

Tarifname

ALS TEDAVİSİNE YÖNELİK HAZIRLANMIŞ BİR KOMPOZİSYON

5 Teknik Alan

Buluş, ALS tedavisine yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde amyotrofik lateral skleroz (ALS), aynı zamanda motor nöron hastalığı olarak da anılan, merkezî sinir sisteminde, omurilik ve beyin sapı adı verilen bölgede motor sinir hücrelerinin (nöronlar) kaybından ileri gelen bir hastalıktır.

Hastalık, merkezî sinir sisteminde, omurilik ve beyin sapı adı verilen bölgede motor sinir hücrelerinin (nöronların) kaybından ileri gelir. Bu hücrelerin kaybı kaslarda düşüklük ve erimeye yol açar. Ayrıca erken ya da geç hareketin birinci nöronu da hastalanır. Zihinsel fonksiyonlar ve bellek ise bozulmaz.

Kaslardaki zayıflık ellerde ya da bacaklarda, ağız-yutak bölgesinde ya da dilde başlayabilir ve sürekli ilerleyerek yayılır. Bu yayılma "bulber" alandaki kasları da tutabileceği için konuşma ve yutma güçlüğüne neden olabilir. İleri evrelerinde solunum yetersizliğine de yol açabilir. Genellikle erişkin yaşlarda (40-50) ve erkeklerde, kadınlara göre biraz daha sık görülür. Görülme sıklığı (insidansı) 100.000 de 1-1,5 civarındadır. Daha genç ve daha ileri yaşlarda da ortaya çıkabilir ve genellikle zayıf insanlarda görüldüğü dikkat çekmektedir.

Mevcut teknikte var olan tedaviler insülin benzeri büyüme faktörü tip-1 ve türevlerinin zerki,kortikosteroid ve türevleri ile uygulanan imünosupresif tedaviler ve diyet modifikasyonlarıdır.

Yine mevcut teknikte yer alan WO 1997/015304 no'lu, "Amyotrofik lateral skleroz tedavisine yönelik ilaç hazırlamak için 1-(2-naft-2-iletıl) -4-(3-trifluorometılfenıl) -1,2,3,6-tetrahidropiridin kullanımı " başlıklı ve "A61K 31/44 " tasnif sınıflı buluş,

amyotrofik lateral skleroz (ALS) tedavisine yönelik ilaçların hazırlanması için 1-(2-naft-2-iletıl) -4-(3-trifluorometılfenıl) -1,2,3,6-tetrahidropıridın veya farmasötık olarak kabul edılebilir asıtlele bırıkte ılave tuzlarının kullanıma ılışkındır.

5 Yıne, EP1483247B1 no'lu, "Arıl ikame edılmıř pırimıdınler ve bunların kullanıma " başlıklı buluş, Formül (I)'deki yeni arıl - ikame edılmıř pırimıdın bılleşıklerı veya bunların farmasötık olarak kabul edılebilir bır tuzunu veya solvatını kullılarak sodyum ıyonu kanallarının bloke edılmesıne tepkı veren bozuklukların tedavısı için bır yöntemle ılıgıldır ve A, R1, R2, R3 ve R4 tanımlamada açıklanmıřtır. Bu buluş ayrıca global ve fokal iskemi sonrası nöronal hasarın tedavısı, amıyotropık lateral skleroz 10 (ALS) gıbi norodejeneretıf durumlardı tedavısı ve önlenmesi, hem akut hem de kronık ağrıının tedavısı, önlenmesi ve hafıfletılması ve dıyabetık nöropatının tedavısı veya önlenmesi için Formül I'in bılleşıklerının antı - kulak çınlaması ajanları, antıkonvulsantlar, antımanık depresantlar, lokal anestezipler ve antıaritmıkler olarak kullanıma ılıle de ılıgıldır.

15 Yıne, EP1755647B1 no'lu, "Amyotrofik lateral sklerozun tedavısı " başlıklı buluş, motor nöron hastalıklarının tedavisinde kullanıma için VEGFıes ılıle ılıgili olup içerisinde bahsedılen VEGFıes 0.01 pg/kg/gün ve 0.6 pg/kg/gün arasına yakın bır aralıktta başlangıç yerine en az 4 haftaya kadar süre ılıle sürekli olarak uygulanmaktadır. Özellıkke daha çok buluş amyotrofik lateral sklerozun (ALS) tedavısı ılıle ılıgıldır.

20 Sonuç olarak ALS tedavisıne yönelik bır kompozısyona olan gereksınıma varlığı ve mevcut çözümlerın yetersızlığı ılıgili teknık alanda bır gelıřtirme yapmayı zorunlu kılmıřtır.

25 **Buluşun Amacı**

Teknığın bılınen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bır amacı, yüksek TNF-a ve nf-kappaB gıbi pro-enflamatuar sıtokınlerı baskılamasıdır.

Buluşun bır dığer amacı, sıner büyüme faktörü ekspresyonunu yükseltmesıdır.

Buluşun bir diğer amacı, BDNF salınımını desteklemesidir.

Buluşun bir diğer amacı, Kısmi follistatin ekspresyon yükseltimi ile kas kütlesi oluşumunu desteklemesidir.

5

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş,

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.

10

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, ALS tedavisine yönelik oluşturulmuş bir kompozisyondur. Buluş konusu kompozisyon, yüksek TNF-a ve nf-kappaB gibi pro-enflamatuar sitokinleri baskılamakta, sinir büyüme faktörü ekspresyonunu yükseltmekte ve BDNF salınımını desteklemekte, kısmi follistatin ekspresyon yükseltimi ile kas kütlesi oluşumunu desteklemektedir.

15

Buluş konusu kompozisyon 3,5-trietil-2,6-oktadienil]-2,4-trimetoksikafeoil]-6-(7-dihidroksifenil)-3-propen-4-one, 3,7-(4-hidroksifenil)-2-propen-1-one, 6-okzodiosgenin-etil-ester, 4-hidroksidioskin ihtiva etmektedir.

20

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

25

% 7 -13 oranında 3,5-trietil-2,6-oktadienil]-2,4-trimetoksikafeoil]-6-(7-dihidroksifenil)-3-propen-4-one,

% 23-41 oranında 3,7-(4-hidroksifenil)-2-propen-1-one,

% 50-22 oranında 6-okzodiosgenin-etil-ester,

% 20-24 oranında 4-hidroksidioskin .

30

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

- 5 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; ALS tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, ALS (amyotrofik lateral skleroz) tedavisine yönelik, 3,5-trietil-2,6-oktadienil]-2,4-trimetoksikafeoil]-6-(7-dihidroksifenil)-3-propen-4-one, 3,7-(4-hidroksifenil)-2-propen-1-one, 6-okzo-diosgenin-etil-ester, 4-hidroksidioskin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
5
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 7 -13 oranında 3,5-trietil-2,6-oktadienil]-2,4-trimetoksikafeoil]-6-(7-dihidroksifenil)-3-propen-4-one içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 23-41 oranında 3,7-(4-hidroksifenil)-2-propen-1-one içermesidir.
15
4. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 50-22 oranında 6-okzo-diosgenin-etil-ester içermesidir.
5. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 20-24 oranında 4-hidroksdi içermesidir.
20
6. Buluş, istem 1 ila 5'te bahsedilen; 3,5-trietil-2,6-oktadienil]-2,4-trimetoksikafeoil]-6-(7-dihidroksifenil)-3-propen-4-one, 3,7-(4-hidroksifenil)-2-propen-1-one, 6-okzo-diosgenin-etil-ester, 4-hidroksidioskin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; ALS (amyotrofik lateral skleroz) tedavisine yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımınıdır.
25
30

ÖZET**ALS TEDAVİSİNE YÖNELİK HAZIRLANMIŞ BİR KOMPOZİSYON**

5 Buluş, ALS(amyotrofik lateral skleroz) tedavisine yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.