

Tarifname

PARKINSON HASTALIĞININ SEMPTOMATİK TEDAVİSİNE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

5

Teknik Alan

Buluş, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde parkinson hastalığı, beynin alt kısımlarındaki gri cevher çekirdeklerinin bozukluğuna bağlı bir sinir sistemi hastalığı. Genellikle orta yaş hastalığıdır. Adını hastalığı ilk defa 1817'de titremeli felç olarak tarifleyen James Parkinson'dan almıştır.

15 Binde bir sıklıkla görülen, müzmin, ilerleyici, tedavisiz iyileşmeyen bir hastalıktır.

Mevcut teknikte, " WO 1999/049852" no'lu, "Parkinson sendromunun tedavisi için D2-Agonist içeren transdermal terapi sistemi ve imalat yöntemleri" başlıklı ve " A61K 9/70" tasnif sınıflı buluş, Matrisin içerik maddelerine karşı eylemsiz bir arka tabakaya , kendiliğinden yapışan etkin miktarda (-)-5,6,7,8-Tetrahidro-6-[propil[2-(2-tienil)-etil] amino]-1-naftol içeren bir matris tabakasına ve kullanımdan önce uzaklaştırılması gereken bir koruma folyosuna sahip transdermal terapi sisteminin özelliği, (-)-5,6,7,8-tetrahidro-6-[propil [2-2(-tienil)-etil] amino] -1- naftol için %>= 5 g/g çözünürlüğe sahip akrilat veya silikon bazlı susuz polimer yapıştırıcı sistemini esas alan ve anorganik silikat partiküllerinden büyük ölçüde arındırılmış bir matris olmasıdır.

25 Yine, "WO 2000/016777" no'lu, "Parkinson hastalığı, ADHD ve mikroadenomların tedavisi için ilaçlar" başlıklı ve "A61K 31/505" tasnif sınıflı buluş, bis-azabisiklik bileşikler olarak da bilinen ve formül (I) ile tanımlı kimi pirido [1,2-a]- pirazin türevlerinin, memelilerde Parkinson hastalığının, dikkat eksikliğine bağlı hiperaktivite bozukluğunun ve mikroadenomlarının tedavisinde kullanımına ve ilgili bileşimlere ilişkindir.

30

Yine, "EP1835924B1" no'lu, "Parkinson hastalığının ve ilgili bozuklukların doğum sonrası hücre kökeni kullanılarak tedavisi" başlıklı ve "A61K 35/44" tasnif sınıflı

buluş, substantia nigra veya striatum bölgesinde meydana gelen bir nörodejeneratif durumdan mustarip bireylere yönelik hücre tabanlı veya rejeneratif tedaviler ile ilgilidir.

Yine, " EP2344471B1" no'lu, "7-piperidinoalkil-3,4-dihidrokinolon türevi" başlıklı ve
5 "C07D 401/06" tasnif sınıflı buluş, Bir melanin konsantre edici hormon reseptörü (MCH reseptörü) antagonistik etkiye dayanılarak, depresyonun, anksiyete bozukluğunun (örn., jeneralize anksiyete bozukluğunun, post travmatik stres bozukluğunun, panik bozukluğunun, obsesif-kompulsif bozukluğun, sosyal anksiyete bozukluğunun), dikkat eksikliği bozukluğunun, maninin, manik-depresif bozukluğun, şizofreninin, duygudurum bozukluğunun, stresin, uyku bozukluğunun, atağın, hafıza fonksiyon bozukluğunun, bilişsel bozukluğun, demansın, amnezinin, deliryumun, mental bozulmanın, obezitenin, yeme bozukluğunun, iştah bozukluğunun, hiperfajinin, bulimyanın, sibofobinin, diyabetin, bir kardiyovasküler hastalığın, hipertansiyonun, dislipideminin, kardiyak infarktın, hareket bozukluğunun (örn.,
10 Parkinson hastalığının, epilepsinin, konvülziyonun, tremorun), ilaç kötüye kullanımı bozukluğunun, ilaç bağımlılığının, ve cinsel fonksiyon bozukluğunun önlenmesinde veya tedavisinde faydalı olan yeni bir bileşiğin, onun farmasötik açıdan kabul edilebilir bir tuzunun, veya bir hidratinin sağlanması. ÇÖZÜM formül (I) tarafından temsil edilen bir bileşik, onun farmasötik açıdan kabul edilebilir bir tuzu, veya bir
15 hidratı.
20

Sonuç olarak, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

25

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, BDNF ekspresyonunu artırmasıdır.

30 Buluşun bir diğer amacı, Doğal dopamin üretimini teşvik etmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, D1 ve D2 reseptör hassasiyetini artırmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, sinir büyüme faktörü ekspresyonunu artırmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, igf-1 ekspresyonunu artırmasıdır.

5

Buluşun bir diğer amacı, prolaktin salınımını baskılamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik, 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 2,3-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on, 11-okso-
10 alfametildioskin, 3,5-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 7-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

15 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.

20 **Buluşun Detaylı Açıklaması**

Buluş, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, BDNF ekspresyonunu artırmakta, doğal dopamin üretimini teşvik etmekte, D1 ve D2 reseptör hassasiyetini artırmakta, sinir büyüme faktörü ekspresyonunu artırmakta, igf-1 ekspresyonunu artırmakta ve
25 prolaktin salınımını baskılamaktadır.

Buluş konusu formülasyon; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 2,3-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on, 11-okso-
30 alfametildioskin, 3,5-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 7-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on ihtiva etmektedir.

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

% 3-8 oranında 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on,

% 11-4 oranında 2,3-bis(6-oksoetil)-4-O-dioskin,

% 16-20 oranında 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on,

% 10-12 oranında 11-okso-alfametildioskin,

% 12-18 oranında 3,5-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on,

5 % 33-11 oranında 7-bis(6-oksoetil)-4-O-dioskin,

% 15-29 oranında 3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on.

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 formülasyonun; parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

15

İSTEMLER

1. Buluş, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik, 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 2,3-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-
5 metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on, 11-okso-alfametildioskin, 3,5-bis(2-dimetil)-
6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 7-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-
stigmast-6-en-fenil-4-on içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da
kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 3-8 oranında
10 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 11-4 oranında 2,3-
bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin içermesidir.
4. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 16-20 oranında
3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on içermesidir.
- 15 5. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 10-12 oranında 11-
okso-alfametildioskin içermesidir.
6. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 12-18 oranında
3,5-bis(2-dimetil)-6-O-stigmast-4-en-kumaroil-3-on içermesidir.
7. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 33-11 oranında 7-
20 bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin içermesidir.
8. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 15-29 oranında
3,5-metoksi-stigmast-6-en-fenil-4-on içermesidir.
9. Buluş, 2-8 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 16,20-bis(2-dimetil)-6-O-
25 stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 2,3-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-
stigmast-6-en-fenil-4-on, 11-okso-alfametildioskin, 3,5-bis(2-dimetil)-6-O-
stigmast-4-en-kumaroil-3-on, 7-bis(6-oksoetil)-4-0-dioskin, 3,5-metoksi-
stigmast-6-en-fenil-4-on içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar
halinde elde edilen bileşimlerin; parkinson hastalığının semptomatik tedavisine
30 yönelik formülasyon un üretiminde kullanımındır.

ÖZET**PARKİNSON HASTALIĞININ SEMPTOMATİK TEDAVİSİNE YÖNELİK BİR
FORMÜLASYON**

5

Buluş, parkinson hastalığının semptomatik tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, BDNF ekspresyonunu artırmakta, doğal dopamin üretimini teşvik etmekte, D1 ve D2 reseptör hassasiyetini artırmakta, sinir büyüme faktörü ekspresyonunu artırmakta, igf-1 ekspresyonunu artırmakta ve prolaktin salınımını baskılamaktadır.

10

Şekil yoktur.

15