

Tarifname

FARNESOID-X- RESEPTÖR ANTAGONİSTİK NİTELİK SERGİLEYEN SORİNİN TÜREVLERİNİN HİPERKOLESTEROLEMİNİN TEDAVİSİ AMAÇLI KULLANIMI

5

Teknik Alan

Buluş, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelimeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde hiperkolesterolemi (kelimenin tam anlamıyla: yüksek kan kolesterol) yüksek kan kolesterol seviyesinin bulunmasıdır. Bir hastalık ama birçok hastalıklara ikincil olabilir ve hastalığı, başta kalp damar hastalıkları birçok formları için katkıda bulunabilecek bir metabolik derangement değil. Şartlar "hiperlipidemi" (yükseltilmiş düzeylerinin, lipitler) ve "hyperlipoproteinemia" (yükseltilmiş düzeylerinin, lipoproteinler) yakından ilgilidir.

Mevcut teknikte yer alan, WO 1998/013034 no'lu, "A61K 31/135" tasnif sınıflı ve "Lipid düzeylerini düşürmek için sibutramin analoglarının kullanımı" başlıklı buluş, R1 ve R2'nin bağımsız bir biçimde H veya metil olduğu (örnek olarak; isteğe bağlı olarak, monohidratı şeklindeki N,N-dimetil-1-[1-(4-klorofenil)siklobutil]-3-metil bütül amin hidroklorür), formül I'in bir bileşiği veya bunun farmasötik olarak kabul edilebilir bir tuzu, insanlarda lipid düzeylerini düşürmek için ve/veya HDL (yüksek yoğunluklu lipoprotein) : LDL (düşük yoğunluklu lipoprotein) kolesterol oranını artırmak için örnek olarak, hiperlipidemi, hiperkolesterolemi veya hipertrigliseridemili hastalarda kullanılır.

Yine, WO 1999/032465 no'lu, "Ariltiazolidindion türevleri" başlıklı buluş, İkameli 5-aril-2,4-tiazolidindionlar güçlü PPAR agonistleridir ve dolayısıyla diyabet, hiperglisemi, hiperlipidemi (hiperkolesterolemi ve hipertrigliseridemi dahil), ateroskleroz, obezite, vasküler restenoz ve PPAR , ve/veya dolayimli başka hastalıkların, bozukların ve durumların tedavisi, kontrolü veya önlenmesinde yararlıdır.

30

- Yine, EP2382970B1 no'lu, "7-ornatılmış-3,5-dihidroksiheptanoik asitleri veya 7-ornatılmış-3,5-dihidroksiheptanoik asitleri içeren stabil farmasötik kompozisyonlar" başlıklı buluş, statinleri içeren stabilize edilmiş farmasötik kompozisyonlar ile ilgili olup ve daha fazla özellikle açık halkalı 7-ornatılmış-3,5-dihidroksiheptanoik asitler veya açık halkalı 7-ornatılmış-3,5-dihidroksiheptanoik asitleri veya bunların farmasötik olarak kabul edilen tuzlarını içeren stabilize edilmiş farmasötik kompozisyonlar ile ilgilidir. Mevcut buluş aynı zamanda, dislipidemilerin tedavisi için, ilaveten hiperlipidemi, hiperkolesterolemi ve hipertrigliseridemi tedavisi için bunun gibi stabilize edilmiş farmasötik kompozisyonların kullanılması ile ilgilidir.
- 5
- 10 Sonuç olarak, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelimeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

15 **Buluşun Amacı**

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, farnesoid-x-reseptör antagonistik etki tesis etmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, 3T3-L1 preadiposit başkalaşımının baskılanmasıdır.

20

Buluşun bir diğer amacı, PPAR gama ekspresyonunun artımıdır.

- Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelimeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin, 4,20-dietil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyondur.
- 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, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelermeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik oluşturulmuş, sorinin türevlerini içeren bir kompozisyondur. Söz konusu kompozisyon; farnesoid-x-reseptör antagonistik etki tesis etme, 3T3-L1 preadiposit başkalaşımının baskılanması ve PPAR gama ekspresyonunun artımını sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin, 4,20-dietil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin ihtiva etmektedir.

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

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

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; farnesoid-X-reseptör antagonistik nitelermeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelermeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin, 4,20-dietil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
5
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliđi, ađırlıkça % 1-99 oranında 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliđi, ađırlıkça % 99-1 oranında 4,20-dietil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin, 4,20-dietil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-sorinin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelermeye ve hiperkolesteroleminin tedavisine yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımıdır.
15
20

ÖZET**FARNESÖİD-X- RESEPTÖR ANTAGONİSTİK NİTELİK SERGİLEYEN SORİNİN
TÜREVLERİNİN HİPERKOLESTEROLEMİNİN TEDAVİSİ AMAÇLI KULLANIMI**

5

Buluş, farnesoid-X- reseptör antagonistik nitelimeye ve hiperkolesteroleminin tedavisi yönelik oluşturulmuş, sorinin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15