

Tarifname

HEPATİK VE İNTESTİNEL DOKU YENİLENMESİNİ TEŞVİK EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde Hepatik Ensefalopati, Karaciğer hastalıkları sonucunda beyin ve sinir sisteminde hasar oluşmasıdır. Hepatik ensefalopati acil bir tıbbi durum olup, hastaneye yatış gerektirir. Tedavinin amacı, acil yaşam desteği, ensefalopatiyi tetikleyen faktörlerin tedavisi ve amonyak ile diğer toksinlerin nötralizasyonu ve vücuttan uzaklaştırılmasıdır. Koma geliştikten sonra hastaya solunum ve dolaşım desteği verilmesi gerekebilir. Tetikleyen faktörler özellikle de üst gastrointestinal sistem kanamaları durdurulmalıdır. Enfeksiyonlar, böbrek yetmezliği ve elektrolit anormalliklerinin (özellikle de potasyum) tedavisi önemlidir. Tekrarlayan ensefalopati olan olgularda protein kısıtlaması gerekir. Bağırsak bakterilerinin amonyak üretmesini önlemek için laktüloz ve neomisin kullanılır. İntestinal ise, bağırsaklara ilişkin doku anlamına gelmektedir.

Mevcut teknikte yer alan, WO 1999/019296 no'lu, "Aminobütirik asit türevleri" başlıklı ve "C07C 233/63" tasnif sınıflı buluş, Genel Formül (I) ile ifade edilen aminobütirik asit türevleri ve tuzları (her simge tarifnameden tanımlandığı gibidir.)Türevler matris metalloproteinazları inhibe ederler ve dolayısıyla romatizma, osteorrit, patolojik kemik resorpsiyonu, osteoporoz, periodontal hastalıklar, interstisyel nefrit, arterioskleroz, pulmoner amfizem, hepatik siroz, kornea zedelenmesi, kanser hücrelerinin metastazına ve infiltrasyonuna veya çoğalmasına bağlı hastalıklar, Otoimmün hastalıklar (Crohn hastalığı ve Sjögren hastalığı), beyaz kan hücrelerinin göçüne veya infiltrasyonuna bağlı hastalıklar, yeni damarlanma,

multipl skleroz, aort anevrizması, endometrit ve benzeri gibi hastalıkların önlenmesi ve/veya tedavisinde yararlıdırlar.

Yine, WO 2001/025210 no'lu, "İkame edilmiş 2-tio-3,5-disiyano-4-aril-6-aminopiridinler ve kullanımları" başlıklı buluş, (I) genel formülünün bileşiklerine, bunların üretimi için bir yöntem ve bunların geniş bir medikal endikasyon spektrumu için farmakolojik açıdan etkili maddeler olarak kullanımlarına ilişkindir. Bundan başka, bozuklukların, özelde kardiyovaskular bozuklukların; ürojenital bozuklukların; solunum bozukluklarının; iltihaplanma ve nöroenflamatuvar bozukluklarının; diyabet, özelde diyabet melitusun; nerodejeneratif bozukluklar; ağrı; kanser ve aynı zamanda hepatic fibroz ve karaciğer sirozunun profilaksı ve/veya iyileştirilmesi için seçici adenosin reseptör ligandları, tercihan seçici adenosin A1, Adenosin A2a ve/veya Adenosin A2b reseptör ligandları temin edilmiştir.

Yine, EP1824563B1 no'lu, "Hepatic ensefalopatinin tedavi edilmesi için ornitin ve fenilasetat ya da fenilbutirat içeren bileşimler" başlıklı buluş, karaciğer dekompanasyonu ya da hepatic ensefalopatinin önlenmesi ya da tedavi edilmesi için fenilasetat ve fenilbutiratın en azından bin ile kombine şekilde kullanım için bir ilacın imalinde ornitin kullanımına ilişkindir. Buluş, aynı zamanda, karaciğer dekompanasyonu ya da hepatic ensefalopatinin önlenmesi ya da tedavi edilmesi için ornitin ile kombine şekilde kullanım için bir ilacın imalinde fenilasetat ve fenilbutiratın en azından birinin kullanımına da ilişkindir.

Yine, EP1888074B1 no'lu, "Karaciğer hastalıklarının önlenmesi ve tedavisi amaçlı pirazolopirimidin türevi içeren madde" başlıklı buluş, karaciğer hastalıklarının tedavisi amaçlı, etken madde olarak pirazolopirimidinon türevi içeren farmasötik bir kompozisyona ilişkindir. Buluşa göre pirazolopirimidinon türevinin hepatic yıldız hücrelerde kolajen sentezinin inhibesinde mükemmel bir etkisi olup bu madde doğrudan portal damar üzerinde etki gösterir. Ayrıntılı olarak pirazolopirimidinon türevi portal damarın çapını genişletir ve portal damardan kan akışını artırır ve nihayet portal kan basıncım düşürür. Dolayısıyla pirazolopirimidinon türevi hepatic fibroz, hepatic fibrozdan kaynaklanan karaciğer sirozu, portal hipertansiyon ve portal hipertansiyondan kaynaklanan çeşitli komplikasyonların tedavisi için faydalı bir şekilde kullanılabilir. İlave olarak buluşa göre pirazolopirimidinon türevi uzun yan

ömrü sayesinde doz uygulama sıklığını da azaltabilir ve dolayısıyla kronik karaciğer hastalıkları olan hastaların ilaç uyumunu iyileştirmede de bir avantaja sahiptir.

5 Sonuç olarak hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik eden bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

10 Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, igf-1 ve epitelyal büyüme faktörü seviyesini yükseltmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, vasküler epitelyal büyüme faktörü seviyesini yükseltmesidir.

15 Buluşun bir diğer amacı, dönüştürülen büyüme faktörü tip 1 ekspresyonunu artırmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, fibroblast büyüme faktörü reseptör hassasiyetini artırmasıdır.

20 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik etmeye yönelik; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on, 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin, 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on 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, hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik eden bir kompozisyondur. Söz konusu kompozisyon; igf-1 ve epitelyal büyüme faktörü seviyesini yükseltir, vasküler

epitelyal büyüme faktörü seviyesini yükseltir, dönüşen büyüme faktörü tip 1 ekspresyonunu artırır, fibroblast büyüme faktörü reseptör hassasiyetini artırır.

5 Buluş konusu kompozisyon; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on, 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin, 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on ihtiva etmektedir.

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

10 % 50-20 oranında 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on,
% 22-18 oranında 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin,
% 28-62 oranında 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on.

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

20 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik etmeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik etmeye yönelik; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on, 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin, 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on 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 % 50-20 oranında 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 22-18 oranında 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin içermesidir.
4. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 28-62 oranında 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on içermesidir.
15
5. Buluş, istem 1 ila 4'te bahsedilen; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-koumaroil-3-on, 2,3-bis(6-okzoetil)-4-0-dioskin, 3,5-methoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik etmeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
20

ÖZET**HEPATİK VE İNTESTİNEL DOKU YENİLENMESİNİ TEŞVİK EDEN BİR
KOMPOZİSYON**

5

Buluş, hepatik ve intestinal doku yenilenmesini teşvik etmeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15