para desarrollar nuevas moléculas, nuevas aplicaciones, llevar a cabo el escalado industrial, adaptarlo a necesidades específicas de las empresas, etc.
- Acuerdos en materia de transferencia de conocimiento.

### CONTACTO COMERCIAL

Víctor Manuel Pérez Lozano  
SGITT-OTRI (Universidad de Alicante)  
Teléfono: +34 96 590 3467  
E-Mail: [otri@ua.es](mailto:otri@ua.es)