

Tarifname

HİPOLİDEMİK NİTELİK SERGİLEYEN PİKRORETİN TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON VE BU KOMPOZİSYONUN YÜKSEK KOLESTEROL TEDAVİSİ AMAÇLI KULLANIMI

5

Teknik Alan

Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde hipolipidemik, lipit düşürücü ilaçlar olarak kanda yüksek lipit seviyelerinin tedavisinde kullanılan çeşitli türde ilaçlardır. Hipolipidemik ilaçlar veya antihiperlipidemik ilaçlar olarak da adlandırılırlar. Lipit düşürücü ilaçlar birkaç sınıfa ayrılabilir. Yan etkileri ve kolesterol profiline olan etkileri bakımından farklılıklar gösterirler. Bazıları "kötü kolesterol" diye bilinen LDL kolesterolünü azaltırken diğerleri "iyi kolesterol" HDL kolesterolünü arttırlar. Klinik kullanımda bir hastanın hangi ilacı alacağını belirlemek için hastanın kolesterol düzeyine, kardiyovasküler risk durumuna, karaciğer ve böbrek fonksiyonuna bakılır ve bunlar, ilacın riskleri ile faydalarıyla birlikte değerlendirilir.

Mevcut teknikte yer alan, WO 2000/020410 no'lu, ve " Heterosiklik ikameli propanolamin türevleri, üretimi, ilaçları,kullanımı" başlıklı buluş, heterosiklik olarak ikame edilmiş propanolamin türevlerini ve bunların farmasötik olarak tolere edilebilir tuzlarını ve fizyolojik olarak fonksiyonel türevlerini konu almaktadır. İçindeki artıkların, belirtilen anlamlara sahip olduğu formül I bileşikleri, bunların fizyolojik olarak tolere edilebilen tuzları, fizyolojik olarak fonksiyonel türevleri ve bunların üretimlerine yönelik yöntemler tanımlanmaktadır. Bileşikler örneğin, hipolipidemik maddelere uygunluk göstermektedirler.

Yine, EP1414439B1 no'lu, ve " Hipolipidemik hipokolesteremik aktivitelere sahip yeni piroller,bunların hazırlanması için işlem ve bunları içeren farmasötik bileşimler ve bunların tıpta kullanımı " başlıklı buluş, genel formül (I)'de açıklanan yeni bileşikler,

bunların tautomerik formları, bunların türevleri, bunların analogları, bunların stereoizomerleri, bunların farmasötik olarak kabul edilebilen tuzları ve bunların farmasötik olarak kabul edilebilen solvatlarının preparasyonu için usuller sunmaktadır. Buluş ayrıca bu tür bileşikler hazırlamak için işleme, bu tür bir bileşiği içeren bir bileşime, bu tür bir bileşiğin ve bileşimin tıpta kullanımına ilişkindir. Bileşikler kanda trigliserit seviyelerini düşürür ve obezite, hiperlipidemi, hiperkolesteremi, sendrom X ve diyabetin tedavisinde yararlı olabilir.

Yine, WO 2000/020437 no'lu, ve " Lipid metabolizma bozukluklarının tedavisinde safra asitleriyle bağlı propanolamin türevleri " başlıklı buluş, Safra asitleri ile bağlanmış propanolamin türevleri, onların imal edilmelerine yönelik yöntemler, bu bileşimleri içeren ilaç maddeleri ve onların kullanımları. Buluş ikame edilmiş propanolamin türevleri ve onların fizyolojik olarak hazmedilebilen tuzları ile fizyolojik işlevli türevleri ile ilgilidir. Formül (1)'in içerinde artıkların belirtilen anlamlara geldiği, ve ayrıca onların fizyolojik olarak hazmedilebilen tuzları, fizyolojik işlevli türevleri ve onların imal edilmelerine yönelik yöntemleri tanımlamaktadır. Bileşimleri örneğin hipolipidemikler olarak uygundurlar.

Sonuç olarak, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

20

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, BAR antagonistik işlev tesis etmesidir.

25

Buluşun bir diğer amacı, CYP7A1 ekspresyonunun artımını tetiklemesidir.

Buluşun bir diğer amacı, sSTAR protein ekspresyonunun artımını tetiklemesidir.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye ve yüksek kolesterol tedavisine yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin, 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin içeren gruptan

30

seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

5 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.

Buluşun Detaylı Açıklaması

- 10 Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik oluşturulmuş, pikroretin türevlerini içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, BAR antagonistik işlev tesis etme, CYP7A1 ekspresyonunun artımını tetikleme ve sSTAR protein ekspresyonunun artımını tetikleme sağlamaktadır.
- 15 Buluş konusu kompozisyon; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin, 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin ihtiva etmektedir.

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

- 20 % 1-99 oranında 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin,
% 99-1 oranında 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin.

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

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; hipolipidemik nitelik sergilemeye ve yüksek kolesterol tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye ve yüksek kolesterol tedavisine yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin, 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin, 4,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-pikroretin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hipolipidemik nitelik sergilemeye ve yüksek kolesterol tedavisine yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**HİPOLİPİDEMİK NİTELİK SERGİLEYEN PİKRORETİN TÜREVLERİNİ İÇEREN
BİR KOMPOZİSYON VE BU KOMPOZİSYONUN YÜKSEK KOLESTEROL
TEDAVİSİ AMAÇLI KULLANIMI**

5

Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye ve yüksek kolesterol tedavisine yönelik oluşturulmuş, pikroretin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Şekil yoktur.

15