

Tarifname

HİPOKAMPAL ASETİLKOLİN SALINIMINI TEŞVİK EDEN NOOTROPİK NİTELİKLİ PROTOBİOSİD TÜREVİ BİLEŞENLER İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik oluşturulmuş nootropik nitelikli protobiosid türevi bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde, bir alkaloid olan asetilkolin tanımlanan ilk nörotransmitterdir. Merkezi sinir sisteminde yer alan bir kimyasal transmitter(iletici) olmasının yanı sıra birçok organizmanın (insanlar dahil)parasempatik sinir sisteminde yer alır. Asetilkolin çizgili kas (iskelet kası) liflerindeki nikotinik reseptöre bağlanarak kas hücresine Na⁺ içeri girmesini ve voltaja duyarlı kalsiyum kanallarının açılması ile depolarize olan kas hücresinin kasılmasını sağlar. Asetilkolinin öğrenme ve hafıza (M1 res) ile de derin bir ilişkisi bulunur ve bu yüzden beyinde asetilkolin içeren nöronlar mevcuttur.

20 Hipokampus, medial temporal lobda yer alan, hafıza ve yön bulmada önemli rolü olan bölgedir. Hipokampal ise hipokampus bölgesi ile ilişkiyi ifade etmektedir.

Mevcut teknikte yer alan EP1474119B1 no'lu, "A61K 31/00" tasnif sınıflı ve "Östrojen-beta reseptörünü seçerek modüle eden fitoöstrojen içeren hülusalardan kullanımını" başlıklı buluş, bir uterotropik etki üretmeden seçerek östrojen beta reseptörü modüle edici etki sergileyen fitoöstrojen içeren hülusalardan kullanımına ilişkindir. Obeziteden oluşan gruptan seçilen klinik tabloların ve patofizyolojik hastalıkların ve muhtemelen metabolik sendrom, özellikle hipertoni, arteriyoskleroz, kalp krizleri, hiperandrojenamiz, hipotalamik gonadotropin salgılatıcı hormon-pals üretici ile bağlantılı menopoza kontinans sorunları; menopoza sıcak basmaları; bozulmuş steroid hormonu sentezi, özellikle luteal yetersizliğinin sonucu olarak insan Corpus luteumunun progesteron sentezi; hipokampal nöronlarda artan östrojen beta

30

reseptörü sentezi ile bağlantılı olan Alzheimer hastalığı üzerindeki etkilerinin tedavisinde kullanılabilir.

Yine, EP1608655B1 no2lu, "Piroloimidazol türevleri, bunların hazırlanışı, bunları içeren farmasötik kompozisyonlar, ve bunların nootropik etmenler olarak kullanımı" başlıklı buluş, nootropik etkiye (örneğin beyinsel fonksiyonların korunması ve uyarılması), analjezik etkiye ve anti hiperaljezik etkiye sahip yeni bisiklik arilimidazolonlardır; anlatılanlar ayrıca bunların hazırlanış işlemi ve bunları içeren ve kavramsal aksaklıkların ve çeşitli tipte ağrıların tedavisi için faydalı farmasotik kompozisyonlardır.

10 Yine, EP2496555B1 no'lu, "Nootropik aktiviteye sahip 2-(5-metil-2-okso-4-fenil-pirrolidin-1-il)-asetamid 4r,5s-enantiyomeri" başlıklı buluş, yüksek farmakolojik değerde idrak geliştirme aktivitesine sahip 2-(5-metil-2-5 okso-4-fenil-pirrolidin-1-il)-asetamid 5S,4R-enantiyomeriyle ve bunun hazırlanışına ilişkin yöntemle ilgili olup söz konusu hazırlama yöntemi 5S-metil-4R-fenilpirrolidin-2-on'un sentezim, etil haloasetatla N-alkilasyonunu ve ara ürün etil 2-(5S-metil-2-okso-4R-fenil-pirrolidin-1-il)-asetatin amonyakla işleminden geçirilmesini içermektedir.

Sonuç olarak, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye 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, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmesidir.

25

Buluşun bir diğer amacı, nikotinic asetilkolin reseptör yoğunluğunu artırmasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik; 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid, 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyondur.

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

Buluş, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik oluşturulmuş nootropik nitelikli protobiosid türevi bileşenler içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon; hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etme ve nikotinik asetilkolin reseptör yoğunluğunu artırma sağlamaktadır.

10

Buluş konusu kompozisyon; 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid, 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid ihtiva etmektedir.

15

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

% 1-99 oranında 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid,

20

% 99-1 oranında 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid.

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; hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

30

İSTEMLER

1. Buluş, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik; 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid, 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid 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 % 1-99 oranında 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid içermesidir.
15
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 6-[[5-floro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)kloro]-4-laroil]amino]-2,2-dimetil-2H-protobiosid, 4-[[4-difloro-2-[(3,4,5-trimetoksifenil)amino]-4-kumaroil]amino]-2,2-dietil-2H-protobiosid içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
20

ÖZET**HİPOKAMPAL ASETİLKOLİN SALINIMINI TEŞVİK EDEN NOOTROPİK
NİTELİKLİ PROTOBİOSİD TÜREVİ BİLEŞENLER İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, hipokampal asetilkolin salınımını teşvik etmeye yönelik oluşturulmuş nootropik nitelikli protobiosid türevi bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15