

# Nuovi composti per il trattamento del dolore acuto



**INVENTORI:** Katia Varani  
Flavia Varano  
Vittoria Colotta  
Daniela Catarzi  
Pier Andrea Borea  
Fabrizio Vincenzi

**CONTITOLARI:** Università degli Studi di Ferrara

**STATUS PATENT:** Concesso

**N° PRIORITÀ:** 102016000070952

**DATA DI CONCESSIONE:** 2 gennaio 2019

**ESTENSIONE:** EP3481836A1; EP3481836B1;  
IT201600070952A1; US2020308192A1; WO2018007957A1

## L'invenzione



L'invenzione consiste in una serie di nuovi composti per il trattamento del dolore acuto. Gli attuali approcci terapeutici per la gestione del dolore includono l'uso di oppioidi ai quali sono associati, come noto, molti effetti collaterali tra cui tolleranza e potenziale dipendenza. La presente invenzione è funzionale allo sviluppo di nuove strategie terapeutiche e nuovi farmaci non oppioidi per il trattamento del dolore.

L'invenzione descrive lo sviluppo di nuovi composti a struttura tiazolo[5,4-d]pirimidinica che risultano essere bloccanti del recettore A2A adenosinico e più potenti rispetto a quelli presenti già in commercio. Affinità e potenza dei composti sono state valutate tramite esperimenti di binding recettoriale e saggi di AMP ciclico. Da questi test risulta evidente che i nuovi composti hanno un'elevata affinità (ordine femtomolare) per il recettore A2A, associata a un'elevata potenza (ordine picomolare). Inoltre i nuovi derivati sono stati testati in modelli animali di dolore acuto, ampiamente utilizzati e validati, quali il writhing e il tail immersion test, e sono risultati efficaci in maniera simile o superiore alla morfina.

## Gli inventori



Prof.ssa Katia Varani, Ordinario di Farmacologia, Università di Ferrara



Prof. Pier Andrea Borea, Ordinario di Farmacologia, Università di Ferrara



Prof. Fabrizio Vincenzi, Associato di Farmacologia, Università di Ferrara



Prof. ssa Flavia Varano, Associato di Chimica Farmaceutica, Università di Firenze

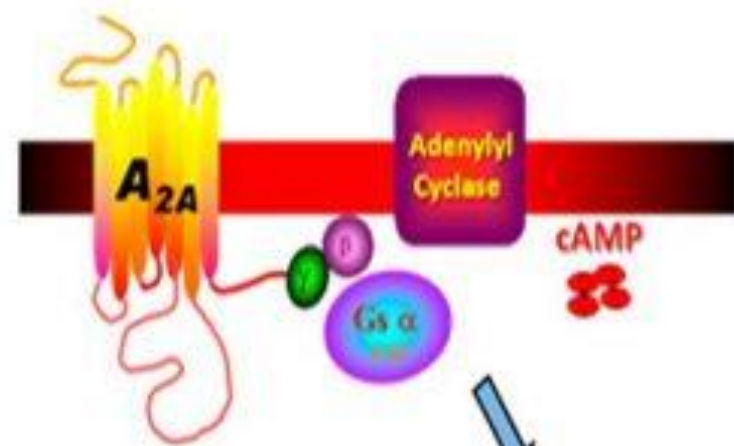


Prof. ssa Daniela Catarzi, Associato di Chimica Farmaceutica, Università di Firenze

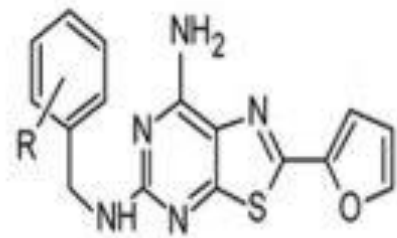


Prof. ssa Vittoria Colotta, Associato di Chimica Farmaceutica, Università di Firenze

# Immagini

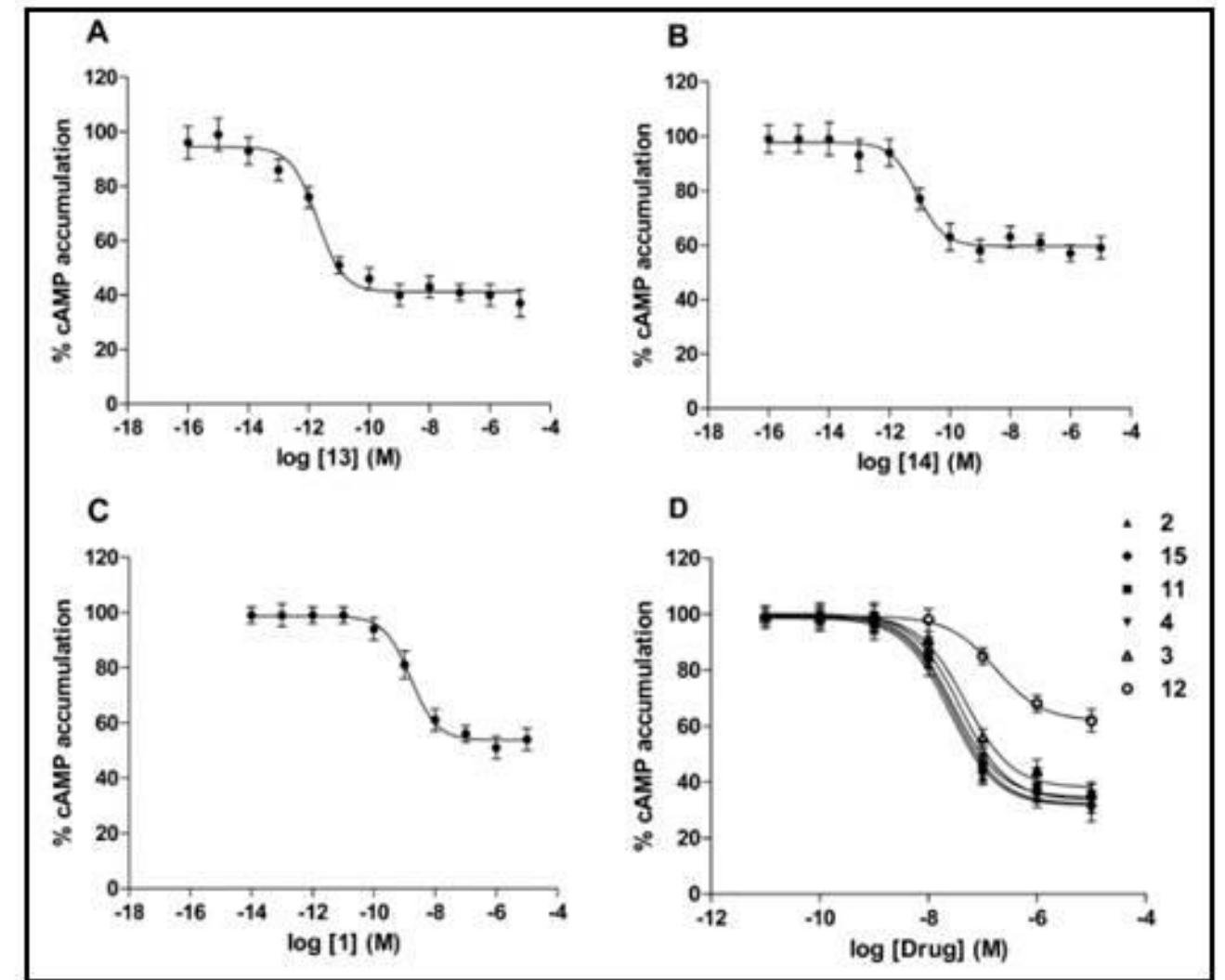


*inverse agonists*

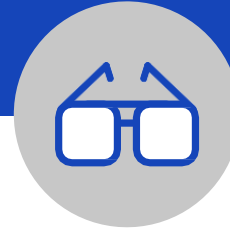


<b>13</b> R = 2-OCH <sub>3</sub>	<b>14</b> R = 3-OCH <sub>3</sub>
A <sub>2A</sub> : KH = 3.55 fM	A <sub>2A</sub> : KH = 5.31 fM
KL = 6.45 nM	KL = 26 nM

**Antinociceptive Effect**



# Applicabilità Industriale



La tecnologia brevettata è stata ideata per i seguenti campi di applicazione:

1. Trattamento del dolore acuto;
2. Trattamento dei processi infiammatori;
3. Trattamento delle fibrosi;
4. Trattamenti oncologici;
5. Trattamenti di patologie neurodegenerative.

Tra i vantaggi della tecnologia è possibile evidenziare che due composti tra i quelli oggetti di brevetto hanno mostrato, nei test funzionali di AMP ciclico, una potenza dell'ordine picomolare, superiore a quella di bloccanti del recettore A2A già commercialmente disponibili, con un'azione antinocicettiva uguale o maggiore rispetto alla morfina e al composto di riferimento nel writhing e nel tail immersion test.

## Possibili Evoluzioni



Il brevetto è disponibile per cessione a titolo definitivo, nonché per licenza esclusiva e non esclusiva. Le licenze sono disponibili per tutta la durata residua dei titoli brevettuali.

Il Gruppo di ricerca è disponibile per nuove attività di ricerca in collaborazione e conto terzi, approfondimenti tecnici, consulenze scientifiche, anche rivolte all'innalzamento del TRL della tecnologia.

Il TRL dell'invenzione è 3.

Per maggiori informazioni:



**Ufficio di Trasferimento Tecnologico dell'Università degli Studi di Firenze**

**Sede: Piazza S. Marco 4 – 50121 Firenze**

**Sito web: [www.unifi.it](http://www.unifi.it)**

**E-mail: [brevetti@unifi.it](mailto:brevetti@unifi.it)**

Per maggiori informazioni:



**Ufficio Regionale di Trasferimento Tecnologico**

**Sede: Via Luigi Carlo Farini, 8 50121 Firenze (FI)**

**E-mail: [urtt@regione.toscana.it](mailto:urtt@regione.toscana.it)**

