

## Tarifname

### NESTİN EKSPRESYONUNU BASKILAMA İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTEREN BİR FORMÜLASYON

5

#### Teknik Alan

Buluş, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

#### Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde kanser tedavisinde kullanılan ilaçlara "antikanser" ilaçlar denmektedir. Kanser türüne göre kemoterapinin amaçları farklılaşabilmektedir. Başlıca amaçlar: Kanser tedavi etmektir. Kanser hücrelerine ait izler tümüyle ortadan kalktığına kanser tedavi edilmiş sayılmaktadır. Kanser kontrol etmek, genel olarak kanserin yayılımını önlemek ve büyümesini yavaşlatmak, kanserin kontrol altında tutulması olarak kabul edilmektedir. Kanser yol açtığı belirtileri gidermektir. Bazı kemoterapi uygulamalarının temel amacı hastanın yaşam niteliğini yükseltebilmek için ağrı ve benzeri belirtileri ortadan kaldırmak ya da hafifletmektir. Kemoterapi ilaçlarının her zaman istenilen faydayı sağlaması mümkün olmayabilir. Kanser tümörleri tedavi ile yok edilemiyorsa veya tedavide geç kalındı ise, kanser hücreleri kan damarları ya da lenfler yoluyla vücuda yayılabilir. Bu durumda metastaz (yayılma) denilen durum meydana gelmiş olur.

Mevcut teknikte, " EP1615638B1 " no'lu, " Antikanser tedavisi için 7-nitro-2,1,3 benzoksadiazol türevlerinin kullanımı " başlıklı ve " A61K 31/4245 " tasnif sınıflı buluş, (Formül (I)); Genel formül (I)'in 7-nitro-benzofurazan veya 7-nitro-2,1,3-benzoksadiazol şeklinde bilinen heterosiklik bileşikler, kanser hücrelerinde çok fazla eksprese edilen ve bunları özellikle pekçok stres faktörüne karşı dirençli kılan glutasyon S-transferaz (GST) süper ailesinin üyelerine karşı kuvvetli inhibe edici aktiviteye sahip bileşikler olarak önerilmektedirler. Bu bileşikler antikanser tedavisinde kullanılmak üzere farmasötik ilaçların üretiminde kullanışlıdır ve ya tek

başına ya da diğer kemoterapötik ajanlarla kombinasyon halinde kullanılabilirler. Buluş aynı zamanda aktif madde olarak formül (I)'in türevlerinin en az birini, isteğe bağlı olarak diğer kemoterapötik ajanlarla kombinasyon halinde kapsayan, antikanser tedavisi için preparatlarla da ilgilidir.

- 5 Yine, " EP1560832B1 " no'lu, " Antikanser aktivitesine sahip pirimido 4,5-d pirimidin türevleri " başlıklı ve " C07D 487/04 " tasnif sınıflı buluş, formül I'e uygun yeni pirimido bileşikleri ile bunların farmasötik açıdan kabul edilebilir tuzlarına ve bunların kanser tedavisi ve mücadelesi için olan ilaçların hazırlanmasında kullanılmasına yöneliktir.
- 10 Yine, " EP1689724B1 " no'lu, " Antikanser ajanları olarak quinazolinone bileşikleri " başlıklı ve " C07D 239/90 " tasnif sınıflı buluş, yeni kinazolin bileşikleri, onların farmasötik olarak kabul edilir tuzları ve bunların ön ilaçları; farmasötik olarak kabul edilir taşıyıcı ile ya tek başına veya en az bir ilaveten terapötik ajan ile kombinasyonda yeni bileşiklerin kompozisyonları; veya tek başına veya en az bir
- 15 ilaveten terapötik ajan ile kombinasyonda yeni bileşiklerin kullanımları ile ilgilidir.

Sonuç olarak, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye 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, nestin ekspresyonunu baskılamasıdır.

25

Buluşun bir diğer amacı, interleukin 6 ekspresyonunu baskılamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-

30 (dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-(dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion, (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit

içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

5 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**

10

Buluş, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, nestin ekspresyonunu baskılar, interleukin 6 ekspresyonunu baskılar.

15 Buluş konusu formülasyon; 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-(dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-(dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion, (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit ihtiva etmektedir.

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

% 20-80 oranında 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-(dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-(dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion,

25 % 80-20 oranında (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit.

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

30

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu formülasyonun; nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

**İSTEMLER**

1. Buluş, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-(dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-  
5 (dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion, (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
- 10 2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 20-80 oranında 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-(dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-(dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 80-20 oranında (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit içermesidir.
- 20 4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 1H-siklopenta[a]fenilantroil-4-il]oksi]-6-(dimetoksietil)oksan-3-il]oksi-8-(dihidroksietil)oksan-3,5,7-trion, (3 $\beta$ ,10 $\beta$ )-12,20-heksahidroksidamar-20-en-4-kafeoil 7-O- $\beta$ -D-glukopiranosil- $\beta$ -D-trihidroksipiranosit içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik bir formülasyonun üretiminde kullanımındır.

**ÖZET****NESTİN EKSPRESYONUNU BASKILAMA İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ  
GÖSTEREN BİR FORMÜLASYON**

5

Buluş, nestin ekspresyonunu baskılama ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, nestin ekspresyonunu baskılar, interleukin 6 ekspresyonunu baskılar.

10 Şekil yoktur.

15