

Tarifname

KAS SPESİFİK KİNAZ RESEPTÖR HASSASİYETİNİN ARTIMI VESİLESİYLE KAS GÜCÜ ARTIMI DESTEKLEYEN TRİSİKLOPENTAON TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik oluşturulmuş, kas gücü artımı destekleyen trisiklopentaon türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde kimya ve biyokimyada kinaz, ATP gibi yüksek enerjili verici moleküllerden fosfat gruplarını özel substratlara fosforilasyon yolu ile aktaran enzim tipidir. Kinazlar, fosfotransferazlar adlı daha büyük bir ailenin bir bölümüdür. Kinazlar, inorganik bir fosfat grubu kullanan bir bağın yıkılması olan fosforolizi yürüten fosforilazlarla ya da fosfat gruplarını ayıran fosfatazlarla karıştırılmamalıdır.

EP2042504B1 no'lu, " Kaynaşmış azol pirimidin türevleri " başlıklı buluş, yeni kaynaşmış azolpirimidin türevlerine, bunları ve bunları ihtiva eden farmasötik preparatları hazırlama yöntemlerine ilişkindir. Buluşa göre olan kaynaşmış azolpirimidin türevleri fosfotidilinositol-3-kinaz (P13K) önlenmesi, özellikle de P13K-y önlenmesi için artan bir etki meydana getirme gücü sergiler, ve P13K ve özellikle de PBK-y aktivitesine bağlı hastalıkların profilaksi ve tedavisi için kullanılabilir. Daha özgün olarak, buluşa göre olan azol türevleri aşağıdaki hastalıkların tedavisi ve profilaksisi için faydalıdır: astim, atopik dermatit, rinit gibi iltihabi ve bağışıklık düzenleyici bozukluklar, alerjik hastalıklar, kronik obstrüktif pulmoner hastalığı (COPD), septik şok, eklem hastalıkları, romatoid artrit, ve Graves hastalığı gibi otoimmün patolojiler, kanser, miyokard kasılabilirlik bozuklukları, kalp yetmezliği, tromboembolizm, iskemi, ve ateroskleroz. Buluşa göre olan bileşikler ayrıca hastalıklar bir insan ya da hayvan denekte P13K aktivitesine de ilişkin olduğu için ayrıca pulmoner hipertansiyon, böbrek yetmezliği, kardiyak hipertrofi, bunların yanı

30

sıra Parkinson hastalığı, Alzheimer hastalığı gibi nörodejeneratif bozuklukları, diyabet ve fokal iskemi için de faydalıdır.

5 TR2011/08485 no'lu, " A61K 31/00 " tasnif sınıflı ve " Tribulus terrestris, avena sativa ve panax ginseng ekstrakt kombinasyonu " başlıklı buluş, kalp ve damar hastalıklarının tedavisinde ve kas gücünün, vücut dayanıklılığının ve fiziksel performansın artırılmasında destekleyici ve takviye edici olarak kullanılmak üzere tribulus terrestris, avena sativa ve panax ginseng bitkilerinin tanımlanmış kısımlarından elde edilen bitkisel farmasötik ürün, bu ürünün formülasyonu ile ilgilidir.

10 Sonuç olarak, kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

15 Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, Kas spesifik kinaz (MuSK) reseptör hassasiyetinin artımı sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, dok-7 ekspresyon artımı sağlamasıdır.

20 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik, 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon, 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da 25 kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

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, kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik oluşturulmuş, kas gücü artımı destekleyen trisiklopentaon türevlerini içeren bir kompozisyondur. Söz konusu kompozisyon; kas spesifik kinaz (MuSK) reseptör hassasiyetinin artımı ve dok-7 ekspresyon artımı sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon, 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon,

% 99-1 oranında 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon.

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; kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik, 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon, 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
- 5
- 10 2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon içermesidir.
- 20 4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 4-[[[(6R,7R)-7-[[[(2Z)-(2-amino-4-tiazolil)](1-karboksi-2-dimetiletoksi)floro]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-5-tia-1-trisiklopentaon, 4-[[[(4R,6R)-6-[[[(4Z)-(2-amino-4-tiazolil)](2-dikarboksi-1-metiletoksi)imino]asetil]amino]-2-karboksi-8-okso-6-tia-4-trisiklopentaon içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
- 25
- 30

ÖZET**KAS SPESİFİK KİNAZ RESEPTÖR HASSASİYETİNİN ARTIMI VESİLESİYLE KAS GÜCÜ ARTIMI DESTEKLEYEN TRİSİKLOPENTAON TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş kas spesifik kinaz reseptör hassasiyetinin artımına yönelik oluşturulmuş, kas gücü artımı destekleyen trisiklopentaon türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Şekil yoktur.

15