

Tarifname

ŞİZOFRENİNİN SEMPTOMATİK TEDAVİSİNE YÖNELİK HAZIRLANMIŞ BİR ADJUVAN FORMÜLASYON

5

Teknik Alan

10 Buluş, şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

Tekniğin Bilinen Durumu

15 Günümüzde şizofreni; düşünüş, duyuş ve davranışlarda önemli bozuklukların görüldüğü, hastanın kişiler arası ilişkilerden ve gerçeklerden uzaklaşarak kendi dünyasında yaşadığı, genellikle gençlik çağında başlayan bir ruhsal hastalıktır. Anlatılmak istenen kişinin iki kişilikli olması değil, aynı anda iki farklı gerçekliğe inanmasıdır. "Gerçek gerçeklik" normal, sıradan bir insanın algılamasına denk düşerken, "ikinci gerçeklik" sağlıklı bir insanın anlayamayacağı, çoğu kez belli bir
20 sisteme dayalı bir gerçekliktir.

Şizofreninin ömür boyu görülme sıklığı genel nüfusta % 0,5-1'dir. Ancak kan bağı olan akrabaları arasında şizofreni hastaları bulunanlarda, şizofreni görülme sıklığı genel toplumdan daha yüksektir. Şizofrenide genetik faktörlerin rolü iyi tanımlanmış olmakla beraber, bu hastalık yalnızca kalıtsal faktörlerin değil, birçok koşulun bir
25 araya gelmesi ile oluşur. Yani şizofreni genetik ve çevresel faktörlerin rol aldığı oldukça kompleks bir hastalıktır.

Günümüzde şizofreni tedavisinde çok yönlü bir yaklaşım yararlı bulunmaktadır. Güncel tedavide temelde antipsikotik ilaçlar kullanılmaktadır. Bunun yanı sıra psikoterapiler ve diğer psikososyal yaklaşımlara da başvurulmaktadır. Antipsikotik
30 ilaçların şizofrenide dopamin varsayımını doğrular biçimde dopamin üzerinden etki ettikleri düşünülmektedir. Hastalığın özellikle akut döneminde hastaların hastanede yatarak tedavi görmesi gerekebilir.

Mevcut teknikte, " WO 1997/003071" no'lu, " Heterosiklokarboksamid türevleri ve tedavi için kullanımları" başlıklı ve " C07D 405/14" tasnif sınıflı buluş, (I) formülüne sahip bileşimler ve bunların ispençiyari olarak kabul edilebilir tuzları ile ilgilidir. Söz konusu formülde A metilen ya da O; B metilen ya da O; g 0, 1, 2, 3 ya da 4; R1 bir tercihe bağlı ikame maddesi; U tercihe bağlı olarak bir ya da daha fazla alkil ile ikame edilen bir alkilen zinciridir; Q nitrojen atomları ihtiva eden bir divalan grubu temsil eder; ve T, merkezi sinir sistemi bozuklukları örneğin, depresyon, endişe, psikoz (örneğin şizofreni), geç diskinezya, Parkinson hastalığı, oburluk, yüksek tansiyon, Tourette sendromu, cinsel fonksiyon bozukluğu, ilaç bağımlılığı, ilaç suistimali, bilişim bozuklukları, Alzheimer hastalığı, yaşlılığa bağlı bunama, obsesif davranış bozuklukları, panik krizleri, sosyal fobiler, beslenme bozuklukları ve anoreksiya gibi bozuklukların tedavisinde kullanılan CO.HET'i temsil eder.

Yine, " WO 1998/011890" no'lu, " Nörolojik bozuklukların tedavisi için benzopiranollerin kullanımı" başlıklı ve " A61K 31/35" tasnif sınıflı buluş, Huntingdon koresi, şizofreni; AIDS, düzensiz uyku (sirkadyan ritim bozuklukları, uykusuzluk ve narkolepsi dahil), tikler (örneğin Giles de la Tourette sendromu), travmatik beyin hasarı, tinnitus, nöralji, özellikle trigeminal nöralji, nörofatik acı, diş ağrısı, kanser ağrısı; diyabetik, çoklu sikleroz (MS) ve motor sinir hastalığı, ataksiyaz, kas sertliği (spastiklik) ve temporomandibular eklem işlemezliği gibi nörodisteziyaz ile sonuçlanan uygunsuz nöron faaliyeti ile ilgili nörolojik bozukluklar gibi dejeneratif bozuklukların tedavisi ve/veya profilaksisi için, faydalı benzopiran türevleri ve benzerleri kapsamında yer almaktadır.

Yine, " WO 2000/021930" no'lu, " (+)-alfa-(2,3-dimetoksifenil)- 1-(2-(4-fluorofenil)etil)-4- piperidinmetanolün esterleri" başlıklı ve " C07D 211/22" tasnif sınıflı buluş, formül (I)'i havi (+) -alfa- (2,3-dimetoksifenil) (1-2-(4-fluorofenil) etil) -4- piperidinmetanolün esterlerine (burada R C4-C20 alkildir), farmasötik formülasyonlara, bu esterlerin üretilmesine ve kullanılmasına ilişkin metotlara yönelmiştir. Bu bileşikler 5HT2A reseptöründe serotoninin etkilerini antagonize eder ve örneğin şizofreni gibi psikozlar misali muhtelif durumların tedavisinde faydalı olur.

Yine, " EP2391625B1" no'lu, " Yeni adenosin reseptör lıgandları ve kullanımları" başlıklı ve " C07D 471/04" tasnif sınıflı buluş, adenosin A2A reseptörleri için yüksek afiniteye sahip yeni bileşikleri sağlamaktadır. Ayrıca Alzheimer hastalığı, Parkinson hastalığı, veya dikkat eksikliği hiperaktivite bozukluğu (ADHD), Huntington's hastalığı, nörokoruma, şizofreni, kaygı bozuklukları ve ağrılar gibi hastalıklarda adenosin A2A reseptörlerinin sinyal yollarının kısmi ya da tamamının inaktif olduğu şekliyle faydalı olabileceği, hastalıklar veya bozuklukların profilaksisi ve/veya tedavisi için adenosin A2A reseptörlerine antagonistler sağlamakta ve bunların söz konusu hastalıklarda tedavi amacıyla kullanımını sağlamaktadır. Mevcut buluş ek olarak, adenosin A2A reseptörlerinin kısmi veya tamamının inaktif olmalarının faydalı olabileceği hastalıklar ve bozuklukların tedavisi ve/veya profilaksisinde adenosin A2A reseptörleri için yüksek afinite ve bunların kullanımları ile bu gibi yeni bileşikleri içeren farmasötik bileşimler ile ilgilidir.

Sonuç olarak, şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

20

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, adrenal medulla dan salınan katekolaminlerin üretimini baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, gaba üretimini tetiklemesidir.

25

Buluşun bir diğer amacı, gabaerjik reseptör hassasiyetini artırmasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik; 11-ketoetil-difloro-anulen, 7-beta-anulen içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir adjuvan formülasyondur.

30

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.

5

Buluşun Detaylı Açıklaması

10 Buluş, şizofreninin semptomatik tedavisine şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik hazırlanmış bir adjuvan formülasyondur. Söz konusu formülasyon, adrenal medulla dan salınan katekolaminlerin üretimini baskılar, gaba üretimini tetikler, gabaerjik reseptör hassasiyetini artırır.

Buluş konusu formülasyon; 11-ketoetil-difloro-anulen, 7-beta-anulen ihtiva etmektedir.

15

Söz konusu formülasyon, yukarıdaki bileşenlerin aşağıdaki ağırlıkça oranlarda karışımından elde edilmektedir;
% 1-99 oranında 11-ketoetil-difloro-anulen,
% 99-1 oranında 7-beta-anulen.

20

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

25

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu formülasyonun; şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik; 11-ketoetil-difloro-anulen, 7-beta-anulen içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir adjuvan formülasyondur.
5
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 11-ketoetil-difloro-anulen içermesidir.
- 10 3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 7-beta-anulen içermesidir.
- 15 4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 11-ketoetil-difloro-anulen, 7-beta-anulen içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik bir adjuvan formülasyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**ŞİZOFRENİNİN SEMPTOMATİK TEDAVİSİNE YÖNELİK HAZIRLANMIŞ BİR
ADJUVAN FORMÜLASYON**

5

Buluş, şizofreninin semptomatik tedavisine yönelik oluşturulmuş bir adjuvan formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, adrenal medulla dan salınan katekolaminlerin üretimini baskılar, gaba üretimini tetikler, gabaerjik reseptör hassasiyetini artırır.

10

Şekil yoktur.

15