

PROCEDIMIENTO DE PREPARACIÓN ENANTIOSELECTIVA DE FÁRMACOS PROFENOS Y FENIDATOS

DESCRIPCIÓN DE LA TECNOLOGÍA

Investigadores de la Universidad Jaume I han desarrollado y patentado un nuevo procedimiento para la producción eficiente de formas enantiopuras de determinados fármacos de gran interés comercial. La invención constituye un método industrial para la síntesis enantioselectiva de fármacos antiinflamatorios, analgésicos y medicamentos para el tratamiento del déficit de atención por hiperactividad, en concreto, profenos y fenidatos. Este método permite la obtención sencilla y directa de formas enantiopuras de los fármacos quirales mencionados, mejorando así los rendimientos y limitando la generación de subproductos o residuos.

Los enantiómeros son dos formas isoméricas de una molécula quiral que son imágenes especulares entre sí pero no son superponibles. Ambas formas pueden estar presentes a la vez en un mismo fármaco, y pueden tener propiedades diferentes.

Los profenos, como el ibuprofeno, son fármacos muy comercializados. Sin embargo aunque solamente una de las formas enantioméricas es activa, algunos de los profenos como el ibuprofeno se comercializan como una mezcla de los dos enantiómeros; en otros casos se comercializa únicamente el enantiómero activo. En aquellos casos en que se comercializa la mezcla es porque el enantiómero que no es activo no es tóxico y porque no existen síntesis enantioselectivas industriales efectivas. Existe una necesidad de preparar fenidatos y profenos de forma enantioselectiva.

Se pueden observar diferentes tipos de situaciones en función de los efectos producidos por un fármaco quiral en el organismo. Existen fármacos quirales en los cuales cada una de sus formas enantiómeras puede provocar efectos opuestos en el organismo.

En otros casos el efecto es similar pero un enantiómero es más activo que otro. En otros casos un enantiómero es activo y el otro inactivo; y también puede ocurrir que un enantiómero tenga un efecto beneficioso mientras que el otro sea tóxico.

Dados los inconvenientes que en algunos casos puede suponer administrar ambas formas quirales de un mismo fármaco, la industria farmacéutica se ve obligada a nuevos pasos de síntesis que les permitan obtener la versión quiral deseada, prescindiendo de la otra versión inactiva, tóxica o ineficiente. Una forma habitual empleada por la industria para lograrlo es preparar el fármaco como racemato (mezcla de ambos enantiómeros) y después llevar a cabo una resolución que permita separar ambas formas quirales. Por ejemplo el dexmetilfenidato (focalin) se prepara por resolución. Sin embargo, la resolución tiene la limitación de que la mitad del producto se pierde.

La solución más eficiente sería que la síntesis fuera directamente enantioselectiva, sin necesidad de realizar un proceso añadido de separación posterior. Y esto es precisamente lo que ofrece la presente invención: un procedimiento aplicable a nivel industrial que permite sintetizar únicamente una de las formas enantiopuras de determinados fármacos quirales como son los profenos y los fenidatos.

Este procedimiento es más sencillo (pues prescinde de la resolución intermedia y, por tanto, elimina pasos de síntesis), permite aprovechar mejor las materias primas de partida y reduce la generación de residuos o subproductos. Además, a diferencia de otros métodos de síntesis enantioselectiva de profenos, el procedimiento desarrollado por la UJI no emplea reactivos sofisticados, con lo que facilita mucho su implantación a nivel industrial.

SECTORES DE APLICACIÓN EMPRESARIAL

La tecnología se dirige a la industria farmacéutica. Más específicamente, la invención es de aplicación para empresas dedicadas a la producción de principios activos y de fármacos antiinflamatorios, analgésicos y medicamentos indicados para el tratamiento del déficit de atención por hiperactividad (TDAH).

VENTAJAS TÉCNICAS Y BENEFICIOS EMPRESARIALES

La utilización de esta tecnología puede ser beneficiosa para las empresas del sector farmacéutico y de principios activos al proporcionar un procedimiento para la preparación de profenos y fenidatos de forma enantioselectiva a nivel industrial. Las principales ventajas de la invención son:

PROCEDIMIENTO DE PREPARACIÓN ENANTIOSELECTIVA DE FÁRMACOS PROFENOS Y FENIDATOS

- Permite obtener formas enantiopuras del fármaco sin necesidad de prepararlo como racemato (mezcla de ambos enantiómeros) y llevar a cabo después una resolución, con lo que no se pierde la mitad del producto y se simplifica el proceso de síntesis.
- Se trata de métodos de síntesis que no emplean reactivos sofisticados, lo cual facilita mucho su aplicación a nivel industrial.
- Al utilizarse pequeñas cantidades de catalizadores de transferencia de fase (tipo PTC), no se generan residuos tóxicos y se obtiene un producto final sin trazas de contaminantes de metales tóxicos.

ESTADO DE DESARROLLO DE LA TECNOLOGÍA

Validada a nivel experimental en entorno de laboratorio.

DERECHOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL E INTELECTUAL

Invencción protegida mediante patente española con referencia P201830342 y fecha de solicitud 05-04-2018.

COLABORACIÓN BUSCADA

- Acuerdo de licencia de uso, fabricación o comercialización.
- Desarrollo de aplicaciones.

IMÁGENES RELACIONADAS



DATOS DE CONTACTO

Hugo Cerdà
Oficina de Cooperación en Investigación y Desarrollo Tecnológico (OCIT)
Universitat Jaume I de Castelló
Tel: +34 964387487
e-mail: patents@uji.es
Web: <http://patents.uji.es>