

## Tarifname

### MEK BASKILAMA METODU İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTERMEYE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

5

#### Teknik Alan

Buluş, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

#### Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde anti-karsinojen; kanser oluşumunu engelleyen veya tümörün büyümesini önleyen maddedir. Mevcut teknikte, " WO 1997/048409" no'lu, " Kanser tedavisinde naaladase inhibitörleri kullanımı" başlıklı ve " A61K 38/05" tasnif sınıflı buluş, dipeptidaz inhibitörlerine ve daha özel olarak ise, N-Asetile o-bağlantılı Asidik Dipeptidazın (NAALADaz) enzim etkinliğinin engellenmesi ve hastalıkların, özellikle prostat kanseri hücrelerinin büyümesinin engellenmesi için, bu buluşun bileşikleri kullanılarak tedavi edilmesi için fosfonat türevleri, hidroksifosfinil türevleri ve fosforamidat türevlerinin kullanıldığı yeni yöntemlere ilişkindir.

Yine, " WO 1997/005873" no'lu, " Kanser hastalıklarının ilerlemesini önlemede flukonazol kullanımı" başlıklı ve " A61K 31/41" tasnif sınıflı buluş, Memelilerde kanserlerin ya da tümörlerin iyileştirilmesi için bir farmasötik bileşim anlatılmıştır, bu bileşim, 2-(2,4-diflüorofenil)-1, 3-bis(1H-1,2,4-triazol-1-il) propan-2-ol ve türevlerini içermektedir. Bir kemoterapik madde, kuvvetlendirici maddeler olarak 2-(2,4-diflüorofenil)-1, 3-bis(1H-1,2,4-triazol-1-il) propan-2-ol ve türevleri ile birlikte kullanılabilir. 2-(2,4-diflüorofenil)-1, 3-bis(1H-1,2,4-triazol-1-il) propan-2-ol ve türevleri, aynı zamanda, diğer anti-viral maddeler ile birlikte, tek başına ya da bir kuvvetlendirici madde ile viral enfeksiyonların iyileştirilmesi için de kullanılabilir.

Yine, " EP1373260B1" no'lu, " Anti-kanser maddeler olarak dibenzo[c]kromen-6-on türevleri" başlıklı ve " C07D 407/04" tasnif sınıflı buluş, Epitelial kanser hücresi

hatlarına ve endotelial hücrelere karşı anti-proliferatif etkiler sergileyen moleküller ve sentez usulleri açıklanmıştır. Moleküllerin ya anti-anjiyojenez ya da başka anti-kanser mekanizmalar vasıtasıyla kanser tedavisine yönelik terapötik preparatlarda kullanımı amaçlanmıştır. Belirtilen bileşikler 6H-dibenzo[b,d]piran-6-on türevleridir ve insan endotelial hücrelerine karşı anti-proliferatif oldukları gösterilmiştir.

Sonuç olarak, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

10

### **Buluşun Amacı**

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, pge-2 ekspresyonunu baskılamasıdır.

15

Buluşun bir diğer amacı, cox-2 ekspresyonunu baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, MEK ekspresyonunu baskılamasıdır.

20 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, (3 $\beta$ ,5 $\beta$ )-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- $\beta$ -D-heksapiranosil- $\beta$ -D-dietilpiranosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

25

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.

30

### Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, pge-2 ekspresyonunu baskılar, cox-2 ekspresyonunu baskılar, MEK ekspresyonunu baskılar.

Cox-2 ağrıdan sorumlu bir enzimdir. Siklooksigenaz (cox) enzimleri hücre içerisinde araşidonik asitten prostoglandin ve eikkosanoitlerin oluşumundan görevli enzimdirlerdir. Bu enzimler hemostatik dengede önemli işlevlere sahiptirler. pge-2 ise; vücutta, PGH 2 üzerine PGE sentazenziminin etkisiyle oluşan, damar genişletici, trombositlerin kümeleşmesini engelleyici, solunum yolları düz kaslarını gevşetici etkili ve ayrıca, inek, koyun ve domuzda sarı cismin erimesini engelleyici etkiye sahip olan prostaglandin türevi bir bileşik, PGE<sub>2</sub>. Düz kasları gevşetici özelliğinden yararlanılarak doğum öncesi serviks uterusunun yeterli açılmadığı durumlarda serviks genişleticisi olarak kullanılır.

Pge-2 Böbreğin medullası, mide bağırsak mukozası ve diğer dokulardan salınan önemli bir prostaglandin, prostaglandin E2. Düz kaslarda kontraksiyon veya gevşeme yapar. Bu özelliğinden yararlanılarak doğum öncesi serviks uterusunun yeterli açılmadığı durumlarda serviks genişleticisi olarak kullanılır.

Buluş konusu formülasyon; 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, (3β,5β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O-β-D-heksapiranosil-β-D-dietilpiranosit ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on,

% 99-1 oranında (3β,5β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O-β-D-heksapiranosil-β-D-dietilpiranosit.

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; mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

**İSTEMLER**

1. Buluş, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, (3 $\beta$ ,5 $\beta$ )-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- $\beta$ -D-heksapiranosil- $\beta$ -D-dietilpiranosit 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 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on içermesidir.  
10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında (3 $\beta$ ,5 $\beta$ )-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- $\beta$ -D-heksapiranosil- $\beta$ -D-dietilpiranosit içermesidir.  
15
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 3,5-bis(3-metoksietil)-6-0-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, (3 $\beta$ ,5 $\beta$ )-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- $\beta$ -D-heksapiranosil- $\beta$ -D-dietilpiranosit içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik formülasyonun üretiminde kullanımındır.  
20

**ÖZET****MEK BASKILAMA METODU İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTERMEYE  
YÖNELİK BİR FORMÜLASYON**

5

Buluş, mek baskılama metodu ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, pge-2 ekspresyonunu baskılar, cox-2 ekspresyonunu baskılar, MEK ekspresyonunu baskılar.

10

Şekil yoktur.

15