

## Tarifname

### TIP 1 DİYABETİN TEDAVİSİNE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

#### 5 Teknik Alan

Buluş, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

#### 10 Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde Diabetes mellitus, sıklıkla yalnızca diyabet olarak adlandırılan, genellikle kalıtsal ve çevresel etkenlerin birleşimi ile oluşan ve kan glukoz seviyesinin aşırı derecede yükselmesiyle (hiperglisemi) sonuçlanan metabolik bir bozukluktur. Vücutta kan şekerinin düzenlenmesi pek çok sayıda kimyasal madde ve hormonun karmaşık etkileşimi sonucunda sağlanır. Şeker metabolizmasının düzenlenmesinde rol oynayan hormonlardan en önemlisi pankreasın beta hücrelerinden salgılanan insülin hormonudur. Diabetes Mellitus ya insülin salgılanmasındaki yetersizlik ya da insülinin etkisindeki bir bozukluk sonucunda ortaya çıkan yüksek kan şekerinin yol açtığı birkaç grup hastalığı tanımlamak için kullanılan ortak bir terimdir. Diyabet ya insülin üretiminin azalması yüzünden (Tip 1 diyabette) ya da insülinin etkisine karşı direnç gelişmesiyle (Tip 2 diyabette ve gestasyonel diyabette) oluşur.

Mevcut teknikte, "EP1894567B1" no'lu, "Konkomitant farmasötik maddeler ve bunların kullanımı" başlıklı ve "A61K 31/496" tasnif sınıflı buluş, Birlikte veya ayrı ayrı uygulanabilen bir konkomitant madde olup, (a) 3-{{(2S,4S)-4-[4-(3-metil-1-fenil-1H-pirazol-5-il)]piperazin-1-il}pirolidin-2-ilkarbonil}tiazolidin, bileşiğin bir organik veya inorganik ve mono- veya di-bazik asit ile bir tuzu veya bunun bir solvatu ve (b) (i) bir anti-diyabetik ilaç, (ii) bir lipid düşürücü ilaç, (iii) bir antihipertansif ilaç, (iv) diyabetik komplikasyonlar için bir terapötik ilaç, (v) bir antiobezite ilacı, (vi) bir anti-platelet ilacı ve (vii) bir antikoagülan, bunların farmasötik olarak uygun bir tuzu ve bunların bir solvatından seçilen bir farmasötik maddenin bir aktif bileşeninden oluşan gruptan seçilen en az bir tip aktif bileşen kombinasyonunu içerir.

Yine, "EP2195312B1" no'lu, "Glukokinaz aktivatörleri olarak faydalı piridin türevleri" başlıklı ve "C07D 417/12" tasnif sınıflı buluş, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> ve D'nin istem l'de belirtilen anlamlara sahip olduğu, formül (I)'e ait yeni heterosiklik bileşikler, glukokinaz aktivatörleridir ve Diyabet Tip 1 ve 2, obezite, nöropati ve/veya nefropatinin 5 Önlenmesi ve/veya tedavisi amaçlı kullanılabilir.

Yine, "EP1758558B1" no'lu, "Oligonükleotit içeren mikro-kürecikler, bunların tip 1 diyabet tedavisi için bir ilacın imalatında kullanımları" başlıklı ve "A61K 9/16" tasnif sınıflı buluş, tip 1 diyabet tedavisi için oligonükleotitler içeren mikroküreciklere ilişkindir; bahsedilen oligonükleotitler, mikroküreciklerin toplam ağırlığına dayalı 10 olarak mikroküreciklerin ağırlıkça yaklaşık % 30 ila yaklaşık % 100'ünü oluştururlar; bahsedilen mikrokürecikler, yaklaşık 50 mikrondan büyük olmayan bir ortalama tanecik boyutuna sahiptirler. Oligonükleotitlerin, CD40, CD80 ve CD86 primer transkriptlerinden ve bunların kombinasyonlarından oluşan gruptan seçilen primer transkriptlere bağlanması hedeflenir.

15 Sonuç olarak, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

## 20 **Buluşun Amacı**

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, etkin pankreatik beta hücrelerinin hücre duvarı geçirgenliğini tesis etme vesilesi ile hücre tamirini tetiklemesidir.

25

Buluşun bir diğer amacı, nöro-endokrin bağlantıyı güçlendirmesidir.

Buluşun bir diğer amacı, insülin salınımını cAMP artımı ile uyarmasıdır.

30 Buluşun bir diğer amacı, sahip olduğu sistemik fosfodiesteraz baskılama niteliği sayesinde insülin salınımını uyarmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, immunomodulatif niteliği sayesinde kronik otoimmün tahribata sebebiyet veren tnf-alfa ve interleukin-6 seviyesini indirgemesidir.

5 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik; 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, 11-dioksi-  
metoksifloro-hekogenin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

10 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**

15

Buluş, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, etkin pankreatik beta hücrelerinin hücre duvarı geçirgenliğini tesis etme vesilesi ile hücre tamirini tetikler, nöro-endokrin bağılantıyı güçlendirir, insülin salınımını cAMP artımı ile uyarır, sahip olduğu sistemik fosfodiesteraz baskılama  
20 niteliği sayesinde insülin salınımını uyarır, immunomodulatif niteliği sayesinde kronik otoimmün tahribata sebebiyet veren tnf-alfa ve interleukin-6 seviyesini indirir.

25

Buluş konusu formülasyon; 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, 11-dioksi-metoksifloro-hekogenin ihtiva etmektedir.

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

% 30-70 oranında 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on,

30 % 70-30 oranında 11-dioksi-metoksifloro-hekogenin.

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; tip 1 diyabetin tedavisine yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

**İSTEMLER**

1. Buluş, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik; 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, 11-dioksi-metoksifloro-hekogenin içeren 5 gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 30-70 oranında 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on içermesidir. 10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 70-30 oranında 11-dioksi-metoksifloro-hekogenin içermesidir.
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 3,7-bis(2-hidroksimetil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiran-4-on, 11-dioksi-metoksifloro-hekogenin 15 içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; tip 1 diyabetin tedavisine yönelik formülasyonun üretiminde kullanımıdır.

**ÖZET****TİP 1 DİYABETİN TEDAVİSİNE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON**

- 5 Buluş, tip 1 diyabetin tedavisine yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, etkin pankreatik beta hücrelerinin hücre duvarı geçirgenliğini tesis etme vesilesi ile hücre tamirini tetikler, nöro-endokrinal bağlantıyı güçlendirir, insülin salınımını cAMP artımı ile uyarır, sahip olduğu sistemik fosfodiesteraz baskılama niteliği sayesinde insülin salınımını uyarır, immunomodulatif niteliği
- 10 sayesinde kronik otoimmün tahribata sebebiyet veren tnf-alfa ve interleukin-6 seviyesini indirger.

Şekil yoktur.