

Tarifname

HİPOLİDEMİK NİTELİK GÖSTEREN SENTETİK BİLEŞENLER İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik oluşturulmuş, sentetik bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde hipolipidemik, lipit düşürücü ilaçlar olarak kanda yüksek lipit seviyelerinin tedavisinde kullanılan çeşitli türde ilaçlardır. Hipolipidemik ilaçlar veya antihiperlipidemik ilaçlar olarak da adlandırılırlar.

15 Lipit düşürücü ilaçlar birkaç sınıfa ayrılabilir. Yan etkileri ve kolesterol profiline olan etkileri bakımından farklılıklar gösterirler. Bazıları "kötü kolesterol" diye bilinen LDL kolesterolünü azaltırken diğerleri "iyi kolesterol" HDL kolesterolünü arttırlar. Klinik kullanımda bir hastanın hangi ilacı alacağını belirlemek için hastanın kolesterol düzeyine, kardiyovasküler risk durumuna, karaciğer ve böbrek
20 fonksiyonuna bakılır ve bunlar, ilacın riskleri ile faydalarıyla birlikte değerlendirilir.

Mevcut teknikte yer alan, WO 1999/035135 no'lu, " C07D 281/10 " tasnif sınıflı ve " Hipolipidemik benzotiyazepin bileşikleri " başlıklı buluş, R1'in H veya metil olduğu formül (I)'e sahip yeni hipolipidemik bileşiklere ve bunların tuzlarına, solvatlarına veya fizyolojik fonksiyonlu türevlerine; bunların hazırlanması için işlemlere ve ara ürünlere;
25 bunları içeren farmasötik bileşimlere ve tıpta, özellikle hiperlipidemik durumların ve ateroskleroz gibi ilişkili hastalıkların önlenmesinde ve tedavisinde kullanılmalarına ilişkindir.

Yine, WO 2000/020437 no'lu, ve " Lipid metabolizma bozukluklarının tedavisinde safra asitleriyle bağlı propanolamin türevleri " başlıklı buluş, Safra asitleri ile
30 bağlanmış propanolamin türevleri, onların imal edilmelerine yönelik yöntemler, bu bileşimleri içeren ilaç maddeleri ve onların kullanımları. Buluş ikame edilmiş propanolamin türevleri ve onların fizyolojik olarak hazmedilebilen tuzları ile fizyolojik

işlevli türevleri ile ilgilidir. Formül (1)'in içlerinde artıkların belirtilen anlamlara geldiği, ve ayrıca onların fizyolojik olarak hazmedilebilen tuzları, fizyolojik işlevli türevleri ve onların imal edilmelerine yönelik yöntemleri tanımlamaktadır. Bileşimleri örneğin hipolipidemikler olarak uygundurlar.

- 5 Yine, EP1414439B1 no'lu, ve " Hipolipidemik hipokolesteremik aktivitelere sahip yeni piroller,bunların hazırlanması için işlem ve bunları içeren farmasötik bileşimler ve bunların tıpta kullanımı " başlıklı buluş, genel formül (I)'de açıklanan yeni bileşikler, bunların tautomerik formları, bunların türevleri, bunların analogları, bunların stereoizomerleri, bunların farmasötik olarak kabul edilebilen tuzları ve bunların
- 10 farmasötik olarak kabul edilebilen solvatlarının preparasyonu için usuller sunmaktadır. Buluş ayrıca bu tür bileşikleri hazırlamak için işleme, bu tür bir bileşiği içeren bir bileşime, bu tür bir bileşiğin ve bileşimin tıpta kullanımına ilişkindir. Bileşikler kanda trigliserit seviyelerini düşürür ve obezite,hiperlipidemi, hiperkolesteremi, sendrom X ve diyabetin tedavisinde yararlı olabilir.
- 15 Sonuç olarak, hipolipidemik nitelik göstermeye 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, ABCA1 artımının tetiklenmesini sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, ABCG1 artımının tetiklenmesini sağlamasıdır.

25

Buluşun bir diğer amacı, THP-1 makropalarında apolipoprotein E mRNA ekspresyonunun artımının tetiklenmesini sağlamasıdır.

- 30 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik; 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid, 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid içeren gruptan seçilen

bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

5 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

10 Buluş, hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik oluşturulmuş, sentetik bileşenler içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, ABCA1 artımını tetikleme, ABCG1 artımını tetikleme ve THP-1 makropolarında apolipoprotein E mRNA ekspresyonunun artımını tetikleme sağlamaktadır.

15 Buluş konusu kompozisyon; 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid, 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid,

% 99-1 oranında 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid.

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; hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik; 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid, 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid 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 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 4-(4-florofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid, 4-(4-aminofenil)-1-metil-1 2 3 6-tetrahidrokumaroil-tinokrisposid içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımınıdır.
15
20

ÖZET**HİPOLİDEMİK NİTELİK GÖSTEREN SENTETİK BİLEŞENLER İÇEREN BİR
KOMPOZİSYON**

5

Buluş, hipolipidemik nitelik göstermeye yönelik oluşturulmuş, sentetik bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15