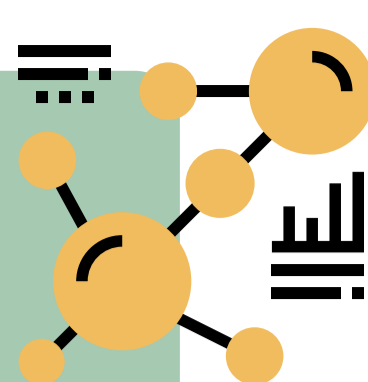


# “Suspensión de estructuras nanométricas cargadas con un derivado lactónico y método para obtener la misma”

MX/a/2020/007122



## Mérito técnico

Esta invención provee una suspensión de estructuras nanométricas cargadas con un derivado lactónico llamadas subag; dichas estructuras presentan una cobertura hidrofílica y un núcleo hidrofóbico. La suspensión de estructuras encapsula rapamicina o cualquier otro derivado lactónico macrocíclico como la eritromicina, claritromicina, azitromicina, diritromicina, roxitromicina, espiramicina y fidaxomicina, en virtud de que los macrólidos presentan un anillo lactónico macrocíclico al que se le unen desoxiazucares. La inclusión de cualquiera de estos compuestos en un subag, mejora diversos parámetros farmacocinéticos.

La suspensión de estructuras nanométricas cargadas con un derivado lactónico se obtiene mediante una trayectoria termodinámica con el objetivo de garantizar la reproducibilidad del método.

## Viabilidad industrial

Los procesos unitarios involucrados en este desarrollo son sencillos y ampliamente conocidos, tales como: mezclar, agitar, enfriar; lo cual es llevado a cabo en equipos de utilización común en la industria farmacéutica. El punto clave en este proceso es el conocer el orden de adición de los excipientes y principios activos, las relaciones de masa, los puntos de enturbiamiento y las temperaturas a manejar en las diferentes fases. Para esto será necesario hacer las pruebas de eficacia y estabilidad.



## Estado de la tecnología

El nivel de madurez de la tecnología de acuerdo con la escala de la NASA está en un TRL = 3. Se han llevado a cabo estudios a nivel laboratorio de caracterización instrumental, estudios de liberación, evaluación morfológica mediante pruebas microscópicas, cantidad de fármaco encapsulado y estudios de liberación *in vitro*.

Es necesario hacer pruebas comparativas con las formas farmacéuticas actuales y comprobar beneficios de la propuesta tecnológica, la cual técnicamente es atractiva pues no existen productos en el mercado con estas características. Sin embargo, es necesario hacer la evaluación completa a nivel clínico, para poder comprobar sus ventajas tecnológicas ya que hasta ahora sólo se han visto a nivel laboratorio.

## Potencial de la tecnología para generar valor

La presente invención provee una suspensión de estructuras nanométricas cargadas con un derivado lactónico macrocíclico para usarse en el tratamiento de Alzheimer. La rapamicina es un fármaco que promueve la autofagia de las proteínas no deseadas que se acumulan intra y extracelularmente en la enfermedad de Alzheimer, por lo que, con este sistema novedoso, se podrá elaborar un tratamiento efectivo vía intranasal.

El tratamiento de enfermedades del sistema nervioso central, es bastante complicado debido a la permeación altamente selectiva de la barrera hematoencefálica, la cual restringe la entrada de prácticamente cualquier sustancia hacia el cerebro, debido a esta problemática, la administración intranasal, un método no invasivo de administración, podría ser una alternativa para lograr un tratamiento efectivo a nivel cerebral.



## Ventajas en el mercado

De acuerdo con la información de la agencia de investigación de mercados Data Bridge, el mercado mundial de fármacos macrólidos (antibióticos) en 2019 fue de USD 4,000 millones y se espera que para el año 2026 se alcance una cifra de USD 9,930 millones. La tasa media de crecimiento anual para este mercado (TMCA) se prevé que será del 12% en el período 2019-2026.

Hay dos vías de administración de este tipo de medicamentos: la oral y la parenteral. Sus aplicaciones de mayor uso por su tipo de infección son: neumonía (*Mycoplasma pneumoniae*), fiebre de Pontiac (*Legionella sp.*), tosferina (*Bordetella pertussis*), enfermedad sintomática por arañazo de gato, bacilarangiomatosis, toxoplasmosis cerebral e infecciones de la piel.

Las empresas líderes en este mercado son: Merck & Co.(E.U.A), Pfizer Inc. (E.U.A), Sandoz International GmbH (Alemania), Teva Pharmaceutical Industries Ltd. (Israel), GlaxoSmithKline plc.(GB), Johnson & Johnson Services, Inc. (E.U.A), Bayer AG (Alemania), Abbott, Novartis AG (Suiza), Sanofi(Francia), AstraZeneca(GB), F. Hoffmann-La Roche AG (Suiza), Cempre, Inc. (E.U.A.), Zikani Therapeutics Inc. (E.U.A.), SM Biomed (Malasia), Barkat Pharmaceutical Group (Siria), Active Pharmaceutical Ingredient Manufacturing (India), Mustafa NevzatİllaçSanayii A.Ş. (Turquía), Zhejiang Guobang Pharmaceutical Co., Ltd. (China), Tianyin Pharmaceutical Co., Inc. (China), Japan Pharmaceutical Manufacturers Association(JPMA) (Japón) y Murli Krishna Pharma (India), entre otros.

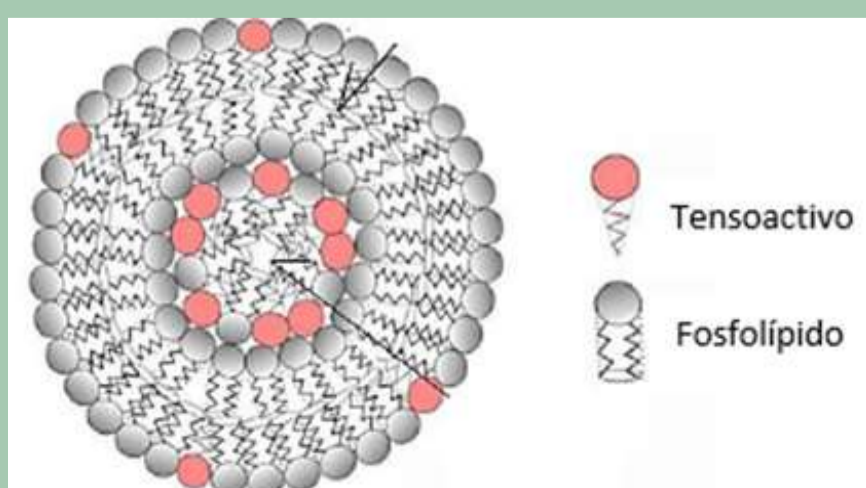
Por otro lado, de acuerdo con la agencia de investigación de mercados Transparency Market Research, el mercado del sirolimus (rapamicina), alcanzó en 2018 la cifra de USD 285 millones y se espera que para el año 2027 su crecimiento sea de USD 304 millones y una TMCA del 1% para el período 2018-2027.

La prescripción de sirolimus es para evitar el rechazo de órganos trasplantados, sobre todo el de riñón (93.75% del mercado) y la linfangioleiomiomatosis (6.25%). La presentación del producto pueden ser balones recubiertos o catéteres.

Las empresas líderes para este producto son: Pfizer, Inc. (E.U.A.), Biocon (India), Dr. Reddy's Laboratories Ltd. (India), Concept Medical, Inc. (E.U.A.), Stentys SA (Francia), Torrent Pharmaceuticals Ltd. (India), Zydus Cadila (India), and Intas Pharmaceuticals Ltd (India).

El valor del mercado para esta aplicación en 2019 fue de USD 4,288 millones, no existen datos del mercado mexicano en bases de datos secundarias abiertas.

## Imagen de la tecnología



Núcleo micelar mixto (formado por tensoactivos y fosfolípidos) rodeado por al menos una bicapa de fosfolípidos denotados como DPPC.