

Tarifname

HİPOLİDEMİK NİTELİK SERGİLEYEN SENTETİK PROTOBİOSİD TÜREVLERİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik oluşturulmuş 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. 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 fonksiyonuna bakılır ve bunlar, ilacın riskleri ile faydalarıyla birlikte değerlendirilir.

Mevcut teknikte yer alan, TR1998/00444 no'lu, " C07H 17/00" tasnif sınıflı ve " Hipolipidemik 1,4-benzotiazepin-1,1-diyoksitler" başlıklı buluş, yeni hipolipidemik bileşimler, yeni işlemler ve bunların hazırlanması için yeni ara bileşimler, bunları içeren farmakolojik terkipler ve tıptaki kullanımları, özellikle profilaksis ve aterosklerosis gibi hiperlipidemik durumların tedavisi ile ilgilidir. Formül (I)'in bileşimleri: Burada R1'den R10'a kadar ve X tanımlandıkları gibidir.

Yine, WO 2000/020410 no'lu, ve " Heterosiklik ikameli propanolamin türevleri, üretimi, ilaçları,kullanımı" başlıklı buluş, heterosiklik olarak ikame edilmiş propanolamin türevlerini ve bunların farmasötik olarak tolere edilebilir tuzlarını ve fizyolojik olarak fonksiyonel türevlerini konu almaktadır. İçindeki artıkların, belirtilen anlamlara sahip olduğu formül I bileşikleri, bunların fizyolojik olarak tolere edilebilen

30

tuzları, fizyolojik olarak fonksiyonel türevleri ve bunların üretimlerine yönelik yöntemler tanımlanmaktadır. Bileşikler örneğin, hipolipidemik maddelere uygunluk göstermektedirler.

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 farmasötik olarak kabul edilebilen solvatlarının preparasyonu için usuller 10 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 sergilemeye yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

20 Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, BAR(bile acid receptor) antagonistik işlev tesis etmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, CYP7A1 ekspresyonunun artımının tetiklenmesidir.

25 Buluşun bir diğer amacı, kolesterol ester hidrolaz ekspresyonunun artımının tetiklenmesidir.

30 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid, 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyondur.

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, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik oluşturulmuş, sentetik protobiosid türevleri içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, BAR(bile acid receptor) antagonistik işlev tesis etme, CYP7A1 ekspresyonunun artımının tetiklenmesi ve kolesteril ester hidrolaz ekspresyonunun artımının tetiklenmesini sağlamaktadır.

10

Buluş konusu kompozisyon; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid, 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid ihtiva etmektedir.

15

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

% 1-99 oranında 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid,

% 99-1 oranında 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid.

20

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

25

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid, 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-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 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid, 17,20-dimetil-1,2,21,22-tetradehidro-2,3,20,21-protobiosid içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
15
20

ÖZET**HİPOLİPİDEMİK NİTELİK SERGİLEYEN SENTETİK PROTOBİOSİD TÜREVLERİ
İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, hipolipidemik nitelik sergilemeye yönelik oluşturulmuş, sentetik protobiosid türevleri içeren bir kompozisyon bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15