



BIS-INDOLES COMO PROTECTORES SOLARES

Solicitud de patente: Mx/a/2019/007726
(estatus: patente pendiente)



RESUMEN

En la presente invención se describe un compuesto de fórmula [1a] bI-H del tipo bisindol, el método de síntesis del compuesto, una composición farmacéutica o cosmética que lo comprende, y el uso del compuesto y la composición con fines de proporcionar protección ante la radiación UV o los rayos solares a un individuo humano. Mediante pruebas de fototoxicidad y citotoxicidad se demuestra la seguridad y eficacia del compuesto y una composición farmacéutica y/o cosmética, así como se destaca su ventaja de eficacia sobre un producto comercial ampliamente utilizado en la actualidad.

Dentro de estos métodos se encuentran los protectores o filtros solares los cuales incluyen compuestos fotoprotectores que pueden estar formulados en cualquier presentación cosmética como cremas, lociones, geles, ungüentos, pastas, aceites, aerosoles, entre otros, y son considerados productos OTC (*over-the-counter*) que son de libre venta. También pueden estar conformados como toallas húmedas, polvos, jabones corporales y champús, o incluso los compuestos fotoprotectores son incorporados en productos cosméticos como por ejemplo en agentes humectantes y bases faciales de maquillaje. Los filtros solares pueden ser de tres tipos de acuerdo a su modo de acción: físicos, biológicos y químicos. Los últimos son los más utilizados, ya que no presentan problemas para ser formulados, y consisten en moléculas orgánicas con grupos cromóforos en la región UV, de estructura electrónica resonante.

ANTECEDENTES E IMPORTANCIA

Recientemente, la humanidad se expone con mayor frecuencia a los rayos UV con fines recreativos y cosméticos. La exposición excesiva a los rayos UV pueden llevar a distintos problemas de salud incluyendo atrofia, cambios de en pigmentación, envejecimiento y tumoraciones. Incluso, la radiación UV es considerada como un carcinógeno, puede actuar como un mutágeno o un agente de daño inespecífico, y tiene la capacidad de iniciar y promover el crecimiento de tumores. Sin embargo, la radiación UV es un factor de riesgo ambiental que puede ser modificable a través de distintos métodos.

GRADO DE AVANCE

De acuerdo con los TRL definidos por la NASA, internacionalmente usados en el sector industrial para delimitar el grado de madurez de una tecnología, el presente desarrollo se encuentra en el nivel 4 de maduración. Se probó el efecto fotoprotector del compuesto FLS-3 y su formulación en una composición farmacéutica o cosmética y se realizaron pruebas de eficacia y seguridad a través de pruebas de fototoxicidad y citotoxicidad bajo buenas prácticas de laboratorio en la Unidad de Investigación Preclínica (UNIPREC).



BIS-INDOLES COMO PROTECTORES SOLARES

Solicitud de patente: Mx/a/2019/007726
(estatus: patente pendiente)



DESCRIPCIÓN DEL DESARROLLO

En la presente invención, se diseñaron, sintetizaron y evaluaron tres sistemas de moléculas de bisindol inspiradas en el producto natural de la caulerpina como sistemas fotoprotectores y fotosensibles.

También se describe en la presente invención una composición farmacéutica y/o cosmética que puede incluir los compuestos bisindoles fotoprotectores y se realizaron ensayos de citotoxicidad y fototoxicidad en células de fibroblasto de ratón (línea celular 3T3), un método alternativo para la evaluación de fototoxicidad (*in vitro* Techniques in Toxicology Invittox No. 44 del European Centre Validation Alternative Methods (ECVAM)), los cuales fueron previamente validados. Los ensayos de citotoxicidad y fototoxicidad cumplieron con los parámetros de reproducibilidad y repetibilidad, así mismo, los resultados obtenidos determinaron la ausencia de citotoxicidad y fototoxicidad a las dosis evaluadas.

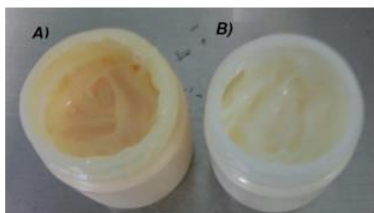


Figura. (A) Formulación con el compuesto FLS-3 al 1 % y (B) Formulación base

CAMPO DE APLICACIÓN

Derivado de la obtención y validación de la molécula fotoprotectora, se ha formulado una composición útil como protector solar, de bajo costo y amigable con el ambiente. La formulación es estable en relación a una formulación base la cual contiene carbómero, tween 80, aceite de almendras, glicerina, trietanolamina y agua destilada. Adicionalmente, la formulación es eficaz, segura y éticamente más responsables al haberse realizado las primeras pruebas de seguridad y eficacia sin emplear animales.

VENTAJAS COMPETITIVAS

Tanto la formulación como el compuesto bisindol demuestran eficacia y seguridad a través de pruebas de fototoxicidad y citotoxicidad, asegurando un mejor producto con mayor seguridad y éticamente más responsable (ECVAM). El fotoprotector del desarrollo presente tiene un efecto protector ante la radiación UV en menores concentraciones a diferencia de los protectores disponibles comercialmente. A diferencia de algunas formulaciones complejas, la composición propuesta en el presente desarrollo incluye 6 componentes comunes y de fácil acceso.