

Tarifname

ANTI-HİPERKOLESTEROLEMİK BİR KOMPOZİSYON

5 Teknik Alan

Buluş, anti-hiperkolesterolemik amaca 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 değildir. Şartlar "hiperlipidemi" (yükseltilmiş düzeylerinin, lipitler) ve "hyperlipoproteinemia" (yükseltilmiş düzeylerinin, lipoproteinler) ile yakından ilgilidir.

Mevcut teknikte yer alan, WO 2000/035425 no'lu, " A61K 9/22 " tasnif sınıflı ve " HMG-CoA Redüktaz inhibitörü içeren durağan farmasötik formül " başlıklı buluş, Lovastatin, pravastatin, simvastatin mevastatin, atorvastatin ile türevleri ve benzerleri HMG-CoA redüktaz inhibitörleri olarak bilinir ve antihiperkolesterolemik maddeler olarak kullanılır. Bunların çoğu, Aspergillus, Menascus, Nocardia, Amycolatopsis, Mucor or Penicillium genus türlerine ait farklı mikroorganizmalar kullanılarak yapılan fermantasyon yoluyla, bazıları da fermantasyon ürünlerinin kimyasal sentez yöntemleriyle elde edilir veya kimyasal sentez ürünleridir. Bunlardaki bileşimindeki çözünme, dolgu maddesi, bağlayıcı madde, yağlayıcı, kaygınlaştırıcı ve çözücü maddeler gibi bileşimlerle de gerçekleştirilebilir. Buluş, hiperkolesterolemi, hiperlipidemi'nin tedavisi için kullanılan durağan solid farmasötik formülle ilgilidir. Farmasötik tuzlarını içeren yeni sabit solid farmasötik formüle ilişkindir.

Yine, WO 1998/013034 no'lu, 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 butil 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 hipertrigliserdemili hastalarda kullanılır.

5 Yine, EP1773450B1 no'lu, ve " Farmasötik bileşikler " başlıklı buluş, bir fenofibrat ile birlikte mikronize bir betain içeren bir farmasötik bileşimdir. En az bir betainin birlikte uygulanması ve birleştirilmesi fenofibrat gibi antikolesterol ajanların uygulanmasıyla ilişkili yan etkilerin azaltılmasına izin vererek karaciğer, pankreas ve böbreklerdeki zararlı etkilerini ciddi şekilde azaltır. Anti-kolesterol ajanların uygulanması ayrıca
10 karaciğer enzimleri veya transaminazlarda artışa ve/veya vücutta homosistein düzeylerinde artışa neden olur ve en az bir betainin birlikte uygulanması veya birleştirilmesi bu artışın azaltılmasına izin verir. Kardiyovasküler, antitrombotik, antiagregan, antiadeziv, lipotropik özellikleri ve diyastolik basınç üzerindeki aktivitesi sayesinde, bir antikolesterol ajan ile en az bir betainin birlikte uygulanması ve
15 birleştirilmesi yan etkilerini azaltırken bu antikolesterol ajanların terapötik etkinliğinin artırılmasına izin verir. Böyle bir kombinasyon özellikle sağladığı koruma, güvenilirlik ve daha yüksek kullanım kolaylığı sayesinde mevcut tedavilere kıyasla özellikle avantajlıdır.

Yine, EP1620455B1 no'lu, ve " Guggulsteronları ve guggulsteröleri hazırlama
20 prosesi " başlıklı buluş, formül (I) ile temsil edilen kolay temin edilebilir bir steroidden, yükselmiş düzeyde 'düşük yoğunluklu lipoprotini' (LDL) ve yüksek seviyelerde kolesterolü etkin düşürme ve düşük seviyelerde 'yüksek yoğunluklu lipoproteini' (HDL) yükseltme etkisine sahip formül (III) ile temsil edilen 4,17(20)-.£-pregnadien-3,16-dionu (E-guggulsteron) ve formül (IV) ile temsil edilen 4,17 (20)-Z-pregnadien-
25 3,16-dionu (Z-guggulsteron) selektif hazırlama amacına yönelik bir yöntemle ilgilidir. Bu buluş, ayrıca, yukarıda verilen formül (II) ile temsil edilen bileşiği hazırlama amacına yönelik bir yöntemle ilgilidir.

Sonuç olarak, anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme
30 yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, HbA(1)c seviyesini baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, total kolesterol seviyesini baskılama sağlamasıdır.

- 5 Buluşun bir diğer amacı, LDL kolesterol seviyesini baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, trigliserit seviyesini düşürme sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, sSTAR protein ekspresyonunu artırma sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, CYp17a1 ekspresyonununu artırma sağlamasıdır.

- 10 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik; asetoksidilofolon, epi-asetoksidilofolon içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

- 15 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

- 20 Buluş, anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik oluşturulmuş bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, HbA(1)c, seviyesini baskılama, total kolesterol seviyesini baskılama, LDL kolesterol seviyesini baskılama, trigliserit seviyesini düşürme, sSTAR protein ekspresyonunu artırma ve CYp17a1 ekspresyonununu artırma sağlamaktadır.

- 25 Buluş konusu kompozisyon; asetoksidilofolon, epi-asetoksidilofolon ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında asetoksidilofolon,

% 99-1 oranında epi-asetoksidilofolon.

5 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; anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik; asetoksidilofolon, epi-asetoksidilofolon 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 asetoksidilofolon içermesidir.
- 10 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında epi-asetoksidilofolon içermesidir.
- 15 4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; asetoksidilofolon, epi-asetoksidilofolon içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**ANTI-HİPERKOLESTEROLEMİK BİR KOMPOZİSYON**

5 Buluş, anti-hiperkolesterolemik amaca yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.