

Tarifname

3,7-BİS(2-HİDROKSİETİL)-3,5-TRİHİDROKSİ-2-(4-EPOKSİFENİL)-8-(3-METİL-2-BÜTEN-1-Yİ)-4H-1-BENZOPİREN-4-ON VE TÜREVLERİNİN OSTEOPOROZ'UN TEDAVİSİNE YÖNELİK KULLANIMI

5

Teknik Alan

Buluş, 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on ve türevlerini içeren bir kompozisyon ve osteoporoz'un tedavisine yönelik kullanımı ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde osteoporoz veya Kemik erimesi, kemik metabolizmasındaki bir bozukluk sonucunda kemikteki protein örgüsünün seyrelmesiyle iskelette ortaya çıkan ve kemiklerin çok kolay kırılabilmesine sebep olan bir hastalıktır. Kemiğin birim hacimdeki mineral yoğunluğu azalmıştır. Bu nedenle kemikler daha kolay kırılır hale gelir. En çok omurlarda, kalça ve bilek kemiklerinde görülse de vücuttaki bütün kemikler bu durumdan etkilenir. Her iki cinste de görülebilmekle beraber hastaların %80'i kadındır.

20

Mevcut teknikte var olan organik nitrat ya da eksojen östrojen takviyeleri hem verimli sonuç alınamayan hem de sahip olduğu metabolik kardiovasküler ve karsinojenik risklerden dolayı uzun süreli sürdürülemeyen tedavilerdir.

Mevcut teknikte WO 1997/019909 no'lu, " Yeni amino alkol türevleri, bunların üretimi için işlemler ve bu bileşikleri içeren farmasötik ajanlar " başlıklı buluş, Formül I bileşikleri ki burada R1 hidrojen ya da metildir, R2 1-10 karbon atomuna sahip düz zincirli ya da dallanmış bir aşağı alkildir, R3 hidrojen ya da aşağı alkildir, n 0-12 arasındadır, R4 6-24 karbon atomuna sahip alkil, alkenil ya da alkinildir, bunların üretimi için işlemler ve osteoporozun tedavisi için bu bileşikleri içeren farmasötik ajanlardır.

30

Yine, WO 1998/001443 no'lu, " Osteoporozun tedavisi için indolin türevleri " başlıklı buluş, Ra'nın, hidrojen, alkil veya tercihe göre ikameli aril olan R5 grubunu temsil ettiği, ve Rb'nin, X'in, alkil grubunun ikameli veya ikamesiz olabildiği bir hidroksi veya bir alkoksi grubunu temsil ettiği veya X'in, R8 ve Rt'nin her birinin bağımsız olarak hidrojen, alkil, ikameli alkil, tercihe göre ikameli alkenil, aril, arilalkil, heterosiklik grup veya bir heterosiklikalkil grubunu temsil ettikleri veya Ra ile Rt'nin, bağlı oldukları nitrojen ile birlikte bir heteroksiklik grubunu oluşturdukları bir formül (a) kısmını temsil ettiği; R1' in bir alkil veya ikameli ya da ikamesiz bir aril grubunu temsil ettiği; ve R2,R3 ile R4'ün herbirinin bağımsız olarak hidrojen, alkil, aril veya ikameli aril'i temsil ettikleri; R6 ve R7' nin herbirinin bağımsız olarak hidrojen, hidroksi, amino, alkoksi, tercihe göre ikameli ariloksi, tercihe göre ikameli benziloksi, alkilamino dialkilamino, halo, triflorometil, triflorometoksi, nitro, alkil, karboksi, karbaloksi, karbamoyl'dir.

Yine, EP2046797B1 no'lu, "Furu[3,2-B]pirrol-3-on türevleri ve sisteinil proteinaz inhibitörü olarak kullanılmaları" başlıklı buluş, (I) formülüne sahip bileşikler, ve bunların farmasötik olarak kabul edilebilir tuzları ile ilgilidir. (I) formülüne sahip bir bileşik veya bir tuz, hidrat, kompleks veya ön-ilacı (I), ki burada; R1 ve R2'den biri eşittir H, ve diğeri F ve Cl arasından seçilir, veya R1 ve R2 ikisi de F'dir; R3 siklopentil ve sikloheksil arasından seçilir; R4 dört adete kadar heteroatom ihtiva eden, isteğe bağlı olarak yer değiştirmiş 5- veya 6-elemanlı monosiklik veya bir 8- veya 10-elemanlı bisiklik aril veya heteroaril halkasıdır. Buluş ayrıca (I) formülüne sahip bileşikler ihtiva eden farmasötik kompozisyonlar, ve bu tür kompozisyonların osteoporoz, Paget hastalığı, Chagas hastalığı, malarya, gingival hastalıklar, hiperkalemi, metabolik kemik hastalığı, matris veya kıkırdak degradasyonu görülen hastalıklar, ve kemik kanseri bozuklukları mesela kemik metastasları ve ilişkili ağrı arasından seçilecek bir hastalığın tedavisinde kullanılması ile ilgilidir.

Sonuç olarak osteoporoz'un tedavisine yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

30

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, osteoblast üretimini desteklemesidir.

5 Buluşun bir diğer amacı, hem sahip olduğu etkin fgf-2 artırım kabiliyeti sayesinde kemik yoğunluğunu destekleme

Buluşun bir diğer amacı, mineral kaybını önlemesidir.

10 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, osteoporoz'un tedavisine yönelik, 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on, 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

15 Buluşun yapısal ve karakteristik özellikleri ve tüm avantajları aşağıda verilen detaylı açıklama sayesinde daha net olarak anlaşılacaktır ve bu nedenle değerlendirmenin de bu detaylı açıklama göz önüne alınarak yapılması gerekmektedir.

20 **Buluşun Detaylı Açıklaması**

25 Buluş, 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on ve türevlerini içeren bir kompozisyon ve osteoporoz'un tedavisine yönelik kullanımınıdır. Buluş konusu kompozisyon hem yeni osteoblast üretimini desteklemekte, hem sahip olduğu etkin fgf-2 artırım kabiliyeti sayesinde kemik yoğunluğunu desteklemekte ve mineral kaybını önlemektedir.

Buluş konusu kompozisyon 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on , 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on ihtiva etmektedir.

30

Söz konusu kompozisyon, yukarıdaki bileşenlerin aşağıdaki ağırlıkça oranlarda karışımından elde edilmektedir;

% 1-99 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on

% 99-1 oranında 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on. .

5

Yukarıda verilen bileşenler verilen ağırlıkça oran aralıklarında ve yukarıdaki gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşimlerinden elde edilmektedir.

10 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; osteoporoz'un tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

- 5 1. Buluş, osteoporoz'un tedavisine yönelik, 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on, 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
- 10 2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 20 4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3,7-bis(2-hidroksietil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on , 2,7-bis(2-ketoetil)-3,5-Trihidroksi-2-(4-epoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-yi)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; osteoporoz'un tedavisine yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımınıdır.

ÖZET**3,7-BİS(2-HİDROKSİETİL)-3,5-TRİHİDROKSİ-2-(4-EPOKSİFENİL)-8-(3-METİL-2-BÜTEN-1-Yİ)-4H-1-BENZOPİREN-4-ON VE TÜREVLERİNİN OSTEOPOROZ'UN TEDAVİSİNE YÖNELİK KULLANIMI**

5

Buluş, osteoporoz'un tedavisine yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15