

Tarifname

ENDOJEN ASETİLKOLİN ÜRETİMİNİ DESTEKLEYİCİ NİTELİK GÖSTEREN BİR FORMÜLASYON

5

Teknik Alan

Buluş, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde bir alkaloid olan asetilkolin tanımlanan ilk nörotransmitterdir. Merkezi sinir sisteminde yer alan bir kimyasal transmitter (iletici) olmasının yanı sıra birçok organizmanın (insanlar dahil) parasempatik sinir sisteminde yer alır. Asetilkolin çizgili kas (iskelet kası) liflerindeki nikotinik reseptöre bağlanarak kas hücrelerine Na^+ içeri girmesini ve voltaja duyarlı kalsiyum kanallarının açılması ile depolarize olan kas hücrelerinin kasılmasını sağlar. Asetilkolinin öğrenme ve hafıza (M1 res) ile de derin bir ilişkisi bulunur ve bu yüzden beyinde asetilkolin içeren nöronlar mevcuttur. Parasempatik sinir sisteminde gangliyon ve sinapslarda yer alan asetilkolin, parasempatik sinir sisteminin uyarılmasıyla beraber gerçekleşen kalp atışının yavaşlaması, tükürük salgısının artması, bronkokonstrüksiyon (bronş lümeninin -boşluğunun daralması), miyozis, mesane ve gıç hareketlerinin artması gibi etkilerin gerçekleşmesine neden olur.

Asetilkolin belli nöronlarda kolin asetil transferaz enzimi tarafından, kolin ve asetil-CoA'dan sentez edilir. Sinaptik boşluğa salınarak görevini tamamladıktan sonra asetilkolin, asetilkolinesteraz enzimi yardımıyla kolin ve asetat'a (asetik asit tuzu) çevrilerek yıkılır.

Mevcut teknikte, " EP1551835B1" no'lu, " Yeni 1,4-diazabisikloalkan türevleri, hazırlanması ve kullanımı" başlıklı ve " C07D 471/08" tasnif sınıflı buluş, 1,4-diazabisikloalkan türevleri, enantiomerlerinden herhangi biri veya enantiomerlerin

herhangi karışımı veya bunun farmasötik olarak kabul edilebilir bir ekleme tuzu ve farmasötik bileşimlerin üretiminde bunların kullanımı ile ilgilidir. Buluşun bileşiklerinin nikotinli asetilkolin reseptörlerinde ve monoamin reseptörler ve taşıyıcıların modülatörlerinde kolinerjik ligandlar oldukları bulunmuştur. Farmakolojik profillerinden dolayı buluşun bileşikleri; merkezi sinir sisteminin (CNS) kolinerjik sistemi ve çevresel sinir sistemi (PNS) ile ilgili olan hastalıkların veya bozuklukların, düzgün kas kontraksiyonu ile ilgili hastalık veya bozuklukların, endokrin hastalıkları veya bozukluklarının, nörodejenerasyonla ilgili hastalık veya bozuklukların, iltihaplanma ile ilgili hastalık veya bozuklukların, ağrının ve kimyasal maddelerin kötü kullanılmasının sonlandırılmasıyla doğan geri çekilme semptomları kadar çeşitli hastalık veya bozuklukların tedavisi için yararlı olabilir.

Yine, " EP2032575B1" no'lu, " Yeni 1,4-diaza-bicyclo[3.2.2]nonyl oxadiazolyl türev ve onun medikal kullanımı" başlıklı ve " C07D 471/08" tasnif sınıflı buluş, 1,4-diaza-bicyclo[3.2.2]nonyl oxadiazolyl türevleri ve onların farmasötik 5 kompozisyonlarının üretimi ile ilgilidir. Buluşun bileşenleri nikotinic asetilkolin reseptörlerindeki kolinerjik ligandlarda bulunur. Farmasötik özelliklerine göre buluşun bileşenlerinin kullanımının faydalı olduğu hastalık ve rahatsızlık tedavileri, merkezi sinir sisteminin (CNS) kolinerjik sistemi, periferik sinir sistemi (PNS), düz kasların kasılmasına bağlı hastalıklar veya bozukluklar, endokrin hastalıkları veya rahatsızlıkları, nörodejenerasyona bağlı hastalık veya rahatsızlıklar, iltihaplanmaya bağlı hastalık veya rahatsızlıklar, ağrı ve kimyasal madde bağımlılığı sonrasında oluşan yoksunluk sendromlarıdır. Ar, metilendioksi veya ethylenedioxy'nin yerine geçebilen bir fenil grubu temsil eder.

Sonuç olarak, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

30

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, kolin asetiltransferaz ekspresyonunun artımını sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, M1 reseptör hassasiyetinin artımını sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, nikotik asetilkolin reseptörlerinin yoğunluğunun artımının desteklenmesini sağlamasıdır.

5 Buluşun bir diğer amacı, asetilkolin esteraz baskılanmasını sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik; (1,3)-ramnosil-simplokomosit, 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da 10 kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

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.

15

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik 20 oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, kolin asetiltransferaz ekspresyonunun artımını, M1 reseptör hassasiyetinin artımını, nikotik asetilkolin reseptörlerinin yoğunluğunun artımının desteklenmesini, asetilkolin esteraz baskılanmasını sağlamaktadır.

25 Buluş konusu formülasyon; (1,3)-ramnosil-simplokomosit, 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit ihtiva etmektedir.

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

30 % 1-99 oranında (1,3)-ramnosil-simplokomosit,
% 99-1 oranında 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit.

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

- 5 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu formülasyonun; endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik; (1,3)-ramnosil-simplokomosit, 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
5
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında (1,3)-ramnosil-simplokomosit içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit içermesidir.
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; (1,3)-ramnosil-simplokomosit, 2,2-difloro-2-(diflorosülfonil)simplokomosit içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik bir formülasyonun üretiminde kullanımındır.
15
20

ÖZET**ENDOJEN ASETİLKOLİN ÜRETİMİNİ DESTEKLEYİCİ NİTELİK GÖSTEREN BİR
FORMÜLASYON**

5

Buluş, endojen asetilkolin üretimini destekleyici nitelik göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Formülasyon, kolin asetiltransferaz ekspresyonunun artımını, M1 reseptör hassasiyetinin artımını, nikotinik asetilkolin reseptörlerinin yoğunluğunun artımının desteklenmesini, asetilkolin esteraz baskılanmasını sağlamaktadır.

10

Şekil yoktur.

15