

## Tarifname

### ENDOJEN FENETİLAMİN ÜRETİMİNİ TETİKLEYEN PİKRORETİN TÜREVLERİNİ HAİZ BİR KOMPOZİSYON VE NOOTROPİK AMAÇLI KULLANIMI

5

#### Teknik Alan

Buluş, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik oluşturulmuş, pikroretin türevlerini haiz bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

#### Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde amfetamin (alfa-metil-fenetilamin), narkolepsi ve dikkat eksikliği ve hiperaktivite bozukluğu dâhil çeşitli bozuklukların tedavisinde, kilo kontrolünde, iştah azaltıcı olarak kullanılan sentetik bir uyarıcıdır (stimülan). Nootropik ise, beyin üzerinde etkili olarak serebral korteksi hipoksiye karşı koruyan ve beynin öğrenme, hafıza, dikkat ve bilinç gibi işlevlerini sedatif veya psikostimülan etki yapmaksızın güçlendiren ilaçlara verilen genel addir.

Mevcut teknikte yer alan EP1343750B1 no'lu, "Fenetilamin türevlerinin hazırlanması için yöntem" başlıklı ve "C07C 213/02" tasnif sınıflı buluşta, verilen formülün bileşiminin hazırlanması için bir yöntem burada R1 hidrojen, hidroksil, veya yedeklenmemiş veya yedeklenmiş alkil veya alkoksi'dir. R2 hidrojen veya hidrojene dönüştürülebilir bir yedektir, ve n 0, 1 veya 2'dir, ve formülün bileşiminin hidrojenize edilmesini oluşturur. Burada, nikel ve kobalt katalizörün varlığında, R1, R2 ve n yukarıda olduğu gibi tanımlanmıştır.

Yine, EP2496555B1 no'lu, "C07D 207/263 " tasnif sınıflı ve "Nootropik aktiviteye sahip 2-(5-metil-2-okso-4-fenil-pirrolidin-1-il)-asetamid 4r,5s-enantiyomeri" başlıklı buluş, yüksek farmakolojik değerde idrak geliştirme aktivitesine sahip 2-(5-metil-2-5-okso-4-fenil-pirrolidin-1-il)-asetamid 5S,4R-enantiyomeriyle ve bunun hazırlanışına ilişkin yöntemle ilgili olup söz konusu hazırlama yöntemi 5S-metil-4R-fenilpirrolidin-2-on'un sentezim, etil haloasetatla N-alkilasyonunu ve ara ürün etil 2-(5S-metil-2-okso-4R-fenil-pirrolidin-1-il)-asetatin amonyakla işlemden geçirilmesini içermektedir.

Sonuç olarak, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

5

### **Buluşun Amacı**

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, endojen fenetilamin üretiminin artımı sağlamasıdır.

10 Buluşun bir diğer amacı, feniletanolamin N-metiltransferaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, prefrontal korteks bölgesinde asetilkolin üretiminin ve salınımının teşvik edilmesini sağlamasıdır.

15 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik; 2,2-difloro-N-[(1R,2R)-2-hidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin, 2,2-diamino-N-[(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

20

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.

25

### **Buluşun Detaylı Açıklaması**

Buluş, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik oluşturulmuş, pikroretin türevlerini haiz bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon, endojen fenetilamin üretiminin artımı, feniletanolamin N-metiltransferaz baskılama, prefrontal korteks bölgesinde asetilkolin üretiminin ve salınımının teşvik edilmesini sağlamaktadır.

30

Buluş konusu kompozisyon; 2,2-difloro-N-[(1R,2R)-2-hidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin, 2,2-diamino-N-[(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin ihtiva etmektedir.

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

5 % 1-99 oranında 2,2-difloro-N-[(1R,2R)-2-hidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin,

% 99-1 oranında 2,2-diamino-N-[(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin.

10 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 fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

15

**İSTEMLER**

1. Buluş, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik; 2,2-difloro-N-[(1R, 2R)-2-hidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin, 2,2-diamino-N-  
5 [(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 2,2-  
10 difloro-N-[(1R,2R)-2-hidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2,2-  
15 diamino-N-[(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 2,2-difloro-N-[(1R,2R)-2-hidroksi-1-  
20 (hidroksietil)-2-(4-aminofenil)etil]-pikroretin, 2,2-diamino-N-[(1R,2R)-4-dihidroksi-1-(hidroksietil)-2-(4-aminofenil)ketoetil]-pikroretin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımıdır.

**ÖZET****ENDOJEN FENETİLAMİN ÜRETİMİNİ TETİKLEYEN PİKRORETİN TÜREVLERİNİ  
HAİZ BİR KOMPOZİSYON VE NOOTROPİK AMAÇLI KULLANIMI**

5

Buluş, endojen fenetilamin üretimini tetiklemeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15