

Tarifname

NÖROTROPİK BİR KOMPOZİSYON

5 Teknik Alan

Buluş, nörotropik bir kompozisyon ile ilgilidir.

Tekniğin Bilinen Durumu

10 Günümüzde nörotropik, sinir sistemi ile ilgilidir. Mevcut teknikte yer alan, WO 1998/033502 no'lu, " A61K 31/44 " tasnif sınıflı ve " 1-[4-(3-Trifloro metilfenil)-1,2,3,6-tetrahidro pirid-1-il]-2-(6,7-dimetoksi naft-2-il)etan'ın nörotropik etkisi olan ilaçların hazırlanmasında kullanılması " başlıklı buluş, 1-[4-(3-trifloro metilfenil)- 1,2,3,6-tetrahidro pirid-1-il]-2-(6,7-dimetoksi naft-2-il) etan'ın (I) beyinsel ve sinirsel hastalıklardan korunmaya yönelik ve/veya bu hastalıkların tedavisine yönelik ilaçların hazırlanması için kullanılmasına ilişkindir.

Yine, WO 1997/001536 no'lu, ve " Nörotropik ve nöroprotektif etkiye sahip 4-aril-1-fenilalkil-1,2,3,6-tetrahidropiridinler " başlıklı buluş, formül 1'e uyan bileşiklerle ilgilidir ki burada Y, -CH- ya da -N-'dir; R1 hidrojen, bir halojen ya da bir CF₃ (C₃-C₄) alkil veya (C₁-C₄) alkoksi grubudur; R2 bir hidrojen bir halojen, bir hidroksil ya da bir CF₃, (C₃-C₄) alkil veya (C₁-C₄) alkoksi grubudur; R3 ve R4'ün her biri hidrojen ya da (C₁-C₃) alkildir; X ise (a) bir (C₃-C₆) alkil, bir (C₃-C₆) alkoksi, bir (C₃-C₇) karboksialkil, bir (C₁-C₄) alkoksikarbonil (C₃-C₆) alkil, bir (C₃-C₇) karboksialkoksi ya da bir (C₁-C₄) alkoksikarbonil (C₃-C₆) alkoksidir; (b) (C₃-C₇) sikloalkil, (C₃-C₇) sikloalkoksi, 25 (C₃-C₇) sikloalkilmetil, (C₃-C₇) sikloalkilamino ve sikloheksenil arasından seçilen bir köktür ki bu kök bir halojen, hidroksil, (C₁-C₄) alkoksi, karboksil, (C₁-C₄) alkoksikarbonil, amino ya da mono- veya di-(C₁-C₄) alkilamino ile ikâme edilmiş olabilir; ya da (c) bir fenil, fenoksi, fenilamino, N-(C₁-C₃) alkilfenilamino, fenilmetil, feniletil, fenilkarbonil, feniltio,.

30 Yine, EP2011497B1 no'lu, " Hemorajik felç ve iskemik felcin akut fazının profilaksisi ve tedavisi için fenotropil " başlıklı buluş, özellikle farmakolojiyle ve nörotropik ve serebrovasküler bir aktivite gösteren ilaç maddeleriyle ilişkilidir. Buluşun yeniliği, bir

organizmaya enjekte edilen bir N-karbomoil-metil-4-fenil-2-pirolidon maddesinin, hayvanların yüzde yüz hayatta kalması şeklinde çok amaçlı bir belirgin etki göstermesi, farklı etiyojilere sahip bir serebral felcin nörolojik semptom kompleksinin gelişmesini önlemesi, bir serebral eğilim alanım ve bunun yıkıcı gelişimini lokalize etmesine dayanmaktadır. Buluşun maddesinin çok amaçlı nörotropik(nöromodülatör) aktivite gösterdiği ve sinir koruyucu-serebrovasküler bir etkiye yol açtığı kanıtlanmıştır.

Sonuç olarak, nörotropik kullanıma yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, muskarinik reseptör yoğunluğunun artımı sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, asetilkolinesteraz enziminin baskılanması sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, dopaminerjik nöronların BDNF artımı vesilesiyle yenilenimi sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, nörotropik kullanıma yönelik; 3-[(3-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-hekzametoksi-2-(4-dimethoksifenil)-8-(3-dimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-dimetoksi-2-(2-dimethoksifenil)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on 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.

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, nörotropik bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, muskarinik reseptör yoğunluğunun artımı, asetilkolinesteraz enziminin baskılanması ve dopaminerjik nöronların BDNF artımı vesilesiyle yenilenimi sağlamaktadır.

5

Buluş konusu kompozisyon; 3-[(3-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-hekzametoksi-2-(4-dimethoksifenil)-8-(3-dimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on,

4-[(6-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-dimetoksi-2-(2-dimethoksifenyl)-8-(3-trimetil-2-büten-1-il)-4H-1-

10 benzopiren-4-on ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 3-[(3-deoksi- α -L-mannopiranozil)oksi]-4-(β -D-glukopiranoziloksi)-6-
15 hekzametoksi-2-(4-dimethoksifenil)-8-(3-dimetil-2-büten-2-il)-4H-1-benzopiren-4-on,

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

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

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; nörotropik amaçlı
kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

25

30

İSTEMLER

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

ÖZET

Buluş, nörotropik kullanıma yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

5

Şekil yoktur.

10