

Tarifname

CİNSEL İSTEK SAĞLAMAYA YÖNELİK BİR KOMPOZİSYON

5 Teknik Alan

Buluş, cinsel istek ve arzu sağlamaya yönelik bir kompozisyon ile ilgilidir.

Buluş özellikle, cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile sağlayan kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde cinsel fonksiyon bozuklukları sertleşme zorluğu, erken boşalma, cinsel isteksizlik gibi başlıkları kapsamaktadır. Bu tip sorunlar kökünde cinsel organlarda ya da sinirlerde yapısal bir tahribat olmadığı takdirde parasempatik sinir sistemi defektlerine ve androjen eksikliğine dayanmaktadır. Penis te bulunan kavernöz dokular nitrik oksit salınımının tetiklediği yumuşak kasların rahatlaması sonucu kan dolar ve ereksiyon gerçekleşir. Nitrik oksit salınımını asetilkolin tetikler ve substansia Nigra da üretilen dopamin asetilkolinle eş zamanlı LHRH üretim sinyali verir. LHRH LH salınımını tetikler ve testisler testosteron üretir. Seks hormonu bağlayıcı globulinlerden kurtulan serbest testosteron 5-alfa-reduktaz adlı enzimle etkileşime girerek DHT ye çevrilir ve salınımı asetilkolin tarafından tetiklenen nitrik oksit DHT ve dopamin tarafından desteklenir.

25 Günümüzde stres ve diyetle bağlı oluşabilen kronik yüksek plazma kortizol, yine strese ve düzensiz beslenmenin sebep olduğu kilo fazlasının üretimini tetiklediği kadınlık hormonları seviyesinde artış, piyasada sayısız üründe bulunan kadınlık hormonu agonisti zenoöstrojenler, düşük dopamine bağlı yüksek prolaktin, strese bağlı düşük asetilkolin ve parasempatik sinir sistemi defektleri gibi bir çok nedenden dolayı cinsel fonksiyon bozuklukları oldukça yaygındır.

30

Halihazırda var olan tedaviler PDE5 baskılanması ile yumuşak kaslarda rahatlama indükleyen ilaçlar, sentetik testosteron türevlerinin androjen defektlerinin tedavisinde kullanımı, LH indükleyici selektif östrojen reseptör modulatorleri, testosteron üretimini

5 tetikleme amacı ile kullanılan aromataz bloklayıcıları, prolaktini indirgeme amacı ile verilen dopaminerjik ilaçlar ya da bunların eş zamanlı kullanımını öngören kompleks tedavilerdir. PDE5 baskılayıcıları orta vadede eş zamanlı testosteron salınımı sağlamadığından fibroza ve cinsel istek kaybına sebebiyet verebildiği gibi orta vadede gelişen toleransla zamanla etkilerini yitirmektedirler. Sentetik testosteron türevleri dışarıdan alındığında LH&FSH üretimini baskılamakta ve aromataz seviyesinin yükselmesine sebep olmaktadır. Böbreküstü bezlerinde DHEA üretimini de indirgediğinden hem asetilkolin üretimi hem de indirek olarak serbest testosteron ve DHT üretimi düşmekte bu sebeple östrojen seviyesi daha da artmaktadır. Sentetik 10 testosteron türevleri prolaktin seviyesinde yükselmeye sebebiyet vermekte ve jinekomasti gibi erkekler için ciddi oranda onur yaralayıcı semptomlara mahal vermektedir. SERM türevi ilaçlar testosteron salınımını tetiklemekte fakat DHT ve DHEA seviyesini yükseltmemekte olup direk DNA hasarına sebebiyet verebilmekte ve özellikle beyinde östron türevlerinin seviyesinin yükselmesine sebebiyet 15 vermektedir. Aromataz bloklayıcı yine enzimatik geri dönüşüm sebebiyle kullanımı bırakıldığında kullanım öncesinden daha yüksek östrojen seviyelerine sebebiyet verebilmekte; kullanım sırasında prostat büyümesine sebep olabilmektedirler. Dopaminerjik ilaçlar etkin olarak prolaktin baskılamakla birlikte zamanla ereksiyon kalitesinde sağladıkları artışı sağlayamaz olmakta ve orta vadede erken boşalmaya 20 sebebiyet vermektedirler.

Yine günümüzde mevcut tekniğe ait; WO 1998/007422 no'lu, "Cinsel fonksiyon bozuklukları için tedavi edici uygulama" başlıklı buluşta, Cinsel fonksiyon bozukluklarının tedavisi için, özellikle bir izozyme seçici PKC inhibitörü, ((S)-3,4-[N,N'-1,1'-(("-ethoxy)-3""(O)-4""- (N,N-dimetilamino)butan)- bis-(3,3'-indoly1)]-1(H)-pyrrole-2,5-dion, özellikle bunun hidroklorür veya mesylate tuzunu kullanan, bir 25 yöntem anlatılmaktadır.

Yine mevcut tekniğe ait EP1429753B1 no'lu, "Gama-bütirobetain içeren farmasötik bileşim" Gama-bütirobetain için yeni medikal kullanım açıklanmıştır. Aynı zamanda, memelilerde cinsel etkinliğin ve iktidarın uyarımı için yararlı olan, ağızdan, parenteral, 30 deri altından, deri üstünden, lokal, dil altından, intrauretral, burun içinden ya da makattan uygulamalar için, gama-bütirobetaini ya da gama-bütirobetainin 3-(2,2,2-trimetilhidrazinyum)propionat ya da sildenafil ile kombinasyonunu içeren farmasötik

bileşimler de açıklanmıştır. Açıklanan bileşimler, 6 hafta için ağızdan uyuşturulmamış erkek sıçanlara uygulandığında cinsel etkinliklerini önemli ölçüde arttırmakta, uyarılma süresini azaltmakta, çiftleşme sayısını ve binme girişimlerinin sonuç verirliliğini arttırmaktadır. İntrakavernöz ya da intravenöz yoldan uygulandığında, bahsedilen farmasotik bileşimler intrakorporeal basıncı ve ereksiyon süresini arttırmakta ve aynı zamanda, uyuşturulmuş hayvanlarda uyarımın ortaya çıkardığı reflektöri ereksiyonu eski haline getirmektedir.

Yine, EP1644014B1 no'lu, "Vazoaktif maddelerin kombinasyonları ve bunların cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde kullanımı" başlıklı buluş zayıf lokal kan tedariki ve/veya yetersiz lubrikasyon ile bağlantılı cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde yararlı olan vazoaktif maddelerin kombinasyonları ile ilgilidir. Aktif Bileşikler: - eskulosid veya visnadin; -forskolin veya bunu içeren ekstreler, veya alternatif olarak Ipomea sınıfından bitkilerin saflaştırılmış lipofilik ekstreleri, -ksimeninik asidin esterleri; isteğe bağlı olarak ikarin veya bunun türevleri veya bunu içeren ekstreler, amentoflavon ve Ginko biloba dimerik flavonlarından seçilmiş en az bir bileşikten seçilir. Bu vazoaktif maddelerin kombinasyonu, cinsel organlara tatbik edilmek için tasarlanmış jeller ve losyonlar içine dahil edilir. Bu formülasyonlar erkek ve kadın cinsel organlarında ereksiyon başlatmak ve orgazm ve cinsel performansı artırmak için yararlıdır. Formülasyonlar, kadın cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde özellikle yararlıdır.

Yine, EP1797876B1 no'lu, "Vazoaktif maddelerin kombinasyonları ve bunların, cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde kullanımı" başlıklı buluş, zayıf lokal kan tedariki ve/veya yetersiz lubrikasyon ile bağlantılı cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde yararlı olan vazoaktif maddelerin kombinasyonları ile ilgilidir. Aktif bileşikler -eskulosid veya visnadin, -forskolin veya bunu içeren ekstreler, veya alternatif olarak Ipomea sınıfından bitkilerin saflaştırılmış lipofilik ekstreleri ksimenirik asidin esterleri; isteğe bağlı olarak ikarin veya bunun türevleri veya bunu içeren ekstreler, amentoflavon ve Ginko biloba dimerik flavonlarından seçilmiş en az bir bileşikten seçilir. Bu vazoaktif maddelerin kombinasyonu, cinsel organlara tatbik edilmek için tasarlanmış jeller ve losyonlar içine dahil edilir. Bu formülasyonlar erkek ve kadın cinsel organlarında ereksiyon başlatmak ve orgazm ve cinsel performansı artırmak için yararlıdır. Formülasyonlar, kadın cinsel işlev bozukluklarının tedavisinde özellikle yararlıdır.

Yine, WO 1997/021439 no'lu buluş, 1-{4-[4-aril (veya heteroaril)-1-piperazinil]bütil} -1 H-azol türevlerinin ve bunların fizyolojik olarak kabul edilebilir tuzlarının, kompulsif obsesif bozukluklar, uykuda apne sendromu, cinsel fonksiyon bozuklukları, kusma ve taşit tutmasının tedavisinde kullanılacak olan ilaçların imalatı için kullanılmasına ilişkindir.

Sonuç olarak cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile sağlayan bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı,

Buluşun bir diğer amacı, asetilkolinin salınımını tetiklediği nitrik oksit seviyesini daha da yükseltmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, yükseltme komutunun ömrünü uzatmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, LH&FSH tetiklemesinin yanısıra kısmi bir fitoandrojen olarak görev gören Ostol androjen reseptör hassasiyetini artırmakta ve kavernoöz dokusunda androjen agonisti bir etki yapmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, ne bir reseptör hassasiyet kaybına ne de reseptör desentezasyonuna sebebiyet vermemesidir.

Buluşun bir diğer amacı, Cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, LH ve FSH salınımını tetiklemekte eNOS seviyesini yükseltme kabiliyetine sahip olmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, Sağladığı nitrik oksit artırımını prolaktin seviyesinin indirgenmesine yardımcı olmasıdır.

- 5 Buluşun bir diğer amacı, Asetilkarnitin asetilkolin üretimini artırır ve ko-enzim a seviyesini yükseltmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, Asetilkolin reseptör hassasiyetini artırır ve böbrek üstü bezlerini bu sayede indirek uyarmasıdır.

10

Buluşun bir diğer amacı, Anti-kortikosteroid etkiye sahip olan asetilkarnitin indirek bir şekilde aromatazı baskılar ve dopaminerjik özelliği sayesinde prolaktini baskılamasıdır.

- 15 Buluşun bir diğer amacı, Melatonin artırıcı özelliği sayesinde genel olarak sağlıklı bir uyku desteği verir ve bu sayede testosteron üretimini desteklemesidir.

Buluşun bir diğer amacı, LHRH üretimini artırıp yine androjen üretimini destekleyici özelliğe sahip olmasıdır.

20

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, bir kompozisyonudur.

Buluş aynı zamanda yukarıda bahsedilen kompozisyonun yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimidir.

25

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.

30

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile sağlayan kompozisyon bir kompozisyonudur.

- 5 Cnidium Monnieri bitkisinin doğal olarak ihtiva ettiği bir kumarin türevidir olan Ostol adlı bileşen asetilkolinin salınımını tetiklediği nitrik oksit seviyesini daha da yükseltmekte, hem de bu yükseltme komutunun ömrünü uzatmaktadır. LH&FSH tetiklemesinin yanısıra kısmi bir fitoandrojen olarak görev gören Ostol androjen reseptör hassasiyetini artırmakta ve kavernoöz dokusunda androjen agonisti bir etki
- 10 yapmaktadır. Bu etkisi sırasında ne bir reseptör hassasiyet kaybına ne de reseptör desentezasyonuna sebebiyet vermemektedir. Cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile sağlamaktadır. LH ve FSH salınımını tetiklemekte eNOS seviyesini yükseltme kabiliyetine sahiptir. Sağladığı nitrik oksit artırımını prolaktin seviyesinin
- 15 indirgenmesine yardımcı olur.

- Asetilkarnitin asetilkolin üretimini artırır ve ko-enzim A seviyesini yükseltir. Asetilkolin reseptör hassasiyetini artırır ve böbrek üstü bezlerini bu sayede indirek uyarır. Anti-kortikosteroid etkiye sahip olan asetilkarnitin indirek bir şekilde aromatazı baskılar ve
- 20 dopaminerjik özelliği sayesinde prolaktini baskılar. Melatonin artırıcı özelliği sayesinde genel olarak sağlıklı bir uyku desteği verir ve bu sayede testosteron üretimini destekler. LHRH üretimini artırıp yine androjen üretimini destekleyici özelliği vardır.

- 25 Buluş konusu kompozisyon ostol ve asetilkarnitin ihtiva etmektedir. Söz konusu bileşenlere ait ağırlıkça oranlar; ostol: %10-90, asetilkarnitin: %90-10 şeklindedir.

- Buluş konusu kompozisyon; yukarıda verilen bileşenler verilen ağırlıkça oran aralıklarında ve yukarıdaki gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar
- 30 halinde birleşimlerinden elde edilmektedir.

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile cinsel istek ve arzuyu eş zamanlı olarak sağlamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği progonadotropik etki ile cinsel istek ve arzu sağlamaya yönelik ostol ve asetilkarnitin 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 % 10-90 oranında ostol içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 10-90 oranında asetilkarnitin içermesidir.
10
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen, cinsel istek ve arzu sağlamaya yönelik kompozisyonunun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**CİNSEL İSTEK SAĞLAMAYA YÖNELİK BİR KOMPOZİSYON**

5 Buluş, hem hipotalamustaki hem de hipofiz bezinde indüklediği pro-gonadotropik etki ile cinsel istek ve arzu sağlamaya yönelik ostol ve asetilkarnitin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Şekil yoktur.

15