

Tarifname

ENDOJEN DHEA SALINIMINI TETİKLEMeye YÖNELİK, SENTETİK FLAVONOL GLİKOSİT TÜREVLERİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik oluşturulmuş, yeni sentetik flavonol glikosit türevleri ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde DHEA (dehidroepiandrosteron) insan vücudunda üretilen (endojen), böbrek üstü bezinden (sürrenal) salgılanan bir hormondur. Kadın ve erkek seks hormonlarının ana maddesidir. 30 yaşından itibaren DHEA düzeyinde azalma başlar.

15 Tip II diyabetlilerde, ilerlemiş böbrek ve böbrek üstü bezi yetmezliği olanlarda, anoreksiya ve AIDS hastalarında, ayrıca insülin, kortizon ve danazol (yapay anrojen) gibi ilaçları kullananlarda DHEA düzeyleri düşük olabilir.

Mevcut teknikte WO 1999/063973 no'lu, " Androst-5-en-3 β ,17 β -diol için farmasötik kompozisyonlar ve kullanımlar " başlıklı ve " A61K 31/00 " tasnif sınıflı buluş,
20 Androst-5-en-3 β , 17 β -diol; osteoporoz veya menopoz semptomları veya östrojen reseptör aktivitesinden etkilenen diğer hastalıkları tedavi etmek veya bunlara yakalanma olasılığını azaltmak için ve DHEA tedavisine iyi yanıt veren, ancak, daha androjeniğe karşı östrojenik etkilerin daha yüksek bir oranının istendiği durumlar için kullanılmaktadır. Talep edilen metotlar ve kombinasyonların aktif muhteviyatlarını
25 sağlamak için, kitler ve farmasötik kompozisyonlar olduğundan, kombinasyon terapileri dahil edilmektedir.

Yine, EP1443966B1 no'lu, " iyi huylu jinekolojik bozuklukları önleme ya da tedavi etme yöntemi " başlıklı buluş, dişi memelilerde iyi huylu östrojene duyarlı jinekolojik bozuklukları önleme ya da tedavi etme yönteminde kullanılmak üzere bir ilacın
30 üretiminde aktif etkili madde kombinasyonu kullanımı olup; özelliği, ilaç, progestojen ve androjen içermesi, yöntem ise; androjen günlük 5 ila 100 mg dehidroepiandrosteron (DHEA) oral doza eşdeğer miktarda verilmek üzere, bu

bozuklukların semptomlarını önlemede ya da azaltmada terapötik olarak etkili miktarda progestojen ve androjen kombinasyonu vermek için söz konusu dişi memeliye ilaç vermektten oluşmasıyla ilgilidir.

5 Yine, EP1824515B1 no'lu, "Dehidroepiandrosteron-glukokortikoid bileşimleri ile dermatit tedavisi" başlıklı buluşta, Dermatit, dehidroepiandrosteronun(DHEA) ve glukokortikoidin kombine uygulaması ile etkin şekilde tedavi edilebilir. Sistemik, topikal ve önceden ambalajlanmış DHEA glukokortikoid düzenlemeleri tarif edilmektedir.

10 Sonuç olarak endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

15 Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, cyp17a1 ekspresyonunun artımı sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, zona retikularis te cAMP seviyesinin artımı sağlamasıdır.

20 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik; 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-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.

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik oluşturulmuş, yeni sentetik flavonol glikosid türevleri ihtiva eden bir kompozisyonudur. Buluş konusu kompozisyon, cyp17a1 ekspresyonunun artımı ve zona retikularis te cAMP seviyesinin artımı sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on,

% 99-1 oranında 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on.

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; endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik; 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-
5 8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
- 10
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 15
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 20
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-7-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(4-dimetoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)deoksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-metoksi-2-(2-metoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
- 25

ÖZET**ENDOJEN DHEA SALINIMINI TETİKLEMeye YÖNELİK, SENTETİK FLAVONOL
GLİKOSİT TÜREVLERİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, endojen dhea salınımını tetiklemeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15