

Informe Sectorial COVID-19

Fármacos para tratamiento experimental

Información tecnológica
Instituto Nacional de la Propiedad Industrial
Septiembre 2020

José Luis Díaz Pérez
Presidente

Mónica Gay
Vicepresidenta

Guillermo Miguel Vispo
Subdirector de Gestión Digital e Información Tecnológica

Ing. Roberto Filini
Jefe de Búsquedas

Carolina Lunati / Pablo García Séleman
Fármacos - Examinadores de búsquedas - Área química

Informes Sectoriales

Publicaciones selectivas de alta calidad sobre distintos sectores productivos

El Servicio de Información Tecnológica elabora publicaciones electrónicas y sectoriales con información puntual, gratuita, esquemática y de rápida lectura.

En este contexto, cabe resaltar que los documentos de patentes son considerados como la fuente de Información Tecnológica más importante, y constituyen un estímulo de nuevas ideas y una respuesta a los problemas técnicos planteados. Asimismo, es considerada como la fuente de información más completa, accesible, práctica y actualizada sobre los desarrollos innovadores de todas las áreas tecnológicas, tanto nacionales como internacionales.

Contenido

Introducción	5
COVID-19	6
Glosario de Términos para este informe	8
Fármacos para el tratamiento experimental del COVID-19	10
Remdesivir	11
Cloroquina	18
Hidroxicloroquina	26
Ivermectina	40
Ivermectina – Complemento	58
Tocilizumab	60
Lopinavir – Ritonavir	67
Fuentes Consultadas	78

Introducción

Desde su aparición en China a finales de 2019, el virus COVID-19 ha generado una situación de salud extremadamente problemática a nivel mundial. Tanto es así que la Organización Mundial de la Salud (OMS) declaró el estado de pandemia en marzo de 2020. El motivo del presente trabajo es el de brindar un aporte a toda la sociedad, desde la perspectiva de la Propiedad Industrial, utilizando para ello la información contenida en los documentos de patentes.

Existen muchas tecnologías que están siendo empleadas para el tratamiento experimental de esta enfermedad, así como para la prevención, protección, aislamiento y recuperación de la población en general.

Entre tales tecnologías, mayormente contenidas y divulgadas en los documentos de patente, mencionaremos en este boletín algunos de los principios activos farmacológicos que están siendo usados para el tratamiento experimental de pacientes con COVID-19.

El importante papel que las patentes juegan en la transferencia de tecnología se ha puesto de manifiesto repetidamente por organizaciones internacionales, tales como la UNCTAD (Conferencia de Naciones Unidas de Comercio y Medio Ambiente) y la OMPI (Organización Mundial de Propiedad Intelectual).

Para entender el papel de las patentes como fuente de información tecnológica hay que recordar el doble objetivo que tiene el sistema de protección por medio de patentes. Por un lado, el de la protección misma, otorgándole al propietario de la patente un monopolio de explotación por un determinado período de tiempo y sobre un territorio dado. Para ello, el titular debe describir su invención con un detalle suficiente para que un experto medio en la materia pueda ejecutarla. De este modo, se cumple el segundo objetivo, que es el de aumentar el acervo científico y tecnológico de la sociedad, al publicar y divulgar por distintos medios las solicitudes de patentes.

La utilización de las patentes como fuente de información tecnológica proporciona información técnica, comercial y legal. Técnica porque describen la tecnología de forma clara y completa. Comercial porque contienen datos sobre la empresa que posee la titularidad del derecho y el (o los) inventores. Por último, legal al indicar cuál es el objeto protegido.

Las patentes contienen más del ochenta por ciento (80 %) de toda la información técnica mundial y constituyen un estímulo de nuevas ideas y una respuesta a los problemas técnicos planteados. Se las considera una de las fuentes de información más completa, accesible, práctica y actualizada sobre los desarrollos innovadores de todas las áreas tecnológicas. Las patentes son documentos de libre lectura y consulta. Para aquellas que están en vigor, la explotación comercial sin autorización del titular del derecho no está permitida en los países donde la protección esté vigente. En cambio, en los países donde no se ha solicitado protección o cuando haya expirado el plazo, las invenciones descritas en los documentos de patente son de libre uso.

Numerosos estudios han puesto de manifiesto el importante papel que las patentes juegan en la transferencia de tecnología. Ellas son documentos de información tecnológica completa al tener que describir, por imperativo legal, la invención de forma detallada para que esta se pueda replicar. Además, presentan una descripción del estado de la técnica, otorgándole al lector una visión más amplia de la tecnología en cuestión. Al identificar al inventor y al solicitante facilitan las negociaciones directas entre los interesados. En conclusión, las patentes son un buen instrumento de transferencia de tecnología, y la mayor parte de ellas son de dominio público.

En tal sentido, el objetivo del presente trabajo es el de identificar información de interés sobre patentes y solicitudes de patentes presentadas en Argentina para algunas de las alternativas más relevantes, que actualmente se utilizan en el tratamiento experimental de pacientes que han contraído COVID-19.

COVID-19

El brote actual del nuevo coronavirus COVID-19, también llamado SARS-Cov 2, que comenzó a finales de 2019, en la provincia china de Hubei, se ha extendido rápidamente alrededor del mundo. Es así que el 11 de marzo de 2020, la Organización Mundial de la Salud (OMS) declaró el estado de pandemia ante el incremento exponencial en la notificación de casos procedentes de diferentes y numerosos países.

Coronavirus: consideraciones generales

Los coronavirus conforman una familia de virus que afectan a los humanos, pero también a los animales. Fueron descubiertos por Tyrrell y Bynoe en 1966, quienes cultivaron en laboratorio los virus de pacientes con resfriados comunes.

Están conformados por una cadena sencilla de ARN (ácido ribonucleico) de sentido positivo (son monocatenarios) y que se encuentra unida a un cápside de proteína fosforilada. Son morfológicamente viriones esféricos con un núcleo central y proyecciones esféricas en forma de corona solar, de allí el nombre coronavirus.

Existen cuatro subfamilias de coronavirus: alfa, beta, gamma y delta. Mientras que las familias alfa y beta se originan en murciélagos; las familias gamma y delta se originan en aves y cerdos.

El tamaño del genoma varía entre 25 y 32 kb. La familia beta de los coronavirus puede producir enfermedades graves e incluso la muerte entre los humanos. El COVID-19 pertenece al tipo B de la familia beta de los coronavirus y está relacionado estrechamente con el virus SARS Cov.



Signos clínicos y recomendaciones

Inicialmente, el signo clínico de la enfermedad que permitió su detección fue la neumonía.

Los signos y síntomas de ésta son variados, entre ellos se destacan: anosmia repentina, fiebre por sobre los 38°C, tos, insuficiencia respiratoria, cefalea, diarrea y/o vómitos, entre otros.

Inicialmente, el signo clínico de la enfermedad que permitió su detección fue la neumonía.

Los signos y síntomas de ésta son variados, entre ellos se destacan: anosmia repentina, fiebre por sobre los 38°C, tos, insuficiencia respiratoria, cefalea, diarrea y/o vómitos, entre otros.

La enfermedad se propaga principalmente por contacto entre las personas a través de las gotículas que una persona infectada despidе al toser, estornudar o hablar. Si bien muchos individuos transitan la enfermedad de manera asintomática, igualmente pueden transmitir el virus a otras personas.

Se consideran como grupos de riesgo para la enfermedad a las personas mayores de sesenta (60) años y a las mujeres embarazadas. Sin embargo, existen enfermedades previas así como condiciones pre-existentes (ambas consideradas comorbilidades) que pueden agravar severamente el cuadro clínico del paciente, entre estas se destacan las enfermedades respiratorias, renales, hepáticas y cardíacas, así como también la obesidad y el tabaquismo. También son consideradas de mayor riesgo aquellas personas que por algún motivo se encuentren inmunosuprimidas.

Los mecanismos recomendados por la OMS para detener la transmisión del virus incluyen la higiene respiratoria y la higiene de manos, así como también mantener una distancia de al menos un metro entre las personas. En el caso de las personas con contagio confirmado, se recomienda el aislamiento del paciente infectado, realizando luego un nuevo test para constatar la disminución de la carga viral. También se aconseja un análisis y seguimiento de aquellos que han tenido contacto estrecho con los casos confirmados.

Siguiendo las recomendaciones de la Organización Mundial de la Salud, cada país y/o región generó sus propios protocolos de detección, aislamiento y tratamiento. Todos estos protocolos son dinámicos y se adaptan continuamente en función de los avances en las investigaciones de este nuevo virus y de la evolución de casos en cada región.

Glosario de términos para este informe

1

Patente: documento legal que concede a su titular el derecho exclusivo de controlar una invención, según se define en sus reivindicaciones, dentro de un territorio dado y por un plazo de tiempo limitado; impidiendo que terceros, entre otras cosas, fabriquen, usen o vendan la invención sin la autorización pertinente del titular.

2

Solicitud de Patente: una solicitud de patente está constituida por una descripción técnica, dibujos, reivindicaciones y otra documentación presentada ante una oficina de patentes. Si la oficina de patentes aprueba la solicitud, ésta se convierte en una patente

3

Reivindicación: las reivindicaciones definen el alcance de la protección legal suministrada por la patente.

4

Dominio Público: cuando expira el plazo de protección de una patente y su titular deja de tener los derechos exclusivos conferidos pasando a estar disponible para la explotación comercial por terceros interesados.

5

Denegada: cuando una solicitud de Patente no es aprobada.

6

Desistida: cuando el solicitante de una patente desiste de la prosecución del trámite.

Glosario de términos para este informe

- 7** **Abandonada:** cuando el titular de una solicitud de la patente abandona por motivos particulares su trámite.
- 8** **Fármaco:** principio activo químico o biológico contenido en una solicitud de patente.
- 9** **Fármacos para el tratamiento experimental del COVID-19:** principios activos químicos y/o biológicos desarrollados previamente, que se encuentran en pruebas para uso en el tratamiento experimental del COVID-19.
- 10** **Acción terapéutica primaria:** primera actividad aprobada para un principio activo en el tratamiento de una enfermedad determinada.
- 11** **Nombre IUPAC:** denominación dada a un compuesto químico por el sistema de nomenclatura de la Unión Internacional de Química Pura y Aplicada (IUPAC).
- 12** **Número CAS:** número de identificación que asigna la Sociedad Americana de Química a cada compuesto químico que se ha descrito en la literatura.

Fármacos para el tratamiento experimental del COVID-19

Remdesivir: análogo de adenosina que inhibe la acción de la ARN polimerasa.

- Número CAS: 1809249-37-3
- Nombre IUPAC:
(2S)-2-((2R,3S,4R,5R)-[5-(4-aminopirroló[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-ilmetoxi]fenoxi-(S)-fosforilamino) ácido propiónico 2-butyl éster
- Acción terapéutica primaria: antiviral

Cloroquina: compuesto de la familia de las 4-aminoquinolinas.

- Número CAS: 54-05-7
- Nombre IUPAC: (RS)-N-(7-cloroquinolin-4-il)-N,N-dietil-pentano-1,4-diamina
- Acción terapéutica primaria: antimalarico y antirreumático

Hidroxicloroquina: compuesto de la familia de las 4-aminoquinolinas, derivado de la cloroquina.

- Número CAS: 118-42-3
- Nombre IUPAC: (RS)-2-[[4-[(7-cloroquinolin-4-il)amino]pentil](etil)amino]etanol
- Acción terapéutica primaria: antimalarico y antirreumático

Ivermectina: mezcla de las lactonas macrocíclicas avermectina B1a y B1b.

- Número CAS: 70288-86-7
- Acción terapéutica primaria: antiparasitario

Tocilizumab: anticuerpo monoclonal humanizado.

- Número CAS: 70288-86-7
- Acción terapéutica primaria: antirreumático

Lopinavir/Ritonavir: son interferones en estudio en distintas fases clínicas que podrían inhibir la replicación viral.

Lopinavir

- Número CAS: 192725-17-0
- Nombre IUPAC:
(2S)-N-[(2S,4S,5S)-5-[(2-(2,6-dimetilfenoxi)acetil]amino]-4-hidroxi-1,6-difenilhexan-2il)-3-metil-2-(2-oxo-1,3-diazinan-1-il)butanamida
- Acción terapéutica primaria: antirretroviral

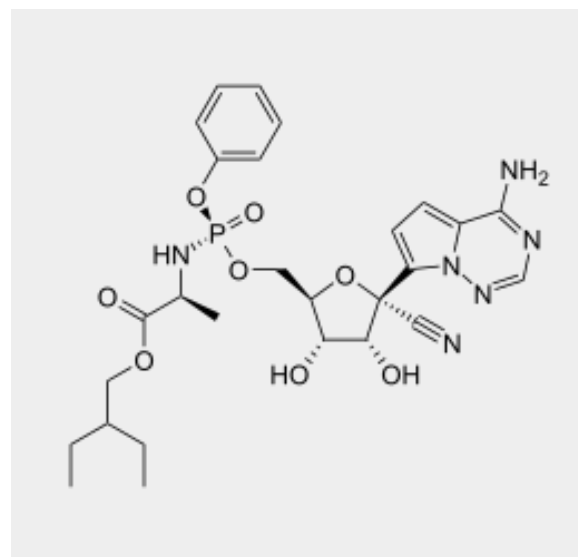
Ritonavir

- Número CAS: 155213-67-5
- Nombre IUPAC:
1,3-triazol-5-ilmetil-N-[(2S,3S,5S)-3-hidroxi-5-(((2S)-3-metil-2-[(metil-[(2-propan-2-il)-1,3-triazol-4-il)metil]carbamoil]amino]butanoil]amino)-1,6-difenilhexan-2-il]carbamato
- Acción terapéutica primaria: antirretroviral

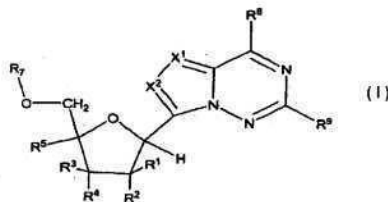
Remdesivir

El Remdesivir (GS5734) es un análogo de nucleósido con actividad antiviral que fue desarrollado por Gilead Science para el combate del Ébola y del virus de Marburgo, mostrando luego cierta efectividad contra otros virus ARN, como el virus Junin, el virus Lassa y el SARS coronavirus. Estudios preliminares indican que podría ser efectivo contra el COVID 19.

A fines de marzo del corriente año, la Organización Mundial de la Salud lanzó a nivel mundial un ensayo clínico sobre diferentes tratamientos contra el COVID-19, denominado "Solidaridad". El uso de remdesivir es uno de ellos y todavía se encuentra bajo estudio. En Argentina se encuentra concedida la patente del compuesto como AR071395B1, actualmente vigente.



ANÁLOGOS CARBA-NUCLEÓSIDOS 1'-SUSTITUIDOS PARA TRATAMIENTO ANTIVIRAL	
Publicación:	AR071395 (A1)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	CONCEDIDA (27/04/2017) VTO (22/04/2029)
Número de solicitud:	P20090101420 22/04/2009
Número(s) de prioridad:	US20080139449P 20081219 ; US20080047263P 20080423
Resumen de AR071395 (A1)	

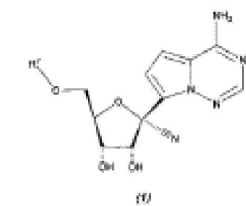
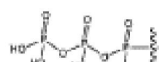
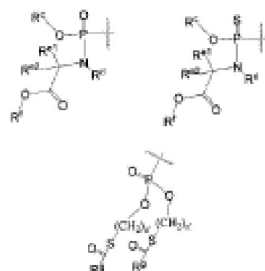


Los compuestos, composiciones, y métodos provistos son útiles para el tratamiento de infecciones virales por Flaviviridae, particularmente infecciones por hepatitis C. Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (1) o una de sus sales aceptables desde el punto de vista farmacéutico; en las cuales: cada R1, R2, R3, R4 o R5 es, en forma independiente, H, ORa, N(Ra)2, N3, CN, NO2, S(O)nRa, halógeno, alquilo C1-8, carbociclilalquilo C4-8, alquilo sustituido C1-8, alqueno C2-8, alqueno sustituido C2-8, alquino C2-8, alquino sustituido C2-8, o arilalquilo C1-8; o cualquiera de dos R1, R2, R3, R4 o R5 en átomos de carbono adyacentes cuando se toman juntos son -O(CO)O- o cuando se toman juntos con los átomos de carbono anulares a los cuales están unidos forman un enlace doble; R6 es ORa, N(Ra)2, N3, CN, NO2, S(O)nRa, C(=O)R11, -C(=O)OR11, -C(=O)NR11R12, -C(=O)SR11, -S(O)R11, -S(O)2R11, -S(O)(OR11), -S(O)2(OR11), -SO2NR11R12, halógeno, alquilo C1-8, carbociclilalquilo C4-8, alquilo sustituido C1-8, alqueno C2-8, alqueno sustituido C2-8, alquino C2-8, alquino sustituido C2-8, o arilalquilo C1-8 o R6 y cualquiera de R1 o R2 cuando se toman juntos son -O(CO)O-; cada n es, en forma independiente, 0, 1 o 2; cada Ra es, en forma independiente, H, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, arilalquilo C1-8, carbociclilalquilo C4-8, -C(=O)R11, -C(=O)OR11, C(=O)NR11R12, -C(=O)SR11, -S(O)R11, -S(O)2R11, -S(O)(OR11), -S(O)2(OR11), o -SO2NR11R12; R7 es H, -C(=O)R11, -C(=O)OR11, -C(=O)NR11R12, -C(=O)SR11, -S(O)R11, -S(O)2R11, -S(O)(OR11), -S(O)2(OR11), -SO2NR11R12, o un resto de fórmula (2); cada Y o Y1 es, en forma independiente, O, S, NR, +N(O)(R), N(OR), +N(O)(OR), o N-NR2; W1 y W2, cuando se toman juntos, son -Y3(C(Ry)2)3Y3-; o uno de W1 o W2 junto con cualquiera de R3 o R4 es -Y3- y el otro de W1 o W2 es de fórmula (3); o W1 y W2 son cada uno, en forma independiente, un grupo de la fórmula (3), en las cuales: cada Y2 es, en forma independiente, un enlace, O, CR2, NR, +N(O)(R), N(OR), +N(O)(OR), N-NR2, S, S-S, S(O), o S(O)2; cada Y3 es, en forma independiente, O, S, o NR; M2 es 0, 1 o 2; cada Rx es, en forma independiente, Ry o el resto de fórmula (4) en las cuales: cada M1a, M1c, y M1d es, en forma independiente, 0 o 1; M12c es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12; cada Ry es, en forma independiente, H, F, Cl, Br, I, OH, R, -C(=Y1)R, -C(=Y1)OR, C(=Y1)N(R)2, -N(R)2, +N(R)3, -SR, -S(O)R, -S(O)2R, -S(O)(OR), -S(O)2(OR), -OC(=Y1)R, -OC(=Y1)OR, -OC(=Y1)N(R)2, SC(=Y1)R, -SC(=Y1)OR, -SC(=Y1)N(R)2, -N(R)C(=Y1)R, -N(R)C(=Y1)OR, -N(R)C(=Y1)N(R)2, -SO2NR2, -CN, -N3, -NO2, -OR, o W3; o cuando se toman juntos, dos Ry en el mismo átomo de carbono forman un anillo carbocíclico de 3 hasta 7 átomos de carbono; cada R es, en forma independiente, H, alquilo C1-8, alquilo sustituido C1-8, alqueno C2-8, alqueno sustituido C1-8, alquino C1-8, alquino sustituido C1-8, arilo C6-20, arilo sustituido C6-20, heterociclilo C2-20, heterociclilo sustituido C2-20, arilalquilo o arilalquilo sustituido; W3 es W4 o W5; W4 es R, -C(Y1)Ry, -C(Y1)W5, -SO2Ry, o -SO2W5; y W5 es un carbociclo o un heterociclo en el cual W5 está, en forma independiente, sustituido con 0 hasta 3 grupos Ry; cada X1 o X2 es, en forma independiente, C-R10 o N; cada R8 es halógeno, NR11R12, N(R11)OR11, NR11NR11R12, N3, NO, NO2, CHO, CN, -CH(=NR11), -CH=NHR11, -CH=N(OR11), -CH(OR11)2, -C(=O)NR11R12, C(=S)NR11R12, -C(=O)OR11, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, carbociclilalquilo C4-8, arilo sustituido en forma opcional, heteroarilo sustituido en forma opcional, C(=O)-alquilo C1-8, -S(O)n-alquilo C1-8, arilalquilo C1-8, OR11 o SR11; cada R9 o R10 es, en forma independiente, H, halógeno, NR11R12, N(R11)OR11, NR11NR11R12, N3, NO, NO2, CHO, CN, -CH(=NR11), CH=NHR11, -CH=N(OR11), -CH(OR11)2, -C(=O)NR11R12, -C(=S)NR11R12, -C(=O)OR11, R11, OR11 o SR11; cada R11 o R12 es, en forma independiente, H, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, carbociclilalquilo C4-8, arilo sustituido en forma opcional, heteroarilo sustituido en forma opcional, -C(=O)-alquilo C1-8, -S(O)n-alquilo C1-8 o arilalquilo C1-8; o R11 y R12 tomados juntos con un nitrógeno al cual ambos están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros donde cualquier átomo de carbono de dicho anillo heterocíclico puede reemplazarse en forma opcional con -O-, -S- o -NRa-; donde cada alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8 o arilalquilo C1-8 de cada R1, R2, R3, R4, R5, R6, R11 o R12 es, en forma independiente, sustituido en forma opcional con uno o más halo, hidroxilo, CN, N3, N(Ra)2 o ORa; y donde uno o más de los átomos de carbono no terminales de cada uno de dicho alquilo C1-8 es reemplazado en forma opcional con -O-, -S- o -NRa-.

MÉTODOS PARA TRATAR INFECCIONES POR EL VIRUS FILOVIRIDAE

Publicación:	AR102467 (A1)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20150103505 29/10/2015
Número(s) de prioridad:	US201462072331P 20141029 ; US201562105619P 20150120

Resumen de AR102467 (A1)

Grupo (R⁷)Grupo (R⁹)

Se proporcionan compuestos, métodos y composiciones farmacéuticas para tratar infecciones por el virus Filoviridae,

administrando ribósidos, fosfatos de ribósido, y profármacos del mismo. Los compuestos, composiciones y métodos provistos son particularmente útiles para el tratamiento de infecciones por el virus de Marburg, virus de Ebola y virus Cueva.

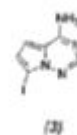
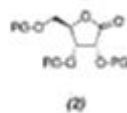
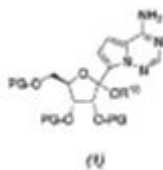
Reivindicación 1: Un método para tratar una infección por Filoviridae en un humano que necesita del mismo que comprende administrar una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de fórmula (1) o una sal, hidrato o éster farmacéuticamente estable, del mismo; en donde, R⁷ se selecciona del grupo que consiste en a) H, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), o -SO₂NR¹¹R¹², b) un resto del grupo de fórmulas (2), c) un resto del grupo de fórmulas (3), en donde: R^c se selecciona del grupo de fenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, un resto de fórmula (4) y un resto de fórmula (5); R^d se selecciona del grupo de H o CH₃; R^{e1} y R^{e2} se seleccionan cada uno independientemente del grupo de H, alquilo C₁₋₆ o bencilo; R^f se selecciona del grupo de H, alquilo C₁₋₈, bencilo, cicloalquilo C₃₋₆, y -CH₂-cicloalquilo C₃₋₆; R^g se selecciona del grupo de alquilo C₁₋₈, -O-alquilo C₁₋₈, bencilo, -O-bencilo, -CH₂-cicloalquilo C₃₋₆, -O-CH₂-cicloalquilo C₃₋₆, y CF₃; y n es un entero seleccionado del grupo de 1, 2, 3, y 4; y d) un grupo de fórmula (6), en donde Q se selecciona del grupo de O, S, NR, *N(O)(R), N(O), *N(O)(O), o N-NR₂; Z¹ y Z², cuando se toman juntos, son -Q¹(C(R^v)₂)₃Q¹- en donde cada Q¹ se selecciona independientemente del grupo de O, S, o NR; y cada R^v se selecciona independientemente del grupo de H, F, Cl, Br, I, OH, R, -C(=Q²)R, -C(=Q²)O, -C(=Q²)N(R)₂, -N(R)₂, -N(R)₃, -SR, -S(O)R, -S(O)₂R, -S(O)(O), -S(O)₂(O), -OC(=Q¹)R, -OC(=Q¹)O, -OC(=Q²)(N(R)₂), -SC(=Q²)R, -SC(=Q²)O, -SC(=Q²)(N(R)₂), -N(R)C(=Q²)R, -N(R)C(=Q²)O, -N(R)C(=Q²)N(R)₂, -SO₂NR₂, -CN, -N₃, -NO₂, -O, o Z³; o cuando se toman juntos, dos R^v sobre el mismo átomo de carbono forman un anillo carbocíclico de 3 a 7 átomos de carbono; cada Q² es independientemente, O, S, NR, *N(O)(R), N(O), *N(O)(O), o N-NR₂; o Z¹ y Z² son cada, independientemente, un grupo de fórmula (7) en donde: cada Q³ se selecciona independientemente del grupo de un enlace, O, CR₂, NR, *N(O)(R), N(O), *N(O)(O), N-NR₂, S, S-S, S(O), o S(O)₂; M₂ es un entero seleccionado del grupo de 0, 1 ó 2; cada R^x es independientemente R^y o la fórmula (8) en donde: cada M_{1a}, M_{1c}, y M_{1d} es un entero independientemente seleccionado del grupo de 0 ó 1; M_{12c} es un entero seleccionado del grupo de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 ó 12; Z³ es Z⁴ o Z⁵; Z⁴ es R, -C(Q²)R^y, -C(Q²)Z⁵, -SO₂R^y, o -SO₂Z⁵; y Z⁵ es un carbociclo o un heterociclo en donde Z⁵ está sustituido independientemente con 0 a 3 grupos R^y; cada R¹¹ o R¹² es independientemente H, alquilo C₁₋₈, alquenilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, arilo C₆₋₂₀ opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, -C(=O)alquilo C₁₋₈, -S(O)□-alquilo C₁₋₈ o arilo C₆₋₂₀alquilo C₁₋₈; o R¹¹ y R¹² tomados juntos con un nitrógeno al que están ambos unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros en donde cualquier átomo de carbono de dicho anillo heterocíclico se puede reemplazar opcionalmente con -O-, -S- o -NR^a; cada R^a se selecciona independientemente del grupo de H, alquilo C₁₋₈, alquenilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, arilo C₆₋₂₀ alquilo C₁₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, -C(=O)R, -C(=O)O, -C(=O)NR₂, -C(=O)SR, -S(O)R, -S(O)₂R, -S(O)(O), -S(O)₂(O), o -SO₂NR₂; en donde cada R se selecciona independientemente del grupo de H, alquilo C₁₋₈, alquilo C₁₋₈ sustituido, alquenilo C₂₋₈, alquenilo C₂₋₈ sustituido, alquinilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈ sustituido, arilo C₆₋₂₀, arilo C₆₋₂₀ sustituido, heterociclilo C₂₋₂₀ heterociclilo C₂₋₂₀ sustituido, arilo C₆₋₂₀alquilo C₁₋₈ o arilo C₆₋₂₀alquilo C₁₋₈ sustituido; cada n es un entero independientemente seleccionado del grupo de 0, 1, ó 2; y en donde cada alquilo C₁₋₈, alquenilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, arilo C₆₋₂₀alquilo C₁₋₈ de cada R¹¹ o R¹² está, independientemente, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo de halo, hidroxilo, CN, N₃, N(R^a)₂ o OR^a; y en donde uno o más de los átomos no terminales de carbono de cada dicho alquilo C₁₋₈ se pueden reemplazar opcionalmente con -O-, -S- o -NR^a.

MÉTODOS PARA LA PREPARACIÓN DE RIBÓSIDOS

Publicación:	AR102468 (A1)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20150103506 29/10/2015
Número(s) de prioridad:	US201462072331P 20141029 ; US201562105619P 20150120

Resumen de AR102468 (A1)

Reivindicación 1: Un método para preparar un compuesto de fórmula (1), el método comprende: formar una mezcla de reacción que comprende un agente de acople, un halo-silano, un compuesto de fórmula (2), y un compuesto de fórmula (3), bajo condiciones apropiadas para preparar el compuesto de fórmula (1), en donde cada PG es independientemente un grupo protector hidroxilo; alternatively, dos grupos PG sobre carbonos adyacentes se pueden combinar para formar un grupo $-C(R^{19})_2-$; R^{10} es H o un grupo sililo; y R^{19} es H, alquilo C_{1-8} , fenilo o fenilo sustituido.

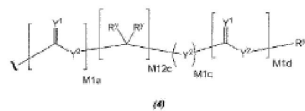
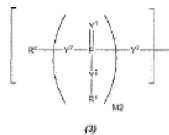
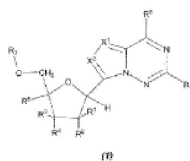


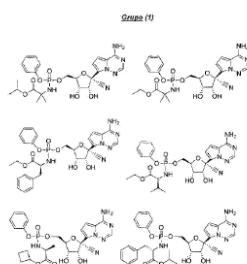
ANÁLOGOS CARBA-NUCLEÓSIDOS 1 -SUSTITUIDOS PARA TRATAMIENTO ANTIVIRAL

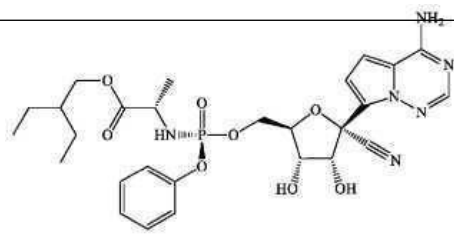
Publicación:	AR107618 (A2)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20170100362 14/02/2017
Número(s) de prioridad:	US20080047263P 20080423

Resumen de [AR107618 \(A2\)](#)

Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (1), o una de sus sales aceptables desde el punto de vista farmacéutico; en las cuales: cada R¹, R², R³, R⁴, o R⁵ es, en forma independiente, H, OR^a, N(R^a)₂, N₃, CN, NO₂, S(O)□R^a, halógeno, alquilo C₁₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, alquilo sustituido C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alqueno sustituido C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, alquinilo sustituido C₂₋₈, o arilalquilo C₁₋₈; o cualquiera de dos R¹, R², R³, R⁴, o R⁵ en átomos de carbono adyacentes cuando se toman juntos son -O(CO)O- o cuando se toman juntos con los átomos de carbono anulares a los cuales están unidos forman un enlace doble; R⁶ es OR^a, N(R^a)₂, N₃, CN, NO₂, S(O)□R^a, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹², halógeno, alquilo C₁₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, alquilo sustituido C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alqueno sustituido C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, alquinilo sustituido C₂₋₈, o arilalquilo C₁₋₈ o R⁶ y cualquiera de R¹ o R² cuando se toman juntos son -O(CO)O-; cada n es, en forma independiente, 0, 1, ó 2; cada R^a es, en forma independiente, H, alquilo C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, arilalquilo C₁₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), o -SO₂NR¹¹R¹²; R⁷ es H, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)R¹¹, -S(O)₂R¹¹, -S(O)(OR¹¹), -S(O)₂(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹², o un compuesto de fórmula (2); cada Y o Y¹ es, en forma independiente, O, S, NR, *N(O)(R), N(OR), *N(O)(OR), o N-NR₂; W¹ y W², cuando se toman juntos, son -Y³(C(R^v)₂)₃Y³⁻; o uno de W¹ o W² junto con cualquiera de R³ o R⁴ es -Y³⁻ y el otro de W¹ o W² es de fórmula (3); o W¹ y W² son cada uno, en forma independiente, un grupo de la fórmula (3), en las cuales: cada Y² es, en forma independiente, un enlace, O, CR₂, NR, *N(O)(R), N(OR), *N(O)(OR), N-NR₂, S, S-S, S(O), o S(O)₂; cada Y³ es, en forma independiente, O, S, o NR; M₂ es 0, 1 ó 2; cada R^x es, en forma independiente, R^y o la fórmula (4), en las cuales: cada M_{1a}, M_{1c}, y M_{1d} es, en forma independiente, 0 ó 1; M_{12c} es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 ó 12; cada R^v es, en forma independiente, H, F, Cl, Br, I, OH, R, -C(=Y¹)R, -C(=Y¹)OR, -C(=Y¹)N(R)₂, -N(R)₂, *N(R)₃, -SR, -S(O)R, -S(O)₂R, -S(O)(OR), -S(O)₂(OR), -OC(=Y¹)R, -OC(=Y¹)OR, -OC(=Y¹)(N(R)₂), -SC(=Y¹)R, -SC(=Y¹)OR, -SC(=Y¹)(N(R)₂), -N(R)C(=Y¹)R, -N(R)C(=Y¹)OR, -N(R)C(=Y¹)N(R)₂, -SO₂NR₂, -CN, -N₃, -NO₂, -OR, o W³; o cuando se toman juntos, dos R^v en el mismo átomo de carbono forman un anillo carbocíclico de 3 hasta 7 átomos de carbono; cada R es, en forma independiente, H, alquilo C₁₋₈, alquilo sustituido C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alqueno sustituido C₁₋₈, alquinilo C₁₋₈, alquinilo sustituido C₁₋₈, arilo C₆₋₂₀ arilo sustituido C₆₋₂₀ heterociclilo C₂₋₂₀ heterociclilo sustituido C₂₋₂₀ arilalquilo o arilalquilo sustituido; W³ es W⁴ o W⁵; W⁴ es R, -C(Y¹)R^v, -C(Y¹)W⁵, -SO₂R^v, o -SO₂W⁵; y W⁵ es un carbociclo o un heterociclo en el cual W⁵ está, en forma independiente, sustituido con 0 hasta 3 grupos R^v; cada X¹ o X² es, en forma independiente, C-R¹⁰ o N; cada R⁸ es halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², N₃, NO, NO₂, CHO, CN, -CH(=NR¹¹), -CH=NHR¹¹, -CH=N(OR¹¹), -CH(OR¹¹)₂, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=S)NR¹¹R¹², -C(=O)OR¹¹, alquilo C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, arilo sustituido en forma opcional, heteroarilo sustituido en forma opcional, -C(=O)alquilo C₁₋₈, -S(O)□-alquilo C₁₋₈, arilalquilo C₁₋₈, OR¹¹ o SR¹¹; cada R⁹ o R¹⁰ es, en forma independiente, H, halógeno, NR¹¹R¹², N(R¹¹)OR¹¹, NR¹¹NR¹¹R¹², N₃, NO, NO₂, CHO, CN, -CH(=NR¹¹), -CH=NHR¹¹, -CH=N(OR¹¹), -CH(OR¹¹)₂, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=S)NR¹¹R¹², -C(=O)OR¹¹, R¹¹, OR¹¹ o SR¹¹; cada R¹¹ o R¹² es, en forma independiente, H, alquilo C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, carbociclilalquilo C₄₋₈, arilo sustituido en forma opcional, heteroarilo sustituido en forma opcional, -C(=O)alquilo C₁₋₈, -S(O)□-alquilo C₁₋₈ o arilalquilo C₁₋₈; o R¹¹ y R¹² tomados juntos con un nitrógeno al cual ambos están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros donde cualquier átomo de carbono de dicho anillo heterocíclico puede reemplazarse en forma opcional con -O-, -S- o -NR^{a-}; donde cada alquilo C₁₋₈, alqueno C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈ o arilalquilo C₁₋₈ de cada R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R¹¹ o R¹² es, en forma independiente, sustituido en forma opcional con uno o más halo, hidroxi, CN, N₃, N(R^a)₂ o OR^{a-}; y donde uno o más de los átomos de carbono no terminales de cada uno de dicho alquilo C₁₋₈ es reemplazado en forma opcional con -O-, -S- o -NR^{a-}.

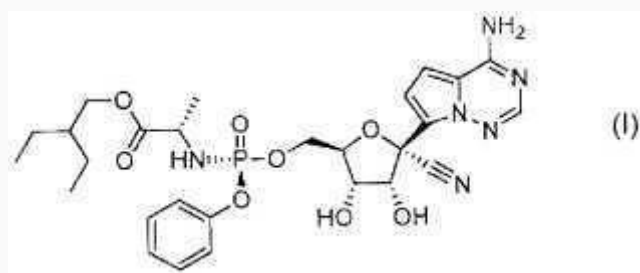


MÉTODOS PARA TRATAR INFECCIONES POR EL VIRUS FILOVIRIDAE	
Publicación:	AR109850 (A2)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20170102926 20/10/2017
Número(s) de prioridad:	US201462072331P 20141029
Resumen de AR109850 (A2)	
	Los compuestos, composiciones y métodos provistos son particularmente útiles para el tratamiento de infecciones por el virus de Marburg, virus de Ebola y virus Cueva. Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque está seleccionado del grupo de fórmulas (1), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

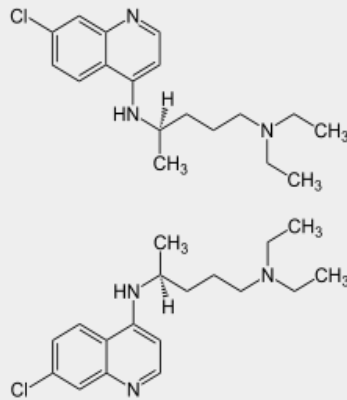
FORMAS CRISTALINAS DE PROPANOATO DE (S)-2-ETILBUTIL 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-AMINOPIRROLO[2,1-F][1,2,4]TRIAZIN-7-IL)-5-CIANO-3,4-DIHIDROXITETRAHIDROFURAN-2-IL)METOXI)(FENOXI)FOSFORIL)AMINO)	
Publicación:	AR111490 (A1)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	DESISTIDA(27/11/2019)
Número de solicitud:	P20180101095 27/04/2018
Número(s) de prioridad:	US201762492364P 20170501
Resumen de AR111490 (A1)	
	
<p>Reivindicación 1: Un compuesto seleccionado del grupo consistente de: propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Forma I; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Forma II; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Forma III; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Forma IV; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Mezcla I; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Mezcla II; propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Mezcla III; y propanoato de (S)-2-etilbutil 2-(((S)-(((2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopirrol[2,1-f][1,2,4]triazin-7-il)-5-ciano-3,4-dihidroxitetrahydrofuran-2-il)metoxi)(fenoxi)fosforil)amino) Forma I Maleato. Reivindicación 82: Una composición que comprende un compuesto de fórmula (1), teniendo una pureza de al menos 99.1%. Reivindicación 83: La composición de la reivindicación 82, en donde la composición comprende menos de 0.05% (p/p) de la impureza A de fórmula (3).</p>	

COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN UN INHIBIDOR DE ARN POLIMERASA Y CICLODEXTRINA PARA EL TRATAMIENTO DE INFECCIONES VIRALES

Publicación:	AR112271 (A1)
Solicitante(s):	GILEAD SCIENCES INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20180101926 11/07/2018
Número(s) de prioridad:	US201762530971P 20170711

Resumen de AR112271 (A1)

Reivindicación 1: Una composición que comprende Compuesto 1 de fórmula (1), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, ciclodextrina, y opcionalmente, al menos un agente de ajuste de pH.



Cloroquina

La cloroquina fue descubierta por Bayer en 1904 pero debido a su alta toxicidad no fue autorizada para combatir la malaria hasta 1947. Su mecanismo de acción radica en la inhibición de la heme polimerasa en el parásito, lo que impide que este convierta heme (compuesto tóxico para las especies Plasmodium) a hemozoína, es así que el compuesto heme se acumula provocando la muerte del parásito.

Debido a su actividad anti-inflamatoria, se utiliza en el tratamiento de la artritis reumatoidea y del lupus eritematoso, aunque su mecanismo de acción no ha sido determinado con exactitud. Estudios in-vitro reportan que la cloroquina antagoniza la histamina, tiene efectos anti-serotonina e inhibe los efectos de la prostaglandina.

En el caso del COVID-19 podría producir un aumento del pH endosómico inhibiendo la fusión celular y deteniendo la replicación del virus. Además, inhibe la glicosilación terminal de ACE2, receptor del virus en las células objetivo.

El 23 de mayo de 2020, la OMS suspendió los ensayos con el compuesto. Esto se debió a que no se ha demostrado una mejora en las condiciones clínicas de los pacientes tratados con el compuesto y éste presenta numerosos efectos adversos por la alta toxicidad de las aminoquinolinas.

MÉTODO COMPOSICIONES Y KITS PARA INCREMENTAR LA BIODISPONIBILIDAD ORAL DE AGENTES FARMACÉUTICOS.	
Publicación:	AR004130 (A1)
Solicitante(s):	BAKER TERRANCE LANE
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (09/01/2007)
Número de solicitud:	P19960104945 28/10/1996
Número(s) de prioridad:	US19950007071P 19951026 ; US19960608776 19960229 ; US19960733142 19961016
Resumen de AR004130 (A1)	
<p>Un método para incrementar la biodisponibilidad ante la administración por vía oral a un paciente mamífero de un agente farmacológicamente activo por comprender la co-administración por vía oral al paciente del agente y de un agente mejorador de la biodisponibilidad seleccionado del grupo integrado por ciclosporinas A a Z, (Me-Ile-4)-ciclosporina, dihidro ciclosporina A, acetil ciclosporina A, y oligopéptidos relacionados producidos por especies en el género Topyccladium, quetoconazol, dexve rapamil, amiodarona, nifedipina, reserpina, quinidina, nicardipina, ácido etacrínico, propafenona, reserpina, amiloride, ergot alcaloides, cefoperazona, tetraciclina, cloroquina, fosfomicina, ivermectina, tamoxifen, VX-710, VX-853, genistein e isoflavonoides relacionados, calfofina, ceramidas, morfina, congéneres de morfina, otros opioides y antagonistas de opioides.</p>	

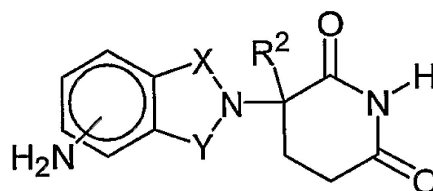
UN ESTUCHE DE COMBINACIÓN USADO EN EL TRATAMIENTO DEL PALUDISMO	
Publicación:	AR028458 (A1)
Solicitante(s):	NICHOLAS PIRAMAL INDIA LTD [IN]; COUNCIL SCIENT IND RES [IN]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (13/05/2013)
Número de solicitud:	P20010102288 14/05/2001
Número(s) de prioridad:	IN2000MUM501 20000531
Resumen de AR028458 (A1)	
<p>Un kit combinado para el tratamiento del paludismo causado por Plasmodium vivax (P. vivax) que contiene dosis individuales de un agente antipalúdico, 3- [1 - [[4 - [(6-metoxi-8-quinolinil) amino] pentil] amino] etiliden] -dihidro-2 (3H) -furanona (I) en forma de cápsulas; dosis individuales del agente antipalúdico, cloroquina en forma de tabletas; y material de instrucción para la administración de los dos medicamentos contra la malaria. El kit combinado es especialmente adecuado para un régimen de tratamiento de 6 días en el que el tratamiento se realiza con cinco tabletas que contienen 500 mg de fosfato de cloroquina (equivalente a 300 mg de base), tres para tomar el día uno y uno cada uno los días dos y tres; y cinco cápsulas que contienen 25 mg de 3- [1 - [[4 - [(6-metoxi-8-quinolinil) amino] pentil] amino] etiliden] -dihidro-2 (3H) -furanona (I), una para tomarse los días dos a seis.</p>	

SALES FARMACÉUTICAS CONSTITUIDAS DE UNA SUSTANCIA ACTIVA FARMACÉUTICA Y AL MENOS UN EDULCORANTE, MEDICAMENTOS QUE CONTIENEN ESTAS SALES Y USO DE ESTAS SALES PARA LA PREPARACIÓN DE MEDICAMENTOS	
Publicación:	AR033423 (A1)
Solicitante(s):	GRUENENTHAL GMBH [DE]
Estado:	DENEGADA (26/09/2013)
Número de solicitud:	P20020100687 27/02/2002
Número(s) de prioridad:	DE20011009763 20010228
Resumen de AR033423 (A1)	
<p>Se refiere a sales farmacéuticas constituidas de una sustancia activa farmacéutica y al menos un edulcorante, medicamentos que contienen estas sales y el uso de estas sales para la preparación de medicamentos.</p>	

MÉTODO PARA EL TRATAMIENTO DEL SÍNDROME DE SJÖGREN	
Publicación:	AR050354 (A1)
Solicitante(s):	GENENTECH INC [US]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	P20050103046 22/07/2005
Número(s) de prioridad:	US20040590302P 20040722
Resumen de AR050354 (A1)	
<p>Se provee un método para el tratamiento de un síndrome de Sjögren en un paciente que involucra administrar una cantidad eficaz de un anticuerpo CD20 y de un agente animalario al paciente, para proveer una mejora significativa en la línea de base en dos o más de sequedad, fatiga, y dolor de las articulaciones en una Escala Visual Análoga, y un artículo de manufactura para el mismo. Se proveen también métodos y artículos que involucran tratar el síndrome de Sjögren en un sujeto, que involucra administrar una cantidad eficaz de un anticuerpo que se une a un marcador de superficie de célula B al sujeto para proveer una exposición inicial y una exposición subsiguiente al anticuerpo dentro de ciertos regímenes de dosificación y un artículo de manufactura para el mismo. Reivindicación 4: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1-3, donde el agente anti-malaria es hidroxiclороquina o cloroquina. Reivindicación 6: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1-4, donde se administra un tercer medicamento en una cantidad eficaz, donde el anticuerpo CD20 es un primer medicamento y el agente anti-malaria es un segundo medicamento. Reivindicación 7: El método de la reivindicación 6 en el cual el tercer medicamento es un agente quimioterapéutico, un agente inmunosupresor, un fármaco anti-reumático modificador de la enfermedad (DMARD), un agente citotóxico, un antagonista de integrina, un fármaco anti-inflamatorio no esterooidal (NSAID), un antagonista de citoquina, un agonista secretor, o una hormona.</p>	
<p>Humanized 2H7.v16 Light Chain</p> <pre> DIQMTQSPSSLSASVGHVITTCRASSSVSMHWYQQKPKAPKPLIYAPENLASEGVPSRFSG EGSGTIDFELTISLQPEDFAITTCQQNSPFPPTFGQGTKEIKRTVAAPSVFIFPPSDRQLES GTASVVCLLNNFYPREAKVQWKVDNALQSGNSQESVTEQDSRDSTYSLSSTLTLSADYKHK VYACEVTHQGLSSPVTKSFNRGEC (SEQ ID NO:13) </pre>	

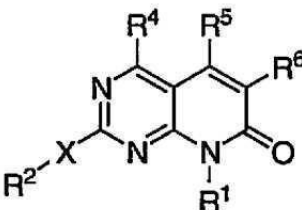
MÉTODOS Y COMPOSICIONES QUE UTILIZAN COMPUESTOS INMUNOMODULADORES PARA EL TRATAMIENTO Y EL MANEJO DE ENFERMEDADES PARASITARIAS

Publicación:	AR051766 (A1)
Solicitante(s):	CELGENE CORP [US]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	P20050104761 11/11/2005
Número(s) de prioridad:	US20040626975P 20041112

Resumen de AR051766 (A1)


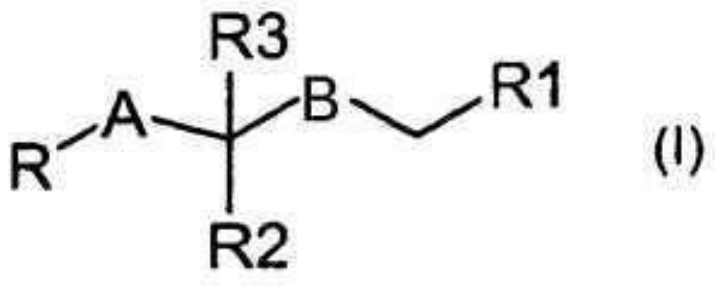
(I)

Métodos para tratar, prevenir y/o mejorar diversas enfermedades y trastornos por parásitos protozoos. Los métodos específicos abarcan la administración de un compuesto inmunomodulador solo o en combinación con un segundo ingrediente activo. También métodos para reducir o evitar los efectos secundarios asociados con tratamientos antiparasitarios convencionales que comprenden la administración de un compuesto inmunomodulador. Además, las composiciones farmacéuticas, las formas de dosificación unitarias únicas y los equipos adecuados para su uso en los métodos. Reivindicación 32: El método de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque el compuesto inmunomodulador es de la fórmula (1) en donde uno de X e Y es C=O y el otro es CH₂ o C=O; R₁ es H, alquilo C1-8, cicloalquilo C3-7, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, C(O)R₃, C(S)R₃, C(O)OR₄, alquil C1-8-N-(R₆)₂, alquil C1-8-OR₅, alquil C1-8-C-(O)-OR₅, C(O)NHR₃, C(S)NHR₃, C(O)NR₃R₃', C(S)NR₃R₃' o alquil C18-O(CO)R₅; R₂ es H, f, bencilo, alquilo C1-8, alqueno C2-8 o alquino C2-8; R₃ y R₃' son independientemente alquilo C1-8, cicloalquilo C3-7, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, alquil C0-8-N(R₆)₂, alquil C1-8-OR₅, alquil C1-8-C(O)OR₅, alquil C1-8-O-(CO)R₅ o C(O)OR₅; R₄ es alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, alquil C1-4-OR₅, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5; R₅ es alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo o heteroarilo C2-5; cada aparición de R₆ es independientemente H, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo o heteroarilo C2-5 o alquil C0-8-C(O)O-R₅ o los grupos R₆ se pueden unir para formar un grupo heterocicloalquilo; n es 0 o 1; y * representa un centro de carbono quiral. Reivindicación 36: Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto inmunomodulador o una de sus sales, solvatos o estereoisómeros farmacéuticamente aceptables, y un segundo ingrediente activo, en donde el segundo agente activo es cloroquina, hidroxiclороquina, quinina, quinidina, pirimetamina, sulfadiazina, doxiciclina, clindamicina, mefloquina, halofantrina, proguanilo, primaquina, atovacuona, azitromicina, pentamidina, anfotericina B, un compuesto pentavalente de antimonio, interferon gama, itraconazol, una combinación de promastigotes muertos y BCG, leucovorina, corticosteroide, sulfonamida, espiramicina, IgG, trimetoprima, sulfametoxazol, suramina, melarsoprol, nifurtimox o benznidazol o una de sus sales, solvatos o estereoisómeros farmacéuticamente aceptables.

MÉTODOS PARA TRATAR CÁNCER USANDO INHIBIDORES DE PIRIDOPIRIMIDINONA DE PI 3K Y MTOR EN COMBINACIÓN CON INHIBIDORES DE AUTOFAGIA	
Publicación:	AR080151 (A1)
Solicitante(s):	EXELIXIS INC [US]; UNIV CALIFORNIA [US]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (26/03/2014)
Número de solicitud:	P20110100408 9/02/2011
Número(s) de prioridad:	US20100367505P 20100726 ; US20100302897P 20100209 ; US20100367512P 20100726
Resumen de AR080151 (A1)	
 <p style="text-align: center;">I</p>	
<p>Reivindicación 1: Método para tratar el cáncer, comprendiendo dicho método administrar a un paciente una cantidad terapéuticamente eficaz de un Compuesto de Fórmula 1: o un isómero sencillo del mismo en el que el compuesto está opcionalmente en forma de una sal farmacéuticamente aceptable y además opcionalmente en forma de un hidrato y además opcionalmente en forma de un solvato del mismo; o administrar una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente eficaz de un Compuesto de Fórmula 1 y un vehículo, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptable junto con uno o más inhibidores autofágicos, en los que en el Compuesto de Formula 1: R1 es hidrogeno, alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilalquilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo opcionalmente sustituido, heterocicloalquilo opcionalmente sustituido, heterocicloalquilalquilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroarilalquilo opcionalmente sustituido; R2 es hidrogeno o alquilo, en el que el alquilo está opcionalmente sustituido con 1,2,3,4,6,5 grupos R8 X es -NR3-; R3 hidrogeno; R4 es alquilo opcionalmente sustituido; R5 es hidrogeno; y R6 es fenilo, acilo o heteroarilo en los que el fenilo y el heteroarilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 grupos R9 cada R8, cuando está presente, es independientemente hidroxilo, halo, alcoxi, haloalcoxi, amino, alquilamino, dialquilaminoalquilo o alcóxialquilamino; y cada R9, cuando está presente, es independientemente halo, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcóxialquilo, carboxialquilo, alcóxicarbonilo, aminoalquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, ariloxi, heterocicloalquilo o heteroarilo y en el que cada cicloalquilo, arilo, heterocicloalquilo y heteroarilo, solos o como parte de otro grupo dentro de R9, están independientemente sustituidos opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5 grupos seleccionados entre halo, alquilo, haloalquilo, hidroxilo, alcoxi, haloalcoxi, amino, alquilamino y dialquilamino. Reivindicación 2: El método de la reivindicación 1, en el que el cáncer se selecciona entre cáncer de mama, cáncer de colon, cáncer rectal, cáncer endometrial, carcinoma gástrico, glioblastoma, carcinoma hepatocelular, cáncer de pulmón de células pequeñas, cáncer de pulmón de células no pequeñas, melanoma, cáncer ovárico, cáncer cervical, cáncer pancreático, carcinoma prostático, leucemia mielogenosa aguda (AML), leucemia mielogenosa crónica (CML) y carcinoma tiroideo. Reivindicación 4: El método de la reivindicación 1, 2, 3, 4, en el que el inhibidor autofágico es cloroquina.</p>	

COMBINACIONES DE UN INHIBIDOR DE TLR Y UN INHIBIDOR DE TIROSINA QUINASA DE BRUTON	
Publicación:	AR102669 (A1)
Solicitante(s):	PHARMACYCLICS LLC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20150103733 16/11/2015
Número(s) de prioridad:	US201462080921P 20141117
Resumen de AR102669 (A1)	
<p>Composiciones y métodos de tratamiento de malignidades en células B en un sujeto que lo necesita, mediante la administración al sujeto de una cantidad terapéuticamente eficaz de una combinación que comprende un inhibidor de BTK y un inhibidor de TLR. Reivindicación 3: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1 - 2, caracterizado porque el inhibidor de TLR no específico se selecciona del grupo que consiste en cloroquina y bafilomicina A. Reivindicación 5: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1 - 4, caracterizado porque el inhibidor de BTK es ibrutinib.</p>	

Documentos A Modo De Complemento

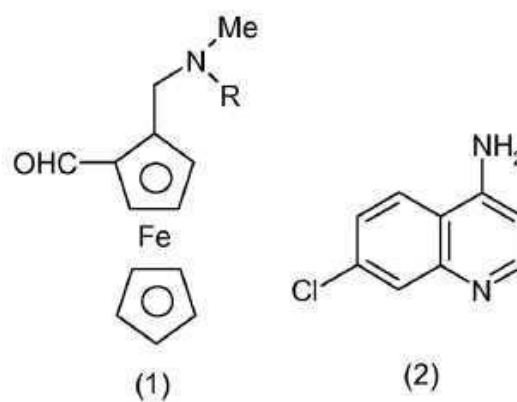
COMPUESTOS ANTIPALÚDICOS CON ESTRUCTURA POLICROMÁTICA, UN MÉTODO DE PREPARACIÓN Y COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA	
Publicación:	AR059837 (A1)
Solicitante(s):	SIGMA TAU IND FARMACEUTI [IT]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (27/04/2010)
Número de solicitud:	P20070101032 14/03/2007
Número(s) de prioridad:	EP20060005307 20060315
Resumen de AR059837 (A1)	
 <p style="text-align: right;">(I)</p>	
<p>En la presente se describen agentes antipalúdicos que tienen un nuevo farmacóforo. Estos compuestos policíclicos pueden inhibir tanto a las cepas de Plasmodium falciparum (Pf) sensibles a la cloroquina como a las resistentes a la cloroquina. Además, la síntesis de estos compuestos comprende algunos pasos de los productos comerciales con un bajo costo de producción. Reivindicación 1: Un compuesto en la forma racémica (R, S) o en sus formas enantioméricas R y S, y sus sales farmacológicamente aceptables, que tiene la estructura de fórmula (1) caracterizado porque: - A es un radical bivalente seleccionado entre el grupo que comprende fenileno, naftileno y heteroarileno mono, bicíclico o tricíclico de 5, 6, 10 o 14 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O y S; R es seleccionado entre el grupo que comprende hidrógeno, halógeno, trifluorometilo, alquilo C1-4 lineal o ramificado, heteroarilo o heterociclilo de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O y S; B es un radical bivalente seleccionado entre fenileno no sustituido o sustituido con OH, halógeno, ciano, -SO₂NH₂, -R1 es seleccionado entre el grupo que comprende di-(C1-4)alquilamino, di-(C1-4)- alquilaminoalquileno (C1-4) y heteroarilo o heterociclilo de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre O, S, S(O), S(O)₂ y N no sustituido o sustituido con acetilo o mesilo; -R2 es seleccionado entre el grupo que comprende hidrógeno, heteroarilo o heterociclilo de 5 o 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O y S, y fenilo no sustituido o sustituido con R4; o R4 junto con R2 forma un grupo benzodiazolilo; R3 es seleccionado entre el grupo que comprende heterocíclico mono o bicíclico de 5, 6, 11 o 12 miembros que contiene un o más heteroátomos seleccionados entre N, O y S; y R4 es seleccionado entre el grupo que comprende hidrógeno, OH, halógeno; N-(C1-4) alquilo y OCH₃, heterocíclico y heterocíclico-metileno, en donde el heterocíclico es un anillo de 5 o 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O y S; con la condición de que R y R2 no sean nunca ambos H.</p>	

PROCEDIMIENTO DE SÍNTESIS DE LA FERROQUINA POR AMINACIÓN REDUCTORA CONVERGENTE

Publicación:	AR081593 (A1)
Solicitante(s):	SANOFI SA [FR]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (14/08/2019)
Número de solicitud:	P20110101985 9/06/2011
Número(s) de prioridad:	FR20100054625 20100611

Resumen de AR081593 (A1)

Reivindicación 1: Procedimiento de síntesis de la ferroquina de fórmula (F) o de su metabolito de fórmula (Fm) que comprende una reacción de aminación reductora, caracterizándose dicha reacción porque: (i) se condensa el aldehído-amino ferroceno de fórmula (3), en la que R representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, con la 7-cloroquinolein-4-amina de fórmula (1); (ii) se reduce el producto de condensación así obtenido de fórmula (2), con R que representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, (iii) se hidroliza el medio de reacción antes del aislamiento de la ferroquina de fórmula (F) o de su metabolito de fórmula (Fm).

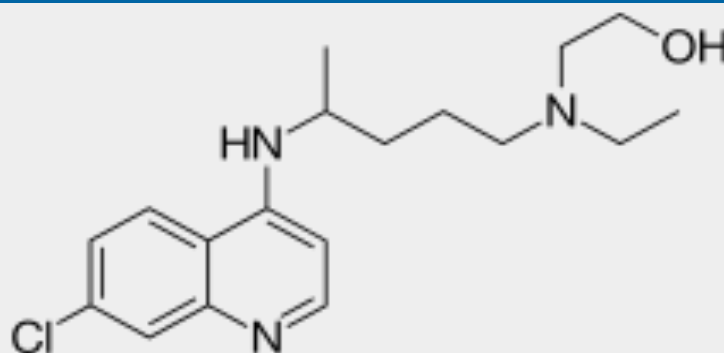


TERAPIAS COMBINADAS PARA PALUDISMO, MÉTODOS DE IDENTIFICACIÓN DE UN COMPUESTO ANTIPALUDISMO, COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA

Publicación:	AR096913 (A1)
Solicitante(s):	UNIV CALIFORNIA [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	P20140102598 14/07/2014
Número(s) de prioridad:	US201361845920P 20130712

Resumen de AR096913 (A1)

Métodos para tratar o prevenir paludismo por administración de un inhibidor de la proteína quinasa y opcionalmente uno o los dos de otro inhibidor de proteína quinasa y un fármaco antipaludismo a un sujeto mamífero infectado o en riesgo de exposición a Plasmodium sp. En algunos aspectos, los regímenes terapéuticos y preventivos de la presente descripción son efectivos para reducir el desarrollo de parásitos en mosquitos que se alimentan de los receptores de los regímenes en recipientes de los regímenes. Adicionalmente, la presente descripción proporciona métodos para controlar agentes antipaludismo candidatos. Reivindicación 1: Un método para tratar o prevenir paludismo que comprende: administración de un primer inhibidor de proteína quinasa y un segundo inhibidor de proteína quinasa a un sujeto mamífero que lo necesita en condiciones efectivas para tratar o prevenir paludismo. Reivindicación 8: El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 7, en donde el sujeto está infectado con P. falciparum, P. vivax, P. ovale, P. malariae o P. knowlesi. Reivindicación 9: El método de acuerdo con la reivindicación 8, en donde el sujeto está infectado con un Plasmodium sp. resistente a cloroquina. Reivindicación 13: El método de acuerdo con la reivindicación 12, en donde el fármaco antipaludismo adicional comprende uno o varios compuestos de las clases de antipaludismo seleccionadas del grupo que consiste en aminoalcoholes, aminoquinolinas, antibióticos, antifolatos, endoperóxidos, sulfonamidas y otros. Reivindicación 32: Un método de identificación de un compuesto antipaludismo, que comprende: (a) medición de la actividad de una proteína quinasa de mamífero o de mosquito en presencia y ausencia de un compuesto de ensayo; y (b) la identificación del compuesto de ensayo como un compuesto antipaludismo cuando se reduce la actividad de la proteína quinasa en presencia en comparación con la ausencia del compuesto de ensayo. Reivindicación 37: Un método de identificación de un compuesto antipaludismo, que comprende: (a) comparación del desarrollo de oocistos o esporozoítos en mosquitos después del consumo de una comida de sangre que comprende Plasmodium sp., en presencia y ausencia de un compuesto de ensayo; y (b) la identificación del compuesto de ensayo como un compuesto antipaludismo cuando se reduce el desarrollo de oocistos y esporozoítos en los mosquitos en presencia en comparación con la ausencia del compuesto de ensayo. Reivindicación 40: Una composición farmacéutica que comprende un primer inhibidor de proteína quinasa, un segundo inhibidor de proteína quinasa y uno o ambos de un excipiente y portador farmacéuticamente aceptable, en donde los inhibidores de quinasa están presentes en cantidades efectivas para tratar o prevenir paludismo en un sujeto mamífero. Reivindicación 42: Una composición farmacéutica que comprende: un inhibidor de proteína quinasa unido a un resto dirigido a mitocondria, y uno o ambos de un excipiente y portador farmacéuticamente aceptable, en donde el inhibidor de proteína quinasa está presente en una cantidad efectiva para tratar o prevenir paludismo en un sujeto mamífero.



Hidroxiclороquina

La hidroxiclороquina es un derivado de la cloroquina, que también presenta actividad antimalárica. Al igual que la cloroquina, se utiliza también para el tratamiento de la artritis reumatoidea y del lupus eritematoso. En ambos casos, el mecanismo de acción coincide con el de la cloroquina. Estudios in-vitro reportan que la cloroquina antagoniza la histamina, tiene efectos anti-serotonina e inhibe los efectos de la prostaglandina.

A fines de marzo del corriente año, la Organización Mundial de la Salud lanzó a nivel mundial un ensayo clínico sobre diferentes tratamientos contra el COVID-19, denominado "Solidaridad". A principios de julio se decidió suspender los ensayos clínicos con este compuesto.

Antecedentes localizados

MÉTODOS PARA TRATAR ENFERMEDADES REUMÁTICAS AL USAR UNA MOLÉCULA CTLA4 SOLUBLE	
Publicación:	AR035037 (A1)
Solicitante(s):	SQUIBB BRISTOL MYERS CO
Estado:	CONCEDIDA (30/09/2010) VTO (02/07/2021)
Número de solicitud:	AR2001P103156 20010702
Número(s) de prioridad:	US20000215913P 20000703
Resumen de AR035037 (A1)	
<p>Una composición farmacéutica para tratar una enfermedad reumática que comprende un portador farmacéuticamente aceptable y una molécula mutada de CTLA4 soluble. La molécula mutada de CTLA4 soluble comprende una mutación en la posición +104 de CTLA4, en donde la leucina en la posición +104 se substituye con ácido glutámico y una mutación en la posición +29 de CTLA4, en donde la alanina en la posición +29 se substituye con la tirosina. Preferentemente, dicha molécula mutada de CTLA4 soluble es L104EA29Yig, la cual se puede iniciar con la metionina en la posición +1 y termina con la lisina en la posición +357 o bien con la alanina en la posición -1 y termina con la lisina en la posición +357. El portador farmacéuticamente aceptable se selecciona de intercambiadores de iones, alúmina, estearato de aluminio, lecitina, proteínas séricas, tales como la albúmina sérica humana, sustancias amortiguadoras, glicina, ácido sórbico, sorbato de potasio, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos vegetales saturados, solución salina amortiguada con fosfato, agua, emulsiones, sales o electrolitos, sílice coloidal, trisilicato de magnesio, polivinilpirrolidona, sustancias a base de celulosa, polietilenglicol, soluciones estériles, tabletas, excipientes, aditivos de sabor y color, composición de lípidos y composiciones poliméricas. Un equipo para tratar la artritis reumatoide, en donde el equipo comprende una cantidad efectiva de una molécula mutada de CTLA4 soluble que se enlaza a una molécula B7. Uso de una molécula mutada de CTLA4 soluble para preparar una composición farmacéutica de utilidad en un método para tratar una enfermedad reumática que comprende administrar a un sujeto una cantidad efectiva de una molécula mutada de CTLA4 soluble que enlaza una molécula B7. Adicionalmente, dicho método comprende administrar a un sujeto una cantidad efectiva de por lo menos un agente inmunosupresor, en donde el agente inmunosupresor se selecciona del grupo que consiste en corticosteroides, fármacos anti-inflamatorios no esteroideos, ciclosporina prednisona, azatioprina, metotrexato, bloqueadores o antagonistas de TNFalfa, infliximab, cualquier agente biológico que tiene por objetivo una citosina inflamatoria, hidroxyclorequina, sulfasalazoprina, sales de oro, etanercept y anakinra.</p>	

USO DE ANTICUERPOS ANTI-TNF ALFA Y OTRO FÁRMACO	
Publicación:	AR039656 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB BERMUDA LTD
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	AR2003P101417 20030424
Número(s) de prioridad:	US20020133715 20020426
Resumen de AR039656 (A1)	
<p>Método de tratamiento de trastornos en los cuales la actividad del TFNa es nociva, por medio de una administración bisemanal, subcutánea de anticuerpos humanos, preferentemente anticuerpos recombinantes humanos, que se unen específicamente al factor de necrosis tumoral a humano (hTNFa) en combinación con otro fármaco que es de utilidad para el tratamiento de dicho trastorno. El anticuerpo de la invención puede ser un anticuerpo de longitud completa o una porción de unión a antígenos del mismo. La invención también abarca conjuntos de elementos que contienen una composición farmacéutica e instrucciones para la dosificación. Reivindicación 4: El método de la cláusula 3, caracterizado porque dicho anticuerpo humano es D2E7. Reivindicación 12: Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende 40 mg de D2E7, uno o varios fármacos adicionales y un vehículo aceptable para uso farmacéutico.</p> <p>Reivindicación 13: La composición farmacéutica de la cláusula 12, caracterizada porque el otro fármaco es un fármaco anti-reumático modificador de la enfermedad (DMARD), un fármaco anti-inflamatorio no esteroide (NSAID), un esteroide o cualquier combinación de los mismos. Reivindicación 14: La composición farmacéutica de la cláusula 13, caracterizado porque el DMARD es hidroxyclorequina, leflunomida, metotrexato, oro parenteral, oro oral, sulfasalazina o cualquier combinación de los mismos. Reivindicación 15: La composición farmacéutica de la cláusula 13, caracterizado porque el NSAID es prednisona, ácido fólico, celecoxib, rofecoxib, paracetamol, naproxeno, ibuprofeno, metilprednisolona, tramadol, Di-gesic, diclofenac, vicodin, triamcinolona, lidocaína, o cualquier combinación de los mismos. Reivindicación 16: La composición farmacéutica de la cláusula 12, caracterizada porque el otro fármaco comprende multivitaminas, calcio, ácido fólico, vacuna del virus de influenza polivalente o cualquier combinación de los mismos</p>	

MÉTODO PARA EL TRATAMIENTO DEL SÍNDROME DE SJÖGREN	
Publicación:	AR050354 (A1)
Solicitante(s):	GENENTECH INC [US]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	AR2005P103046 20050722
Número(s) de prioridad:	US20040590302P 20040722
Resumen de AR050354 (A1)	
<p>Se provee un método para el tratamiento de un síndrome de Sjögren en un paciente que involucra administrar una cantidad eficaz de un anticuerpo CD20 y de un agente antimalaria al paciente, para proveer una mejora significativa en la línea de base en dos o más de sequedad, fatiga, y dolor de las articulaciones en una Escala Visual Análoga, y un artículo de manufactura para el mismo. Se proveen también métodos y artículos que involucran tratar el síndrome de Sjögren en un sujeto, que involucra administrar una cantidad eficaz de un anticuerpo que se une a un marcador de superficie de célula B al sujeto para proveer una exposición inicial y una exposición subsiguiente al anticuerpo dentro de ciertos regímenes de dosificación y un artículo de manufactura para el mismo. Reivindicación 4: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1-3, donde el agente anti-malaria es hidroxicloroquina o cloroquina. Reivindicación 6: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1-4, donde se administra un tercer medicamento en una cantidad eficaz, donde el anticuerpo CD20 es un primer medicamento y el agente anti-malaria es un segundo medicamento. Reivindicación 7: El método de la reivindicación 6 en el cual el tercer medicamento es un agente quimioterapéutico, un agente inmunosupresor, un fármaco anti-reumático modificador de la enfermedad (DMARD), un agente citotóxico, un antagonista de integrina, un fármaco anti-inflamatorio no esteroide (NSAID), un antagonista de citoquina, un agonista secretor, o una hormona.</p>	
<p>Humanized 2H7.v16 Light Chain</p> <pre> DIQMTQSPSSLSASVGVDTITCRASSVSYMHWYQQKPKAPKPLIYAPSNLASGVPSRFSG EGSGTDPELTISLQPEDFAITTCQQNSPFPPTGQGTVEIKRTVAAPSVFIFPPSDEQLKE GTASVVCLLNNFYPREAKVQWKVDNALQSGNSQESVTEQDSKDSTYSLSSTLTLSKADYKKEK VYACEVTHQGLSSPVTKSFNRGEC (SEQ ID NO:13) </pre>	

MÉTODOS Y COMPOSICIONES QUE UTILIZAN COMPUESTOS INMUNOMODULADORES PARA EL TRATAMIENTO Y EL MANEJO DE ENFERMEDADES PARASITARIAS

Publicación:	AR051766 (A1)
Solicitante(s):	CELGENE CORP [US]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	AR2005P104761 20051111
Número(s) de prioridad:	US20040626975P 20041112

Resumen de AR051766 (A1)

Métodos para tratar, prevenir y/o mejorar diversas enfermedades y trastornos por parásitos protozoos. Los métodos específicos abarcan la administración de un compuesto inmunomodulador solo o en combinación con un segundo ingrediente activo. También métodos para reducir o evitar los efectos secundarios asociados con tratamientos antiparasitarios convencionales que comprenden la administración de un compuesto inmunomodulador. Además las composiciones farmacéuticas, las formas de dosificación unitarias únicas y los equipos adecuados para su uso en los métodos. Reivindicación 32: El método de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque el compuesto inmunomodulador es de la fórmula (1) en donde uno de X e Y es C=O y el otro es CH₂ o C=O; R₁ es H, alquilo C1-8, cicloalquilo C3-7, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, C(O)R₃, C(S)R₃, C(O)OR₄, alquil C1-8-N-(R₆)₂, alquil C1-8-OR₅, alquil C1-8-C-(O)-OR₅, C(O)NHR₃, C(S)NHR₃, C(O)NR₃R₃', C(S)NR₃R₃' o alquil C18-O(CO)R₅; R₂ es H, f, bencilo, alquilo C1-8, alqueno C2-8 o alquino C2-8; R₃ y R₃' son independientemente alquilo C1-8, cicloalquilo C3-7, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, alquil C0-4-heteroarilo C2-5, alquil C0-8-N(R₆)₂, alquil C1-8-OR₅, alquil C1-8-C(O)OR₅, alquil C1-8-O-(CO)R₅ o C(O)OR₅; R₄ es alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, alquil C1-4-OR₅, bencilo, arilo, alquil C0-4-heterocicloalquilo C1-6, alquil C0-4-heteroarilo C2-5; R₅ es alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo o heteroarilo C2-5; cada aparición de R₆ es independientemente H, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, bencilo, arilo o heteroarilo C2-5 o alquil C0-8-C(O)O-R₅ o los grupos R₆ se pueden unir para formar un grupo heterocicloalquilo; n es 0 o 1; y * representa un centro de carbono quiral. Reivindicación 36: Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto inmunomodulador o una de sus sales, solvatos o estereoisómeros farmacéuticamente aceptables, y un segundo ingrediente activo, en donde el segundo agente activo es cloroquina, hidroxiclороquina, quinina, quinidina, pirimetamina, sulfadiazina, doxiciclina, clindamicina, mefloquina, halofantrina, proguanilo, primaquina, atovacuona, azitromicina, pentamidina, anfotericina B, un compuesto pentavalente de antimonio, interferón gama, itraconazol, una combinación de promastigotes muertos y BCG, leucovorina, corticosteroide, sulfonamida, espiramicina, IgG, trimetoprima, sulfametoxazol, suramina, melarsoprol, nifurtimox o benznidazol o una de sus sales, solvatos o estereoisómeros farmacéuticamente aceptables.

MÉTODOS PARA TRATAR ENFERMEDADES AUTOINMUNES UTILIZANDO UNA MOLÉCULA DE FUSIÓN TACI- IG

Publicación:	AR060935 (A1)
Solicitante(s):	ARES TRADING SA [CH]; ZYMOGENETICS INC [US]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (13/07/2017)
Número de solicitud:	AR2007P102090 20070515
Número(s) de prioridad:	US20060747270P 20060515

Resumen de AR060935 (A1)

Métodos y composiciones para el tratamiento de enfermedades autoinmunes, incluyendo artritis reumatoide, que comprenden administrar a un paciente que necesita el tratamiento una molécula de fusión TACI-Ig (ligando interactivo de ciclofilina que modula calcio-inmunoglobulina) en cantidad suficiente para suprimir las funciones que inducen proliferación en BlyS (estimulador de linfocitos B) y APRIL (ligando inductor de proliferación). Reivindicación 12: El método de acuerdo con la reivindicación 11, en donde dicho medicamento es seleccionado a partir del grupo formado por hidroxiclороquina, sulfasalazina, metotrexato, leflunomida, rituximab, infliximab, azatioprina, D-penicilamina, minociclina, Oro (oral o intramuscular), ciclosporina, un corticosteroide, una droga anti-inflamatoria no esteroide (NSAIDS), una citocina, una anti-citosina y un interferón.

COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE COMPRENDE UNA MOLÉCULA CTLA4 SOLUBLE Y UN SEGUNDO AGENTE Y USO DE LA CTLA4 SOLUBLE PARA PREPARAR LA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA

Publicación:	AR066511 (A2)
Solicitante(s):	SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (18/01/2013)
Número de solicitud:	AR2008P101975 20080509
Número(s) de prioridad:	US20000215913P 20000703
Resumen de AR066511 (A2)	

El uso de un primer agente y un segundo agente, en donde a) el primer agente es una molécula mutante soluble CTLA4, y b) el segundo agente está seleccionado del grupo que consiste en corticosteroides, fármacos antiinflamatorios no esteroides, ciclosporina prednisona, azatioprina, metotrexato, bloqueantes o antagonistas de TNFalfa, infliximab, cualquier agente biológico dirigido a citoquina inflamatoria, hidroxiclороquina, sulfasalazopriina, sales áuricas, etanercept y anakinra para la preparación de una composición farmacéutica para bloquear interacciones de B7 con CTLA4 y/o CD28.

INHIBIDORES DE JANUS QUINASAS PARA EL TRATAMIENTO DE OJO SECO Y OTRAS ENFERMEDADES RELACIONADAS CON LOS OJOS. INSERTO OFTALMICO

Publicación:	AR073530 (A1)
Solicitante(s):	INCYTE CORP [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR2009P103822 20091002
Número(s) de prioridad:	US20080102242P 20081002
Resumen de AR073530 (A1)	

Reivindicación 1: Un método para el tratamiento de un desorden de ojo seco en un paciente en necesidad del mismo, caracterizado porque comprende administrar a dicho paciente una cantidad terapéuticamente efectiva de un agente seleccionado entre (a) compuestos de fórmula (1) donde A1 y A2 se seleccionan independientemente entre C y N; T, U, y V se seleccionan independientemente entre O, S, N, CR5, y NR6; donde el anillo de 5 miembros formado por A1, A2, U, T, y V es aromático; X es N o CR4; Y es alquileo C1-8, alquenileno C2-8, alquinileno C2-8, (CR11R12)p-(cicloalquileo C3-10)-(CR11R12)q, (CR11R12)p-(arilen)-(CR11R12)q, (CR11R12)-(heterocicloalquileo C1-10)-(CR11R12)q, (CR11R12)p-(heteroarilen)-(CR11R12)q, (CR11R12)pO(CR11R12)q, (CR11R12)pS(CR11R12)q, (CR11R12)pC(O)(CR11R12)q, (CR11R12)pC(O)NRc(CR11R12)q, (CR11R12)pC(O)O(CR11R12)q, (CR11R12)OC(O)(CR11R12)q, (CR11R12)pOC(O)NRc(CR11R12)q, (CR11R12)pNRc(CR11R12)q, (CR11R12)pNRcC(O)NRd(CR11R12)q, (CR11R12)pS(O)(CR11R12)q, (CR11R12)pS(O)NRc(CR11R12)q, (CR11R12)pS(O)2(CR11R12)q, o (CR11R12)pS(O)2NRc(CR11R12)q, donde dicho alquileo C1-8, alquenileno C2-8, alquinileno C2-8, cicloalquileo, arileno, heterocicloalquileo, o heteroarileno, se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre -D1-D2-D3-D4; Z es H, halo, alquilo C1-8, alqueno C2-8, alquino C2-8, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, =C-Ri, =N-Ri, Cy1, CN, NO2, ORa, SRa, C(O)Rb, C(O)NRcRd, C(O)ORa, OC(O)Rb, OC(O)NRcRd, NRcRd, NRcC(O)Rb, NRcC(O)NRcRd, NRcC(O)ORa, C(=NRi)NRcRd, NRcC(=NRi)NRcRd, S(O)Rb, S(O)NRcRd, S(O)2Rb, NRcS(O)2Rb, C(=NOH)Rb, C(=NO(alquil C1-6))Rb, y S(O)2NRcRd, donde dicho alquilo C1-8, alqueno C2-8, o alquino C2-8, se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5, o 6 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo C1-4, alqueno C2-4, alquino C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, Cy1, CN, NO2, ORa, SRa, C(O)Rb, C(O)NRcRd, C(O)ORa, OC(O)Rb, OC(O)NRcRd, NRcRd, NRcC(O)Rb, NRcC(O)NRcRd, NRcC(o)ORa, C(=NRi)NRcRd, NRcC(=NRi)NRcRd, S(O)Rb, S(O)NRcRd, S(O)2Rb, NRcS(O)2Rb, C(=NOH)Rb, C(=NO(alquil C1-6))Rb, y S(O)2NRcRd; donde cuando Z es H, n es 1; o la porción -(Y)n-Z se toma junto con i) A2 al cual la porción se encuentra unido, ii) R5 o R6 de tanto T como V, y iii) el átomo de C o N al cual el R5 o R6 de tanto T como V se encuentra unido para formar un anillo arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo de 4 a 20 miembros fusionado al anillo de 5 miembros formado por A1, A2, U, T, y V, donde dicho anillo arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo de 4 a 20 miembros se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, o 5 sustituyentes seleccionados

independientemente entre -(W)m-Q; W es alquilenilo C1-8, alquenilenilo C2-8, alquinilenilo C2-8, O, S, C(O), C(O)NRc', C(O)O, OC(O), OC(O)NRc', NRc', NRc'C(O)NRd', S(O), S(O)NRc', S(O)2, o S(O)2NRc'; Q es H, halo, CN, NO2, alquilo C1-8, alquenilo C2-8, alquinilo C2-8, haloalquilo C1-8, halosulfanilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo, donde dicho alquilo C1-8, alquenilo C2-8, alquinilo C2-8, haloalquilo C1-8, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo se sustituyen opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, Cy2, CN, NO2, ORa', SRa', C(O)Rb', C(O)NRc'Rd', c(o)oRa', OC(O)Rb', OC(O)NRc'Rd', NRc'Rd', NRc'C(O)Rb', NRc'C(O)NRc'Rd', NRc'C(O)ORa', S(O)Rb', S(O)NRc'Rd', S(O)2Rb', NRc'S(O)2Rb', y S(O)2NRc'Rd'; Cy1 y Cy2 se seleccionan independientemente entre arilo, heteroarilo, cicloalquilo, y heterocicloalquilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, CN, NO2, ORa", SRa", C(O)Rb", C(O)NRc'Rd", c(o)oRa", OC(O)Rb", OC(O)NRc'Rd", NRc'Rd", NRc'C(O)Rb", NRc'C(O)NRc'Rd", NRc'C(O)ORa", S(O)Rb", S(O)NRc'Rd", S(O)2Rb", NRc'S(O)2Rb", y S(O)2NRc'Rd"; R1, R2, R3, y R4 se seleccionan independientemente entre H, halo, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO2, OR7, SR7, C(O)R8, C(O)NR9R10, C(O)OR7, OC(O)R8, OC(O)NR9R10, NR9R10, NR9C(O)R8, NR9C(O)OR7, S(O)R8, S(O)NR9R10, S(O)2R8, NR9S(O)2R8, y S(O)2NR9R10; R5 es H, halo, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, CN, NO2, OR7, SR7, C(O)R8, C(O)NR9R10, C(O)OR7, OC(O)R8, OC(O)NR9R10, NR9R10, NR9C(O)R8, NR9C(O)OR7, S(O)R8, S(O)NR9R10, S(O)2R8, NR9S(O)2R8, o S(O)2NR9R10; R6 es H, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, OR7, C(O)R8, C(O)NR9R10, C(O)OR7, S(O)R8, S(O)NR9R10, S(O)2R8, o S(O)2NR9R10; R7 es H, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo; R8 es H, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo; R9 y R10 se seleccionan independientemente entre H, alquilo C1-10, haloalquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, alquilcarbonilo C1-6, arilcarbonilo, alquilsulfonilo C1-6, arilsulfonilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo; o R9 y R10 junto con el átomo de N al cual se encuentran unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros; R11 y R12 se seleccionan independientemente entre H y -E1-E2-E3-E4; D1 y E1 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, alquinilenilo C2-6, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno, donde cada uno de alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, alquinilenilo C2-6, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno se sustituye opcionalmente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO2, N3, SCN, OH, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alcoxialquilo C2-8, alcoxi C1-6, haloalcoxi C1-6, amino, alquilamino C1-6, y dialquilamino C2-8; D2 y E2 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, alquinilenilo C2-6, (alquilen C1-6)r-O-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-S-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-NRe-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-CO-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-C(O)O-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-CONRe-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-SO-(alquilen C1-6)s, (alquilen)r-SO2-(alquilen C1-6)s, (alquilen C1-6)r-SONRe-(alquilen C1-6)s, y (alquilen)r-NReCONRf-(alquilen C1-6)s, donde cada uno de alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, y alquinilenilo C2-6 se sustituyen opcionalmente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO2, N3, SCN, OH, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alcoxialquilo C2-8, alcoxi C1-6, haloalcoxi C1-6, amino, alquilamino C1-6, y dialquilamino C2-8; D3 y E3 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, alquinilenilo C2-6, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno, donde cada uno de alquilenilo C1-6, alquenilenilo C2-6, alquinilenilo C2-6, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno se sustituye opcionalmente con 1, 2 o 3 sus sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO2, N3, SCN, OH, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alcoxialquilo C1-6, alcoxi C1-6, haloalcoxi C1-6, amino, alquilamino C1-6, y dialquilamino C2-8; D4 y E4 se seleccionan independientemente entre H, halo, alquilo C1-4, alquenilo C2-4, alquinilo C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, Cy1, CN, NO2, ORa, SRa, C(O)Rb, C(O)NRcRd, C(O)ORa, OC(O)Rb, OC(O)NRcRd, NRcRd, NRcC(O)Rb, NRcC(O)NRcRd, NRcC(o)ORa, C(=NRi)NRcRd, NRcC(=NRi)NRcRd, S(O)Rb, S(O)NRcRd, S(O)2Rb, NRcS(O)2Rb, C(=NOH)Rb, C(=NO(alquil C1-6))Rb, y S(O)2NRcRd; donde dicho alquilo C1-8, alquenilo C1-8, o alquinilo C1-6, se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5, o 6 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo

alquilo C1-4, alqueno C2-4, alquino C2-4, haloalquilo C1-4, halosulfanilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, Cy1, CN, NO₂, ORa, SRa, C(O)Rb, C(O)NRcRd, C(O)ORa, OC(O)Rb, OC(O)NRcRd, NRcRd, NRcC(O)Rb, NRcC(O)NRcRd, NRcC(o)ORa, C(=NRi)NRcRd, NRcC(=NRi)NRcRd, S(O)Rb, S(O)NRcRd, S(O)2Rb, NRcS(O)2Rb, C(=NOH)Rb, C(=NO(alquil C1-6))Rb, y S(O)2NRcRd; Ra es H, Cy1, -(alquil C1-6)-Cy1, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alqueno C2-6, alquino C2-6, donde dicho alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alqueno C2-6, o alquino C2-6 se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; Rb es H, Cy1, -(alquil C1-6)-Cy1, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alqueno C2-6, alquino C2-6, donde dicho alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alqueno C2-6, o alquino C2-6 se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, alquilo, halo, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; Ra' y Ra'' se seleccionan independientemente entre H, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alqueno C2-6, alquino C2-6, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo.

USO DE ANTICUERPOS ANTI-TNF ALFA Y OTRO FÁRMACO. MÉTODO DE TRATAMIENTO. COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA. CONJUNTO DE ELEMENTOS

Publicación:	AR077473 (A2)
Solicitante(s):	ABBOTT BIOTECH LTD [BM]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	AR2010P102558 20100714
Número(s) de prioridad:	US20020133715 20020426

Resumen de AR077473 (A2)

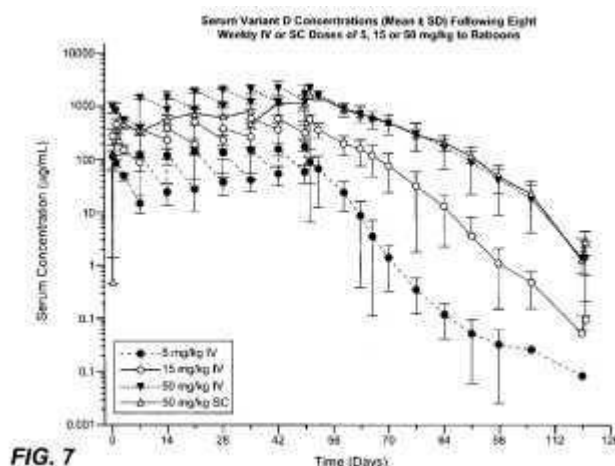
Método de tratamiento de trastornos en los cuales la actividad del TFN es nociva, por medio de una administración bisemanal, subcutánea de anticuerpos humanos, preferentemente anticuerpos recombinantes humanos, que se unen específicamente al factor de necrosis tumoral humano (hTNF) en combinación con otro fármaco que es de utilidad para el tratamiento de dicho trastorno. El anticuerpo de la solicitud puede ser un anticuerpo de longitud completa o una porción de unión a antígenos del mismo. La solicitud también abarca conjuntos de elementos que contienen una composición farmacéutica e instrucciones para la dosificación. Reivindicación 2: Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende 40 mg de D2E7, uno o varios fármacos adicionales y un vehículo aceptable para uso farmacéutico. Reivindicación 3: La composición farmacéutica de la cláusula 2, caracterizada porque el otro fármaco es un fármaco anti-reumático modificador de la enfermedad (DMARD), un fármaco anti-inflamatorio no esteroide (NSAID), un esteroide o cualquier combinación de los mismos. Reivindicación 4: La composición farmacéutica de la cláusula 2, caracterizada porque el DMARD es hidroxicloroquina, Leflunomida, metotrexato, oro parenteral, oro oral, sulfasalazina o cualquier combinación de los mismos. Reivindicación 5: La composición farmacéutica de la cláusula 2, caracterizada porque el NSAID es prednisona, ácido fólico, celecoxib, rofecoxib, paracetamol, naproxeno, ibuprofeno, metilprednisolona, tramadol, Di-gesic, diclofenac, vicodin, triamcinolona, lidocaína o cualquier combinación de los mismos.

**MÉTODOS PARA TRATAR ENFERMEDADES AUTOINMUNES USANDO ANTICUERPOS ANTI CD4.
FORMULACIÓN FARMACÉUTICA**

Publicación:	AR077718 (A1)
Solicitante(s):	GENENTECH INC [US]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (07/08/2012)
Número de solicitud:	AR2009P102665 20090714
Número(s) de prioridad:	US20080081012P 20080715

Resumen de AR077718 (A1)

Reivindicación 1: Un método de tratamiento de una enfermedad autoinmunitaria en un sujeto mamífero, donde el método comprende la administración al sujeto, de una cantidad terapéuticamente eficaz de un anticuerpo de CD4 no reductor, donde el anticuerpo contiene una modificación de manera de incrementar la semivida sérica, en comparación con el anticuerpo sin la modificación, y donde el anticuerpo se administra por vía subcutánea en una dosis entre 0,2 mg/kg y 10 mg/kg. Reivindicación 14: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde la modificación del anticuerpo incrementa la unión del anticuerpo a FcRn, en relación con la unión del anticuerpo no modificado a FcRn. Reivindicación 22: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde la enfermedad autoinmunitaria se selecciona de lupus, lupus eritematoso sistémico, lupus eritematoso cutáneo, lupus nefritis/extrarrenal, esclerosis múltiple, esclerosis múltiple de recaída-remisión, esclerosis múltiple progresiva secundaria, esclerosis múltiple progresiva primaria, artritis reumatoide, soriasis y artritis soriásica. Reivindicación 26: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde el anticuerpo comprende las secuencias CDR de cadena liviana de SEC. ID. Ns:1. Reivindicación 29: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde el anticuerpo comprende las secuencias CDR de cadena pesada de SEC. ID. Ns: 6. Reivindicación 32: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde el anticuerpo tiene una modificación adicional que reduce la unión a un receptor Fcy, en comparación con el anticuerpo sin la modificación adicional. Reivindicación 33: El método de la reivindicación 32, donde el anticuerpo comprende una región Fc que es aglicosilada. Reivindicación 36: El método de la reivindicación 35, donde el anticuerpo comprende una sustitución N297A como se muestra en SEC. ID. Nss: 4; 5 y 6. Reivindicación 37: El método de la reivindicación 36, donde el anticuerpo comprende además una sustitución N434A como se muestra en SEC. ID. Ns: 5. Reivindicación 38: El método de la reivindicación 36, donde el anticuerpo comprende además una sustitución N434H como se muestra en SEC. ID. Ns: 6. Reivindicación 41: El método de la reivindicación 1 o la reivindicación 5, donde el anticuerpo se administra en combinación con por lo menos un segundo compuesto seleccionado de un DMARD, un corticoesteroide y un AINE. Reivindicación 42: El método de la reivindicación 41, donde el DMARD se selecciona de metotrexato, leflunomida, sulfasalazina e hidroxicloroquina. Reivindicación 55: Un método de tratamiento de una enfermedad autoinmunitaria en un sujeto mamífero, donde el método comprende la administración al sujeto, de una cantidad terapéuticamente eficaz de un anticuerpo de CD4 no reductor, donde el anticuerpo contiene una modificación de manera de incrementar la semivida sérica, en comparación con el anticuerpo sin la modificación, y donde el anticuerpo se administra por vía subcutánea en una dosis uniforme de entre 150 mg y 350 mg. Reivindicación 103: Un método de tratamiento de una enfermedad autoinmunitaria en un sujeto mamífero, donde el método comprende la administración al sujeto, de una cantidad terapéuticamente eficaz de un anticuerpo de CD4 no reductor, donde el anticuerpo contiene una modificación de manera de incrementar la semivida sérica, en comparación con el anticuerpo sin la modificación, y donde el anticuerpo se administra por vía subcutánea en una dosis uniforme de entre 150 mg y 350 mg, en combinación con un agente de dispersión de fármaco intersticial. Reivindicación 105: El método de la reivindicación 103 o la reivindicación 104, donde el agente de dispersión de fármaco intersticial es una glicoproteína de hialuronidasa activa neutra soluble.



COMPOSICIONES PARA EL TRATAMIENTO DE LA ARTRITIS REUMATOIDE Y MÉTODOS PARA SU UTILIZACIÓN	
Publicación:	AR088289 (A1)
Solicitante(s):	REGENERON PHARMA [US]; SANOFI SA [FR]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (22/10/2015)
Número de solicitud:	AR2012P103770 20121010
Número(s) de prioridad:	US201161545864P 20111011 ; EP20120305889 20120720
Resumen de AR088289 (A1)	
<p>Composiciones y métodos para tratar y mejorar los síntomas de la artritis reumatoide utilizando un anticuerpo o cualquiera de sus fragmentos de unión al antígeno que se une de modo específico al receptor de la interleuquina-6 humana (hIL-6R) con un DMARD. Reivindicación 1: Un método para tratar la artritis reumatoide en un sujeto que ha sido previamente tratado de modo ineficaz mediante la administración de metotrexato, leflunomida, sulfasalazina y/o hidroxicloroquina, que comprende administrar al sujeto una cantidad eficaz de sarilumab (SAR153191). Reivindicación 16: Una composición farmacéutica que comprende una cantidad eficaz de sarilumab y un miembro del grupo que consiste en metotrexato, leflunomida, sulfasalazina e hidroxicloroquina</p>	

TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES NEURODEGENERATIVAS CON UNA COMBINACIÓN DE LAQUINIMOD Y FINGOLIMOD	
Publicación:	AR101901 (A1)
Solicitante(s):	TEVA PHARMA [IL]
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (01/10/2018)
Número de solicitud:	AR2015P102975 20150916
Número(s) de prioridad:	US201462050842P 20140916
Resumen de AR101901 (A1)	
<p>Método para tratar a un sujeto que padece una enfermedad neurodegenerativa que comprende la administración periódica de una cantidad de laquinimod y una cantidad de fingolimod, en donde las cantidades son eficaces para tratar al sujeto cuando se administran juntas. Envases y composiciones farmacéuticas que comprenden laquinimod y fingolimod para tratar a un sujeto que padece una enfermedad neurodegenerativa. Composición farmacéutica que comprende laquinimod para usar como una terapia adyuvante o en combinación con fingolimod, y una composición farmacéutica que comprende fingolimod para usar como una terapia adyuvante o en combinación con laquinimod, para tratar el mencionado sujeto. Reivindicación 51: El método de cualquiera de las reivindicaciones 1 - 50, caracterizado porque además comprende la administración de fármacos antiinflamatorios no esteroides (AINEs), salicilatos, fármacos de acción lenta, compuestos de oro, hidroxicloroquina, sulfasalazina, combinaciones de fármacos de acción lenta, corticosteroides, fármacos citotóxicos, fármacos inmunosupresores y/o anticuerpos. Reivindicación 114: Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende una cantidad de laquinimod y una cantidad de fingolimod para usar en el tratamiento de un sujeto que padece una enfermedad neurodegenerativa, en donde el laquinimod y el fingolimod se administran simultáneamente, contemporáneamente o concomitantemente.</p>	

MÉTODO CON INHIBIDORES DE JANUS QUINASAS PARA EL TRATAMIENTO DE OJO SECO Y OTRAS ENFERMEDADES RELACIONADAS CON LOS OJOS	
Publicación:	AR112822 (A2)
Solicitante(s):	INCYTE HOLDINGS CORP [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR2018P102672 20180919
Número(s) de prioridad:	US20080102242P 20081002
Resumen de AR112822 (A2)	
<p>Reivindicación 1: Un método para el tratamiento de un desorden de ojo seco en un paciente en necesidad del mismo, caracterizado porque comprende administrar a dicho paciente una cantidad terapéuticamente efectiva de un agente seleccionado entre: (a) compuestos de fórmula (1), donde: A¹ y A² se seleccionan independientemente entre C y N; T, U, y V se seleccionan independientemente entre O, S, N, CR⁵, y NR⁶; donde el anillo de 5 miembros formado por A¹, A², U, T, y V es aromático; X es N o CR⁴; Y es C₁₋₈ alquilenilo, C₂₋₈ alquenileno, C₂₋₈ alquinileno, (CR^{11R12})□-(C₃₋₁₀ cicloalquileno)-(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□-(arilen)-(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□-(C₁₋₁₀ heterocicloalquileno)-(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□-(heteroarilen)-(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□O(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□S(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□C(O)(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□C(O)NR^c(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□C(O)O(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□OC(O)(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□OC(O)NR^c(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□NR^c(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□NR^cC(O)NR^d(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□S(O)(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□S(O)NR^c(CR^{11R12})q, (CR^{11R12})□S(O)₂(CR^{11R12})q, o (CR^{11R12})□S(O)₂NR^c(CR^{11R12})q, donde dicho C₁₋₈ alquilenilo, C₂₋₈ alquenileno, C₂₋₈ alquinileno, cicloalquileno, arileno, heterocicloalquileno, o heteroarileno, se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre -D¹-D²-D³-D⁴; Z es H, halo, C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alquenilo, C₂₋₈ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, =C-Rⁱ, =N-Rⁱ, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, C(=NRⁱ)NR^cR^d, NR^cC(=NRⁱ)NR^cR^d, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b, C(=NOH)R^b, C(=NO(C₁₋₈ alquil))R^b, y S(O)₂NR^cR^d, donde dicho C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alquenilo, o C₂₋₈ alquinilo, se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5, ó 6 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, C(=NRⁱ)NR^cR^d, NR^cC(=NRⁱ)NR^cR^d, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b, C(=NOH)R^b, C(=NO(C₁₋₈ alquil))R^b, y S(O)₂NR^cR^d; donde cuando Z es H, n es 1; o la porción -(Y)□-Z se toma junto con i) A² al cual la porción se encuentra unido, ii) R⁵ o R⁶ de tanto T como V, y iii) el átomo de C o N al cual el R⁵ o R⁶ de tanto T como V se encuentra unido para formar un anillo arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo de 4 a 20 miembros fusionado al anillo de 5 miembros formado por A¹, A², U, T, y V, donde dicho anillo arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo de 4 a 20 miembros se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, ó 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre -(W)□-Q; W es C₁₋₈ alquilenilo, C₂₋₈ alquenileno, C₂₋₈ alquinileno, O, S, C(O), C(O)NR^c, C(O)O, OC(O), OC(O)NR^c, NR^c, NR^cC(O)NR^d, S(O), S(O)NR^c, S(O)₂, o S(O)₂NR^c; Q es H, halo, CN, NO₂, C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alquenilo, C₂₋₈ alquinilo, C₁₋₈ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo, donde dicho C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alquenilo, C₂₋₈ alquinilo, C₁₋₈ haloalquilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, Cy², CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b, y S(O)₂NR^cR^d; Cy¹ y Cy² se seleccionan independientemente entre arilo, heteroarilo, cicloalquilo, y heterocicloalquilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)OR^a, NR^cS(O)R^b, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, y S(O)₂NR^cR^d; R¹, R², R³, y R⁴ se seleccionan independientemente entre H, halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO₂, OR⁷, SR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, OC(O)R⁸, OC(O)NR⁹R¹⁰, NR⁹R¹⁰, NR⁹C(O)R⁸, NR⁹C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰, S(O)₂R⁸, NR⁹S(O)₂R⁸, y S(O)₂NR⁹R¹⁰; R⁵ es H, halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, CN, NO₂, OR⁷, SR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, OC(O)R⁸, OC(O)NR⁹R¹⁰, NR⁹R¹⁰, NR⁹C(O)R⁸, NR⁹C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰, S(O)₂R⁸, NR⁹S(O)₂R⁸, o S(O)₂NR⁹R¹⁰; R⁶ es H, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alquenilo, C₂₋₄ alquinilo, C₁₋₄ haloalquilo, OR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰.</p>	

$OC(O)NR^9R^{10}$, NR^9R^{10} , $NR^9C(O)R^8$, $NR^9C(O)OR^7$, $S(O)R^8$, $S(O)NR^9R^{10}$, $S(O)_2R^8$, $NR^9S(O)_2R^8$, y $S(O)_2NR^9R^{10}$; R^5 es H, halo, C_{1-4} alquilo, C_{2-4} alquenilo, C_{2-4} alquinilo, C_{1-4} haloalquilo, halosulfanilo, CN, NO_2 , OR^7 , SR^7 , $C(O)R^8$, $C(O)NR^9R^{10}$, $C(O)OR^7$, $OC(O)R^8$, $OC(O)NR^9R^{10}$, NR^9R^{10} , $NR^9C(O)R^8$, $NR^9C(O)OR^7$, $S(O)R^8$, $S(O)NR^9R^{10}$, $S(O)_2R^8$, $NR^9S(O)_2R^8$, o $S(O)_2NR^9R^{10}$; R^6 es H, C_{1-4} alquilo, C_{2-4} alquenilo, C_{2-4} alquinilo, C_{1-4} haloalquilo, OR^7 , $C(O)R^8$, $C(O)NR^9R^{10}$, $C(O)OR^7$, $S(O)R^8$, $S(O)NR^9R^{10}$, $S(O)_2R^8$, o $S(O)_2NR^9R^{10}$; R^7 es H, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo; R^8 es H, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo; R^9 y R^{10} se seleccionan independientemente entre H, C_{1-10} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alquilcarbonilo, arilcarbonilo, C_{1-6} alquilsulfonilo, arilsulfonilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo; o R^9 y R^{10} junto con el átomo de N al cual se encuentran unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros; R^{11} y R^{12} se seleccionan independientemente entre H y $-E^1-E^2-E^3-E^4$; D^1 y E^1 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, C_{2-6} alquinileno, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno, donde cada uno de C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, C_{2-6} alquinileno, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno se sustituye opcionalmente con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO_2 , N_3 , SCN, OH, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alcoxialquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalcoxi, amino, C_{1-6} alquilamino, y C_{2-6} dialquilamino; D^2 y E^2 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, C_{2-6} alquinileno, $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-O-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-R-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-NR^e-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-CO-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-COO-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-CONR^e-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-SO-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-SO_2-(C_{1-6}$ alquilen) g , $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-SONR^e-(C_{1-6}$ alquilen) g , y $(C_{1-6}$ alquilen) $^f-NR^eCONR^f-(C_{1-6}$ alquilen) g , donde cada uno de C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, y C_{2-6} alquinileno se sustituye opcionalmente con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO_2 , N_3 , SCN, OH, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alcoxialquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalcoxi, amino, C_{1-6} alquilamino, y C_{2-6} dialquilamino; D^3 y E^3 se encuentran independientemente ausentes o se seleccionan independientemente entre C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, C_{2-6} alquinileno, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno, donde cada uno de C_{1-6} alquileno, C_{2-6} alquenileno, C_{2-6} alquinileno, arileno, cicloalquileno, heteroarileno, y heterocicloalquileno se sustituye opcionalmente con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, CN, NO_2 , N_3 , SCN, OH, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alcoxialquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalcoxi, amino, C_{1-6} alquilamino, y C_{2-6} dialquilamino; D^4 y E^4 se seleccionan independientemente entre H, halo, C_{1-4} alquilo, C_{2-4} alquenilo, C_{2-4} alquinilo, C_{1-4} haloalquilo, halosulfanilo, C_{1-4} hidroxialquilo, C_{1-4} cianoalquilo, Cy^1 , CN, NO_2 , OR^a , SR^a , $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d , $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $NR^cC(O)OR^a$, $C(=NR^i)NR^cR^d$, $NR^cC(=NR^i)NR^cR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2R^b$, $C(=NOH)R^b$, $C(=NO(C_{1-6}$ alquil)) R^b , y $S(O)_2NR^cR^d$, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, o C_{2-6} alquinilo, se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, C_{1-4} alquilo, C_{2-4} alquenilo, C_{2-4} alquinilo, C_{1-4} haloalquilo, halosulfanilo, C_{1-4} hidroxialquilo, C_{1-4} cianoalquilo, Cy^1 , CN, NO_2 , OR^a , SR^a , $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d , $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $NR^cC(O)OR^a$, $C(=NR^i)NR^cR^d$, $NR^cC(=NR^i)NR^cR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2R^b$, $C(=NOH)R^b$, $C(=NO(C_{1-6}$ alquil)) R^b , y $S(O)_2NR^cR^d$; R^a es H, Cy^1 , $-(C_{1-6}$ alquil)- Cy^1 , C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, o C_{2-6} alquinilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; R^b es H, Cy^1 , $-(C_{1-6}$ alquil)- Cy^1 , C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, o C_{2-6} alquinilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; R^a y R^b se seleccionan independientemente entre H, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, arilo,

cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; R^b y R^b se seleccionan independientemente entre H, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo, donde dicho C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; R^c y R^d se seleccionan independientemente entre H, Cy¹, -(C₁₋₆ alquil)-Cy¹, C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, donde dicho C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, o C₂₋₆ alquino, se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre Cy¹, -(C₁₋₆ alquil)-Cy¹, OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, y halosulfanilo; o R^c y R^d junto con el átomo de N al cual se encuentran unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre Cy¹, -(C₁₋₆ alquil)-Cy¹, OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, y halosulfanilo; R^c y R^d se seleccionan independientemente entre H, C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo, donde dicho C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; o R^c y R^d junto con el átomo de N al cual se encuentran unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; R^c y R^d se seleccionan independientemente entre H, C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo y heterocicloalquilalquilo, donde dicho C₁₋₁₀ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₂₋₆ alquino, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo o heterocicloalquilalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₆ haloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; o R^c y R^d junto con el átomo de N al cual se encuentran unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre OH, CN, amino, halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, halosulfanilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo; Rⁱ es H, CN, NO₂, o C₁₋₆ alquilo; R^e y R^f se seleccionan independientemente entre H y C₁₋₆ alquilo; Rⁱ es H, CN, o NO₂; m es 0 ó 1; n es 0 ó 1; p es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6; q es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6; r es 0 ó 1; y s es 0 ó 1; donde cuando X es N, n es 1, y la porción formada por A¹, A², U, T, V, y -(Y)□-Z tiene la fórmula (4); luego Y es diferente de (CR¹¹R¹²)□C(O)NR^c(CR¹¹R¹²)q; (b) compuestos de fórmula (2), donde: L^a es SO₂ o CO; R^{1a} es C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, fenilo, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, indolilo, NR^{2a}R^{3a}, o OR^{4a}, donde dicho alquilo, cicloalquilo, fenilo, o heteroarilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre F, CN, y C₁₋₄ alquilo; R^{2a} y R^{3a} se seleccionan independientemente entre H, C₁₋₄ alquilo, y fenilo; y R^{4a} es C₁₋₆ alquilo, fenilo, o bencilo; (c) compuestos de fórmula (3), donde: R^{5a} y R^{6a} se seleccionan independientemente entre H, F, CN, OH, C₁₋₄ alquilo, benciloxi, C₂₋₆ dialquilaminosulfonilo, y heteroarilo de 5 miembros, donde dicho alquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados entre F, OH, CN, y C₁₋₄ alcoxi, y donde dicho heteroarilo de 5 miembros se sustituye opcionalmente con C₁₋₄ alquilo; y sales aceptables farmacéuticamente del mismo; siempre que el compuesto de fórmula (1) no se seleccione entre

4-[5-(2-isopropil-5-metilciclohexiloximetil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrol[2,3-b]piridina;

4-[5-(4-tert-butilfenoximetil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrol[2,3-b]piridina;

4-[5-ciclopentiletil-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(2,6-difluorofenil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(1-tert-butil-3-metil-1H-pirazol-5-il)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(benciloximetil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(3-fluorofenil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(fenoximetil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(4-metoxibencil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(feniltiometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(3-metilbutil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-bencil-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(2,2-dimetilpropil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(formil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(furan-2-il)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(1-metil-1H-pirrol-2-il)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-(sec-butil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina;
 4-[5-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-pirrolo[2,3-b]piridina; y sales aceptables farmacéuticamente de cualquiera de los precedentes. Reivindicación 18: Un método de acuerdo con la reivindicación 17, caracterizado porque dicho agente terapéutico adicional es acetónido de fluocinolona, rimexolona, ciclosporina, riaminolona, dexametasona, fluocinolona, cortisona, prednisolona, flumetolona, civamida, testosterona, ecabet de sodio, ácido 15-(s)-hidroxieicosatetraenoico, (2S,3S,4R,5R)-3,4-dihidroxi-5-[6-[(3-iodofenil)metilamino]purin-9-il]-N-metil-oxolan-2-carboxamida, gefarnato, cevilemina, doxiclina, minociclina, oxitetraciclina, voclosporina, rivoglitazona, lacritin rebamipida, pilocarpina, tacrolimus, pimecrolimus, loteprednol etabonato, rituximab, diquafosol tetrasódico, dehidroepiandrosterona, anakinra, efalizumab, micofenolato de sodio, etanercept, hidroxicloquina o talidomida. Reivindicación 51: Un equipo para el tratamiento de desórdenes de ojo seco, que comprende una composición oftálmica o farmacéutica e instrucciones; caracterizado porque dicha composición comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un agente seleccionado entre: (a) compuestos de fórmula (1), donde: A¹ y A² se seleccionan independientemente entre C y N; T, U, y V se seleccionan independientemente entre O, S, N, CR⁵, y NR⁶; donde el anillo de 5 miembros formado por A¹, A², U, T, y V es aromático; X es N o CR⁴; Y es C₁₋₈ alquileo, C₂₋₈ alqueniilo, C₂₋₈ alquinileo, (CR¹¹R¹²)□-(C₃₋₁₀ cicloalquileo)-(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□-(arilen)-(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□-(C₁₋₁₀ heterocicloalquileo)-(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□-(heteroarilen)-(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□O(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□S(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□C(O)(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□C(O)NR^c(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□C(O)O(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□OC(O)(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□OC(O)NR^c(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□NR^c(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□NR^cC(O)NR^d(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□S(O)(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□S(O)NR^c(CR¹¹R¹²)q, (CR¹¹R¹²)□S(O)₂(CR¹¹R¹²)q, o (CR¹¹R¹²)□S(O)₂NR^c(CR¹¹R¹²)q, donde dicho C₁₋₈ alquileo, C₂₋₈ alqueniilo, C₂₋₈ alquinileo, cicloalquileo, arileno, heterocicloalquileo, o heteroarileno, se sustituye opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre -D¹-D²-D³-D⁴; Z es H, halo, C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alqueniilo, C₂₋₈ alquiniilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, =C-Rⁱ, =N-Rⁱ, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, C(=NRⁱ)NR^cR^d, NR^cC(=NRⁱ)NR^cR^d, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b, C(=NOH)R^b, C(=NO(C₁₋₆ alquil))R^b, y S(O)₂NR^cR^d, donde dicho C₁₋₈ alquilo, C₂₋₈ alqueniilo, o C₂₋₈ alquiniilo, se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4, 5, ó 6 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, C₁₋₄ alquilo, C₂₋₄ alqueniilo, C₂₋₄ alquiniilo, C₁₋₄ haloalquilo, halosulfanilo, C₁₋₄ hidroxialquilo, C₁₋₄ cianoalquilo, Cy¹, CN, NO₂, OR^a

Documentos A Modo De Complemento

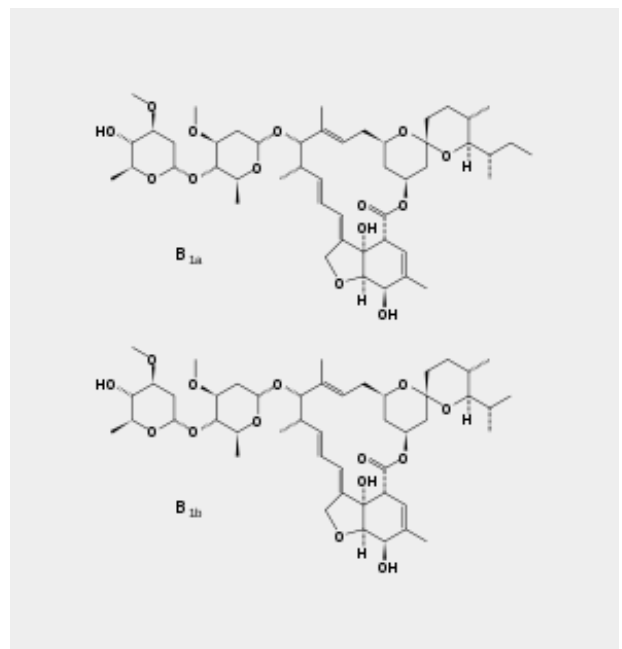
MÉTODO, COMPOSICIONES Y KITS PARA INCREMENTAR LA BIODISPONIBILIDAD ORAL DE AGENTES FARMACÉUTICOS	
Publicación:	AR004130 (A1)
Solicitante(s):	BAKER TERRANCE LANE
Estado:	DESISTIDA FORZOSA (09/01/2007)
Número de solicitud:	AR1996P104945 19961028
Número(s) de prioridad:	US19950007071P 19951026 ; US19960608776 19960229 ; US19960733142 19961016
Resumen de AR004130 (A1)	
<p>Un método para incrementar la biodisponibilidad ante la administración por vía oral a un paciente mamífero de un agente farmacológicamente activo por comprender la co-administración por vía oral al paciente del agente y de un agente mejorador de la biodisponibilidad seleccionado del grupo integrado por ciclosporinas A a Z, (Me-Ile-4)-ciclosporina, dihidro ciclosporina A, acetyl ciclosporina A, y oligopéptidos relacionados producidos por especies en el género Topocladium, ketoconazol, dexve rapamil, amiodarona, nifedipina, reserpina, quinidina, nicardipina, ácido etacrínico, propafenona, reserpina, amiloride, ergot alcaloides, cefoperazona, tetraciclina, cloroquina, fosfomicina, ivermectina, tamoxifen, VX-710, VX-853, genistein e isoflavonoides relacionados, calfofina, ceramidas, morfina, congéneres de morfina, otros opioides y antagonistas de opioides</p>	

Ivermectina

La ivermectina es una lactona macrocíclica desarrollada por Merck como C-076. Es una mezcla de avermectinas B1/B2 que se obtiene de la bacteria *Streptomyces avermectilis*. Presenta actividad antiparasitaria y antihelmitica en animales. También se usa en el tratamiento de la rosácea en humanos y como adyuvante de crecimiento. Su efecto antihelmítico radica en la activación de canales cloruro que se expresa en las neuronas de los nematodos.

Se ha comprobado su acción antiviral en el caso de virus ARN como en el caso del virus del zika virus del dengue y virus de la fiebre del Nilo entre otros. En el caso del COVID 19 se comprobó que in vitro es capaz de reducir 5000 veces la carga viral del virus 48 hs después de su administración.

En Argentina, el compuesto se encuentra concedido como patente AR215000B1, actualmente dentro del dominio público.



Antecedentes localizados

PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE C-076	
Publicación:	AR215000 B1
Solicitante(s):	MERCK & CO INC [US]
Estado:	CONCEDIDA (31-08-1979) Dominio público
Número de solicitud:	AR19770267229 15/04/1977
Número(s) de prioridad:	US19760678328 19760419
Resumen AR215000 (A1)	
<p>Un procedimiento para la preparación de nuevos compuestos antiparasitarios C-076 obtenidos de un caldo de fermentación caracterizados porque comprende: a) Fermentar con una cepa de Streptomyces avermitilis productora de C-076 un medio nutritivo acuoso que contiene: (i) alrededor de 0,5 a 5% en peso de una fuente asimilable de carbono, (ii) alrededor de 0,2 a 6% en peso de una fuente asimilable de nitrógeno y (iii) sales inorgánica, en condiciones aerobias, a una temperatura comprendida entre 20 y 40% aproximadamente, a un pH de 5,0 a 9,0 aproximadamente y, b) recuperar el C-076 de dicho caldo de fermentación.</p>	

PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR UNA FORMULACIÓN ESTABILIZADA DE IVERMECTINA EN AGUA	
Publicación:	AR229354 (A1)
Solicitante(s):	MERCK & CO INC [US]
Estado:	CONCEDIDA (29/07/1983) Dominio público
Número de solicitud:	AR19810286180 23/07/1981
Número(s) de prioridad:	US19800174957 19800804
Resumen AR229354 (A1)	
<p>Agente antiparasitario insoluble e inestable en agua, se hace soluble por la formación de partículas coloidales llamadas micelas, con agentes activos en superficies como solubilizantes y estabilizantes utilizando cosolventes orgánicos miscibles en agua y/o substratos apropiados en la formulación acuosa. Las formulaciones líquidas son adecuadas para el uso para la administración parenteral u oral en el tratamiento de infecciones parasitarias.</p>	

PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE IVERMECTINA	
Publicación:	AR001025 (A1)
Solicitante(s):	BAYER ANIMAL HEALTH GMBH [DE]
Estado:	CONCEDIDA (28/12/2005) Dominio público
Número de solicitud:	AR19960101511 23/02/1996
Número(s) de prioridad:	DE19951007018 19950301
Resumen de AR001025 (A1)	
<p>La presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de 22,23-dihidro-ivermectinas mediante hidrogenación catalítica selectiva de ivermectina B(1a) y/o B(1b) donde como catalizador se emplea un compuesto complejo de Rh que se obtiene mediante la transformación de la sal de sodio, con una hidrazina o una sal de hidrazina y una fosfina terciaria o de un compuesto complejo Rh-fosfina con una hidrazina o una sal de hidrazina</p>	

MÉTODO, COMPOSICIONES Y KITS PARA INCREMENTAR LA BIODISPONIBILIDAD ORAL DE AGENTES FARMACÉUTICOS	
Publicación:	AR004130 (A1)
Solicitante(s):	BAKER TERRANCE LANE
Estado:	DESISTIDA (09/01/07)
Número de solicitud:	AR19960104945 28/10/1996
Número(s) de prioridad:	US19950007071P 19951026 ; US19960608776 19960229 ; US19960733142 19961016
Resumen de AR004130 (A1)	
<p>Un método para incrementar la biodisponibilidad ante la administración por vía oral a un paciente mamífero de un agente farmacológicamente activo por comprender la co-administración por vía oral al paciente del agente y de un agente mejorador de la biodisponibilidad seleccionado del grupo integrado por ciclosporinas A a Z, (Me-Ile-4)-ciclosporina, dihidro ciclosporina A, acetil ciclosporina A, y oligopéptidos relacionados producidos por especies en el género Topycladium, quetoconazol, dexve rapamil, amiodarona, nifedipina, reserpina, quinidina, nicardipina, ácido etacrínico, propafenona, reserpina, amiloride, ergot alcaloides, cefoperazona, tetraciclina, cloroquina, fosfomicina, ivermectina, tamoxifen, VX-710, VX-853, genistein e isoflavonoides relacionados, calfofina, ceramidas, morfina, congéneres de morfina, otros opioides y antagonistas de opioides.</p>	

COMPOSICIONES ENDOPARASITICIDAS	
Publicación:	AR005640 (A1)
Solicitante(s):	BAYER ANIMAL HEALTH GMBH [DE]
Estado:	DENEGADA (01/04/05)
Número de solicitud:	AR19960102860 31/05/1996
Número(s) de prioridad:	DE19951020275 19950602
Resumen de AR005640 (A1)	
Mezclas de avermectinas, 22,23-dihidroavermectinas B1 (ivermectinas) y milbemicinas, de la clase de compuestos de las lactonas macrocíclicas, en combinación con depsipéptidos cíclicos, dado el caso en presencia de Praziquantel o Epsipr antel, para el aumento de la actividad endoparasitica en composiciones endoparasiticas	

UNA COMPOSICIÓN PARASITICIDA INYECTABLE DE LARGA ACCIÓN Y PROCEDIMIENTO PARA PREPARARLA.	
Publicación:	AR006365 (A1)
Solicitante(s):	BIOGÉNESIS S A [AR]
Estado:	CONCEDIDA (26/01/07) Dominio público
Número de solicitud:	AR19970101168 21/03/1997
Número(s) de prioridad:	AR1997P101168 19970321
Resumen de AR006365 (A1)	
Se describe una composición parasitica inyectable de larga acción que comprende ivermectina en una concentración del 1% (p/p), alcohol bencílico, polivinilpirrolidona, N-metil-2-pirrolidona en una proporción de entre 40-65%(v/p) del total y adyuvantes.	

COMPOSICIONES ENDO-ECTOPARASITICIDAS	
Publicación:	AR010375 (A1)
Solicitante(s):	BAYER ANIMAL HEALTH GMBH [DE]
Estado:	DENEGADA (30/04/10)
Número de solicitud:	AR19970106069 19/12/1997
Número(s) de prioridad:	DE19961054079 19961223
Resumen de AR010375 (A1)	
Composiciones avermectinas, 22, 23-dihidroavermectina B1 (ivermectina) y milbemicinas de la clase de las lactonas macrocíclicas con agonistas o antagonistas de los receptores nicotínicos de la acetilcolina de los insectos, en caso dado en presencia de otros productos activos, así como de diluyentes o de excipientes.	

COMPOSICIÓN VETERINARIA INYECTABLE DE IVERMECTINA DE LIBERACIÓN PROGRAMABLE	
Publicación:	AR011035 (A1)
Solicitante(s):	PASSERON EDUARDO JULIO [AR]; GELLON ALBERTO ATILIO [AR]; TARONI ELBIO HUMBERTO [AR]
Estado:	ABANDONADA (21/02/05)
Número de solicitud:	AR19970105882 15/12/1997
Número(s) de prioridad:	US19960768296 19961217
Resumen de AR011035 (A1)	
<p>Una composición inyectable de ivermectina de liberación programable que proporciona una secuencia de pulsos de liberación, de ivermectina a la sangre de los animales tratados. La composición comprende una solución de 0,2 % a 10 % p/p de ivermectina en un solvente elegido de entre propilenglicol y una mezcla de glicéridos de los ácidos caproico, caprílico y cáprico en partes iguales. La solución es empleada como vehículo para suspender microesferas de 100 micrones a 200 micrones de diámetro de un polímero biodegradable que contiene entre 0,5 y 50 % de ivermectina, Las microesferas pueden estar formadas por ácido poliláctico, ácido poliglicólico o un copolímero de ácidos poliláctico- poliglicólico. El sistema multiliberador programable puede ser obtenido también con una matriz biodegradable elegida de polímeros naturales endurecidos tales como gelatina o albúmina, además de los copolímeros de ácidos láctico y glicólico. Los polímeros naturales pueden haber sido sometidos a un proceso de endurecimiento para aumentar la resistencia a agentes biológicos, por ejemplo, tratándose con una solución de glutaraldehído o calentando las proteínas hasta su temperatura de coagulación. En una realización, se tratan microesferas de gelatina cargadas de ivermectina en una solución acuosa de glutaraldehído al 25% durante 24 horas y se las suspende luego en el solvente. Otra realización incluye una suspensión de un copolímero de DL-poliláctico-poliglicólico 1:1 con microesferas cargadas de ivermectina. Esta relación de monómeros puede ser variada para producir pulsos de ivermectina a intervalos de duración programable</p>	

FORMULACIONES SISTÉMICAS	
Publicación:	AR030770 (A1)
Solicitante(s):	LILLY CO ELI [US]
Estado:	DENEGADA (28/02/14)
Número de solicitud:	AR20010104429 19/09/2001
Número(s) de prioridad:	AR2001P104429 20010919
Resumen de AR030770 (A1)	
<p>La presente se refiere a una composición activa para controlar o erradicar plagas de Phthiraptera, Siphonaptera o Acarina generalmente en animales domésticos, que comprende una combinación sinérgica de por lo menos un compuesto A83543 y por lo menos una lactona macrocíclica. La invención se refiere también al uso de la composición activa en formulaciones plaguicidas, las formulaciones mismas y a las diversas aplicaciones de dichas formulaciones como plaguicidas, específicamente en el control de todas las especies de plagas de Phthiraptera, Siphonaptera o Acarina, generalmente en animales domésticos. Dichas aplicaciones incluyen el control de dichas plagas de Phthiraptera, Siphonaptera o Acarina externas en animales domésticos que incluyen, sin limitarse a ello, ovejas, ganado vacuno, porcinos, aves de corral, cabras, camélidos, caballos, perros y gatos.</p>	

UNA COMPOSICIÓN PARASITICIDA	
Publicación:	AR038852 (A1)
Solicitante(s):	NORBROOK LAB LTD
Estado:	DENEGADA (30/05/14)
Número de solicitud:	AR20030100640 27/02/2003
Número(s) de prioridad:	GB20020004712 20020228
Resumen de AR038852 (A1)	
<p>Una composición preparada para el tratamiento de animales con parásitos, parásitos que se saben susceptibles a al menos una entre avermectinas, milbemicinas, o salicilanilidas, comprende por ejemplo ivermectina en una cantidad comprendida entre el 0,1 y el 10 % (p/v), un solvente seleccionado dentro del grupo consistente en glicerol formal, propilenglicol, polietilenglicol y combinaciones de los mismos, y una salicilanilida tal como closantel en una dosis requerida por el animal a ser tratado, habitualmente de alrededor de 2,5 mg/kg vivo de peso del animal a ser tratado, una especie polimérica seleccionada dentro del grupo consistente en polivinilpirrolidona y copolímeros de bloque de polioxipropileno/polioxietileno, dichas especies poliméricas mejoran la biodisponibilidad del closantel en la medida que pueden lograrse niveles en plasma sanguíneo de dicho compuesto de más de alrededor de 20 ppm a lo largo de un período de tratamiento.</p>	

UNA COMPOSICIÓN PARASITICIDA INYECTABLE	
Publicación:	AR038853 (A1)
Solicitante(s):	NORBROOK LAB LTD
Estado:	ABANDONADA (21/02/05)
Número de solicitud:	AR20030100641 27/02/2003
Número(s) de prioridad:	GB20020004713 20020228
Resumen de AR038853 (A1)	
<p>Una composición inyectable preparada para el tratamiento de animales con parásitos, parásitos que se saben susceptibles a al menos una entre avermectinas, milbemicinas o salicilanilidas, comprende por ejemplo ivermectina en una cantidad comprendida entre el 0,1 y el 10 % (p/v), un solvente seleccionado dentro del grupo consistente en glicerol formal, propilenglicol, polietilenglicol y combinaciones de los mismos, y una salicilanilida tal como closantel en una cantidad tal que la composición inyectable libere alrededor de 2,5 mg de closantel/kg vivo de peso del animal a ser tratado y una especie polimérica seleccionada dentro del grupo consistente en polivinilpirrolidona y copolímeros de bloque de polioxipropileno/polioxietileno, dichas especies poliméricas mejoran la biodisponibilidad de la salicilanilida, por ejemplo, closantel.</p>	

COMPOSICIÓN ANTIHELMÍNTICA E INYECTABLE MEJORADORA DEL CRECIMIENTO	
Publicación:	AR041390 (A1)
Solicitante(s):	VIBRAC
Estado:	DENEGADA (21/04/2015)
Número de solicitud:	AR20030103490 25/09/2003
Número(s) de prioridad:	AR2003P103490 20030925
Resumen de AR041390 (A1)	
<p>Composiciones inyectables que contienen un solvente líquido sin polímeros sólidos, agente(s) antihelmínticos(s) y mejorador(es) de crecimiento hormonal(ea), donde el(los) agente(s) antihelmínticos(s) y el(los) mejorador(es) de crecimiento hormonal(es) se disuelve(n) en el sistema de solventes sin polímero. La presente se relaciona adicionalmente a los métodos para mejorar el crecimiento animal e inhibir la infección/plaga parasitaria con estas composiciones, así como también los métodos para preparar tales composiciones. Reivindicación 1: Una composición inyectable, que comprende: un solvente líquido, al menos un agente antihelmíntico seleccionado a partir del grupo que consiste en avermectinas, milbemicinas, y derivados de las mismas, y al menos un mejorador de crecimiento hormonal, caracterizado porque el agente antihelmíntico y el mejorador de crecimiento hormonal se disuelven en el solvente, y donde el solvente líquido se encuentra libre de polímeros sólidos o de formación de película</p>	

COMPOSICIÓN DE APLICACIÓN TÓPICA PARA EL TRATAMIENTO DE ECTOPARÁSITOS	
Publicación:	AR041767 (A1)
Solicitante(s):	AMELONG JAVIER; AMELONG FERNANDO CARLOS
Estado:	DESISTIDA (03/08/12)
Número de solicitud:	AR20030104559 11/12/2003
Número(s) de prioridad:	AR2003P104559 20031211
Resumen de AR041767 (A1)	
<p>Una composición con ivermectina de aplicación tópica, útil para tratar infestaciones producidas por ectoparásitos, principalmente sarna y pediculosis mediante un procedimiento sencillo y rápido. Esta composición logra con una reducida cantidad por aplicación y tratamiento de droga en solución, aproximadamente 0,01 ml., y utilizando una vía de administración más inocua que la oral o la inyectable, la eliminación de los parásitos, esto se posibilita con su aplicación mediante la incorporación a champús, crema de enjuague, gel o lociones. En virtud de sus características puede aplicarse en un lavado de cabello rutinario, no requiriéndose tratamiento complementario ni peine fino para suprimir la infestación.</p>	

UTILIZACIÓN DE IVERMECTINA PARA EL TRATAMIENTO DE DESÓRDENES DERMATOLÓGICOS	
Publicación:	AR044050 (A1)
Solicitante(s):	GALDERMA SA [CH]
Estado:	DENEGADA (16/06/2017)
Número de solicitud:	AR20040101354 22/04/2004
Número(s) de prioridad:	FR20030005048 20030424
Resumen de AR044050 (A1)	
<p>Utilización de ivermectina para la fabricación de una composición farmacéutica tópica destinada al tratamiento de la rosácea. Reivindicación 15: Composición tópica destinada al uso humano caracterizada porque es una emulsión que comprende: a) una fase aceitosa que comprende cuerpos grasos; b) al menos un emulsionante tensioactivo; c) ivermectina; d) uno o varios solventes y/o propenetrante del activo; e) y agua. Reivindicación 20: Utilización de la composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 15 a 19, para la preparación de un medicamento destinado al tratamiento de las afecciones dermatológicas.</p>	

SUPLEMENTOS LÍQUIDOS QUE COMPRENDEN UNO O MÁS MEDICAMENTOS	
Publicación:	AR047861 (A1)
Solicitante(s):	IAMS COMPANY [US]
Estado:	DESISTIDA (30/12/10)
Número de solicitud:	AR20050100157 14/01/2005
Número(s) de prioridad:	US20040758997 20040116
Resumen de AR047861 (A1)	
<p>Composición líquida que comprende entre 0,00001% y 99% de un medicamento como ser imidacloprid, nitenpiram, lufenuron, fipronil, milbemicina oxima, o bien moxidectina, ivermectina, pirantel, milbemicina oxima, lufenuron, selamectina o un anticuerpo y sus combinaciones, un saborizante y más de 50% agua en peso de la composición, esencialmente libre de azúcares, con pH entre 3 y 7, para administración a animales de compañía, para tratar pulgas, garrapatas, dirofilaria immitis, condiciones bacterianas o virales y sus combinaciones. Puede no tener prácticamente sabor a tomate y administrarse diariamente, semanalmente o mensualmente, por vía oral y con un alimento. Estuche que comprende uno o varios envases con una o más composiciones. Proceso para elaborar dicha composición que comprende mezclar medicamento, saborizante y agua y esterilizar entre 76sC y 115sC. Se aplican para el cuidado de mascotas. Método de tratamiento</p>	

GEL - CREMA QUE CONTIENE IVERMECTINA	
Publicación:	AR049009 (A1)
Solicitante(s):	GALDERMA SA [CH]
Estado:	DESISTIDA (13/07/2016)
Número de solicitud:	AR20050101014 16/03/2005
Número(s) de prioridad:	FR20040002798 20040318
Resumen de AR049009 (A1)	
<p>Composición farmacéutica a base de un compuesto de la familia de las avermectinas, en forma de un gel-crema, que comprende en un medio fisiológicamente aceptable, una fase aceitosa dispersada en una fase acuosa para un emulsionante polimérico no tensioactivo, y dicha fase aceitosa comprende aceites que tienen un punto de fusión inferior a 30sC y está exenta de cuerpos grasos sólidos que tengan un punto de fusión superior a 30sC. Procedimiento de preparación y utilización en la fabricación de una preparación farmacéutica destinada al tratamiento de las afecciones dermatológicas, rosácea, entre otras</p>	

UTILIZACIÓN DE AL MENOS UN COMPUESTO DE LA FAMILIA DE LAS AVERMECTINAS O DE LA FAMILIA DE LAS MILBEMICINAS PARA EL TRATAMIENTO DE LAS PATOLOGÍAS OFTÁLMICAS	
Publicación:	AR056553 (A1)
Solicitante(s):	GALDERMA SA [CH]
Estado:	DESISTIDA (22/03/2017)
Número de solicitud:	AR20060104302 29/09/2006
Número(s) de prioridad:	US20060818316P 20060705 ; FR20050010025 20050930
Resumen de AR056553 (A1)	
Utilización de, al menos, un compuesto de la familia de las avermectinas o de la familia de las milbemicinas para la preparación de una composición farmacéutica destinada al tratamiento de las patologías oftálmicas, entre ellas, la rosácea oftálmica. Utilización de la ivermectina para la preparación de una composición farmacéutica destinada al tratamiento de la rosácea oftálmica.	

COMPOSICIÓN QUE COMPRENDE AL MENOS UNA FASE ACUOSA Y AL MENOS UNA FASE GRASA QUE COMPRENDE IVERMECTINA	
Publicación:	AR060543 (A1)
Solicitante(s):	GALDERMA SA [CH]
Estado:	ABANDONADA (03/11/08)
Número de solicitud:	AR20070101680 19/04/2007
Número(s) de prioridad:	FR20060003452 20060419
Resumen de AR060543 (A1)	
La presente se refiere a una composición farmacéutica a base de un compuesto de la familia de las avermectinas que comprende, al menos, una fase grasa y, al menos, una fase acuosa; dicho compuesto de la familia de las avermectinas está disuelto en dicha fase grasa. También se refiere a su procedimiento de preparación, y a su utilización en la fabricación de una preparación farmacéutica destinada al tratamiento de las afecciones dermatológicas, en particular, de la rosácea. Reivindicación 1: Composición farmacéutica que comprende, al menos, una fase grasa, al menos, una fase acuosa y, al menos, un compuesto de la familia de las avermectinas, caracterizada porque la fase grasa comprende, al menos, un solvente aceitoso distinto de los aceites minerales y vegetales, en el cual está disuelto el compuesto de la familia de las avermectinas.	

FORMULACIONES INYECTABLES DE ACCIÓN PROLONGADA	
Publicación:	AR069033 (A1)
Solicitante(s):	SCHERING-PLOUGH LTD [CH]
Estado:	ABANDONADA (03/12/14)
Número de solicitud:	AR20080104654 24/10/2008
Número(s) de prioridad:	BR2007PI05822 20071025 ; US20080095015P 20080908
Resumen de AR069033 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Una formulación inyectable líquida de acción prolongada para combatir ectoparásitos y endoparásitos en un animal, que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de al menos una lactona macrocíclica, un solvente que está seleccionado del grupo que consiste en hidrocarburos aromáticos, halocarbonos; tetrahidrofurano, alcohol bencílico, benzoato de bencilo, glicerol formal y mezclas de ellos; y al menos un polímero de poliéster biológicamente aceptable y biodegradable. Reivindicación 2: La formulación de acuerdo con la reivindicación 1, en donde: el polímero de poliéster biológicamente aceptable y biodegradable está seleccionado del grupo que consiste en poli(láctico)s, poli(glicólico)s, poli(láctico(s)-co-glicólico)s, poli(ácido(s)láctico)s, poli(ácido(s) glicólicos)s y poli(ácido(s) láctico(s)-ácido(s) co-glicólico)s, polianhídridos, poliortoésteres, polieterésteres, polietilenglicol, policaprolactona, poliesteramidas, polifosfazinas, policarbonatos, poliamidas, y sus copolímeros y mezclas. Reivindicación 7: La formulación de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, en donde la lactona macrocíclica está seleccionada del grupo que consiste en abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, lepimectina y selamectina, milbemectina, milbemicina D, oxima de milbemicina, moxidectina y mezclas de ellas. Reivindicación 12: Uso de una formulación inyectable líquida de acción prolongada de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 10 para la preparación de un medicamento para el tratamiento de parasitosis de un animal.</p>	

FORMULACIÓN FARMACÉUTICA SÓLIDA CON LIBERACIÓN RETARDADA QUE COMPRENDE EMODEPSIDA Y PRAZIQUANTEL	
Publicación:	AR071620 (A1)
Solicitante(s):	BAYER ANIMAL HEALTH GMBH [DE]
Estado:	DENEGADA (26/06/20)
Número de solicitud:	AR20090101599 04/05/2009
Número(s) de prioridad:	DE20081022520 20080507
Resumen de AR071620 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Preparación farmacéutica sólida con liberación retardada, que comprende: a) al menos un ingrediente farmacéuticamente activo, b) polivinilpirrolidona y/o un derivado de polivinilpirrolidona con un valor de K de al menos 17, c) al menos una carga. Reivindicación 5: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, que comprende un depsipéptido. Reivindicación 6: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con la reivindicación 5, que comprende emodepsida. Reivindicación 7: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con la reivindicación 6, que comprende emodepsida y praziquantel. Reivindicación 8: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende un analgésico. Reivindicación 9: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con la reivindicación 8, que comprende metamizol. Reivindicación 10: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, que comprende una lactona macrocíclica. Reivindicación 11: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con la reivindicación 10, que comprende ivermectina. Reivindicación 12: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende un derivado de ácido fosfórico farmacológicamente aceptable. Reivindicación 13: Preparación farmacéutica sólida de acuerdo con la reivindicación 12, que comprende butafosfano.</p>	

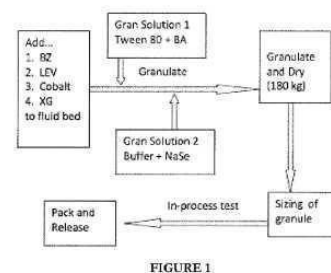
FORMULACIÓN LÍQUIDA PARA SUMINISTRO ORAL	
Publicación:	AR073780 (A1)
Solicitante(s):	BOMAC RESEARCH LTD [NZ]
Estado:	DESISTIDA (08/11/12)
Número de solicitud:	AR20090103850 07/10/2009
Número(s) de prioridad:	NZ20080571920 20081008
Resumen de AR073780 (A1)	
<p>Traducir este texto al Too Una formulación oral líquida de gran volumen de tipo oral drench que incluye una mezcla de: al menos un compuesto de lactona macrocíclica lipófila en combinación con; al menos un compuesto antihelmíntico hidrófilo; caracterizada porque el compuesto o compuestos de lactona macrocíclica lipófila están mezclados con aceite, en donde e) aceite está caracterizado por incluir ácido ricinoleico. Reivindicación 7: La formulación según lo reivindicado en una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el compuesto o compuestos de lactona macrocíclica lipofila están seleccionados de: abamectina, ivermectina, y combinaciones de las mismas. Reivindicación 8: La formulación según lo reivindicado en una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el compuesto antihelmíntico hidrófilo es levamisol HCl. Reivindicación 13: La formulación según lo reivindicado en la reivindicación 12, en donde los otros agentes se seleccionan de; bencimidazoles sustituidos o instituidos, closantel, praziquantel, y combinaciones de los mismos. Reivindicación 44: El método según lo reivindicado en la reivindicación 43, en donde los otros agentes están seleccionados de levamisol HCl, bencimidazoles sustituidos o insustituidos, closantel, praziquantel, y combinaciones de los mismos.</p>	

FORMULACIÓN DE DORAMECTINA EN DOSIS ELEVADA	
Publicación:	AR075428 (A1)
Solicitante(s):	PFIZER [US]
Estado:	CONCEDIDA (15/04/2019)
Número de solicitud:	AR20100100431 15/02/2010
Número(s) de prioridad:	US20090152911P 20090216 ; US20090219837P 20090624
Resumen de AR075428 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Composición veterinaria antiparasitaria que comprende a) doramectina al 3-6% p/v, b) aceite de algodón al 39-60% v/v, c) benzoato de bencilo al 30-50% v/v; y opcionalmente d) uno o más entre conservante, excipiente auxiliar y vitamina liposoluble. Reivindicación 4: Composición según la reivindicación 3, que comprende adicionalmente una o más vitaminas liposolubles seleccionadas del grupo que consiste en vitamina A, vitamina D y vitamina E. Reivindicación 8: Utilización de la composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 para preparar un medicamento para la prevención, tratamiento o control de parásitos en el ganado, que comprende la administración por vía parenteral de dicho medicamento a dicho animal. Reivindicación 10: Composición veterinaria politerápica antiparasitaria que comprende a) doramectina al 1-3% p/v, b) agente antiparasitario al 1-3% p/v o combinación al 1-3% p/v de más de un agente antiparasitario seleccionado del grupo que consiste en abamectina, ivermectina, eprinomectina, moxidectina y milbemicina, c) aceite de algodón al 39-75% v/v, d) benzoato de bencilo al 25-50% v/v; y opcionalmente e) uno o más entre un conservante, excipiente auxiliar y vitamina liposoluble, en la que dicha vitamina se selecciona del grupo que consiste en vitamina A, vitamina D y vitamina E.</p>	

SISTEMA DE ADMINISTRACIÓN DE FÁRMACO DE LACTONA MACROCÍCLICA.USO. MÉTODO DE TRATAMIENTO	
Publicación:	AR075846 (A1)
Solicitante(s):	ORGANON NV [NL]; INTERVET INT BV [NL]
Estado:	DESISTIDA (11/04/13)
Número de solicitud:	AR20100100817 16/03/2010
Número(s) de prioridad:	EP20090155383 20090317 ; US20090160942P 20090317
Resumen de AR075846 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Un sistema de administración de fármaco para la liberación controlada de una lactona macrocíclica como ingrediente activo, que comprende un depósito no poroso sólido de un copolímero de polietileno acetato de vinilo farmacéuticamente aceptable, cargado con la lactona macrocíclica y un recubrimiento no poroso que cubre el depósito, el recubrimiento comprende un copolímero de polietileno acetato de vinilo, donde la lactona macrocíclica es liberada sustancialmente por difusión a través del recubrimiento del sistema de administración de fármaco. Reivindicación 7: Un sistema de administración de fármaco de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la lactona macrocíclica se selecciona entre el grupo que comprende ivermectina, moxidectina, selamectina, doramectina, abamectina y mezclas de ellos. Reivindicación 8: Un sistema de administración de fármaco de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque el depósito comprende un agente de radiocontraste, preferentemente, sulfato de bario. Reivindicación 10: Un sistema de administración de fármacos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque el sistema de administración se presenta en forma de implante.</p>	

PREPARACIONES ANTIHELMÍNTICAS GRANULADAS Y SISTEMAS DE SUMINISTROS	
Publicación:	AR079409 (A1)
Solicitante(s):	MUKHOPADHYAY DEBASHIS [NZ]; CLEVERLY DOUGLAS ROBERT [NZ]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20100103280 07/09/2010
Número(s) de prioridad:	NZ20090579546 20090907 ; NZ20090579545 20090907 ; NZ20090579544 20090907
Resumen de AR079409 (A1)	

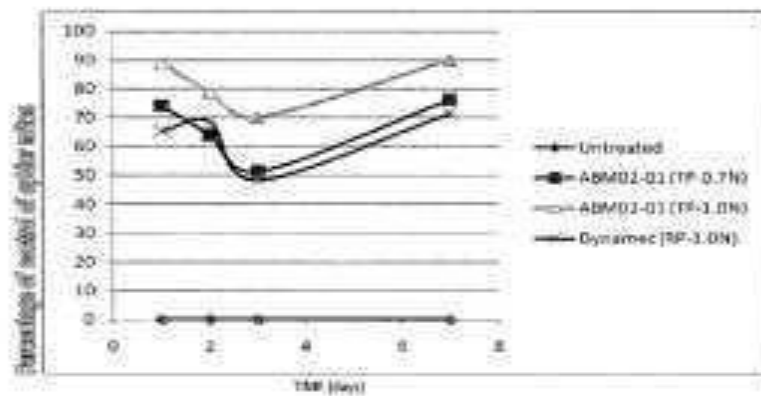
Una composición antihelmíntica en forma de gránulo estable que comprende dos o más agentes activos antihelmínticos seleccionados entre uno o más imidazotiazoles, uno o más benzimidazoles, una o más lactonas macrocíclicas, una o más salicilanilidas, praziquantel, en la cual el gránulo estable es fácilmente dispersable en agua para proveer una mezcla homogénea de los agentes activos antihelmínticos para la administración a un mamífero no humano, en donde el gránulo comprende, además, un agente de suspensión si los agentes activos antihelmínticos comprenden un benzimidazol, un agente de humedecimiento si los agentes activos antihelmínticos comprenden una lactona macrocíclica, un agente de humedecimiento si los agentes activos antihelmínticos comprenden una salicilanilida y un agente de suspensión si los agentes activos antihelmínticos comprenden praziquantel. Sistema de dosificación para dosificar los animales en forma oral con un agente antihelmíntico. Método para preparar una formulación de suministro líquida estable para tratar un animal a partir de la composición antihelmíntica en forma de gránulo estable y método para obtener una composición antihelmíntica en forma de gránulo. Reivindicación 7: Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada porque la lactona macrocíclica se selecciona entre avermectina, ivermectina y abamectina. Reivindicación 8: Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada porque el benzimidazol se selecciona entre oxfendazol, albendazol o fenbendazol.



MICROCAPSULAS QUE CONTIENEN LACTONAS DE MACROLIDOS ABAMECTINA, MILBEMECTINA, AVERMECTINAS, MILBEMICINAS, EMAMECTINAS, IVERMECTINAS Y MECTINAS EN GENERAL	
Publicación:	AR080604 (A1)
Solicitante(s):	GAT MICROENCAPSULATION AG [AT]
Estado:	DESISTIDA (08/11/18)
Número de solicitud:	AR20100102896 06/08/2010
Número(s) de prioridad:	WO2009EP05747 20090807
Resumen de AR080604 (A1)	
<p>Formulaciones microencapsuladas de lactonas de macrólidos (abamectina, milbemectina, milbemicinas, emamectina, avermectinas, ivermectinas) en las que el principio activo está protegido de la degradación UV, con unas características de liberación excepcionales que se asemejan a las de un concentrado en emulsión o, si se desea, de efecto prolongado; además con propiedades reológicas adecuadas y con toxicidad reducida. Proporciona un procedimiento de microencapsulación único para la estabilidad química y la actividad biológica de las mectinas, por ejemplo abamectina, y proporciona microcápsulas de mectinas a emplear en formulaciones SC, WG/SC, ZC, CE/SC y cualquier tipo de formulación que contenga microcápsulas y combinada con otros principios biológicamente activos. Reivindicación 1: Suspensión de microcápsulas en agua caracterizada porque: a) las microcápsulas engloban al menos un compuesto como principio activo de lactona de macrólido a 0,1-40% disuelto y/o disperso en un disolvente oleoso que es esencialmente insoluble en agua, en la que la proporción total entre disolvente oleoso y agua de la suspensión es de 10:90 a 70:30; b) La pared de las microcápsulas está formada por un material polimérico a 0,1-35%, en la que la cantidad de material que forma la pared en el caso de una pared de poliurea, poliuretano, poliurea/poliuretano o poliurea/poliuretano-glicolurilo debe ser de al menos 10% del peso de la lactona de macrólido microencapsulada; c) El tamaño medio de las microcápsulas es de 0,5-50 pm; d) La fase acuosa contiene al menos: i) uno o más hidrocoloide(s) polisacárido(s) del grupo de las gomas y/o sus derivados a 0,1-30%, en la que la proporción entre la lactona de macrólido y la(s) goma(s) es de 10:1 a 1:20. y ii) uno o más compuesto(s) tensioactivo(s) a 0,3-30%; que se seleccionan a partir de a) y/o b); a) al menos una sal alcalina o alcalinotérrica que contiene grupo sulfonato de naftaleno, condensados de formaldehído de naftaleno, lignosulfonato, lignosulfonato o succinato sulfometilado, sulfosuccinato; y/o sus derivados a 0,5 a 30% y/o b) al menos un dispersante del tipo de un polímero de alquencil o alcanil o alquilen pirrolidinona y/o sus derivados de 0,3 a 15%; en la que a) + b) están de 0,3% a una proporción de 1:50 de las lactonas de macrólidos correspondientes; e) Agentes de coformulación adicionales si y cuando fueran necesarios dependiendo del uso final de la suspensión; refiriéndose todos los porcentajes al porcentaje en peso total de la suspensión, a no ser que se indique lo contrario. Reivindicación 15: Procedimiento de fabricación de una suspensión de microcápsulas de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque: a) Se prepara una primera fase acuosa con agua, al menos un hidrocoloide, al menos un lignosulfonato o su derivado, un estabilizador de pH que preferentemente además tiene propiedades antioxidantes y opcionalmente un protector UV soluble o emulsionable o dispersable en agua y, si fuera necesario, los agentes de coformulación habituales; b) Se prepara una fase oleosa con un disolvente no miscible en agua capaz de disolver la cantidad objetivo de la lactona de macrólido, una mezcla de material que forma las paredes compuesta por isocianatos y opcionalmente derivados de glicolurilo, eventualmente con alcoholes o aminas funcionales que pueden reaccionar con los isocianatos, al menos un catalizador soluble o emulsionable o dispersable en aceites capaz de desencadenar la formación polimérica de la pared, un antioxidante liposoluble, un protector UV liposoluble y el principio activo de lactona de macrólido; c) La fase oleosa se emulsiona en la fase acuosa a aproximadamente 50-70sC con tensión de alta cizalla; d) Según la resistencia que se desee para la pared, puede añadirse un catalizador secundario del tipo de amina funcional a la emulsión producida en (c), de diez a treinta minutos después de (c), y opcionalmente un ácido sulfónico o cualquier ácido para alcanzar pH inferior a 5,1 pero superior a 3,5 para evitar la descomposición de las mectinas; e) Aproximadamente 10-30 minutos después de (d), puede añadirse una fase acuosa secundaria con agitación suave a la solución producida en (d). Si el uso final de la suspensión requiere una gran estabilidad con respecto a la dispersión que contiene agua, para una vida útil en depósito larga, puede añadirse al menos un emulsionante de HLB 6 a 14, preferentemente un copolímero de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno, un lignosulfonato y/o un dispersante diferente de un lignosulfonato, de acuerdo con la reivindicación 1; f) Se practica un periodo de endurecimiento de las microcápsulas con agitación suave hasta que se han completado las reacciones que forman la pared, a aproximadamente 50-70sC en un primer periodo y después se deja enfriar la solución a temperatura ambiente;</p>	

g) Se prepara una fase acuosa terciaria que contiene agua, un agente modificador de la viscosidad que es un coloide polisacárido, preferentemente una goma, y finalmente se añaden los aditivos agrícolas habituales como poliglicoles después de la etapa (e) con agitación suave; h) La solución resultante después de la etapa (g) está lista para envasar y usar por el consumidor. I) Finalmente se mezcla la solución resultante de la etapa (g) en forma de otros tipos de formulación fitosanitaria para conseguir otros tipos de formulación diferentes de la suspensión de cápsulas (SC) como formulaciones ZX o ZC y finalmente se seca la SC o sus mezclas, para producir WG/SC, y /o finalmente se microencapsula la suspensión resultante en un medio con base oleosa en el que la fase acuosa y las microcápsulas que contienen la lactona de macrólido se microencapsulan y se emulsionan y se suspenden en la fase oleosa continua. Reivindicación 16: El uso de formulaciones microencapsuladas de lactonas de constituidas por una suspensión de microcápsulas que comprende al menos una lactona de macrólido microencapsulada en microcápsulas con un tamaño de partícula medio de 0,5-2 micrómetros y un percentil 90 inferior a 15 micrómetros, para lograr de forma simultánea en productos de protección vegetal: a) reducir la toxicidad dérmica y oral aguda con respecto a la de un concentrado en emulsión de la misma lactona(s) de macrólido(s) a la misma concentración; b) reducir la degradación UV o por luz visible con respecto a la de un concentrado en emulsión de la misma lactona(s) de macrólido(s) a la misma concentración; c) lograr un efecto biológico (velocidad y patrón de actividad contra organismos indeseables) comparable al de un concentrado en emulsión de la misma lactona(s) de macrólido(s) a la misma concentración.

Figure 1
Efficacy of the Microencapsulated Formulation containing the insecticide Captan (Suspension of Abtractin at 1.5 %, code ABM02-01) vs. Dynamic (Granulation Concentrate of Abtractin at 1.5 %)



FORMULACIONES INYECTABLES PARASITICIDAS DE LEVAMISOL Y LACTONAS MACROCÍCLICAS. MÉTODO DE PREPARACIÓN. MÉTODO DE TRATAMIENTO.	
Publicación:	AR081187 (A1)
Solicitante(s):	MERIAL LTD [US]
Estado:	DESISTIDA (06/06/14)
Número de solicitud:	AR20110101654 12/05/2011
Número(s) de prioridad:	US20100333882P 20100512
Resumen de AR081187 (A1)	
<p>Formulaciones que contienen levamisol / lactona macrocíclica inyectables que son efectivas contra plagas animales incluyendo endoparásitos. Las formulaciones se pueden utilizar para combatir parásitos en aves y mamíferos. Método mejorado para erradicar, controlar y prevenir la infestación por parásitos de aves y mamíferos. Reivindicación 1: Una formulación farmacéutica o veterinariamente aceptable adaptada para ser inyectada a un animal, caracterizada porque dicha formulación comprende; a) una cantidad efectiva de un levamisol; b) una cantidad efectiva de por lo menos una lactona macrocíclica; c) un sistema farmacéuticamente aceptable de solventes y tensioactivos donde el sistema provee una estabilidad aceptable ante el almacenamiento tanto para el levamisol como la lactona macrocíclica y donde el sistema provee una viscosidad que es apropiada para la inyección; y donde el sistema comprende por lo menos un tensioactivo. Reivindicación 3: La formulación de la reivindicación 1, caracterizada porque la lactona macrocíclica es ya sea ivermectina o eprinomectina y está presente en una cantidad suficiente para administrar una dosis de por lo menos 150 microgramos/kg de peso corporal del animal. Reivindicación 4: La formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 o 3 caracterizada porque además comprende un antioxidante, un conservante, y agua apta para inyección donde el agua apta para inyección se provee en una cantidad suficiente para llevar la formulación a un volumen apropiado para inyectarla.</p>	

FORMULACIÓN INYECTABLE DE UNA LACTONA MACROCÍCLICA Y LEVAMISOL, FORMULACIÓN Y USO VETERINARIO	
Publicación:	AR081970 (A1)
Solicitante(s):	INTERVET INT BV [NL]
Estado:	EN TRAMITE
Número de solicitud:	AR20110102154 22/06/2011
Número(s) de prioridad:	EP20100167222 20100624 ; US20100420849P 20101208
Resumen de AR081970 (A1)	
<p>Formulaciones para controlar parásitos que comprenden una combinación de un compuesto de una lactona macrocíclica y levamisol, en donde el levamisol se encuentra en forma de partículas suspendidas en un solvente no acuoso. Reivindicación 1: Una formulación de una solución de una lactona macrocíclica caracterizada porque comprende levamisol en forma de partículas en un sistema de solvente no acuoso. Reivindicación 6: La formulación de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizada porque el compuesto de lactona macrocíclica es seleccionado entre el grupo que comprende abamectina, doramectina, eprinomectina, ivermectina y moxidectina. Reivindicación 9: La formulación de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizada porque la formulación incluye adicionalmente por lo menos un medicamento adicional seleccionado entre el grupo de antihelmínticos, suplementos dietarios, vitaminas, minerales. Reivindicación 11: La formulación de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizada porque comprende: aprox. 1,5 a 4% p/v de ivermectina, aprox. 15 a 18,8% p/v de levamisol, y en donde el levamisol se encuentra en partículas y la ivermectina se encuentra substancialmente en un sistema de solvente no acuoso que comprende un aceite y un solvente orgánico. Reivindicación 12: La formulación de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizada porque el aceite comprende aceite de ricino y un triglicérido de cadena mediana o una mezcla de triglicéridos de cadena mediana. Reivindicación 13: La formulación de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizada porque el solvente orgánico es dimetilacetamida.</p>	

COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE COMPRENDE CLORURO DE ISOMETAMIDIUM EN SOLUCIÓN PARA EL TRATAMIENTO DE LA TRIPANOSOMIASIS EN ANIMALES	
Publicación:	AR089037 (A1)
Solicitante(s):	INVEST FARMACÉUTICAS Y VETERINARIAS S L [ES]; REVEEX DE VENEZUELA C A LAB [VE]
Estado:	DESISTIDA (15/12/15)
Número de solicitud:	AR20120104496 29/11/2012
Número(s) de prioridad:	ES20120030092 20120124
Resumen de AR089037 (A1)	
<p>Composición farmacéutica, que comprende cloruro de isometamidium a una concentración entre 1 y 4% (peso/volumen), isopropilidenoglicerol o glicerinformal a una concentración entre 40 y 95% (peso/volumen), un poliol a una concentración entre 0 y 50% (peso/volumen), 15-hidroxiestearato de polietilenglicol a una concentración entre 0,5 y 7% (peso/volumen), en solución junto con excipientes farmacéuticamente aceptables, para el tratamiento de la tripanosomiasis en animales. La composición farmacéutica es una solución inyectable lista para usar y se puede administrar por vía intravenosa, subcutánea o intramuscular en rumiantes équidos y camélidos. La composición puede comprender además agentes antiparasitarios, como la ivermectina, a una concentración entre 1 y 5% (peso/volumen) para el tratamiento de la tripanosomiasis y la eliminación de parásitos gastrointestinales y pulmonares en animales.</p>	

PROCESO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN ANTIHELMÍNTICA, COMPOSICIÓN ANTIHELMÍNTICA, MÉTODO DE TRATAMIENTO VETERINARIO Y MÉTODO DE TRATAMIENTO ANTIHELMÍNTICO	
Publicación:	AR098630 (A1)
Solicitante(s):	OURO FINO SAÚDE ANIMAL PARTICIPAÇÕES S A [BR]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20140104530 05/12/2014
Número(s) de prioridad:	BR20131031277 20131205
Resumen de AR098630 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Proceso para preparar una composición anti-helmíntica, caracterizado porque incluye las siguientes etapas: (a) adicionar cerca de 40 - 60% de Albendazole base libre en una mezcla de solventes orgánicos, mezcla que debe ser previamente calentada en la faja de temperatura entre 55 - 75°C; (b) homogeneizar la mezcla utilizando agitación mecánica por cerca de 20 - 40 minutos hasta completa solubilización; (c) resfriar la mezcla homogeneizada hasta cerca de 30 - 40°C; (d) adicionar la cantidad total de Avermectina en la mezcla resfriada en la etapa (c); (e) homogeneizar la mezcla obtenida en la etapa (d) a través de agitación mecánica por cerca de 10 - 20 minutos hasta completa solubilización, obteniéndose una solución; (f) adicionar un agente de viscosidad y aplicar agitación mecánica hasta homogeneización completa de la mezcla; (g) adicionar un agente de permeabilidad y homogeneizar; y, (h) adicionar la cantidad restante de sulfóxido de Albendazole base y homogeneizar la suspensión final. Reivindicación 6: Proceso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque la avermectina es seleccionada entre Ivermectina, Abamectina, Moxidectina, Eprinomectin y Doramectina. Reivindicación 7: Composición antihelmíntica obtenida de acuerdo con el proceso definido en las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada porque dicha composición incluye una cantidad eficaz de una mezcla inyectable de sulfóxido de Albendazole base a Avermectina.</p>	

UN NANOVEHÍCULO DE LIBERACIÓN CONTROLADA PARA EL TRATAMIENTO Y PREVENCIÓN DE LA PEDICULOSIS	
Publicación:	AR102397 (A1)
Solicitante(s):	FUNDACIÓN UNIV DE MORÓN [AR]; LAURENZA JULIO DANIEL [AR]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20150103422 21/10/2015
Número(s) de prioridad:	AR2015P103422 20151021
Resumen de AR102397 (A1)	
<p>Un nanovehículo de liberación controlada para el tratamiento y prevención de la pediculosis que comprende liposomas de carga positiva constituidos por fosfolípido, alcohol, polímero cuaternizado, materia activa, tensioactivo, conservante y agua; donde dichos liposomas son menores a 220 nanómetros y se adhieren, formando una película, sobre piojos y cabellos; y liberan dicha materia activa durante un tiempo de al menos 7 días sobre cabellos sometidos a lavados diarios</p>	

FORMULACIÓN INYECTABLE DE UNA LACTONA MACROCÍCLICA Y LEVAMISOL	
Publicación:	AR107108 (A1)
Solicitante(s):	INTERVET INT BV [NL]
Estado:	EN TRAMITE
Número de solicitud:	AR20160103960 21/12/2016
Número(s) de prioridad:	US201562270721P 20151222
Resumen de AR107108 (A1)	
<p>Formulaciones para controlar parásitos, que comprenden una combinación de un compuesto de lactona macrocíclica y levamisol, en donde el levamisol está en forma de particulado suspendido en triacetín y tiene un tamaño de partícula eficaz promedio (D_{50}) de £ 250 mm. Reivindicación 1: Una formulación farmacéutica inyectable que comprende lactona macrocíclica y levamisol y triacetín como portador en donde la lactona macrocíclica está en la solución y el levamisol está en la suspensión y tiene un tamaño de partícula eficaz promedio (D_{50}) de £ 250 mm. Reivindicación 12: La formulación como se reivindica en la reivindicación 11, en donde el compuesto de lactona macrocíclica es eprinomectina, ivermectina o moxidectina. Reivindicación 16: La formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, que comprende: aproximadamente 0,5 - 10% p/v de ivermectina, aproximadamente 15 - 20% p/v de levamisol, aproximadamente 0,1 - 1% p/v de monoestearato de aluminio, aproximadamente 0,1 - 1% p/v de hidroxitolueno butilado (BHT) y, triacetín, cantidad suficiente 100% (v/v). Reivindicación 20: Un método para tratar o prevenir parasitosis provocada por parásitos internos o externos que comprende administrar a un animal que lo necesita una cantidad eficaz de la formulación de cualquiera una de las reivindicaciones 1 - 16. Reivindicación 23: Un proceso para preparar una formulación farmacéutica inyectable que comprende: a) disolver una lactona macrocíclica en triacetín; b) mezclar la solución de lactona macrocíclica con levamisol; y c) triturar la mezcla del paso b) para lograr un tamaño de partícula promedio eficaz (D_{50} £ 250 mm).</p>	

COMPOSICIONES QUE COMPRENEN TIMOLOL Y UN AGENTE ANTIINFLAMATORIO	
Publicación:	AR108793 (A1)
Solicitante(s):	ALMIRALL SA [ES]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20170101656 15/06/2017
Número(s) de prioridad:	EP20160382279 20160616
Resumen de AR108793 (A1)	
<p>Refiere a combinaciones que comprenden timolol y un compuesto útil para el tratamiento de rosácea seleccionado de ivermectina, metronidazol y praziquantel y al uso de estas combinaciones en el tratamiento tópico de rosácea. Reivindicación 1: Combinación para su uso tópico que comprende (a) timolol o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y (b) un compuesto activo útil para el tratamiento de rosácea seleccionado de ivermectina, metronidazol, praziquantel y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos. Reivindicación 7: Composición farmacéutica adecuada para administración tópica que comprende una combinación según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en la que los componentes (a) y (b) están presentes en la misma formulación. Reivindicación 9: Composición farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones 7 u 8, en la que la composición es una loción, una crema o un gel. Reivindicación 14: Método de tratamiento de un paciente que padece rosácea, método que comprende administrar por vía tópica a dicho paciente una combinación según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o una composición farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 10. Reivindicación 17: Uso de (a) timolol o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 2 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de rosácea mediante coadministración tópica con (b) un agente antiinflamatorio según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 4 ó 5</p>	

COMPOSICIONES DE GRÁNULOS PARASITICIDAS CON DOBLE PRINCIPIO ACTIVO, SUS MÉTODOS Y USOS	
Publicación:	AR112209 (A1)
Solicitante(s):	MERIAL INC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20180101766 26/06/2018
Número(s) de prioridad:	US201762524746P 20170626
Resumen de AR112209 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Un gránulo parasiticida para uso veterinario caracterizado porque comprende: (e) por lo menos un compuesto lactona macrocíclica, (f) por lo menos un regulador del crecimiento de insectos (IGR); (g) por lo menos un excipiente tensioactivo, y (h) por lo menos un excipiente diluyente, donde dichos gránulos se conservan estables y farmacéuticamente activos durante por lo menos 6 meses, y cuando dicho gránulo se mezcla en agua, forma una composición líquida eficaz como parasiticida</p>	

Ivermectina – Complemento

Los documentos que se agregan a continuación son documentos que reivindican el uso de ivermectina para la inhibición de distintos tipos de virus, no presentan solicitudes equivalentes en Argentina, y se adicionan a modo de complemento por considerarse de interés para la presente publicación.

INHIBITION OF ZIKA VIRUS INFECTION	
Publicación:	WO2017214080 (A1)
Solicitante(s):	UNIV MASSACHUSETTS [US]
Número de solicitud:	WO2017US36053 20170606
Número(s) de prioridad:	US201662348039P 20160609
Resumen de WO2017214080 (A1)	
Methods for treating or reducing the risk of developing Zika virus infection in a subject, comprising administering an effective amount of lanatoside C, ribavirin and/or ivermectin to the subject.	

SMALL-MOLECULE INHIBITORS OF DENGUE AND WEST NILE VIRUS PROTEASES	
Publicación:	WO2013134135 (A1)
Solicitante(s):	UNIV TEXAS [US]
Número de solicitud:	WO2013US28893 20130304
Número(s) de prioridad:	US201213412448 20120305
Resumen de WO2013134135 (A1)	
The present invention concerns methods and compositions comprising an effective amount of one or more small molecule azoaryl NS2B-NS3 protease inhibitors. The methods and compositions can be used under conditions that prevent or treat a flavivirus infection, such as infections caused by dengue virus and West Nile virus in a subject.	

AVERMECTINS AND MILBEMYCINS FOR THE TREATMENT OF FLAVIVIRUS INFECTIONS	
Publicación:	WO2011051159 (A1)
Solicitante(s):	CONSIGLIO NAZIONALE RICERCHE [IT]; UNIV AIX MARSEILLE II [FR]; UNIV LEUVEN KATH [BE]; MILANI DE MAYO DE MARI MARIO [IT]; MASTRANGELO ELOISE [IT]; BOLOGNESI MARTINO [IT]; DE LAMBALLERIE XAVIER [FR]; PASTORINO BORIS [FR]; NEYTS JOHAN [BE]; KAPTEIN SUZANNE [NL]
Número de solicitud:	WO2010EP65880 20101021
Número(s) de prioridad:	EP20090174368 20091028
Resumen de WO2011051159 (A1)	
The present invention relates to the use of a substance selected from the group consisting of avermectins and milbemycins, particularly the substance ivermectin, for preparing an antiviral medicament for the treatment of a Flavivirus infection, preferably an infection caused by YFV (yellow fever virus), DENV (Dengue virus), JEV (Japanese encephalitis virus), TBEV (tick-borne encephalitis virus) or MODV (Modoc virus). The antiviral medicament of the present invention is suitable for oral administration to a Flavivirus-infected subject, such as a human being or other mammal.	

MACROCYCLIC LACTONE COMBINATION COMPOSITIONS, VACCINES AND METHODS FOR PRODUCING SAME	
Publicación:	WO2010120195 (A1)
Solicitante(s):	ANCARE SCIENT LTD [NZ]; HOLMES ROBERT WILLIAM LACHLAN [NZ]; RAZZAK MAJID HAMEED ABDUL
Número de solicitud:	WO2010NZ00067 20100414
Número(s) de prioridad:	NZ20090576201 20090414 ; NZ20090576391 20090420
Resumen de WO2010120195 (A1)	
<p>An injectable composition, capable of preventing or controlling parasitic, viral, or bacterial infections or diseases, for example scours, in pregnant cows and viral infections or diseases in neonatal calves by parenterally administering to each cow in a herd of pregnant cows, a dose of a combination composition comprising: (a) at least one inactivated viral component derived from rotavirus and/or coronavirus; (b) a macrocyclic lactone active compound; and (c) a pharmaceutically acceptable parenteral carrier and preservative. The injectable compositions which include eprinomectin result in extremely low milk residues.</p>	

TARGETED DELIVERY OF GLYCINE RECEPTORS TO EXCITABLE CELLS	
Publicación:	WO2008143875 (A1)
Solicitante(s):	UNIV PITTSBURGH [US]; CASCIO MICHAEL [US]; GLORIOSO JOSEPH C III [US]; GOSS JAMES R [US]; KRISKY DAVID M [US]
Número de solicitud:	WO2008US06152 20080514
Número(s) de prioridad:	US20070917752P 20070514
Resumen de WO2008143875 (A1)	
<p>The invention provides a method of modulating electrophysiological activity of an excitable cell. The method involves causing exogenous expression of a glycine receptor (GlyR) protein in an excitable cell of a subject. Thereafter, the excitable cell is exposed to an allosteric modulator of the GlyR protein. Modulation of the exogenous GlyR protein (an ion channel) in response to the allosteric modulator modulates the electrophysiological activity of the excitable cell. The method can be used to control pain in a subject. The invention further provides a replication-defective HSV vector comprising an expression cassette encoding a GlyR protein, stocks and pharmaceutical compositions containing such vectors, and a transgenic animal.</p>	

Tocilizumab

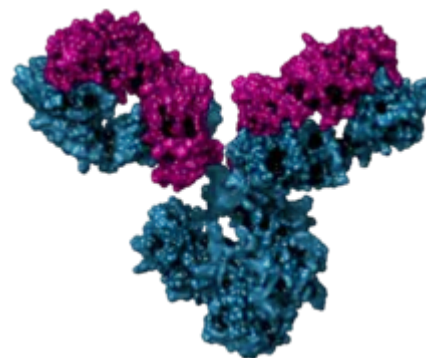
El tocilizumab es un anticuerpo monoclonal humanizado de la familia de la IgG1 que inhibe el receptor de la interleukina 6 principal responsable de procesos proinflamatorios e inflamatorios causados por distintos factores o enfermedades

Fue desarrollado por Chugai Pharmaceuticals para el tratamiento de la artritis reumatoidea grave o moderada, el dolor idiopático y la enfermedad de Castleman. En el caso del COVID 19 se ha comprobado en laboratorio que el compuesto inhibe la unión del receptor de la interleukina 6 con la glicoproteína gp130, deteniendo así la llamada tormenta de citoquinas responsable de la formación de trombos y del ingreso de fluidos en los alvéolos pulmonares lo que provoca graves trastornos respiratorios a los pacientes con el virus.

En Argentina, el compuesto se encuentra concedido como patente AR068564B1 actualmente vigente.

Anticuerpo monoclonal

<u>Fuente</u>	<u>Humanizado</u>
<u>Objetivo</u>	IL6R (CD126)
Identificadores	
<u>Número CAS</u>	<u>375823-41-9</u>
<u>Código ATC</u>	<u>L04AC07</u>
<u>DrugBank</u>	<u>DB06273</u>
Datos químicos	
<u>Fórmula</u>	<u>C₆₄₂₈H₉₉₇₆N₁₇₂₀O₂₀₁₈S₄₂</u>
<u>Peso mol.</u>	<u>145.0kDa</u>
Datos clínicos	
Nombre comercial	RoActemra®, Actemra®

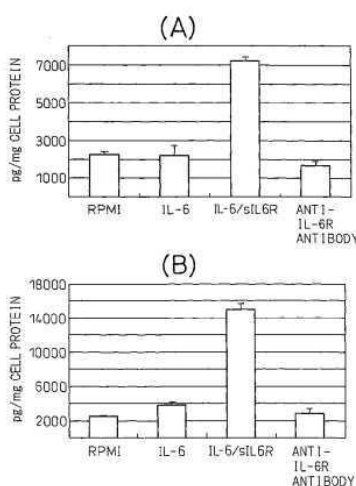


Antecedentes localizados

MÉTODOS PARA TRATAR ENFERMEDADES RELACIONADAS CON INTERLEUQUINA 6	
Publicación:	AR044104 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	DESISTIDA (30/11/15)
Número de solicitud:	AR20040101424 27/04/2004
Número(s) de prioridad:	GB20030009619 20030428
Resumen de AR044104 (A1)	
<p>Una composición farmacéutica para el tratamiento de enfermedades relacionadas con interleuquina-6 (IL-6), que comprende un antagonista de interleuquina-6 (antagonistas de IL-6) e inmunosupresores. El antagonista de IL-6 es preferentemente un anticuerpo contra un receptor de interleuquina-6 (IL-6R). Reivindicación 15: La composición farmacéutica de acuerdo con cualquier de las reivindicaciones 1 a 14, en donde dichas enfermedades relacionadas con IL-6 son artritis reumatoidea, plasmocitosis, hiperinmunoglobulinemia, anemia, nefritis, caquexia, mieloma múltiple, enfermedad de Castleman, nefritis proliferativa mesangial, lupus eritematoso sistémico, enfermedad de Crohn, colitis ulcerativa, pancreatitis, psoriasis, artritis idiopática juvenil o artritis idiopática juvenil sistémica, vasculitis y enfermedad de Kawasaki. Reivindicación 22: La composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y las reivindicaciones 6 a 21, en donde dicho inmunosupresor es metotrexato (MTX). Reivindicación 30: Un uso de un antagonista de IL-6 para la producción de una composición farmacéutica que comprende inmunosupresores, para la reducción o prevención de reacciones alérgicas luego del tratamiento de enfermedades relacionadas con IL-6 con el antagonista de IL-6.</p>	

AGENTE TERAPÉUTICO PARA EL MESOTELIOMA	
Publicación:	AR046290 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	DESISTIDA (25/08/16)
Número de solicitud:	AR20040103743 15/10/2004
Número(s) de prioridad:	JP20030358152 20031017
Resumen de AR046290 (A1)	
<p>Agente terapéutico para el mesotelioma que contiene un antagonista de la interleuquina-6 (IL-6) tal como en anticuerpo para el receptor de IL-6 (IL-6R) y un inhibidor del crecimiento celular del mesotelioma que contiene un antagonista de IL-6 tal como el anticuerpo para IL-6R.</p>	

Fig.3



UN AGENTE PREVENTIVO PARA LA VASCULITIS.	
Publicación:	AR048210 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	DESISTIDA (12/04/16)
Número de solicitud:	AR20040104641 13/12/2004
Número(s) de prioridad:	JP20030423517 20031219
Resumen de AR048210 (A1)	
Un agente preventivo y/o terapéutico para lavasculitis tal como la poliarteritis nudosa, el síndrome de aortitis y una vasculitis asociada con anomalías inmunológicas, comprendiendo dicho agente un antagonista de interleuquina 6 (IL-6) como componente activo.	

AGENTES TERAPÉUTICOS PARA TRASTORNOS DEL OÍDO INTERNO QUE CONTIENEN UN ANTAGONISTA DE IL- 6 COMO UN INGREDIENTE ACTIVO	
Publicación:	AR048335 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	DESISTIDA (20/07/12)
Número de solicitud:	AR20050101169 23/03/2005
Número(s) de prioridad:	JP20040087270 20040324 ; JP20040268800 20040915
Resumen de AR048335 (A1)	
Un método terapéutico y/o preventivo para trastornos del oído interno que comprende un antagonista de IL-6, preferentemente un anticuerpo anti-IL-6R, como un ingrediente activo.	

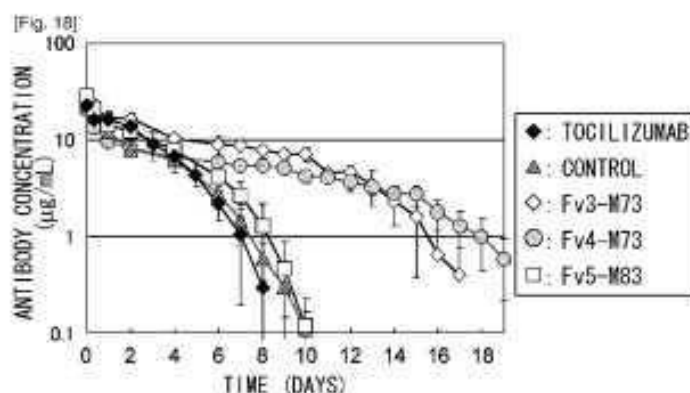
DOSIS FIJA POR INYECCIÓN ÚNICA PARA OCRELIZUMAB (2H7). USO DE RITUXIMAB. FORMULACIÓN FARMACEUTICA. KIT.	
Publicación:	AR068531 (A1)
Solicitante(s):	HOFFMANN LA ROCHE [CH]
Estado:	DESISTIDA (24/10/11)
Número de solicitud:	AR20080104116 22/09/2008
Número(s) de prioridad:	US20070974641P 20070924 ; GB20070018684 20070924
Resumen de AR068531 (A1)	
<p>Uso de un antagonista de CD20 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad autoinmune, en donde el medicamento es para la administración a un paciente humano en una infusión intravenosa (i.v.) única, terapéuticamente eficaz, de dicho antagonista. El antagonista de CD20 preferentemente es un anticuerpo de CD20, y la enfermedad autoinmune preferentemente es artritis reumatoidea. Reivindicación 4: El uso según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 3, en el que el antagonista del CD20 es un anticuerpo monoclonal del CD20. Reivindicación 6: El uso según una cualquiera de las reivindicaciones 4 o 5, en el que el anticuerpo monoclonal de CD20 es quimérico, humanizado o humano. Reivindicación 26: El uso según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 25, en el que el anticuerpo de CD20 está destinado a la administración en combinación con un fármaco elegido entre el grupo formado por los fármacos antiinflamatorios no esteroideos (NSAID), los analgésicos, los glucocorticosteroides, la ciclofosfamida, el adalimumab, la leflunomida, el infliximab, el etanercept, el ofatumumab, el tocilizumab, el AME-133, el Immu-106 y los inhibidores de COX-2. Reivindicación 27: El uso según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 26, para administración que contiene un segundo agente terapéutico. Reivindicación 29: El uso según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 28, en el que el segundo agente terapéutico es el metotrexato. Reivindicación 50: Un artículo fabricado que contiene (a) un contenedor que contiene un antagonista de CD20; y (b) un prospecto con instrucciones para tratar una enfermedad autoinmune en un sujeto humano, dichas instrucciones indican la cantidad terapéuticamente eficaz completa del antagonista del CD20 que se tiene que administrar al sujeto en forma de infusión intravenosa única. Reivindicación 58: Una formulación farmacéutica que contiene una cantidad eficaz completa de un anticuerpo de CD20 en una forma apropiada para la administración intravenosa una sola vez. Reivindicación 59: La formulación farmacéutica de la reivindicación 58, en la que el anticuerpo de CD20 es la variante 2H7 A humanizada que contiene una cadena L de longitud completa de SEQ ID N°: 6 y una cadena H de longitud completa de SEQ ID N°: 7, o un fragmento de la misma. Reivindicación 62: La formulación farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones de 58 a 61, en la que dicha variante 2H7 A humanizada se formula a razón de 20 mg/ml de anticuerpo en histidina sulfato 10 mM, 60 mg/ml de sucrosa, 0,2 mg/ml de polisorbato 20 y agua estéril para inyección, de pH = 5,8.</p>	

ANTICUERPO ANTI- RECEPTOR DE IL-6 (INTERLEUQUINA 6)	
Publicación:	AR068564 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	CONCEDIDA (27/02/20)
Número de solicitud:	AR20080104191 26/09/2008
Número(s) de prioridad:	JP20070250165 20070926
Resumen de AR068564 (A1)	
<p>Mutaciones de aminoácidos específicos en la región variable, la región de marco y la región constante de TOCILIZUMAB (anticuerpo IgG1 anti-receptor de IL-6 humanizado) y esto permite reducir el riesgo de inmunogenicidad y la heterogeneidad originada en los enlaces disulfuro en la región bisagra, y también permite mejorar la actividad de unión a antígeno, la retención en plasma, la estabilidad bajo condiciones ácidas y la estabilidad en preparaciones con concentraciones elevadas. Composiciones farmacéuticas que comprenden dichos anticuerpos.</p>	

ANTICUERPOS ANTI-RECEPTOR IL-6, COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN Y MÉTODOS PARA PRODUCIRLOS	
Publicación:	AR073404 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	EN TRAMITE
Número de solicitud:	AR20090103711 25/09/2009
Número(s) de prioridad:	JP20080248213 20080926 ; JP20090060806 20090313 ; JP20090067925 20090319
Resumen de AR073404 (A1)	
<p>Composiciones farmacéuticas que comprenden moléculas de segunda generación que son superiores a tocilizumab, por alteración de las secuencias de aminoácidos de las regiones variable y constante de tocilizumab, que es un anticuerpo IgG1 anti-receptor del IL-6 humanizado para aumentar la capacidad para neutralizar antígenos y para incrementar la farmacocinética, de modo tal que se ejerce un efecto terapéutico con una menor frecuencia de administración, y se logran mejoras de la inmunogenicidad, seguridad y propiedades fisicoquímicas (estabilidad y homogeneidad). También se proporcionan métodos para producir estas composiciones farmacéuticas. Se han generado moléculas de segunda generación que son superiores a tocilizumab mediante una combinación apropiada de estas alteraciones de la secuencia de aminoácidos en los dominios CDR, regiones variables y regiones constantes.</p>	

FORMULACIÓN FARMACÉUTICA QUE CONTIENE MOLÉCULAS DE ANTICUERPO MEJORADAS, POLIPÉPTIDOS. MÉTODO PARA ESTABILIZAR SOLUCIÓN, ANTICUERPO.

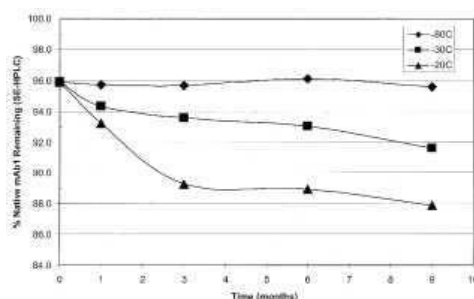
Publicación:	AR075908 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	DESISTIDA (13/03/14)
Número de solicitud:	AR20100100904 19/03/2010
Número(s) de prioridad:	JP20090069095 20090319

Resumen de AR075908 (A1)


Reivindicación 1: Una formulación farmacéutica, caracterizada porque comprende al menos un polipéptido seleccionado entre: (a) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:1 (CDR1 de VH4-M73), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:2 (CDR2 de VH4-M73) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:3 (CDR3 de VH4-M73); (b) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:4 (CDR1 de VH3-M73), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:5 (CDR2 de VH3-M73) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:6 (CDR3 de VH3-M73); (c) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:7 (CDR1 de VH5-M83), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:8 (CDR2 de VH5-M83) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:9 (CDR3 de VH5-M83); (d) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:10 (CDR1 de VL1), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:11 (CDR2 de VL1) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:12 (CDR3 de VL1); (e) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:13 (CDR1 de VL3), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:14 (CDR2 de VL3) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:15 (CDR3 de VL3); y (f) un polipéptido que comprende una CDR1 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:16 (CDR1 de VL5), una CDR2 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:17 (CDR2 de VL5) y una CDR3 que comprende la secuencia de la SEQ ID N°:18 (CDR3 de VL5). Reivindicación 5: Una formulación farmacéutica estable de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizada porque comprende 1-500 mM de agente amortiguador de histidina y/o citrato, 1-1500 mM de al menos un aminoácido catiónico, 1-200 mg/mL de anticuerpo, y 1-400 mM de un carbohidrato. Reivindicación 12: La formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizada porque contiene el polipéptido y/o anticuerpo en una cantidad inferior o igual a 240 mg/ml. Reivindicación 15: La formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizada porque la formulación es líquida. Reivindicación 16: La formulación de acuerdo con la reivindicación 15, caracterizada porque no se sometió a liofilización durante la preparación de la misma.

FORMULACIONES ESTABILIZADAS QUE CONTIENEN ANTICUERPOS ANTI-RECEPTOR DE INTERLEUQUINA-6 (IL-6R)

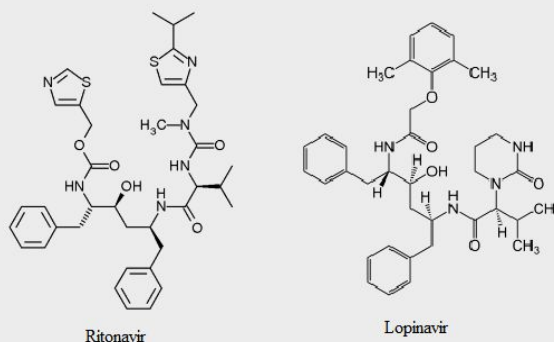
Publicación:	AR079836 (A1)
Solicitante(s):	REGENERON PHARMA [US]
Estado:	EN TRAMITE
Número de solicitud:	AR20110100021 05/01/2011
Número(s) de prioridad:	US20100293227P 20100108

Resumen de AR079836 (A1)


La presente proporciona formulaciones farmacéuticas que comprenden un anticuerpo humano que se une de modo específico al receptor de interleuquina-6 humana (hIL-6R). Las formulaciones pueden contener, además de un anticuerpo anti-hIL-6R, al menos un aminoácido, al menos un azúcar y/o al menos un tensioactivo no iónico. Las formulaciones farmacéuticas de la presente solicitud muestran un grado sustancial de estabilidad del anticuerpo después de una conservación durante varios meses. Reivindicación 2: La formulación farmacéutica de la reivindicación 1, en la que el carbohidrato es un azúcar seleccionado del grupo que consiste en sacarosa, glucosa, manitol, lactosa y trehalosa. Reivindicación 7: La formulación farmacéutica de una cualquiera de las reivindicaciones 1-6, en la que la histidina se encuentra a una concentración de aproximadamente 5 a 50 mM. Reivindicación 8: La formulación farmacéutica de una cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en la que el carbohidrato se encuentra a una concentración de aproximadamente 1% al 20%. Reivindicación 10: La formulación farmacéutica de la reivindicación 9, en la que dicho tensioactivo no iónico se selecciona del grupo que consiste en polisorbato 20, polisorbato 80 y monooleato de polioxietilensorbitán. Reivindicación 12: La formulación farmacéutica de una cualquiera de las reivindicaciones 9-11, en la que dicho tensioactivo no iónico se encuentra a una concentración de aproximadamente 0,01% al 1%. Reivindicación 13: La formulación farmacéutica de una cualquiera de las reivindicaciones 9-12, que comprende: (i) de aproximadamente 25 a 200 mg/ml de dicho anticuerpo humano que se une de modo específico a hIL-6R; (ii) histidina de aproximadamente 10 a 25 mM; (iii) sacarosa de aproximadamente 5% al 10%; y (iv) polisorbato 20 de aproximadamente 0,1% al 0,2%. Reivindicación 15: La formulación farmacéutica de una cualquiera de las reivindicaciones 9-14, que comprende además arginina. Reivindicación 16: La formulación farmacéutica de la reivindicación 15, en la que la arginina se encuentra a una concentración de aproximadamente 5 a 100 mM. Reivindicación 19: La formulación farmacéutica de la reivindicación 15, que comprende: (i) aproximadamente 175 mg/ml de dicho anticuerpo humano que se une de modo específico a hIL-6R; (ii) histidina aproximadamente 25 mM; (iii) sacarosa aproximadamente al 5%; (iv) polisorbato 20 aproximadamente al 0,2%; y (v) arginina aproximadamente 50 mM. Reivindicación 23: La formulación farmacéutica de la reivindicación 19 o de la reivindicación 20, en la que al menos 96% de la forma nativa de dicho anticuerpo se recupera después de nueve meses de conservación a 5°C, según se determina mediante una cromatografía líquida de alta resolución de exclusión molecular (SE-HPLC).

PROCESO DE PRODUCCIÓN CON IONES DE COBRE CONTROLADOS	
Publicación:	AR104050 (A1)
Solicitante(s):	CHUGAI PHARMACEUTICAL CO LTD [JP]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20160100777 23/03/2016
Número(s) de prioridad:	JP20150063662 20150326
Resumen de AR104050 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Un método de cultivo celular caracterizado porque comprende añadir un medio para siembra que contiene células a un medio inicial y comenzar a cultivar la célula en el medio inicial, en donde el medio inicial tiene un aditivo de medio de cultivo obtenido de organismos añadido al mismo y el contenido de cobre del medio inicial al inicio del cultivo de células no es más que 0,02 ppm. Reivindicación 20: Un método de cultivo celular que utiliza un medio inicial caracterizado porque un aditivo de medio de cultivo obtenido de organismos con un contenido de cobre medido ha sido añadido al medio inicial. Reivindicación 26: Un proceso para producir una composición farmacéutica que contiene una proteína deseada, caracterizado porque comprende las etapas de: 1) producir la proteína deseada mediante el proceso de producción de acuerdo a la reivindicación 25; y 2) producir la composición farmacéutica mediante la mezcla de la proteína deseada producida en la etapa 1) con un vehículo y un aditivo que son aceptables para uso farmacéutico y formular la misma.</p>	

COMPOSICIONES DE NANOPARTÍCULAS Y MÉTODOS PARA FABRICARLAS Y USARLAS	
Publicación:	AR109685 (A1)
Solicitante(s):	ABRAXIS BIOSCIENCE LLC [US]
Estado:	EN TRÁMITE
Número de solicitud:	AR20170102820 10/10/2017
Número(s) de prioridad:	US201662406367P 20161010
Resumen de AR109685 (A1)	
<p>Composiciones que comprenden nanopartículas (a) un fármaco hidrófobo, (b) una albúmina, y (c) un polipéptido bioactivo. Método para realizar composiciones que comprenden nanopartículas que contienen (a) un fármaco hidrófobo, (b) una albúmina, y (c) un polipéptido bioactivo. Métodos de uso, composiciones farmacéuticas, medicamentos, y sus kits.</p>	



Lopinavir – Ritonavi

Lopinavir/Ritonavir (LPV/R), que se vende bajo la marca Kaletra entre otros, es un medicamento de combinación en dosis fija para el tratamiento y la prevención del VIH. Se trata de una combinación de Lopinavir con una baja dosis de Ritonavir. La combinación puede usarse para la prevención del HIV después de una lesión por pinchazo con aguja u otra exposición potencial. Se administra por vía oral como una tableta, cápsula o solución.

Ambos compuestos son antirretrovirales de la familia de los inhibidores de la proteasa. El ritonavir funciona al disminuir la descomposición del lopinavir.

Lopinavir/Ritonavir como un solo medicamento fue aprobado para su uso en los Estados Unidos el año 2000. Está en la Lista de Medicamentos Esenciales de la Organización Mundial de la Salud, esta lista recoge los medicamentos más efectivos y seguros que se necesitan en un sistema de salud.

A fines de marzo del corriente año, la Organización Mundial de la Salud lanzó a nivel mundial un ensayo clínico sobre diferentes tratamientos contra el COVID-19, denominado "Solidaridad".

El uso de de lopinavir-ritonavir fue incluido en este ensayo, en combinación con interferón β -1a. A principios de julio, y comprobando la ineficacia del tratamiento con lopinavir-ritonavir, se decidió interrumpir estos grupos de tratamiento. A la fecha del presente boletín, los individuos que habían sido asignados a estos ensayos clínicos son tratados solamente con interferón β -1a.

En Argentina, la combinación de ambos compuestos (lopinavir/ritonavir) se encuentra concedida como patente AR005053B1, actualmente en dominio público.

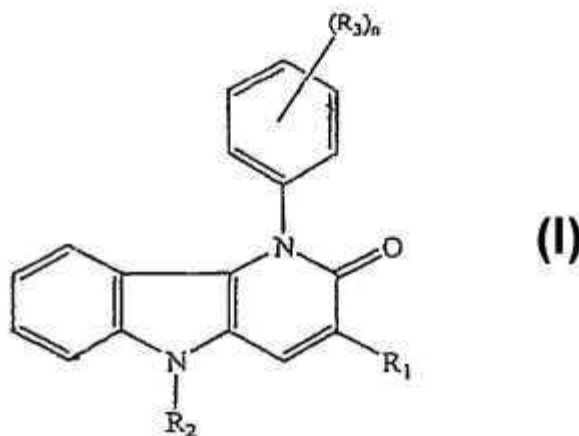
Antecedentes localizados

FORMA DE DOSIFICACIÓN FARMACÉUTICA SÓLIDA, CON LOPINAVIR Y RITONAVIR, Y PROCESO PARA SU PREPARACIÓN.	
Publicación:	AR077411 (A2)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	DENEGADA (29/03/2017)
Número de solicitud:	AR20100102529 13/07/2010
Número(s) de prioridad:	US20050064467 20050223
Resumen de AR077411 (A2)	
<p>Una forma de dosificación farmacéutica caracterizada porque comprende: lopinavir y ritonavir formulados en forma de solución sólida o de dispersión sólida; un polímero soluble en agua farmacéuticamente aceptable con una Tg de por lo menos 50°C, y un tensioactivo farmacéuticamente aceptable con valores HLB de entre 4 y 10. Reivindicación 13: La forma de dosificación de la reivindicación 1, caracterizada porque dicho polímero soluble en agua es un copolímero de N-vinil pirrolidona y acetato de vinilo, y donde dicho tensioactivo es un éster de sorbitán y ácido graso. Reivindicación 26: Una forma de dosificación farmacéutica sólida caracterizada porque comprende; lopinavir y ritonavir formulados en forma de solución sólida o de dispersión sólida; un polímero soluble en agua farmacéuticamente aceptable que tiene un Tg de al menos 50°C, y una combinación de tensioactivos que tienen un valor de HLB de entre 4 y 10.</p>	

USO	DE	DE
6-(3-CLORO-2-FLUORBENCIL)-1-[(2S)-1-HIDROXI-3-METILBUTAN-2-IL]-7-METOXI-4-OXO-1,4-DIHIROQUINOLINA-3-CARBOXÍLICO. COMPOSICION FARMACEUTICA		
Publicación:		
Solicitante(s):		
Estado:		
Número de solicitud:		
Número(s) de prioridad:		
Resumen de AR067184 (A1)		
<p>Reivindicación 1: El uso de ácido 6-(3-cloro-2-fluorbencil)-1-[(2S)-1-hidroxi-3-metilbutan-2-il]-7-metoxi-4-oxo-1,4-dihidroquinolona-3-carboxílico, o de una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto; lopinavir, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico; y un compuesto que inhibe el citocromo P-450, para el tratamiento profiláctico o terapéutico de una infección viral en un ser humano. Reivindicación 21: Una composición farmacéutica que comprende ácido 6-(3-cloro-2-fluorbencil)-1-[(2S)-1-hidroxi-3-metilbutan-2-il]-7-metoxi-4-oxo-1,4-dihidroquinolona-3-carboxílico, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico; lopinavir, o una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto; y un portador o diluyente farmacéuticamente aceptable. Reivindicación 26: La composición de cualquiera de las reivindicaciones 21-25, que además comprende 100 +/- 50 mg de ritonavir, o de una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto. Reivindicación 55: El uso de lopinavir, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico, en combinación con un compuesto que inhibe el citocromo P-450, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico, a fin de preparar un medicamento útil para mejorar la farmacocinética de ácido 6-(3-cloro-2-fluorbencil)-1-[(2S)-1-hidroxi-3-metilbutan-2-il]-7-metoxi-4-oxo-1,4-dihidroquinolona-3-carboxílico, o de una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto, luego de la administración a un ser humano. Reivindicación 57: Un agente antiviral que comprende: (a) ácido 6-(3-cloro-2-fluorbencil)-1-[(2S)-1-hidroxi-3-metilbutan-2-il]-7-metoxi-4-oxo-1,4-dihidroquinolona-3-carboxílico, o una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto; (b) lopinavir, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico; y (c) un compuesto que inhibe el citocromo P-450; para el uso en combinación en el tratamiento profiláctico o terapéutico de una infección viral en un ser humano. Reivindicación 59: Un compuesto ácido 6-(3-cloro-2-fluorbencil)-1-[(2S)-1-hidroxi-3-metilbutan-2-il]-7-metoxi-4-oxo-1,4-dihidroquinolona-3-carboxílico, o una sal aceptable para uso farmacéutico de dicho compuesto, que se usa en combinación con lopinavir, o una de sus sales aceptables para uso farmacéutico, y con un compuesto que inhibe el citocromo P-450, en el tratamiento profiláctico o terapéutico de una infección viral en un ser humano</p>		

COMBINACIONES DE 1- FENIL-1,5 - DIHIDRO - PIRIDO - (3,2-B) INDOL -2- ONAS SUSTITUIDAS Y OTROS INHIBIDORES DE VIH

Publicación:	AR048962 (A1)
Solicitante(s):	TIBOTEC PHARM LTD [IE]
Estado:	ABANDONADA (03/12/2014)
Número de solicitud:	AR20050102016 17/05/2005
Número(s) de prioridad:	EP20040102173 20040517

Resumen de AR048962 (A1)


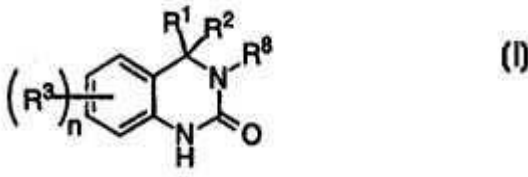
La presente se refiere a combinaciones de 1-fenil-1,5-dihidro-pirido-[3,2-B]indol-2-onas sustituidas y otros inhibidores de VIH. También se refiere a productos que comprenden un compuesto de la fórmula (1) y otro inhibidor de VIH, como una preparación combinada para el uso simultáneo, separado o secuencial en el tratamiento de infecciones retrovirales tales como una infección por VIH, en particular, en el tratamiento de infecciones con retrovirus resistentes a múltiples fármacos.

Reivindicación 1: Una combinación antiviral que comprende (a) un compuesto de la fórmula (1), un N-óxido, sal, forma estereoisomérica, mezcla racémica, profármaco, éster o metabolito del mismo, en la cual n es 1, 2 o 3; R1 es H, ciano, halo, aminocarbonilo, hidroxycarbonilo, alquiloxicarbonilo C1-4, alquilcarbonilo C1-4, mono- o di(alquil C1-4)aminocarbonilo, arilaminocarbonilo, N-(aril)-N-(alquil C1-4)aminocarbonilo, metanimidamidilo, N-hidroxi-metanimidamidilo, mono- o di(alquil C1-4)metanimidamidilo, Het1 o Het2; R2 es H, alquilo C1-10, alqueno C2-10, cicloalquilo C3-7, en donde dicho alquilo C1-10, alqueno C2-10 y cicloalquilo C3-7 pueden estar opcionalmente sustituidos, cada uno en forma individual e independiente, con un sustituyente seleccionado del grupo integrado por ciano, NR4aR4b, pirrolidinilo, piperidinilo, homopiperidinilo, piperazinilo, 4-(alquil C1-4)-piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolinilo, 1,1-dioxo-tiomorfolinilo, arilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, hidroxycarbonilo, alquilcarbonilo C1-4, N(R4aR4b)carbonilo, alquiloxicarbonilo C1-4, pirrolidin-1-ilcarbonilo, piperidin-1-ilcarbonilo, homopiperidin-1-ilcarbonilo, piperazin-1-ilcarbonilo, 4-(alquil C1-4)-piperazin-1-ilcarbonilo, morfolin-1-ilcarbonilo, tiomorfolin-1-ilcarbonilo, 1-oxotiomorfolin-1-ilcarbonilo y 1,1-dioxo-tiomorfolin-1-ilcarbonilo; R3 es nitro, ciano, amino, halo, hidroxilo, alquilo C1-4, hidroxycarbonilo, aminocarbonilo, alquiloxicarbonilo C1-4, mono- o di(alquil C1-4)aminocarbonilo, alquilcarbonilo C1-4, metanimidamidilo, mono- o di(alquil C1-4)metanimidamidilo, N-hidroxi-metanimidamidilo o Het1; R4a es H, alquilo C1-4 o alquilo C1-4 sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo integrado por amino, mono- o di(alquil C1-4)amino, pirrolidinilo, piperidinilo, homopiperidinilo, piperazinilo, 4-(alquil C1-4)-piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolinilo y 1,1-dioxo-tiomorfolinilo; R4b es H, alquilo C1-4 o alquilo C1-4 sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo integrado por amino, mono- o di(alquil C1-4)amino, pirrolidinilo, piperidinilo, homopiperidinilo, piperazinilo, 4-(alquil C1-4)-piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolinilo y 1,1-dioxo-tiomorfolinilo; arilo es fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno en forma individual, del grupo integrado por alquilo C1-6, alcoxi C1-4, halo, hidroxilo, amino, trifluorometilo, ciano, nitro, hidroxialquilo C1-6, cianoalquilo C1-6, mono- o di(alquil C1-4)amino, aminoalquilo C1-4, mono- o di(alquil C1-4)aminoalquilo C1-4; Het1 es un sistema anular de 5 miembros en donde uno, dos, tres o cuatro miembros del anillo

son heteroátomos seleccionados, cada uno en forma individual e independiente, del grupo integrado por N, O y S, y en donde los demás miembros del anillo son átomos de C; y, donde sea posible, cualquier miembro del anillo de N puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C1-4; cualquier átomo de C del anillo puede estar opcionalmente sustituido, cada uno en forma individual e independiente, con un sustituyente seleccionado del grupo integrado por alquilo C1-4, alqueno C2-6, cicloalquilo C3-7, hidroxilo, alcoxi C1-4, halo, amino, ciano, trifluorometilo, hidroxialquilo C1-4, cianoalquilo C1-4, mono- o di(alquilo C1-4)amino, aminoalquilo C1-4, mono- o di(alquilo C1-4)aminoalquilo C1-4, arilalquilo C1-4, aminoalqueno C2-6, mono- o di(alquilo C1-4)aminoalqueno C2-6, furanilo, tienilo, pirrolilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, arilo, hidroxicarbonilo, aminocarbonilo, alquiloicarbonilo C1-4, mono- o di(alquilo C1-4)aminocarbonilo, alquilcarbonilo C1-4, oxo, tio; y en donde cualquiera de los grupos anteriores furanilo, tienilo, pirrolilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo y triazolilo pueden estar opcionalmente sustituidos con alquilo C1-4; Het2 es piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo o triazinilo, en donde cualquier átomo de C del anillo de cada uno de dichos anillos aromáticos de 6 miembros que contienen N puede estar opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo integrado por alquilo C1-4; (b) otro inhibidor de VIH. Reivindicación 10: La combinación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, donde el otro inhibidor de VIH está seleccionado entre: inhibidores de unión, tales como, por ejemplo sulfato de dextrán, suramina, polianiones, CD4 soluble, PRO-542, BMS-806; inhibidores de fusión tales como por ejemplo, T20, T1249, RPR 103611, YK-FH312, IC 9564, 5-Hélice, D-péptido ADS-JI; inhibidores de la unión del correceptor tales como, por ejemplo AMD 3100, AMD-3465, AMD 7049, AMD3451 (biciclámicos), TAK 779, T-22, ALX40-4C; SHC-C (SCH351125), SHC-D, PRO-140, RPR103611; inhibidores de RT tales como, por ejemplo, foscarnet y sus profármacos; nucleósidos RTI tales como, por ejemplo AZT, 3TC, DDC, tenofovir, DDI, D4T, abacavir, FTC, DAPD (amdoxovir), dOTC (BCH-10652), fozivedina, DPC 817; nucleótidos RTI tales como, por ejemplo PMEA, PMPA (TDF o tenofovir); NNRTI tales como, por ejemplo, nevirapina, delavirdina, efavirenz, CI TIBO 8 y 9 (tivrapiña), lovirida, TMC-125, 4-[[4-[[4-(2-cianoetenil)-2,6-difenil]amino-2-pirimidinil]amino]benzonitrilo (R278474), dapivirina (R147681 o TMC120), MKC-442, UC 781, UC782, caprovirina, QM96521, GW420867X, DPC961, DPC963, DPC082, DPC083, calanolida A, SJ-3366, TSAO, TSAO 4"desaminado, MV150, MV026048, PNU-142721; inhibidores H de RNAsa tales como, por ejemplo, SP1093V, PDI26338; inhibidores de TAT tales como, por ejemplo RO-5-3335, K12, K37; inhibidores de integrasa tales como, por ejemplo, K 708906, L731988, S-1360; inhibidores de proteasa tales como, por ejemplo, amprenavir y fosamprenavir, ritonavir, nelfinavir, saquinavir, indinavir, lopinavir, palinavir, BMS 186316m, atazanavir, DPC 681, DPC 684, tipranavir, AG1776, mozenavir, DMP-323, GS3333, KNI-413, KNI-272, L754394, L756425, LG-71350, PD161374, PD1173606, PD177298, PD178350, PD178392, PNU 14135, TMC-114, ácido maslínico, U-140690; inhibidores de la glicosilación tales como, por ejemplo castanoespermina, desoxinojirimicina; inhibidores de la entrada CGP64222.

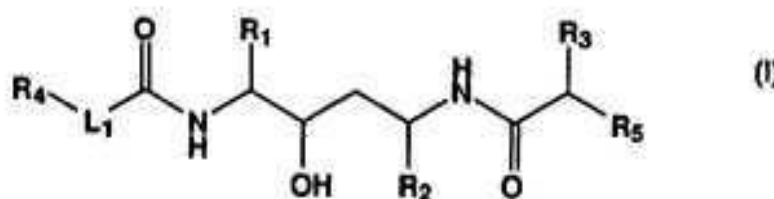
Reivindicación 11: Una combinación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, donde el otro inhibidor de VIH está seleccionado entre: (i) un inhibidor de fusión tal como, por ejemplo, T20, T1249, RPR103611, YK-FH312, IC 9564, 5-Hélice, D-péptido ADS-JI, enfuvirtida (ENF), GSK-873,140, PRO-542, SCH-417,690, TNX-355, maraviroc (UK-427,857); preferentemente uno o más inhibidores de fusión tales como, por ejemplo, enfuvirtida (ENF), GSK-873,140, PRO-542, SCH-417,690, TNX-355, maraviroc (UK-427,857); (ii) un nucleósido RTI tal como, por ejemplo AZT, 3TC, zalcitabina (ddC), ddl, d4T, abacavir (ABC), FTC, DAPD (amdoxovir), dOTC (BCH-10652), fozivudina, D-D4FC (DPC 817 o Reverset TM); alovedina (MIV-310 o FLT), elvicitabina (ACH-126,443); preferentemente uno o más nucleósidos RTI tales como, por ejemplo, AZT, 3TC, zalcitabina (ddC), ddl, d4T, abacavir (ABC), FTC, DAPD(amdoxovir), D-D4FC (DPC 817 o Reverset TM); alovedina (MIV-310 o FLT), elvicitabina (ACH-126,443); (iii) un nucleótido RTI tal como, por ejemplo, PMEA, PMPA, (TDF o tenofovir) o fumarato de tenofovir disoproxilo; preferentemente tenofovir o fumarato de tenofovir disoproxilo; (iv) un NNRTI tal como, por ejemplo, nevirapina, delavirdina, efavirenz, CI TIBO 8 y 9 (tivrapiña), lovirida, TMC-125, 4-[[4-[[4-(2-cianoetenil)-2,6-difenil]amino-2-pirimidinil]amino]benzonitrilo (TMC278 o R278474), dapivirina (R147681 o TMC 120), MKC-442, UC 781, UC782, caprovirina, QM96521, GW420867X, DPC 961, DPC963, DPC082, DPC083 (o BMS-561390), calanolida A, SJ-3366, TSAO, TSAO 4"desaminado, MV150, MV026048, PNU-142721; o preferentemente uno o más NNRTI tales como, por ejemplo, nevirapina, delavirdina, efavirenz, TMC125, TMC278, TMC120, caprovirina, DPC083, calanolida A; (v) un inhibidor de proteasa tal como, por ejemplo, amprenavir y fosamprenavir, lopinavir, ritonavir (como también combinaciones de ritonavir y lopinavir tales como Kaletra TM), nelfinavir, saquinavir, indinavir, palinavir, BMS186316, atazanavir, DPC 681, DPC 684, tipranavir, AG1776, mozenavir, DMP-323, GS3333, KNI-413, KNI-272, L754394, L756425, LG-71350, PD161374, PD1173606, PD177298, PD178390, PD178392, PNU 14135, TMC-114, ácido maslínico, U-140690; en particular uno o más inhibidores de proteasa tales como, por ejemplo, amprenavir y fosamprenavir, lopinavir, ritonavir (como también combinaciones de ritonavir y lopinavir), nelfinavir, saquinavir, indinavir, atazanavir, tipranavir, TMC-114.

SISTEMAS SABORIZANTES PARA COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS Y MÉTODOS PARA HACER DICHAS COMPOSICIONES	
Publicación:	AR030715 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	DESISTIDA (28/12/2010)
Número de solicitud:	AR20010104207 04/09/2001
Número(s) de prioridad:	US20000655192 20000905
Resumen de AR030715 (A1)	
<p>Sistemas saborizantes para una composición farmacéutica líquida y composiciones farmacéuticas que contienen dichos sistemas saborizantes. Los sistemas saborizantes de la invención incluyen por lo menos un agente edulcorante, por lo menos dos ingredientes con sabor, y por lo menos un modificador del sabor que se selecciona entre el grupo que consiste en ácido cítrico, citrato de sodio, cloruro de sodio y mezclas de los mismos. Por lo menos dos de los ingredientes saborizados se seleccionan entre el grupo que consiste en un ingrediente con sabor a vainilla, un ingrediente con sabor a menta, un ingrediente con sabor a mentol, un ingrediente con sabor a algodón de azúcar, y mezclas de los mismos. El (los) agente(s) edulcorante(s) comprende(n) glicerina, glicirricinato de monoamonio, sacarina sódica, acesulfame potásico, jarabe de maíz de alta fructosa, y/o mezclas de los mismos. Las composiciones farmacéuticas de la invención incluyen un sistema saborizante de la invención, un sistema solvente, y por lo menos un agente farmacéuticamente activo, como por ejemplo lopinavir o derivados del mismo, ritonavir o derivados del mismo, o mezclas de los mismos. También se describen métodos para hacer dichas composiciones farmacéuticas líquidas</p>	

3,4-DIHI-DRO-2(1H)-QUINAZOLINONAS 4,4-DISUSTITUIDAS ÚTILES COMO INHIBIDORES DE LA TRANSCRIPTASA INVERSA DEL HIV, COMPOSICIÓN Y KIT FARMACÉUTICOS QUE LAS CONTIENEN	
Publicación:	AR012340 (A1)
Solicitante(s):	DU PONT [US]
Estado:	ABANDONADA (21/02/2005)
Número de solicitud:	AR19980101558 06/04/1998
Número(s) de prioridad:	US19970838540 19970409 ; US19980071322P 19980114
Resumen de AR012340 (A1)	
	
<p>La presente invención hace conocer 3,4-dihidro-2(1H)-quinazolinonas 4,4- disustituidas de la fórmula (I), o las formas estereoisoméricas, mezclasestereoisoméricas o sales apras para uso farmacéutico de las mismas, que son de utilidad como inhibidores de la transcriptasa inversa del HIV y con composiciones farmacéuticas y kits de diagnóstico que contienen a las mismas, donde: R1 es alquilo-C1-3 sustituido con 1-7 halogenos; R2 se selecciona dealquilo-C1-5 sustituido con 1-2 R4, alquenilo-C2-5 sustituido con 1-2 R4 y alquinilo-C2-5 sustituido con 1 R4; R3, en cada aparición, se selecciona independientemente de alquilo-C1-4, OH, alcoxi-C1-4, F, Cl, Br, I, NR5R5a, NO2, CN, C(O)R6, NHC(O)R7 y NHC(O)NR5R5a, como alternativa, si hay dosR3 y están unidos a átomos de carbono adyacentes, entonces se pueden combinar para formar -OCH2O-; R4 se selecciona de cicloalquilo-C3-5 sustituido con 0-2 R3, fenilo sustituido con 0-5 R3 y un sistema heterocíclico de 5-6 miembros que contiene de 1-3 heteroátomos seleccionados entre O, N y S, sustituido con 0-2R3; R5 y R5a se seleccionan independientemente de H y alquilo C1-3; R6 se selecciona de H, OH, alquilo C1-4, alcoxi-C1-4, y NR5R5a; R7 se selecciona dealquilo C1-3 y alcoxi-C1-3; R8 se selecciona de H, cicloalquilo-C3-5 y alquilo C1-3 y n se selecciona de 0, 1, 2, 3 y 4.</p>	

COMPUESTOS DE DIFENILHEXANO, UN PROCEDIMI**ENTO PARA SU PREPARACIÓN, COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS Y EL USO DE DICHS COMPUESTOS, Y PROCEDIMIENTOS PARA LA MANUFACTURA DE MEDICAMENTOS PARA INHIBIR LA INFECCIÓN DE HIV**

Publicación:	AR005053 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	CONCEDIDA (29/07/2005) VENCIMIENTO (12/12/2016)
Número de solicitud:	AR19960105646 12/12/1996
Número(s) de prioridad:	US19950572226 19951213 ; US19960753201 19961121
Resumen de AR005053 (A1)	



Se describe un compuesto que tiene un sustituyente de la fórmula (I) como inhibidor de la proteasa del HIV. En la fórmula R3 y R5 tienen los valores definidos en la memoria descriptiva. También se describen composiciones que comprenden dicho compuesto, usos del compuesto para preparar medicamentos así como procedimientos e intermediarios para prepararlo y procedimientos para preparar los intermediarios.

COMPOSICIONES Y MÉTODOS PARA AUMENTAR LA BIODISPONIBILIDAD DE AGENTES FARMACÉUTICOS

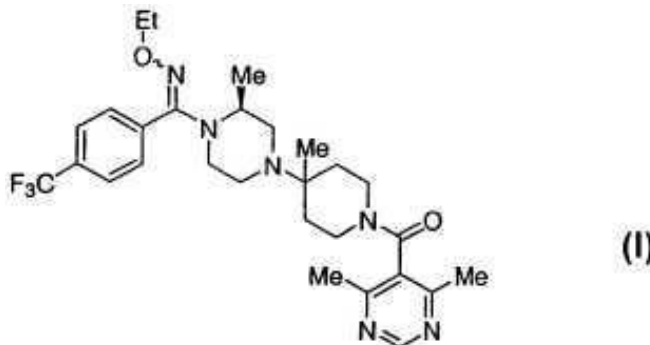
Publicación:	AR033293 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	ABANDONADA (03/11/2008)
Número de solicitud:	AR20020101595 30/04/2002
Número(s) de prioridad:	US20010367353P 20010501
Resumen de AR033293 (A1)	

Método para aumentar la biodisponibilidad de agentes farmacéuticamente activos. Se usa lopinavir, sus equivalentes aceptables para uso farmacéutico y derivados del mismo como inhibidores de la glicoproteína P.

COMPUESTOS ARIL OXIMA-PIPERAZINAS, COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA, EL USO DE DICHS COMPUESTOS PARA LA MANUFACTURA DE MEDICAMENTOS ÚTILES COMO ANTAGONISTAS DE CCR5 Y UN EQUIPO

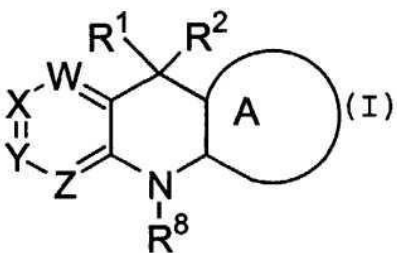
Publicación:	AR033622 (A1)
Solicitante(s):	SCHERING CORP [US]
Estado:	DESISTIDA (23/09/2011)
Número de solicitud:	AR20020101139 27/03/2002
Número(s) de prioridad:	US20010279950P 20010329

Resumen de AR033622 (A1)

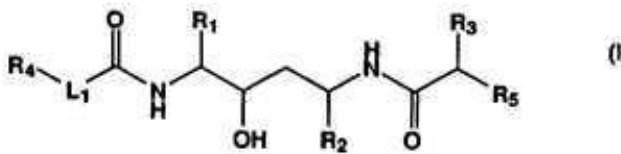


Un compuesto aril oxima-piperazinas que incluye enantiómeros, estereoisómeros, rotámeros, tautómeros, racematos y prodrogas de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto o de dicha prodroga, teniendo dicho compuesto la estructura general de fórmula (1), en la cual: X está seleccionado del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, -CF₃, -CF₃O, -CN, CH₃SO₂-, y CF₃SO₂-; R₁ es H, alquilo de cadena recta o alquilo de cadena ramificada, fluoro-alquilo C1-6, alquilenilo C1-6 portador de un cicloalquilo C3-7 (por ejemplo, ciclopropilmetilo), -CH₂CH₂OH, -CH₂CH₂-O-(C1-6)alquilo, -CH₂C(O)-O-(C1-6)alquilo, -CH₂C(O)NH₂, -CH₂C(O)-NH(C1-6)alquilo, o -CH₂C(O)-N((C1-6)alquilo)₂; R₂ es H, un alquilo C1-6 de cadena recta o un alquilo de cadena ramificada, o alquilenilo C2-6; R₃ es alquilo C1-6 de cadena recta o alquilo ramificado; fenilo sustituido con R₄, R₅, R₆; heteroarilo de 6 miembros sustituido con R₄, R₅, R₆; N-óxido de heteroarilo de 6 miembros sustituido con R₄, R₅, R₆; heteroarilo de 5 miembros sustituido con R₇, R₈; naftilo; fluorenilo; difenilmetilo; un resto de fórmula (2); o un resto de fórmula (3); donde R₄ y R₅ pueden ser iguales o diferentes y están independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C1-6, halógeno, -NR₁₂R₁₃, -OH, -CF₃, -OCH₃, -O-acilo, -OCF₃ y -Si(CH₃)₃; R₆ es R₄, hidrógeno, fenilo, -NO₂, -CN, -CH₂F, -CHF₂, -CHO, -CH=NOR₁₂, piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, -N(R₁₂)CONR₁₃R₁₄, -NHCONH(cloro-(C1-6)alquilo), -NHCONH((C3-10)cicloalquilo(C1-6)alquilo), NHCO(C1-6)alquilo, -NHCOCF₃, -NHSO₂N((C1-6)alquilo)₂, -NHSO₂(C1-6)alquilo, -N(SO₂CF₃), -NHCO₂(C1-6)alquilo, cicloalquilo C3-10, -SR₁₅, -SOR₁₅, SO₂R₁₅, -SO₂NH(C1-6)alquilo, -OSO₂(C1-6)alquilo, -OSO₂CF₃, hidroxil(C1-6)alquilo, -CONR₁₂R₁₃, -CON(CH₂CH₂-O-CH₃)₂, -OCONH(C1-6)alquilo, -CO₂R₂, -Si(CH₃)₃ o -B(OC(CH₃)₂); R₇ es alquilo C1-6, -NH₂ o R₉-fenilo; R₉ es 1 a 3 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y que están independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C1-6, -CF₃, -CO₂R₁₂, -CN, alcoxi C1-6 y halógeno; R₁₀ y R₁₁ pueden ser iguales o diferentes y están independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C1-6, o R₁₀ y R₁₁ conjuntamente son un grupo alquilenilo C2-5 y con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo espiro de 3 a 6 átomos de carbono; R₁₂, R₁₃ y R₁₄ pueden ser iguales o diferentes y están independientemente seleccionados del grupo que consiste de H y alquilo C1-6; y R₁₅ es alquilo C1-6 o fenilo; las composiciones farmacéuticas que contienen uno o más de los compuestos, uso de dichos compuestos para la manufactura de medicamentos para el tratamiento, prevención y mejora de una o más enfermedades asociadas con el receptor CCR5 y un equipo que comprende envases separados en un solo paquete, composiciones farmacéuticas para usarlas en combinación para tratar el Virus de Inmunodeficiencia Humana que comprende en un envase una composición farmacéutica que comprende una cantidad eficaz de un antagonista CCR5 de la reivindicación 1, en un portador farmacéuticamente aceptable, y en envases separados, una o más composiciones farmacéuticas que comprenden una cantidad eficaz de un agente antiviral u otro agente útil en el tratamiento del Virus de Inmunodeficiencia Humana en un portador farmacéuticamente aceptable.

CAPSULA ELÁSTICA BLANDA Y METODO PARA SU PREPARACION	
Publicación:	AR034995 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB
Estado:	ABANDONADA (03/11/2008)
Número de solicitud:	AR20020101897 22/05/2002
Número(s) de prioridad:	US20010866285 20010525
Resumen de AR034995 (A1)	
<p>Cápsula elástica blanda que comprende un relleno y un revestimiento, donde dicho relleno comprende: un agente o combinación de agentes farmacéuticos, un alcohol, un ácido graso, y dicho revestimiento comprende: gelatina, y por lo menos un agente plastificante, donde el antedicho revestimiento tiene un estado inicial y un estado de equilibrio, y en dicho estado inicial se subplastifica el revestimiento y el antedicho relleno contiene una cantidad en exceso de alcohol respecto de la cantidad necesaria para solubilizar el agente farmacéutico y dicho alcohol no está presente en el estado inicial de la composición de revestimiento, y donde en el estado de equilibrio se plastifica el revestimiento mediante el alcohol proveniente del relleno para proporcionar una dureza de la cápsula apropiada y el relleno retiene suficiente alcohol como para mantener al agente farmacéutico en solución. Método para preparar dichas cápsulas. Estas cápsulas elásticas blandas pueden ser utilizadas con un amplio rango de agentes farmacéuticos que incluyen antibióticos, agentes farmacéuticos anti-SIDA, como por ejemplo los compuestos inhibidores de la proteasa de VIH, y toda una serie de otros agentes medicinalmente activos.</p>	

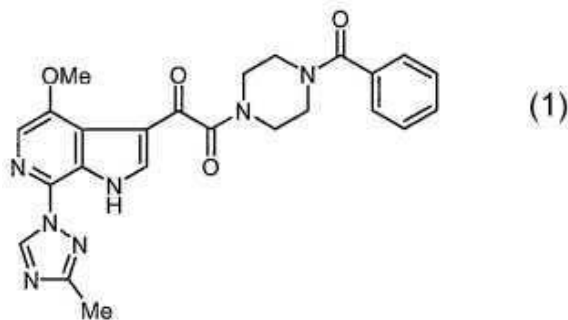
COMPUESTOS TRICICLICOS ÚTILES COMO INHIBIDORES DE LA TRANSCRIPTADA INVERSA DEL VIH	
Publicación:	AR038164 (A1)
Solicitante(s):	SQUIBB BRISTOL MYERS CO
Estado:	ABANDONADA (03/11/2008)
Número de solicitud:	AR20030100142 17/01/2003
Número(s) de prioridad:	US20020349641P 20020118
Resumen de AR038164 (A1)	
	
<p>Se refiere a los compuestos tricíclicos de 2-pirimidona de la fórmula (1) o las formas estereoisoméricas, mezclas estereoisoméricas o formas salinas farmacéuticamente aceptables de los mismos, que son útiles como inhibidores de la transcriptasa inversa del VIH, y a las composiciones farmacéuticas y a los kit(s) de diagnóstico que comprenden los mismos, y los métodos para utilizar los mismos para el tratamiento de la infección viral como un estándar o reactivo de ensayo. Reivindicación 1: Un compuesto de la fórmula (1) o una forma estereoisomérica o mezcla de formas estereoisoméricas, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde: A es un anillo seleccionado de fórmula (2) y (3); P es oxígeno o azufre; Q es oxígeno o NH; Ra se selecciona de hidrógeno, CN, alquilo C1-4, alquenilo C1-4, alquinilo C1-4, OH, (alquil C1-4)-O-, (alquil C1-4)-NH, y NH₂; Rb se selecciona de hidrógeno, alquilo C1-4, alquenilo C1-4, y alquinilo C1-4; W es nitrógeno o CR₃; X es nitrógeno o CR₃a; Y es nitrógeno o CR₃b; Z es nitrógeno o CR₃c; con la condición de que si dos de W, X, Y y Z son nitrógeno, entonces los restantes son diferentes a nitrógeno; R1 se selecciona del grupo de</p>	

ciclopropilo, hidroximetilo, CN, y alquilo C1-4 sustituido con 0-9 átomos de halógeno; R2 se selecciona del grupo de metilo sustituido con 0-3 R3f, alquilo C1-6 sustituido con 0-2 R4, haloalquilo C2-6, alqueno C2-5 sustituido con 0-2 R4, alqueno C2-5 sustituido con 0-1 R4, cicloalquilo C3-6 sustituido con 0-2 R3d, fenilo sustituido con 0-2 R3d, y un sistema heterocíclico de 3-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, sustituidos con 0-2 R3d; R3 se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, CF3, F, Cl, Br, I, -(CH2)tNR5R5a, -NO2, CN, -C(O)R6, -(CH2)tNHC(O)R7, -(CH2)tNHC(O)NR5R5a, NHSO2R10, -S-(alquilo C1-5), -S(O)-(alquilo C1-5), -S(O)2(alquilo C1-4), -SO2NR5R5a, y un anillo heteroaromático de 5-6 miembros que contiene 1-4 heteroátomos seleccionados del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre; R3a se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, CF3, F, Cl, Br, I, -(CH2)tNR5R5a, -NO2, CN, C(O)R6, -(CH2)tNHC(O)R7, -(CH2)tNHC(O)NR5R5a, NHSO2R10, -S-(alquilo C1-4), -S(O)-(alquilo C1-4), -S(O)2(alquilo C1-4), -SO2NR5R5a, y un anillo heteroaromático de 5-6 miembros que contiene 1-4 heteroátomos seleccionados del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre; alternativamente, R3 y R3a conjuntamente forman -OCH2O-; R3b se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, F, Cl, Br, I, -NR5R5a, -NO2, -CN, -C(O)R6, -NHC(O)R7, -NHC(O)NR5R5a, -NHSO2R10, y -SO2NR5R5a; alternativamente, R3a y R3b conjuntamente forman -OCH2O-; R3c se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, F, Cl, Br, I, -NR5R5a, -NO2, -CN, -C(O)R6, -NHC(O)R7, -NHC(O)NR5R5a, -NHSO2R10, y -SO2NR5R5a; alternativamente, R3b y R3c conjuntamente forman -OCH2O-; R3d, en cada aparición, se selecciona independientemente del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, F, Cl, Br, I, -NR5R5a, -NO2, -CN, C(O)R6, -NHC(O)R7, -NHC(O)NR5R5a, -NHSO2R10, y -SO2NR5R5a; R3e, en cada aparición, se selecciona independientemente del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, -OH, alcoxi C1-4, OCF3, F, Cl, Br, I, -NR5R5a, -NO2, -CN, C(O)R6, -NHC(O)R7, -NHC(O)NR5R5a, -NHSO2R10, y -SO2NR5R5a; R3f, en cada aparición, se selecciona independientemente del grupo de hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C1-4, -CN, -OH, -O-R11, OCF3, -O(CO)-R13, -OS(O)2-(alquilo C1-4), NR12R12a, -C(O)R13, -NHC(O)R13, -SR11, -S(O)R11, -S(O)2R11, -NHSO2R10, y -SO2NR12R12a; R4 se selecciona del grupo de hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo C1-6 sustituido con 0 a 2 R3e, carbociclo C3-10 sustituido con 0-2 R3e, fenilo sustituido con 0-5 R3e, y un sistema heterocíclico de 5-10 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre, sustituido con 0-2 R3e; R5 y R5a se seleccionan independientemente del grupo de hidrógeno y alquilo C1-4, alternativamente, R5 y R5a, junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, se combinan para formar un anillo de 5-6 miembros que contienen 0-1 átomos de oxígeno o de nitrógeno; R6 se selecciona del grupo de hidrógeno, OH, alquilo C1-4, alcoxi C1-4, y NR5R5a; R7 se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-3 y alcoxi C1-3; R8 se selecciona del grupo de hidrógeno, (alquil C1-6)carbonilo, alcoxi C1-6, (alcoxi C1-4)carbonilo, ariloxi C6-10, (aril C6-10)oxicarbonilo, (aril C6-10)metilcarbonilo, (alquil C1-4)carboniloxi (alcoxi C1-4)carbonilo, (arilcarboniloxi C6-10)(alcoxi C1-4)carbonilo, alquilaminocarbonilo C1-6, fenilaminocarbonilo, fenil(alcoxi C1-4)carbonilo, y NR5R5a (alquil C1-6)carbonilo; R9 se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-4, alqueno C1-4, alqueno C1-4, (alquil C1-6)carbonilo, alcoxi C1-6, (alcoxi C1-4)carbonilo, ariloxi C6-10, (aril C6-10)oxicarbonilo, (aril C6-10)metilcarbonilo, (alquil C1-4)carboniloxi (alcoxi C1-4)carbonilo, (arilcarboniloxi C6-10)(alcoxi C1-4)carbonilo, alquilaminocarbonilo C1-6, fenilaminocarbonilo, fenil(alcoxi C1-4)carbonilo, y NR5R5a (alquil C1-6)carbonilo; R10 se selecciona del grupo de alquilo C1-4 y fenilo; R11 se selecciona del grupo de alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alquilo C1-6 sustituido con cicloalquilo C3-6 sustituido con 0-2 R3e, alqueno C2-6, alqueno C2-6, carbociclo C3-6 sustituido con 0-2 R3e; R12 y R12a se seleccionan independientemente de hidrógeno, alquilo C1-6, alquilo C1-6 sustituido con cicloalquilo C3-6, sustituido con 0-2 R3e, y carbociclo C3-6 sustituido con 0-2 R3e; alternativamente, R12 y R12a pueden unirse para formar un anillo heterocíclico de 4-7 miembros; R13 se selecciona del grupo de hidrógeno, alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alcoxi C1-6, alqueno C2-6, alqueno C2-6, -O-(alqueno C2-6), -O-(alqueno C2-6), -NR12R12a, carbociclo C3-6, y -O-(carbociclo C3-6); y t se selecciona de 0 y 1.

UNA FORMULACIÓN SÓLIDA DE DOSIFICACIÓN FARMACÉUTICA	
Publicación:	AR055734 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	DENEGADA (03/11/2008)
Número de solicitud:	AR20060100645 22/02/2006
Número(s) de prioridad:	US20050064467 20050223
Resumen de AR055734 (A1)	
<p>Reivindicación 1: Una forma de dosificación farmacéutica caracterizada porque comprende una forma no disuelta de (2S,3S,5S)-2-(2,6-Dimetilfenoxiacetil)amino-3-hidroxi-5-[2S-(1-tetrahidro-pirimid-2-onil)-3-metilbutanoil]-amino-1,6-difenilhexano (ABT- 378; Lopinavir) en una cantidad efectiva para uso terapéutico. Reivindicación 2: La forma de dosificación de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizada porque además comprende (2S,3S,5S)-5-(N-(N-((N-metil-N-((2-isopropil-4-tiazolil)metil)amino)carbonil)-L-valinil)amino-2-(N-((5-tiazolil)metoxi-carbonil)-amino)-amino-1,6-difenil-3-hidroxihexano (Ritonavir).</p>	
COMPUESTO INHIBIDOR DE LA PROTEASA DEL HIV, SU USO PARA PREPARAR MEDICAMENTOS, COMPOSICIONES QUE LO COMPRENDEN, PROCEDIMIENTOS E INTERMEDIARIOS PARA PREPARARLOS Y PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR LOS INTERMEDIARIOS	
Publicación:	AR025352 (A1)
Solicitante(s):	ABBOTT LAB [US]
Estado:	DESISTIDA (22/03/2004)
Número de solicitud:	AR20000104345 23/08/2000
Número(s) de prioridad:	US19950572226 19951213 ; US19960753201 19961121
Resumen de AR025352 (A1)	
 <p style="text-align: right;">(1)</p>	
<p>Un compuesto de la fórmula (1) en la cual R1 y R2 son independientemente seleccionados entre el grupo que consiste en alquilo inferior, cicloalquilo y arilalquilo; R3 es alquilo inferior, hidroxialquilo o cicloalquilalquilo; R4 es arilo o heterocíclico; R5 es según fórmulas de la a) hasta la i), en la cual n es 1, 2 o 3, m es 1, 2 o 3, m es 1 o 2, X es O, S o NH, Y es -CH2-, -O-, -S- o -N(R6)- donde R6 es hidrógeno, alquilo inferior, cicloalquilalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo, Y es -CH2-, o -N(R6)- donde R6 es hidrógeno, alquilo inferior, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo, Y es -N(R6)- donde R6 es hidrógeno, alquilo inferior, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo o arilalquilo y Z es O, S o NH, y L1 es a)-O-; b) -S-; c) -N(R7)- donde R7 es hidrógeno, alquilo inferior, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, d) -O- alquilenilo-; e) -S-alquilenilo-; f) -S-(O)-alquilenilo-; g) -S-(O)2-alquilenilo-; h) -N(R7)-alquilenilo donde R7 es como se lo describiera anteriormente; i) -alquilenil-O-; j) -alquilenil-S-; k) -alquilenil-N(R7)-donde R7 es como se lo describiera anteriormente; l) alquilenilo o m) alquilenileno; o una sal éster o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo con la condición de que el compuesto no sea (2S, 3S, 5S)-2-(2,6-dimetilfenoxiacetil)amino-3-hidroxi-5-[2S-(1-tetrahidro-pirimid-2-onil)-3-metilbutanoil]amino-1,6-difenilhexano; su uso para preparar medicamentos, composiciones que lo comprenden, procedimientos e intermediarios para prepararlos y procedimiento para preparar los intermediarios.</p>	

MÉTODOS DE TRATAMIENTO DE INFECCIÓN DE VIH

Publicación:	AR048333 (A1)
Solicitante(s):	SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]
Estado:	DENEGADA (31/08/2016)
Número de solicitud:	AR20050101159 23/03/2005
Número(s) de prioridad:	US20040555767P 20040324

Resumen de AR048333 (A1)


Composiciones farmacéuticas y métodos para usar el compuesto 1 en combinación con otros agentes para el tratamiento de pacientes con SIDA o infección de VIH. Reivindicación 1: Un método para el tratamiento de la infección de VIH en un paciente humano, caracterizado porque comprende la administración de una cantidad efectiva terapéuticamente de 1-benzoyl-4-[2-[4-metoxi-7-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-1H-pirrol-2,3-c]piridin-3-il]-1,2-dioxoetil]-piperazina o una sal o solvato de la misma farmacéuticamente aceptable, con una cantidad terapéuticamente efectiva de al menos otro agente utilizado para el tratamiento del SIDA o VIH, seleccionado del grupo que consiste de inhibidores de transcriptasa inversa de VIH del nucleósido, inhibidores de transcriptasa inversa del VIH diferente del nucleósido, inhibidores de proteasa de VIH, inhibidores de fusión de VIH, inhibidores de fijación de VIH, inhibidores de CCR5, inhibidores de CXCR4, inhibidores de la maduración o gemación de VIH, e inhibidores de integrasa de VIH.

Fuentes Consultadas

Organización Mundial de la Salud	https://www.who.int/es
Organización Mundial de la Propiedad Intelectual	https://www.wipo.int/portal/es/
Ministerio de Salud – Argentina	https://www.argentina.gob.ar/salud
PubChem: (base de datos de química de los Institutos Nacionales de Salud (NIH) de Estados Unidos de América)	https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/
Latipat (base de datos de patentes en cooperación entre la Oficina Europea de Patentes y la Oficina Española de Patentes y Marcas)	https://lp.espacenet.com/
Instituto Nacional de la Propiedad Industrial (INPI) – Argentina	https://www.argentina.gob.ar/inpi
The COVID 19 Epidemic. Christian O Meyer et. Al. Trop. Med. Intern. Health 2020 mar, 25 (3) pag. 273-280	
Clinical efficacy of Lopinavir/Ritonavir in the treatment of COVID 19 Journal of English Medicine School 2020 mar. 25	
The FDA approved the drug Ivermectin inhibits replication the SARS COV2 in vitro. Leon Caly et. Al Antiviral Investig. 2020 Jun. vol,178	
Cytokine release syndrome in severe COVID 19 interleukin 6 release system Chi Zhang et,al Interjournal of Antimicrobial Agent 2020 mar. 15	

Este boletín fue publicado por
**Instituto Nacional de la
Propiedad Industrial**
Septiembre 2020